

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2008に準拠して作成

局所麻酔剤

日本薬局方 リドカイン注射液

リドカイン 注「NM」0.5%

リドカイン 注「NM」1%

リドカイン 注「NM」2%

LIDOCAINE Inj. 「NM」0.5%・1%・2%

剤形	注射液
製剤の規制区分	劇薬、処方せん医薬品 (注意—医師等の処方せんにより使用すること)
規格・含量	リドカイン注「NM」0.5%：1 mL 中塩酸リドカイン 5mg 含有 リドカイン注「NM」1%：1 mL 中塩酸リドカイン 10mg 含有 リドカイン注「NM」2%：1 mL 中塩酸リドカイン 20mg 含有
一般名	和名：リドカイン (JAN) 洋名：Lidocaine (JAN, INN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：1984年10月11日 (局方品承認移行による) 薬価基準収載年月日：1971年12月16日 発売年月日：2001年10月1日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	販売：ファイザー株式会社 提携：マイラン製薬株式会社 製造販売元：ナガセ医薬品株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ファイザー株式会社 製品情報センター 学術情報ダイヤル 0120-664-467 Fax 03-3379-3053 医療用製品情報 http://pfizerpro.jp/cs/sv/pfizerpro/di/Page/1259675500452

本 IF は 2013 年 1 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。
最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ
<http://www.info.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

IF利用の手引きの概要

—日本病院薬剤師会—

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IFと略す）の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会によってIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会において新たなIF記載要領が策定された。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IFの様式]

- ① 規格はA4判、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ② IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③ 表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

[IFの作成]

- ① IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ② IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④ 製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤ 「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」（以下、「IF記載要領2008」と略す）により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IFの発行]

- ① 「IF記載要領2008」は、平成21年4月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については「IF記載要領2008」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく異なる場合にはIFが改訂・発行される。

3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4.利用に際しての留意点

IFを薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

目 次

I. 概要に関する項目			
1. 開発の経緯	1	7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	5
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	8. 生物学的試験法	7
		9. 製剤中の有効成分の確認試験法	7
		10. 製剤中の有効成分の定量法	7
II. 名称に関する項目		11. 力価	7
1. 販売名	2	12. 混入する可能性のある夾雑物	7
(1) 和名	2	13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	7
(2) 洋名	2	14. その他	7
(3) 名称の由来	2		
2. 一般名	2	V. 治療に関する項目	
(1) 和名（命名法）	2	1. 効能又は効果	8
(2) 洋名（命名法）	2	2. 用法及び用量	8
(3) ステム	2	3. 臨床成績	8
3. 構造式又は示性式	2	(1) 臨床データパッケージ	8
4. 分子式及び分子量	2	(2) 臨床効果	8
5. 化学名（命名法）	2	(3) 臨床薬理試験：忍容性試験	9
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	(4) 探索的試験：用量反応探索試験	9
7. CAS登録番号	2	(5) 検証的試験	9
		(6) 治療的使用	9
III. 有効成分に関する項目		VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 物理化学的性質	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	10
(1) 外観・性状	3	2. 薬理作用	10
(2) 溶解性	3	(1) 作用部位・作用機序	10
(3) 吸湿性	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	10
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点	3	(3) 作用発現時間・持続時間	10
(5) 酸塩基解離定数	3		
(6) 分配係数	3	VII. 薬物動態に関する項目	
(7) その他の主な示性値	3	1. 血中濃度の推移・測定法	11
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(1) 治療上有効な血中濃度	11
3. 有効成分の確認試験法	3	(2) 最高血中濃度到達時間	11
4. 有効成分の定量法	3	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	11
		(4) 中毒域	11
		(5) 食事・併用薬の影響	11
		(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因	11
IV. 製剤に関する項目		2. 薬物速度論的パラメータ	11
1. 剤形	4	(1) コンパートメントモデル	11
(1) 剤形の区別、規格及び性状	4	(2) 吸収速度定数	11
(2) 溶液及び溶解時のpH、浸透圧比、粘度、比重、安定なpH域等	4	(3) バイオアベイラビリティ	11
(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類	4	(4) 消失速度定数	11
2. 製剤の組成	4	(5) クリアランス	11
(1) 有効成分（活性成分）の含量	4	(6) 分布容積	12
(2) 添加物	4	(7) 血漿蛋白結合率	12
(3) 電解質の濃度	4	3. 吸収	12
(4) 添付溶解液の組成及び容量	4	4. 分布	12
(5) その他	5	(1) 血液－脳関門通過性	12
3. 注射剤の調整法	5	(2) 血液－胎盤関門通過性	12
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5		
5. 製剤の各種条件下における安定性	5		
6. 溶解後の安定性	5		

(3) 乳汁への移行性	12	(2) 副次的薬理試験	22
(4) 髄液への移行性	12	(3) 安全性薬理試験	22
(5) その他の組織への移行性	12	(4) その他の薬理試験	22
5. 代 謝	12	2. 毒性試験	22
(1) 代謝部位及び代謝経路	12	(1) 単回投与毒性試験	22
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450等) の分子種	12	(2) 反復投与毒性試験	22
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	12	(3) 生殖発生毒性試験	22
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	12	(4) その他の特殊毒性	22
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	13		
6. 排 泄	13	X. 管理的事項に関する項目	
(1) 排泄部位及び経路	13	1. 規制区分	23
(2) 排泄率	13	2. 有効期間又は使用期限	23
(3) 排泄速度	13	3. 貯法・保存条件	23
7. 透析等による除去率	13	4. 薬剤取扱い上の注意点	23
		(1) 薬局での取り扱いについて	23
		(2) 薬剤交付時の注意 (患者等に留意すべき必須事項等) ..	23
VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目		5. 承認条件等	23
1. 警告内容とその理由	14	6. 包 装	23
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	14	7. 容器の材質	23
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意と その理由	14	8. 同一成分・同効薬	23
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意と その理由	14	9. 国際誕生年月日	23
5. 慎重投与内容とその理由	15	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	24
6. 重要な基本的注意とその理由及び 処置方法	16	11. 薬価基準収載年月日	24
7. 相互作用	17	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更 追加等の年月日及びその内容	24
(1) 併用禁忌とその理由	17	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	24
(2) 併用注意とその理由	17	14. 再審査期間	24
8. 副作用	17	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	24
(1) 副作用の概要	17	16. 各種コード	24
(2) 重大な副作用と初期症状	18	17. 保険給付上の注意	24
(3) その他の副作用	18		
(4) 項目別副作用発現頻度及び 臨床検査値異常一覧	19	XI. 文 献	
(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術 の有無等背景別の副作用発現頻度	19	1. 引用文献	25
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び 試験法	19	2. その他の参考文献	25
9. 高齢者への投与	19	XII. 参考資料	
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19	1. 主な外国での発売状況	26
11. 小児等への投与	20	2. 海外における臨床支援情報	26
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	20		
13. 過量投与	20	XIII. 備 考	
14. 適用上の注意	20	1. その他の関連資料	27
15. その他の注意	20	(1) JANコード	27
16. その他	21		
IX. 非臨床試験に関する項目			
1. 薬理試験	22		
(1) 薬効薬理試験	22		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

1935年スウェーデンの Löfgren 及び Lundquist は植物塩基 gramine の合成類縁体が麻酔性を有することを発見し、この種の多数の誘導体について研究した結果、1943年リドカインの合成に成功した。その後、Björn、Goldberg、Gordh を始めとする研究者による極めて多数の基礎並びに臨床実験を経て、1948年スウェーデンの Astra 社がその製品を発売するに至った。

リドカイン注「NM」0.5%、1%、2%は、帝国化学産業株式会社（現ナガセ医薬品株式会社）が開発を企画し、規格及び試験方法を設定し、1971年12月に製造許可を取得した。その後1984年10月に局方品として承認を取得した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、アミド型の局所麻酔剤であり、プロカインより作用の発現が速やか、局所刺激作用が弱い、麻酔効果が強い、作用持続が長い、などの特長を持ち、すべての局所麻酔によく用いられる。
- (2) 本剤は、使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していないが、リドカインの重大な副作用として、ショック、意識障害・振戦・痙攣、異常感覚、知覚・運動障害、悪性高熱が報告されている。

II. 名称に関する項目

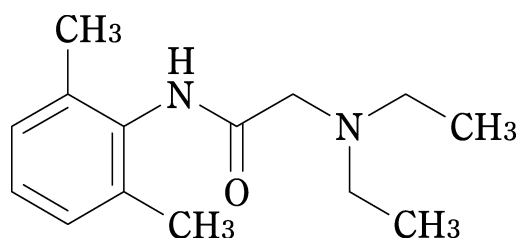
1. 販売名

- (1) 和名：リドカイン注「NM」0.5%、リドカイン注「NM」1%
リドカイン注「NM」2%
- (2) 洋名：LIDOCAINE Inj. 「NM」0.5%、LIDOCAINE Inj. 「NM」1%
LIDOCAINE Inj. 「NM」2%
- (3) 名称の由来：本剤の一般名「リドカイン」に由来する

2. 一般名

- (1) 和名（命名法）：リドカイン（JAN）
- (2) 洋名（命名法）：Lidocaine（JAN、INN）、Lignocaine（BP）
- (3) ステム：caine（局所麻酔剤）

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₄H₂₂N₂O
分子量：234.34

5. 化学名（命名法）

2-Diethylamino-*N*-(2,6-dimethylphenyl)acetamide (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

なし

7. CAS 登録番号

137-58-6

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

溶 媒	1gを溶かすのに要する溶媒量	日本薬局方の 溶解性表記
メタノール、エタノール (95)	1mL未満	極めて溶けやすい
酢酸 (100)、ジエチルエーテル	1mL以上 10mL未満	溶けやすい
水	10000mL以上	ほとんど溶けない

本品は、希塩酸に溶ける。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

融点：66～69℃

(5) 酸塩基解離定数

pKa²⁾：7.9 (25℃)

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方「リドカイン」の確認試験法による。

4. 有効成分の定量法

日本薬局方「リドカイン」の定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

剤形：注射液
規格：

販売名	規格
リドカイン注「NM」0.5%	1mL中 塩酸リドカイン 5mg 含有
リドカイン注「NM」1%	1mL中 塩酸リドカイン 10mg 含有
リドカイン注「NM」2%	1mL中 塩酸リドカイン 20mg 含有

性状：無色澄明の注射液

(2) 溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

pH：5.0～7.0

浸透圧比：約1（生理食塩液に対する比）

(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

販売名	1mL中 塩酸リドカイン含量
リドカイン注「NM」0.5%	5mg
リドカイン注「NM」1%	10mg
リドカイン注「NM」2%	20mg

(2) 添加物

1mL中 パラオキシ安息香酸メチル：0.5mg

パラオキシ安息香酸ブチル：0.05mg

リン酸水素ナトリウム水和物、塩酸、等張化剤、pH 調節剤

(3) 電解質の濃度

該当しない

(4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

(5) その他

特になし

3. 注射剤の調整法

該当しない

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性^{3)~5)}

保存条件	包装形態	保存期間	結果
室温	密封容器 箱入り	5年	いずれの試験項目も規格に適合した ^{注)} 。

注) 試験項目：性状、pH、含量

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

(1) pH変動試験

	試料 pH	1/10N HCl	最終 pH または 変化点 pH	移動 指数	変化 所見	希釈試験 ^{注)}				浸透 圧比
		1/10N NaOH				0	30min	1hr	3hr	
0.5%	5.70	10.00mL	1.37	4.33						1
		10.00mL	12.25	6.85						
1%	5.73	10.00mL	1.32	4.41						
		1.45mL	7.69	1.96	白濁	6.65 —	—	—	5.78 —	
2%	5.74	10.00mL	1.33	4.41						
		1.40mL	7.69	1.95	白濁	6.59 —	—	—	5.78 —	

注) 外観変化が認められた場合は、蒸留水 500mL (pH:5.78) を加えて外観変化を観察し、透明になった場合を (—) と表記。0 欄に希釈直後の pH を示す。

(2) 配合変化試験結果

商品名 使用量	配合前 pH (外観)	リドカイン注「NM」2% 20mL (pH5.0~7.0)					
		試験項目		1 週間後	2 週間後	3 週間後	4 週間後
ボスミン注 1mL	2.3~5.0 (無色澄明)	外観	Lot 1	変化なし	微紅色	淡褐色	淡褐色
			Lot 2	変化なし	微紅色	淡褐色	淡褐色
			Lot 3	変化なし	ほとんど 無色	微紅色	淡褐色

試験条件：直射日光を避け室温保存

商品名 使用量	配合前 pH	リドカイン注「NM」0.5% 20mL (pH5.59)								
		試験項目	配合直後	1hr	2hr	3hr	6hr	24hr	48hr	
ノイトロピン 特号 3cc 3mL	7.48	外観	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
		pH	5.74	5.76	5.77	5.77	5.76	5.80	5.80	
		含量(%)	99	99	100	100	100	100	100	
		リドカイン注「NM」1% 10mL (pH5.59)								
		外観	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	
		pH	5.79	5.83	5.83	5.83	5.83	5.86	5.88	
		含量(%)	99	100	100	101	100	100	100	
		リドカイン注「NM」2% 5mL (pH5.73)								
		外観	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	
		pH	5.87	5.91	5.92	5.91	5.92	5.95	5.98	
		含量(%)	100	99	99	100	99	100	99	

試験条件：室温保存

商品名 使用量	配合前 pH (外観)	リドカイン注「NM」1% 5mL (pH5.55)							
		試験項目	配合直後	1hr	2hr	3hr	6hr	24hr	48hr
オルガドロン 注射液 1mL	8.10 (無色澄明)	外観	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
		pH	6.34	6.30	6.29	6.30	6.31	6.38	6.39
		含量(%)	100	100	99	101	103	101	101
デカドロン 注射液 8mg/2mL ^{注)}	7.0~8.5 (無色澄明)	リドカイン注「NM」1% 20mL (pH5.0~7.0)							
		試験項目	配合直後	0.5hr	1 hr	3hr	6hr		
		外観	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
		pH	6.36	6.36	6.36	6.36	6.36	6.36	6.36
		含量(%)	100	101.4	101.1	100.2	99.9		
デポ・ メドロール 40mg/1mL	5.5~7.0 (懸濁)	リドカイン注「NM」1% 20mL (pH5.0~7.0)							
		外観	白沈	白沈	白沈	白沈	白沈	白沈	白沈
		pH	5.70	5.68	5.67	5.68	5.68	5.68	5.68
		含量(%)	99	—	—	—	—	—	98

試験条件：室温保存

注) 有効成分 デキサメタゾンリン酸エステルナトリウムとして

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日本薬局方「リドカイン注射液」の確認試験法による。

10. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方「リドカイン注射液」の定量法による。

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

リドカイン注「NM」0.5%

硬膜外麻酔、伝達麻酔、浸潤麻酔

リドカイン注「NM」1%、2%

硬膜外麻酔、伝達麻酔、浸潤麻酔、表面麻酔

2. 用法及び用量

塩酸リドカインとして、通常成人1回200mg（0.5%の場合40mL、1%の場合20mL、2%の場合10mL）を基準最高用量とする。ただし、年齢、麻酔領域、部位、組織、症状、体質により適宜増減する。なお、各種麻酔方法による用量は次表のとおりである（mg数は塩酸リドカインとしての投与量、括弧内mL数は各濃度における注射液の投与量を示す）。

種類 麻酔方法	0.5%注射液	1%注射液	2%注射液
硬膜外麻酔	25～150mg (5～30mL)	100～200mg (10～20mL)	200mg (10mL)
交感神経遮断	25～100mg (5～20mL)	—	—
伝達麻酔	15～200mg (3～40mL)	30～200mg (3～20mL)	40～200mg (2～10mL)
指趾神経遮断	15～50mg (3～10mL)	30～100mg (3～10mL)	60～120mg (3～6mL)
肋間神経遮断	25mg まで (5mL まで)	50mg まで (5mL まで)	—
浸潤麻酔	10～200mg (2～40mL)	20～200mg (2～20mL)	40～200mg (2～10mL)
表面麻酔	—	適量を塗布又は噴霧する。	

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

アミド型局所麻酔剤（ブピバカイン、メピバカイン、プロピトカイン、ロピバカイン）

2. 薬理作用

（1）作用部位・作用機序

作用部位：神経線維

作用機序：神経細胞膜のNa⁺チャネルを抑制することによって神経の活動電位発生を抑制するという局所麻酔薬共通の作用により、知覚神経の求心性伝導を抑制する¹⁾。

（2）薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

（3）作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当しない

(2) 最高血中濃度到達時間

該当資料なし

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(4) 中毒域

6~10 μ g/mL以上²⁾

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) コンパートメントモデル

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸 収

投与方法、投与部位等により大きく異なる。なお、健康な皮膚からはほとんど吸収されない²⁾。

4. 分 布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

5. 代 謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種

主としてCYP1A2およびCYP3A4

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】				
項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔	表面麻酔
(1) 大量出血やショック状態の患者 [過度の血圧低下が起こることがある。]				
(2) 注射部位又はその周辺に炎症のある患者 [化膿性髄膜炎症状を起こすことがある。]		○	—	—
(3) 敗血症の患者 [敗血症性の髄膜炎を生じるおそれがある。]				
(4) 本剤の成分又はアミド型局所麻酔薬に対し過敏症の既往歴のある患者		○	○	○

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）				
項目	麻酔方法	硬膜外 麻 酔	伝達・浸 潤麻酔	表 面 麻 酔
(1) 中枢神経系疾患 髄膜炎、灰白脊髄炎、脊髄ろう等の患者及び脊髄・脊椎に腫瘍又は結核等のある患者〔硬膜外麻酔により症状が悪化するおそれがある。〕 (2) 血液凝固障害や抗凝血薬投与中の患者〔出血しやすく、血腫形成や脊髄への障害を起こすことがあるので、やむを得ず投与する場合は観察を十分に行うこと。〕 (3) 脊柱に著明な変形のある患者〔脊髄や神経根の損傷のおそれがあり、また麻酔範囲の予測も困難であるので、やむを得ず投与する場合は患者の全身状態の観察を十分に行うこと。〕 (4) 妊産婦（「 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 」の項参照） (5) 腹部腫瘍のある患者〔仰臥位性低血圧を起こしやすく、麻酔範囲が広がりやすい。麻酔中はさらに増悪することがあるので、投与量の減量を考慮するとともに、患者の全身状態の観察を十分に行うこと。〕 (6) 重篤な高血圧症、心弁膜症等の心血管系に著しい障害のある患者〔血圧低下や病状の悪化が起こりやすいので、患者の全身状態の観察を十分に行うこと。〕		○	—	—
(7) 高齢者（「 高齢者への投与 」及び「 重要な基本的注意 」の項参照） (8) 全身状態が不良な患者〔生理機能の低下により麻酔に対する忍容性が低下していることがある。〕（「 重要な基本的注意 」の項参照） (9) 心刺激伝導障害のある患者〔症状を悪化させることがある。〕 (10) 重篤な肝機能障害又は腎機能障害のある患者〔中毒症状が発現しやすくなる。〕		○	○	○

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意			
項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔 表面麻酔
<p>(1) まれにショックあるいは中毒症状を起こすことがあるので、本剤の投与に際しては、十分な問診により患者の全身状態を把握するとともに、異常が認められた場合に直ちに救急処置のとれるよう、常時準備をしておくこと。なお、事前の静脈路確保が望ましい。</p> <p>(2) 本剤の投与に際し、その副作用を完全に防止する方法はないが、ショックあるいは中毒症状をできるだけ避けるために、次の諸点に留意すること。</p> <p>1) 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。</p> <p>2) できるだけ薄い濃度のものを用いること。</p> <p>3) できるだけ必要最小量にとどめること。</p>		○	○
<p>4) 必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。</p> <p>5) 注射の速度はできるだけ遅くすること。</p> <p>6) 注射針が、血管又はくも膜下腔に入っていないことを確かめること。</p>		○	○
<p>7) 試験的に注入 (test dose) し、注射針又はカテーテルが適切に留置されていることを確認すること。</p> <p>8) 麻酔範囲が予期した以上に広がることにより、過度の血圧低下、徐脈、呼吸抑制を来すことがあるので、麻酔範囲に注意すること。</p>		○	—
<p>9) 血管の多い部位（頭部、顔面、扁桃等）に注射する場合には、吸収が速いので、できるだけ少量を投与すること。</p>		—	○
<p>10) 気道内表面麻酔の場合には、吸収が速いので、できるだけ少量を使用すること。</p> <p>11) 外傷、びらん、潰瘍又は炎症部位への投与は吸収が速いので注意すること。（「過量投与」の項参照）</p>		—	○
<p>12) 前投薬や術中に投与した鎮静薬、鎮痛薬等による呼吸抑制が発現することがあるので、これらの薬剤を使用する際は少量より投与し、必要に応じて追加投与することが望ましい。なお、高齢者、小児、全身状態が不良な患者、肥満者、呼吸器疾患を有する患者では特に注意し、異常が認められた際には、適切な処置を行うこと。</p>		○	○
<p>(3) 注射針又はカテーテルが適切に位置していないなどにより、神経障害が生じることがあるので、穿刺に際し異常を認めた場合には本剤の注入を行わないこと。</p>		○	○

項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔	表面麻酔
(4) 球後麻酔、眼球周囲麻酔施行時は次の諸点に留意すること。 1) 持続性の眼筋運動障害が発現するおそれがあるので、できるだけ薄い濃度で、必要最少量を用いることとし、外眼筋内への注入は避けること。また、血管収縮剤は障害を悪化させることがあるので、必要な場合にのみ使用すること。 2) 視神経鞘内への誤注入により、一過性の失明、心肺停止を起こすことがあるので、注射針はできるだけ短く、先の鈍いものを使用することが望ましい。		—	○	—
(5) 本剤に血管収縮剤（アドレナリン等）を添加して投与する場合には、血管収縮剤の添付文書に記載されている禁忌、慎重投与、重大な副作用等の使用上の注意を必ず確認すること。		○	○	○

7. 相互作用

本剤は、主として肝代謝酵素 CYP1A2 及び CYP3A4 で代謝される。

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

併用注意（併用に注意すること）		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
クラスⅢ抗不整脈剤 アミオダロン等	心機能抑制作用が増強するおそれがあるので、心電図検査等によるモニタリングを行うこと。	作用が増強することが考えられる。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用（頻度不明）			
項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔 表面麻酔
(1) ショック 徐脈、不整脈、血圧低下、呼吸抑制、チアノーゼ、意識障害等を生じ、まれに心停止を来すことがある。また、まれにアナフィラキシーショックを起こしたとの報告があるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には、適切な処置を行うこと。		○	○
(2) 意識障害、振戦、痙攣 意識障害、振戦、痙攣等の中毒症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。（「 過量投与 」の項参照）			
(3) 異常感覚、知覚・運動障害 注射針又はカテーテルの留置時に神経（神経幹、神経根）に触れることにより一過性の異常感覚が発現することがある。また、神経が注射針や薬剤あるいは虚血によって障害を受けると、まれに持続的な異常感覚、疼痛、知覚障害、運動障害、硬膜外麻酔では膀胱直腸障害等の神経学的疾患があらわれることがある。			
(4) 悪性高熱 まれに原因不明の頻脈・不整脈・血圧変動、急激な体温上昇、筋強直、血液の暗赤色化（チアノーゼ）、過呼吸、発汗、アシドーシス、高カリウム血症、ミオグロビン尿（ポートワイン色尿）等を伴う重篤な悪性高熱があらわれることがある。本剤を投与中、悪性高熱に伴うこれらの症状を認めた場合は、直ちに投与を中止し、ダントロレンナトリウムの静注、全身冷却、純酸素による過換気、酸塩基平衡の是正等、適切な処置を行うこと。また、本症は腎不全を続発することがあるので、尿量の維持を図ること。		○	○

(3) その他の副作用

その他の副作用	
	頻度不明
1) 中枢神経 ^{注)}	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈等
2) 消化器 ^{注)}	悪心・嘔吐等
3) 過敏症	蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等

注)このような症状があらわれた場合は、ショックあるいは中毒へ移行することがあるので、患者の全身状態の観察を十分に行い、必要に応じて適切な処置を行うこと。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

- 1) 本剤の成分又はアミド型局所麻酔薬に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) まれにアナフィラキシーショックを起こしたとの報告があるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には、適切な処置を行うこと。
- 3) 蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等の過敏症があらわれることがある。

9. 高齢者への投与

<p>高齢者への投与</p> <p>[硬膜外麻酔]</p> <p>一般に高齢者では、麻酔範囲が広がりやすく、生理機能の低下により麻酔に対する忍容性が低下しているため、投与量の減量を考慮するとともに、患者の全身状態の観察を十分に行うなど慎重に投与すること。</p>

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦、産婦、授乳婦等への投与				
項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔	表面麻酔
(1)妊婦等 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]		○	○	○
(2)妊産婦 1)妊娠後期の患者には、投与量の減量を考慮するとともに、患者の全身状態の観察を十分に行うなど慎重に投与すること。[妊娠末期は、仰臥位性低血圧を起こしやすく、麻酔範囲が広がりやすい。麻酔中はさらに増悪することがある。]（「慎重投与」の項参照）		○	—	—
2) 頸動脈ブロックにより胎児の徐脈を起こすおそれがある。		—	○*	—

*：伝達麻酔

11. 小児等への投与

小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

13. 過量投与

過量投与

局所麻酔剤の血中濃度の上昇に伴い、中毒が発現する。特に誤って血管内に投与した場合には、数分以内に発現することがある。その症状は、主に中枢神経系及び心血管系の症状としてあらわれる。

徴候・症状

中枢神経系の症状 初期症状として不安、興奮、多弁、口周囲の知覚麻痺、舌のしびれ、ふらつき、聴覚過敏、耳鳴、視覚障害、振戦等があらわれる。症状が進行すると意識消失、全身痙攣があらわれ、これらの症状に伴い低酸素血症、高炭酸ガス血症が生じるおそれがある。より重篤な場合には呼吸停止を来すこともある。

心血管系の症状 血圧低下、徐脈、心筋収縮力低下、心拍出量低下、刺激伝導系の抑制、心室性頻脈及び心室細動等の心室性不整脈、循環虚脱、心停止等があらわれる。

処置

呼吸を維持し、酸素を十分投与することが重要である。必要に応じて人工呼吸を行う。振戦や痙攣が著明であれば、ジアゼパム又は超短時間作用型バルビツール酸製剤（チオペンタールナトリウム等）を投与する。心機能抑制に対しては、カテコールアミン等の昇圧剤を投与する。心停止を来した場合には直ちに心マッサージを開始する。

14. 適用上の注意

適用上の注意

使用目的 眼科（点眼）用として使用しないこと。

15. その他の注意

その他の注意

- (1) ポルフィリン症の患者に投与した場合、急性腹症、四肢麻痺、意識障害等の急性症状を誘発するおそれがある。
- (2) 因果関係は明らかでないが、外国において術後に本剤を**関節内**（特に肩関節）に**持続投与**された患者で軟骨融解を発現したとの報告がある。

16. その他

【取扱い上の注意】

1. 本剤は使用前にゴム栓をアルコール綿等で清拭すること。
2. 本剤は金属を侵す性質があるので、長時間金属器具（カニューレ、注射針等）に接触させないことが望ましい。なお、金属器具を使用した場合は、使用后十分に水洗すること。

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験 (「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験⁶⁾

LD₅₀ (mg/kg)

投与法 動物種	経口	腹腔内	静注
マウス	292	105	19.5

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：リドカイン注「NM」0.5%・1%・2%；劇薬、処方せん医薬品^{注)}

有効成分：リドカイン；劇薬

注) 注意—医師等の処方せんにより使用すること

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：5年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

該当しない

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包 装

20mL×5バイアル、100mL×1バイアル

7. 容器の材質

無色透明のソーダガラス瓶

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：キシロカイン注射液 0.5%・1%・2%

同 効 薬：メピバカイン塩酸塩、ブピバカイン塩酸塩水和物、ロピバカイン塩酸塩水和物、レボブピバカイン塩酸塩

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
リドカイン注「NM」0.5%	1984年10月11日*	15900AMZ00961000
リドカイン注「NM」1%	1984年10月11日*	15900AMZ00962000
リドカイン注「NM」2%	1984年10月11日*	15900AMZ00963000

*：局方品承認制移行による（旧許可年月日：1971年12月16日）

11. 薬価基準収載年月日

1971年12月16日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果公表年月日：1974年11月20日（薬発第1046号）

薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しない。

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投与期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

製品名	HOT(9桁) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算 コード
リドカイン注「NM」0.5%	101661110	1214401A1019	641210094
リドカイン注「NM」1%	101663510	1214401A3011	641210100
リドカイン注「NM」2%	101664209	1214401A4018	641210103

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) 第十六改正日本薬局方解説書、廣川書店、C-5182
- 2) JPDI、日本薬局方 医薬品情報、日本薬剤師研修センター編、じほう、2006、p1980
- 3) ナガセ医薬品(株)：リドカイン注「NM」0.5%の安定性試験 (NM0254)
- 4) ナガセ医薬品(株)：リドカイン注「NM」1%の安定性試験 (NM0255)
- 5) ナガセ医薬品(株)：リドカイン注「NM」2%の安定性試験 (NM0256)
- 6) Merck Index, 14th ed. ,Merck & Co., Inc., 2006, p950

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報

リドカイン製剤の妊婦への投与に関する FDA のカテゴリー分類は以下のとおりである。

FDA: Pregnancy Category B

<参考>分類の概要

FDA: Pregnancy Category

B: NO EVIDENCE OF RISK IN HUMANS

Adequate, well-controlled studies in pregnant woman have not shown increased risk of fetal abnormalities despite adverse findings in animals, or, in the absence of adequate human studies, animal studies show no fetal risk. The chance of fetal harm is remote, but remains a possibility.

なお、本剤の本邦における「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりである。

【使用上の注意】「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」

項目	麻酔方法	硬膜外麻酔	伝達・浸潤麻酔	表面麻酔
(1)妊婦等 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]		○	○	○
(2)妊産婦 1)妊娠後期の患者には、投与量の減量を考慮するとともに、患者の全身状態の観察を十分に行うなど慎重に投与すること。[妊娠末期は、仰臥位性低血圧を起こしやすく、麻酔範囲が広がりやすい。麻酔中はさらに増悪することがある。]（「慎重投与」の項参照）		○	—	—
2) 頸動脈ブロックにより胎児の徐脈を起こすおそれがある。		—	○*	—

*:伝達麻酔

XIII. 備 考

1. その他の関連資料

(1) JAN コード

製品名	JAN コード	
	20mL×5 バイアル	100mL×1 バイアル
リドカイン注「NM」0.5%	4987114099105	4987114099006
リドカイン注「NM」1%	4987114099303	4987114099204
リドカイン注「NM」2%	4987114099501	4987114099402

文献請求先・製品情報お問い合わせ先

ファイザー株式会社 製品情報センター
〒151-8589 東京都渋谷区代々木 3-22-7
学術情報ダイヤル 0120-664-467
FAX 03-3379-3053

製造販売元

ナガセ医薬品株式会社
〒664-0898 兵庫県伊丹市千僧 4-323

販売

ファイザー株式会社
〒151-8589 東京都渋谷区代々木 3-22-7

提携

マイラン製薬株式会社
〒541-0053 大阪市中央区本町 2丁目 6番 8号