

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 2013 に準拠して作成

抗不整脈剤

リドカイン静注液2% 「タカタ」

日本薬局方 リドカイン注射液

LIDOCAINE

剤形	水性注射剤
製剤の規制区分	劇薬、処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1管（5mL）中 リドカイン塩酸塩 100mg
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 薬価基準収載年月日 発売年月日	製造販売承認年月日：2018年7月9日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2018年12月14日（販売名変更による） 発売年月日：1999年7月9日
開発・製造販売（輸入） ・提携販売会社名	製造販売元：高田製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	高田製薬株式会社 学術部 TEL: 0120-989-813 FAX: 048-816-4183 医療関係者向けホームページ https://www.takata-seiyaku.co.jp

本 IF は 2018 年 7 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、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構ホームページ <https://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

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 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、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 IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

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 版、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]

- ①IF 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。
- ②IF 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 2013」(以下、「IF 記載要領 2013」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 2013」は、平成 25 年 10 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 2013」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変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、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ある。

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、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。

(2013 年4月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	13
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	13
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	13
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	13
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	13
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	13
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	13
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	13
5. 化学名（命名法）	2	8. 副作用	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	9. 高齢者への投与	15
7. CAS 登録番号	2	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	15
III. 有効成分に関する項目	3	11. 小児等への投与	16
1. 物理化学的性質	3	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	13. 過量投与	16
3. 有効成分の確認試験法	3	14. 適用上の注意	16
4. 有効成分の定量法	3	15. その他の注意	16
IV. 製剤に関する項目	4	16. その他	16
1. 剤形	4	IX. 非臨床試験に関する項目	17
2. 製剤の組成	4	1. 薬理試験	17
3. 注射剤の調製法	4	2. 毒性試験	17
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	X. 管理的事項に関する項目	18
5. 製剤の各種条件下における安定性	5	1. 規制区分	18
6. 溶解後の安定性	5	2. 有効期間又は使用期限	18
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	3. 貯法・保存条件	18
8. 生物学的試験法	5	4. 薬剤取扱い上の注意点	18
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	5	5. 承認条件等	18
10. 製剤中の有効成分の定量法	5	6. 包装	18
11. 力価	5	7. 容器の材質	18
12. 混入する可能性のある夾雑物	5	8. 同一成分・同効薬	18
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6	9. 国際誕生年月日	18
14. その他	6	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	19
V. 治療に関する項目	7	11. 薬価基準収載年月日	19
1. 効能又は効果	7	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	19
2. 用法及び用量	7	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	19
3. 臨床成績	7	14. 再審査期間	19
VI. 薬効薬理に関する項目	9	15. 投与期間制限医薬品に関する情報	19
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	9	16. 各種コード	19
2. 薬理作用	9	17. 保険給付上の注意	19
VII. 薬物動態に関する項目	10	XI. 文献	20
1. 血中濃度の推移・測定法	10	1. 引用文献	20
2. 薬物速度論的パラメータ	10	2. その他の参考文献	20
3. 吸収	11	XII. 参考資料	21
4. 分布	11	1. 主な外国での発売状況	21
5. 代謝	11	2. 海外における臨床支援情報	21
6. 排泄	12	XIII 備考	21
7. トランスポーターに関する情報	12	その他の関連資料	21
8. 透析等による除去率	12		

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、植物性塩基 gramine の合成異性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試験を経て、1948年、スウェーデンにてその製品を発売するに至った。

一方、心筋梗塞や心臓手術にみられる種々の不整脈の治療にもリドカインの静脈内投与が行われ、有効性が確認されている。

現在、抗不整脈用剤として市販されているリドカイン製剤は、そのままボラス静注に使用できる静注用2%5mL及び緊急時に素早く対応できる点滴用キット1%200mLがある。

本剤は静注用2%5mLで当社が1999年1月に製造販売承認を得て、同年7月より発売している。

なお、医療事故防止対策に基づき、販売名をオリベス静注用2%からリドカイン静注液2%「タカタ」に変更し、2018年7月に承認を得た。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) リドカインは、Class I (Vaughan Williams の分類)に属し、膜安定化作用を有する。活動電位の急激な脱分極は、細胞膜がナトリウムチャネルの通過性を急激に増大させ、ナトリウムイオンを細胞外から細胞内に取り込むことによって生じるが、このナトリウムチャネルの通りを阻害するので、活動電位の脱分極速度(立ち上がり速度)は抑制される。
- (2) リドカインは、主としてプルキンエ線維と心室筋に作用し、洞結節の自動能を抑制、心房での軽度の不応期の延長、刺激閾値の上昇、ヒス・プルキンエ系で自動能の抑制、伝導時間の延長、心室における興奮性の低下、心室内伝導時間の遅延、自動能の抑制などである。
- (3) 心室性期外収縮、心室性発作性頻拍、急性心筋梗塞時及び手術に伴う心室性不整脈の予防、上室性期外収縮、上室性発作性頻拍などに有効であり、特に心室性期外収縮と心室性発作性頻拍に有効である。
- (4) 重大な副作用として、刺激伝導系抑制、ショック、意識障害、振戦、痙攣、悪性高熱があらわれることがある。(「VIII. 8. (2) 重大な副作用と初期症状」参照)

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

リドカイン静注液2%「タカタ」

(2) 洋名

Lidocaine Injection 2%”TAKATA”

(3) 名称の由来

一般名による

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

リドカイン(JAN)

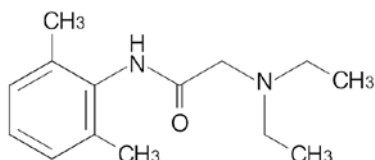
(2) 洋名（命名法）

Lidocaine(JAN、INN)

(3) ステム

不明

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

特になし

7. CAS 登録番号

リドカイン: 137-58-6

リドカイン塩酸塩: 6108-05-0

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

メタノール又はエタノール(95)に極めて溶けやすく、酢酸(100)又はジエチルエーテルに溶けやすく、水にほとんど溶けない。

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

該当資料なし

(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

日局「リドカイン」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)

4. 有効成分の定量法

日局「リドカイン」の定量法による。

0.1mol/L 過塩素酸による滴定

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

剤形の区別:水性注射剤

規格:1管(5mL)中 リドカイン塩酸塩 100mg

性状:無色澄明の水性注射液

(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(生理食塩液に対する比):約 1

(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

1管(5mL)中 リドカイン塩酸塩 100mg

(2) 添加物

塩化ナトリウム、水酸化ナトリウム

(3) 電解質の濃度

1管中に Na を約 9.1mg (0.4mEq)を含有する。

(4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

(5) その他

該当しない

3. 注射剤の調製法

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

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温、36ヵ月)の結果、3年間安定であることが確認された。¹⁾

(1)長期保存試験(室温、36ヵ月)

	開始時	12ヵ月後	24ヵ月後	36ヵ月後
性状	無色澄明の液			
確認試験	適合	-	-	適合
pH	6.08-6.14	6.00-6.08	6.05-6.08	6.05-6.08
定量:リドカイン(%)	98.9-99.8	98.4-98.6	99.1-99.5	97.8-98.8
残存率(%)	100	98.8-99.5	99.4-100.6	98.5-99.9

(2)加速試験(40±1℃)¹⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、6ヵ月)の結果、3年間安定であることが推測された。

	開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状	無色澄明			
pH	6.11-6.28	6.12-6.29	6.13-6.28	6.04-6.19
浸透圧比	1.00-1.01	1.00-1.01	1.00	1.00-1.01
残存率(%)	100	99.6-100.1	100.1-100.9	100.8-102.0

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

該当資料なし

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

日局「リドカイン注射液」の確認試験による。

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「リドカイン注射液」の定量法による。

液体クロマトグラフィー

11. 力価

本剤は力価表示に該当しない。

12. 混入する可能性のある夾雑物²⁾

2,6-Dimethylaniline、2,6-Dimethylmonochloroacetanilide

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

期外収縮(心室性)、発作性頻拍(心室性)、急性心筋梗塞時及び手術に伴う心室性不整脈の予防

期外収縮(上室性)、発作性頻拍(上室性)

2. 用法及び用量

静脈内 1 回投与法

リドカイン塩酸塩として、通常、成人 1 回 50～100mg(1～2mg/kg) (2.5～5mL)を、1～2 分間で、緩徐に静脈内注射する。

効果が認められない場合には、5 分後に同量を投与する。また、効果の持続を期待する時には 10～20 分間隔で同量を追加投与してもさしつかえないが、1 時間内の基準最高投与量は 300mg (15mL)とする。

本剤の静脈内注射の効果は、通常 10～20 分で消失する。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

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

ジソピラミド、プロカインアミド、プロパフェノン

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序²⁾

リドカインは、心筋細胞のNa⁺チャネル機能を抑制し(一般的には、膜安定化作用と呼ばれる)、活動電位の最大立上り速度の低下、興奮伝導の遅延をもたらし、異所性自動能を抑制するので抗不整脈薬として用いられている。

(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

該当資料なし

(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

該当資料なし

(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) 解析方法

該当しない

(2) 吸収速度定数

該当しない

(3) バイオアベイラビリティ

該当しない

(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

該当しない

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

(参考:海外データ)³⁾

肝臓のミクロソームに局在する酸化酵素類により脱メチル化を受けて、モノエチルグリシンキシリジドとグリシンキシリジドに代謝される(いずれも活性代謝物)。更にモノエチルグリシンキシリジドはモノエチルグリシンとキシリジドに分解される。このキシリジドは更に代謝を受け 4-ヒドロキシ-2,6-ジメチルアニリンとなって尿中に排出される。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種⁴⁾

リドカインは、主として肝代謝酵素 CYP1A2 及び CYP3A4 で代謝される。

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当しない

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

「5. (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当しない

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路⁵⁾

肝臓及び腎臓から排出される。

(2) 排泄率⁵⁾

主に肝臓から70～95%が排泄される。また腎臓からの排泄率は20%以下である。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率⁶⁾

本剤は非透析性である。

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

添付文書に記載なし

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）】

1. 重篤な刺激伝導障害（完全房室ブロック等）のある患者 [心停止を起こすおそれがある。]
2. 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

- (1) 著明な洞性徐脈、刺激伝導障害のある患者 [症状を悪化させるおそれがある。]
- (2) 循環血液量が減少している患者、ショック状態にある患者、あるいは心不全のある患者 [心停止を起こすおそれがある。]
- (3) 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。]
- (4) 高齢者 [「VIII. 9. 高齢者への投与」の項参照]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

過量投与を避けるため、できるだけ頻回の血圧測定及び心電図の連続監視下で投与すること。

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

添付文書に記載なし

(2) 併用注意とその理由

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
シメチジン	リドカインの血中濃度が上昇したとの報告がある。	シメチジンの肝代謝酵素阻害作用により、リドカインの代謝が抑制されると考えられる。
メプロロール、 プロプラノロール、 ナドロール	リドカインの血中濃度が上昇することがある。	これらの薬剤の心拍出量、肝血流量減少作用により、リドカインの代謝が遅延すると考えられる。
リトナビル、 ホスアンプレナビルカルシウム水和物、 アタザナビル硫酸塩	リドカインの AUC が上昇することが予想される。	肝代謝酵素に対する競合的阻害作用により、リドカインの代謝が遅延すると考えられる。
セイヨウオトギリソウ (St. John's Wort, セント・ジョーンズ・ワート) 含有食品	リドカインの代謝が促進され血中濃度が低下するおそれがあるので、リドカイン投与時はセイヨウオトギリソウ含有食品を摂取しないよう注意すること。	肝代謝酵素誘導作用により、リドカインの代謝が促進され、血中濃度が低下すると考えられる。
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。	併用により血中濃度が上昇し、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）

- 1) **刺激伝導系抑制、ショック** PQ 間隔の延長又は QRS 幅増大等の刺激伝導系抑制、あるいは徐脈、血圧低下、ショック、意識障害等を生じ、心停止を来すことがある。また、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。[「Ⅷ. 13. 過量投与」の項参照]

3) **悪性高熱** 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

種類	頻度	頻度不明
中枢神経 ^{注)}		せん妄、めまい、眠気、不安、多幸感、しびれ感等
消化器 ^{注)}		嘔吐等
過敏症		蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等

注) 症状があらわれた場合には、投与を中止又は減量し、必要に応じて適切な処置を行うこと。(太字)

(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

「Ⅷ. 2. 禁忌内容とその理由」に以下の記載あり。

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

2. 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

「Ⅷ. 8. (2) 重大な副作用と初期症状」に以下の記載あり。

1) **刺激伝導系抑制、ショック** PQ 間隔の延長又は QRS 幅増大等の刺激伝導系抑制、あるいは徐脈、血圧低下、ショック、意識障害等を生じ、心停止を来すことがある。また、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。

9. 高齢者への投与

本剤は主として肝臓で代謝されるが、高齢者では肝機能が低下していることが多いため血中濃度が高くなりすぎ、振戦、痙攣等の中毒症状を起こすおそれがある。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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。]

11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児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

添付文書に記載なし

13. 過量投与

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

- (1) **投与経路：**静脈内1回投与のみに使用すること。
- (2) **投与时：**高度の洞性徐脈、あるいは房室ブロック等の徐拍性不整脈とともに心室性不整脈(期外収縮、頻拍)が認められる場合には、人工ペースメーカーによって心拍数を増加させ、本剤を用いること。
- (3) **調製時：**本剤中のリドカインは塩酸塩であり、アルカリ性注射液(炭酸水素ナトリウム液等)との配合により、リドカインが析出するので配合しないこと。
- (4) **アンプルカット時：**本剤はワンポイントカットアンプルであるが、アンプルのカット部分をエタノール綿等で清拭してからカットすることが望ましい。

15. その他の注意

- (1) 本剤の投与により、新生児にメヘモグロビン血症があらわれたとの報告がある。
- (2) 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。

16. その他

該当資料なし

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

急性毒性⁷⁾

表Ⅸ-1 急性毒性試験

(LD₅₀, mg/kg)

動物種 \ 投与経路	静脈内	皮下
マウス	25 ~ 48	270 ~ 390
ラット	約 25	—

(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： リドカイン静注液 2%「タカタ」 劇薬、処方箋医薬品^{注)}

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分： リドカイン塩酸塩 劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：外箱等に表示(3年)

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

該当資料なし

(3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

5 mL×10 管(ガラスアンプル)

7. 容器の材質

無色ガラスアンプル

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：静注用キシロカイン 2%(アスペンジャパン株式会社)

同 効 薬：プロカインアミド塩酸塩、ジソピラミドリン酸塩

9. 国際誕生年月日

1949年11月23日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

承認年月日	2018年7月9日
承認番号	23000AMX00541

注) オリベス静注用2%販売名変更に伴う製造販売承認年月日:1999年1月28日

11. 薬価基準収載年月日

オリベス静注液2%(旧販売名):1999年7月9日

リドカイン点滴静注液1%「タカタ」(新販売名):2018年12月14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

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投与期間制限医薬品に関する情報

該当しない

16. 各種コード

販売名	HOTコード(9桁)	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
リドカイン静注液2% 「タカタ」	101665903	1214401A5014	1214401A5049

17. 保険給付上の注意

特になし

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 高田製薬(株)社内資料(安定性)
- 2) 日本薬局方解説書編集委員会編:第十五改正日本薬局方解説書(廣川書店):C-4618, 2006
- 3) Arthur, G. R.:Handbook of Experimental Pharmacolgy, V.81, pp. 165-186 , Springer Verlag, Berlin (1987)
- 4) Wang, J-S. et al.:Drug. Metab. Dispos., 28 (8), 959 (2000)
- 5) 杉 薫:Med. Pract., 9 (7), 1193 (1992)
- 6) 林 正博ほか:透析患者への薬剤, pp. 30-31, 日本メディカルセンター, 東京 (1995)
- 7) Newton, D. W. et al.:Drug. Intell. Clin.Pharm., 12, 546 (1978)

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

販売名	国名
Xylocaine	アメリカ、スウェーデン
Xylocard	イギリス、オーストラリア、カナダ、スイス
Xylocitin	ドイツ
Rapidocaine	スイス

2. 海外における臨床支援情報

XIII 備考

1. その他の関連資料

MEMO

MEMO

製造販売

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1