

## 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

リドカイン注射液

# リドカイン静注用 2% シリンジ「テルモ」

Lidocaine for Intravenous Injection 2%

剤形	注射剤
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	本文IV－2 製剤の組成参照
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：2005年2月4日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2005年6月10日（販売名変更による） 発売年月日：2000年12月8日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：テルモ株式会社
医療情報担当者の 連絡先	TEL. FAX.
問い合わせ窓口	テルモ・コールセンター ☎ 0120-12-8195（9：00～17：45 土・日・祝日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.terumo.co.jp/medical/login.html">http://www.terumo.co.jp/medical/login.html</a>

本 IF は 2009 年 8 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 ー 日本病院薬剤師会 ー

## 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。
- ②IFの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。

(2008年9月)

# 目 次

## I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯……………1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 ……2

## II. 名称に関する項目

1. 販売名……………3
2. 一般名……………3
3. 構造式又は示性式……………3
4. 分子式及び分子量……………3
5. 化学名（命名法）……………3
6. 慣用名，別名，略号，記号番号 ……3
7. CAS 登録番号……………3

## III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質……………4
2. 有効成分の各種条件下における安定性……………4
3. 有効成分の確認試験法……………4
4. 有効成分の定量法……………4

## IV. 製剤に関する項目

1. 剤形……………5
2. 製剤の組成……………5
3. 注射剤の調製法……………5
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
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）……………6
8. 生物学的試験法……………6
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 ……6
10. 製剤中の有効成分の定量法……………6
11. 力価……………6
12. 混入する可能性のある夾雑物 ……6
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報……………6
14. その他……………6

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果……………7
2. 用法及び用量……………7
3. 臨床成績……………8

## VI. 薬物薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群……………9
2. 薬理作用……………9

## VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法……………10
2. 薬物速度論的パラメータ……………10
3. 吸収……………11
4. 分布……………11
5. 代謝……………12
6. 排泄……………12
7. 透析等による除去率……………12

## 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……………13
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌含む）……………13
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由……………13
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由……………13
5. 慎重投与内容とその理由……………13
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法……………13
7. 相互作用……………14
8. 副作用……………15
9. 高齢者への投与……………16
10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 ……16
11. 小児等への投与……………16
12. 臨床検査結果に及ぼす影響……………16
13. 過量投与……………17

# 目 次

---

- 14. 適用上の注意 ……………17
- 15. その他の注意 ……………17
- 16. その他 ……………17

## IX. 非臨床試験に関する項目

- 1. 薬理試験 ……………18
- 2. 毒性試験 ……………18

## X. 管理的事項に関する項目

- 1. 規制区分 ……………19
- 2. 有効期間又は使用期限 ……………19
- 3. 貯法・保存条件 ……………19
- 4. 薬剤取扱い上の注意点 ……………19
- 5. 承認条件等 ……………19
- 6. 包装 ……………19
- 7. 容器の材質 ……………19
- 8. 同一成分・同効薬 ……………19
- 9. 国際誕生年月日 ……………19
- 10. 製造販売承認年月日及び承認番号 20
- 11. 薬価基準収載年月日 ……………20
- 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 20
- 13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日  
及びその内容 ……………20
- 14. 再審査期間 ……………20
- 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 20
- 16. 各種コード ……………20
- 17. 保険給付上の注意 ……………20

## X I . 文献

- 1. 引用文献 ……………21
- 2. その他の参考文献 ……………21

## X II . 参考資料

- 1. 主な外国での発売状況 ……………22
- 2. 海外における臨床支援情報 ……………22

## X III . 備考

- その他の関連資料 ……………23

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

リドカイン静注用 2%シリンジ「テルモ」は、必須の救急薬として心室性不整脈の治療等に用いられるリドカイン注射液を予めシリンジに充填したプレフィルドシリンジ（以下、PFS）製剤である。

救急患者の救命率をあげるためには、カーラやドリンカーの救命曲線に示されるように、救急処置をいかに早く開始できるかがポイントであり、救急処置開始時間を短縮するための手段として、ドクターヘリ、ドクターカー等が活用されている。心肺停止に近い状態の患者の場合、一般の救急車で来院した場合に比較してドクターカーによる救命率は3～4倍になっており、その有用性が証明されている<sup>1)</sup>。その理由として医師が搭乗しており、緊急性の高い薬剤や機器を積載し、現場もしくは車中での患者への投薬が可能であり、より早い処置を施すことが可能であるためとされている。

しかし、救命救急に用いる薬剤は、

- ①アンプル或いはバイアル製剤が主であり、投薬準備にはアンプル或いはバイアルの開封、シリンジによる薬剤の吸引など煩雑な操作を要する。
- ②慌ただしい救急現場や、移動中の車内やヘリコプター機内でのアンプルから薬液を吸い取る操作は、時間を要するばかりでなく、針刺し事故やアンプル片によるケガの可能性が増大する。
- ③環境の悪い災害現場などの救急処置については、異物の混入や環境に存在する細菌の混入等に不安を抱く医療関係者もいる。
- ④薬剤取り違いの問題点も指摘されている。

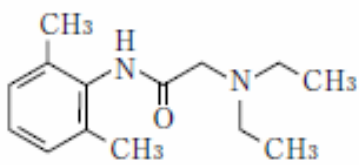
これらの医療現場における各種の問題に対応するため、欧米では迅速性・安全性を特徴とする PFS 製剤が広く使われており、日本でも救急薬の PFS 製剤の要望が強かったため、開発を行い、後発医薬品として 2000 年 9 月に承認を取得、同年 12 月静注用 2%リドクイックシリンジという名称で上市した。2005 年、医療事故防止のため、販売名をリドカイン静注用 2%シリンジ「テルモ」と変更し、現在に至っている。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

本剤は、リドカイン注射液を予めシリンジに充填した静脈内 1 回投与法専用の PFS 製剤であり、以下の特徴がある。

- ①投薬準備が容易かつ速やかに行える。
- ②災害医療現場のような汚染環境下においても、異物混入や細菌汚染のリスクが減少する。
- ③慌ただしい救急医療現場においても、針刺しやアンプルカットによるケガのリスクが減少する。
- ④薬剤とシリンジを一体化したため、携帯性に優れている。
- ⑤はじめから薬剤名がシリンジに記載されているため、薬剤取り違えの防止に寄与する。
- ⑥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。
  - ・重大な副作用  
刺激伝導系抑制，ショック，意識障害，振戦，痙攣，悪性高熱

## Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名	
(1) 和名	リドカイン静注用 2%シリンジ「テルモ」
(2) 洋名	Lidocaine for Intravenous Injection 2%
(3) 名称の由来	一般名 + 剤形 + 含量 (濃度)
2. 一般名	
(1) 和名 (命名法)	リドカイン (JAN) [日局]
(2) 洋名 (命名法)	Lidocaine (JAN, INN)
(3) ステム	局所麻酔剤 -caine
3. 構造式又は示性式	
4. 分子式及び分子量	分子式 : C <sub>14</sub> H <sub>22</sub> N <sub>2</sub> O 分子量 : 234.34
5. 化学名 (命名法)	2-Diethylamino- <i>N</i> -(2,6-dimethylphenyl) acetamide (IUPAC 命名法による)
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	吸湿しない <sup>2)</sup>
(4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点	融点 : 66～69°C <sup>3)</sup>
(5) 酸塩基解離定数	pKa : 7.9 (25°C) <sup>2)</sup>
(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	室温褐色瓶密栓で 60 ヶ月保存するとき、外観、含量とも変化を認めない <sup>2)</sup> 。
3. 有効成分の確認試験法	日局「リドカイン」による。
4. 有効成分の定量法	日局「リドカイン」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

剤形の区別：溶液  
規格：「2.製剤の組成」参照  
性状：無色澄明の液である。

(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

		1シリンジ5mL中
有効成分	リドカイン (リドカイン塩酸塩として)	86.5 mg (100 mg)
添加物	塩化ナトリウム (等張化剤)	27.5 mg
	希塩酸 (pH 調節剤)	適量
	水酸化ナトリウム (pH 調節剤)	適量

(2) 添加物

(3) 電解質の濃度

該当資料なし

(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. 注射液の調製法

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

保存条件	保存期間	試験結果
室温, ブリスタ 一包装未開封	37 カ月	全ての試験項目が規格内であった <sup>4)</sup>

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)

pH 変動試験

規格 pH	試料 pH	0.1mol/L HCl (A)mL ----- 0.1mol/L NaOH(B)mL	最終 pH 又は 変化点 pH	移動 指数	変化 所見
5.0 ~ 7.0	5.59	(A) 10.0	1.24	4.35	—
	5.59	(B) 1.51	7.67	2.08	白濁

希釈試験 (変化点pH7.67の液につき, 蒸留水500mLで希釈し, 3時間室温にて観察)

項目	希釈直後	30分	2時間	3時間
外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
pH	7.58	7.74	7.75	7.78

配合変化試験

配合薬剤	項目	配合前	試験開始時	24時間後
ダントリウム静注用 20mg [アステラス]	外観	無色澄明	黄濁	黄色, 沈殿+++
	pH	5.59	7.21	7.28
メイロン静注 7% (20mL) [大塚製薬工場]	外観	無色澄明	無色澄明	無色, 結晶+
	pH	5.59	7.97	8.33

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」による.

10. 製剤中の有効成分の定  
量法

日局「リドカイン注射液」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）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 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。

〈参考〉

#### 操作方法

<p>①</p> 	<p>キャップを矢印の方向にまわしてはずす。</p>
<p>②</p> 	<p>シリンジ先端部に直接手が触れないように注意し，注射針等と接続して使用する。</p>

注意：注射針等の使用にあたり，針刺しに留意すること。

- 
3. 臨床成績
- (1) 臨床データパッケージ
  - (2) 臨床効果
  - (3) 臨床薬理試験：忍容性試験
  - (4) 探索的試験：用量反応探索試験
  - (5) 検証的試験
    - 1) 無作為化並行用量反応試験
    - 2) 比較試験
    - 3) 安全性試験
    - 4) 患者・病態別試験
  - (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）
    - 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

該当資料なし

## 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	プロカインアミド塩酸塩
2. 薬理作用	
(1) 作用部位・作用機序	リドカインは、心筋細胞のNa <sup>+</sup> 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）、活動電位の最大立ち上がり速度の低下、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る <sup>3)</sup> 。
(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	作用発現時間：2分以内（25～100mg単回静注） <sup>2)</sup> 作用持続時間：10～20分以内 <sup>2)</sup>

## 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	リドカインの有効血中濃度域は $1.5\sim 6.0\ \mu\text{g/mL}$ であるとされているが、遊離型のリドカインが有効であるので、有効濃度に個人的なばらつきが見られるのは、リドカインが結合しやすい血中 $\alpha_1$ -AG量による。とくに心筋梗塞症の患者では、 $\alpha_1$ -AGの血中濃度が上昇している場合があるので、見かけ上の血中総リドカイン濃度は有効範囲内にあっても、遊離型リドカインが有効量に達していない場合がある <sup>5)</sup> 。
(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	$6\sim 10\ \mu\text{g/mL}$ 以上 <sup>2)</sup>
(5) 食事・併用薬の影響	「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 7. 相互作用」の項を参照のこと。
(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	25, 75 及び 100mgを静注時の消失半減期は 1.8～2.1 時間である〔健康成人, 外国データ〕 <sup>2)</sup> 。
(5) クリアランス	$18.1\pm 1.9\sim 22.5\pm 1.9\text{mL/min/kg}$ 〔平均±S.E., 健康成人男性, 25, 75 及び 100mg静注, 外国データ, GLC法〕 <sup>6)</sup> 。
(6) 分布容積	$3.21\pm 0.45\sim 3.92\pm 0.41\text{L/kg}$ 〔平均±S.E., 健康成人男性, 25, 75 及び 100mg静注, 外国データ, GLC法〕 <sup>6)</sup> 。
(7) 血漿蛋白結合率	治療域濃度での結合率は約 70%である <sup>2)</sup> 。

<p>3. 吸収</p>	<p>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<sup>2)</sup>．</p> <p>注) 本剤の承認されている効能・効果は，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）であり，静脈内に投与する．</p>
<p>4. 分布</p> <p>(1) 血液－脳関門通過性</p> <p>(2) 血液－胎盤関門通過性</p> <p>(3) 乳汁への移行性</p> <p>(4) 髄液への移行性</p> <p>(5) その他の組織への移行性</p>	<p>〈参考〉</p> <p>リドカインを 3.8mg/kg/min で定速静注すると，血液－脳関門を通過し，脳静脈，脳脊髄液中リドカイン濃度は動脈血中濃度のピーク（96 μg/mL）の 2～4 分後にピーク（29 及び 16 μg/mL）に達し，三者の濃度は以後，同様の速度で減少する〔イヌでのデータ〕<sup>6)</sup>．</p> <p>〈参考〉</p> <p>妊婦にリドカイン塩酸塩を 50mg 硬膜外投与したとき，臍帯静脈血中濃度と母体血漿中濃度の比は 0.5～0.7 で，胎盤を通過する<sup>2)</sup>．</p> <p>注) 本剤の承認されている効能・効果は，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）であり，静脈内に投与する．</p> <p>〈参考〉</p> <p>授乳婦にリドカイン塩酸塩を 50mg 硬膜外投与し，乳汁中への移行を調査したところ，乳汁中濃度は血清中濃度の約 30% であった．乳汁中で投与後 30 分で最大となり，60 分後に急速に低下した<sup>2)</sup>．</p> <p>注) 本剤の承認されている効能・効果は，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）であり，静脈内に投与する．</p> <p>〈参考〉</p> <p>リドカインを 20mg/kg 静注 30 分後の髄液中濃度は血中濃度の 53.2±7.3% であった〔イヌでのデータ〕<sup>2)</sup>．</p> <p>〈参考〉</p> <p>リドカインを 2mg/kg 静注後，速やかに血中から消失し，肺，脳，腎，脾，及び腸管に 70% が移行し，臓器からの消失も速やかであった〔ラットでのデータ〕<sup>2)</sup>．</p>



<p>5. 代謝</p> <p>(1) 代謝部位及び代謝経路</p> <p>(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450等)の分子種</p> <p>(3) 初回通過効果の有無及びその割合</p> <p>(4) 代謝物の活性の有無及び比率</p> <p>(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ</p>	<p>肝臓で、主としてCYP1A2及びCYP3A4により、<i>N</i>-脱エチル化、芳香核の水酸化や酸アミドの解裂等の経路で急速に代謝される。代謝物として、monoethylglycinexylidide (MEGX), glycinexylidide (GX), 2,6-xylidine, 4-hydroxy-2,6-xylidine等が確認されている<sup>2)</sup>。</p> <p>主として肝代謝酵素 CYP1A2 及び CYP3A4 で代謝される。</p> <p>肝臓での初回通過効果は約 70%である<sup>2)</sup>。</p> <p>Monoethylglycinexylidide (MEGX) と glycinexylidide (GX) は、リドカインとほぼ同等かやや弱い薬理的/毒性学的利用を有している<sup>2)</sup>。</p> <p>〈参考〉 健康成人に 200mg を筋注後のリドカイン及び monoethylglycinexylidide (MEGX) のC<sub>max</sub>及び消失半減期は、それぞれ 1.25, 0.18 μg/mL及び1.7, 4.6時間である〔外国データ〕<sup>2)</sup>。</p> <p>注) 本剤の承認されている効能・効果は、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) であり, 静脈内に投与する。</p>
<p>6. 排泄</p> <p>(1) 排泄部位及び経路</p> <p>(2) 排泄率</p> <p>(3) 排泄速度</p>	<p>主として尿中排泄<sup>2)</sup></p> <p>〈参考〉 <sup>3</sup>H標識リドカイン塩酸塩250mgを外国人健康人に経口投与したとき, 24時間後までの尿中放射能排泄率は投与量の83.8%, 未変化体は投与量の2.8%であった<sup>6)</sup>。</p> <p>注) 本剤の承認されている効能・効果は、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) であり, 静脈内に投与する。</p> <p>該当資料なし</p>
<p>7. 透析等による除去率</p>	<p>血液透析：血中濃度にほとんど影響ない<sup>2)</sup>。</p>

## 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)	<b>【禁忌】（次の患者には投与しないこと）</b> (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) 重症の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（「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

(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

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

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。
メトプロロール 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 アンプレナビル 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

### (2) 重大な副作用と初期症状

### (3) その他の副作用

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ため、副作用発現頻度については不明である。

#### (1) 重大な副作用

##### 1) 刺激伝導系抑制, ショック

ときに 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, 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) 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水和物の静注, 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。

#### (2) その他の副作用

	頻度不明
中枢神経 <sup>※)</sup>	せん妄 眠気 不安 興奮 霧視 多幸福感 しびれ感 眩暈等
消化器 <sup>※)</sup>	嘔吐等
過敏症	蕁麻疹等の皮膚症状 浮腫等

※) このような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。

(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	<div style="border: 1px solid red; padding: 5px;"> <p><b>【禁忌】(次の患者には投与しないこと)</b>  (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</p> </div>
9. 高齢者への投与	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p>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.</p> </div>
10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p>(1) 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.]</p> <p>(2) 授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが, やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること.  [授乳中の投与に関する安全性は確立していない.]</p> </div>
11. 小児等への投与	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p>小児等に対する安全性は確立していない.</p> </div>
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	該当資料なし

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) 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.

(3) 投与时

1) 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.

2) ブリスター包装開封後は速やかに使用すること.

15. その他の注意

(1) 本剤の投与により, 新生児にメト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

該当しない

## Ⅷ. 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

LD<sub>50</sub> (mg/kg) <sup>2)</sup>

投与経路	マウス	ラット	ウサギ
静脈内	25~48	約 25	25.6

(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：劇薬，処方せん医薬品 <sup>注)</sup> 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：3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	<ul style="list-style-type: none"> <li>● 本剤はシリンジポンプでは使用しないこと。</li> <li>● ブリスター包装内は滅菌しているため，使用時まで開封しないこと。</li> <li>● ブリスター包装は開封口から静かに開けること。</li> <li>● ブリスター包装から取り出す際，押子を持って無理に引き出さないこと。ガasketが変形し，薬液が漏出するおそれがある。</li> <li>● シリンジが破損するおそれがあるため，強い衝撃を避けること。</li> <li>● シリンジに破損等の異常が認められるときは使用しないこと。</li> <li>● シリンジ先端部のシールがはがれているときは使用しないこと。</li> <li>● 内容液が漏れている場合や，内容液に混濁や浮遊物等の異常が認められるときは使用しないこと。</li> <li>● キャップを外した後，シリンジ先端部には触れないこと。</li> <li>● 開封後の使用は1回限りとし，使用後の残液は容器とともに速やかに廃棄すること。</li> <li>● シリンジの再滅菌・再使用はしないこと。</li> <li>● 注射針等は針刺しや感染防止に留意し，安全な方法で廃棄すること。</li> </ul>
(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	5mL×10本
7. 容器の材質	シリンジ：ポリプロピレン ガasket：熱可塑性エラストマー
8. 同一成分・同効薬	静注用キシロカイン2%（アストラゼネカ） オリベス静注用2%（高田製薬）
9. 国際誕生年月日	不明



10. 製造販売承認年月日及び承認番号	製造販売承認年月日：2005年2月4日 承認番号：21700AMZ00078000						
11. 薬価基準収載年月日	旧販売名 静注用 2%リドクイックシリンジ 製造販売承認年月日：2000年9月29日  2005年6月10日  旧販売名 静注用 2%リドクイックシリンジ 2000年11月24日 (2006年3月31日経過措置期間終了)						
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. 投薬期間制限医薬品に関する情報	該当しない						
16. 各種コード	<table border="1"> <tr> <td data-bbox="596 1256 1102 1294">HOT コード</td> <td data-bbox="1118 1256 1316 1294">1136555010102</td> </tr> <tr> <td data-bbox="596 1308 1102 1346">厚生労働省薬価基準収載医薬品コード</td> <td data-bbox="1118 1308 1316 1346">2129409G1036</td> </tr> <tr> <td data-bbox="596 1359 1102 1397">レセプト電算処理システムコード</td> <td data-bbox="1118 1359 1316 1397">620002610</td> </tr> </table>	HOT コード	1136555010102	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	2129409G1036	レセプト電算処理システムコード	620002610
HOT コード	1136555010102						
厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	2129409G1036						
レセプト電算処理システムコード	620002610						
17. 保険給付上の注意	本剤は保険診療上の後発医薬品である。						

## X I . 文 献

---

### 1. 引用文献

- 1) 川前金幸, 大友康裕: 医学のあゆみ. 1992; 163: 885-887.
- 2) 日本薬局方医薬品情報 2006: じほう, 東京. 2006: 1980-1988.
- 3) 第十五改正日本薬局方解説書: 廣川書店, 東京. 2006: C-4618-4623.
- 4) テルモ株式会社: PF-N05LD2 の安定性試験 (社内資料)
- 5) 臨床薬物治療学大系 11 循環器疾患: 情報開発研究所, 東京. 1987: 47-49.
- 6) 日本薬局方医薬品情報 2001: じほう, 東京. 2001: 1822-1830.

### 2. その他の参考文献

## 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<br>情報 | 該当しない |

### XⅢ. 備考

---

その他の関連資料

テルモ、PFS はテルモ株式会社の登録商標です。

