

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のI F記載要領 2013 に準拠して作成

局所麻酔剤 日本薬局方
劇薬 処方箋医薬品
<h2>プロカイン塩酸塩注射液</h2> <h3>Procaine Hydrochloride Injection</h3> <p>ロカイン[®] 注1% ロカイン[®] 注2%</p>

剤形	水性注射液
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	ロカイン注1%：プロカイン塩酸塩 1w/v%（10mg/mL） ロカイン注2%：プロカイン塩酸塩 2w/v%（20mg/mL）
一般名	和名：プロカイン塩酸塩（JAN） 洋名：Procaine Hydrochloride（JAN）
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：2007年3月22日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：1954年1月1日 発売年月日：1954年1月1日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：扶桑薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	扶桑薬品工業株式会社 研究開発センター 学術部門 TEL 06-6964-2763 FAX 06-6964-2706（9:00～17:30/土日祝日を除く） 医療関係者向けホームページ http://www.fuso-pharm.co.jp/

本I Fは2013年6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。

I F 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、I F と略す）の位置付け並びに I F 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 I F 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 I F 記載要領 2008 が策定された。

I F 記載要領 2008 では、I F 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-I F）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の e-I F が提供されることとなった。

最新版の e-I F 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-I F 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-I F の情報を検討する組織を設置して、個々の I F 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、I F 記載要領の一部改訂を行い I F 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. I F とは

I F 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 I F 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 I F 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。

[I F の様式]

- ①規格は A 4 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 I F 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「I F 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。

[I F の作成]

- ① I F 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 I F に記載する項目及び配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの I F 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、「I F 記載要領 2013」と略す）により作成された I F 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。

[I F の発行]

- ① 「I F 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、「I F 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 I F が改訂される。

3. I F の利用にあたって

「I F 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 I F 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、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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、I F 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、I F 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、I F 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

I F 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。I F 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、I F 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	IV-12 混入する可能性のある夾雑物	7
I-1 開発の経緯	1	IV-13 注意が必要な容器・外観が特殊な容器 に関する情報	7
I-2 製品の治療学的・製剤学的特性	1	IV-14 その他	7
II. 名称に関する項目	2	V. 治療に関する項目	8
II-1 販売名	2	V-1 効能又は効果	8
(1) 和名	2	V-2 用法及び用量	8
(2) 洋名	2	V-3 臨床成績	8
(3) 名称の由来	2	(1) 臨床データパッケージ	8
II-2 一般名	2	(2) 臨床効果	8
(1) 和名(命名法)	2	(3) 臨床薬理試験	8
(2) 洋名(命名法)	2	(4) 探索的試験	8
(3) ステム	2	(5) 検証的試験	8
II-3 構造式又は示性式	2	1) 無作為化並行用量反応試験	8
II-4 分子式及び分子量	2	2) 比較試験	8
II-5 化学名(命名法)	2	3) 安全性試験	8
II-6 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	2	4) 患者・病態別試験	8
II-7 CAS登録番号	2	(6) 治療的使用	8
III. 有効成分に関する項目	3	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))	8
III-1 物理化学的性質	3	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	8
(1) 外観・性状	3	VI. 薬効薬理に関する項目	9
(2) 溶解性	3	VI-1 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	9
(3) 吸湿性	3	VI-2 薬理作用	9
(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点	3	(1) 作用部位・作用機序	9
(5) 酸塩基解離定数	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	9
(6) 分配係数	3	(3) 作用発現時間・持続時間	9
(7) その他の主な示性値	3	VII. 薬物動態に関する項目	10
III-2 有効成分の各種条件下における安定性	3	VII-1 血中濃度の推移・測定法	10
III-3 有効成分の確認試験法	3	(1) 治療上有効な血中濃度	10
III-4 有効成分の定量法	3	(2) 最高血中濃度到達時間	10
IV. 製剤に関する項目(注射剤)	4	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	10
IV-1 剤形	4	(4) 中毒域	10
(1) 剤形の区別, 外観及び性状	4	(5) 食事・併用薬の影響	10
(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	(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	10
(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類	4	VII-2 薬物速度論的パラメータ	10
IV-2 製剤の組成	4	(1) 解析方法	10
(1) 有効成分(活性成分)の含量	4	(2) 吸収速度定数	10
(2) 添加物	4	(3) バイオアベイラビリティ	10
(3) 電解質の濃度	5	(4) 消失速度定数	10
(4) 添付溶解液の組成及び容量	5	(5) クリアランス	10
(5) その他	5	(6) 分布容積	10
IV-3 注射剤の調製法	5	(7) 血漿蛋白結合率	10
IV-4 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意	5	VII-3 吸収	10
IV-5 製剤の各種条件下における安定性	5	VII-4 分布	10
IV-6 溶解後の安定性	5	(1) 血液-脳関門通過性	10
IV-7 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6	(2) 血液-胎盤関門通過性	10
IV-8 生物学的試験法	7	(3) 乳汁への移行性	11
IV-9 製剤中の有効成分の確認試験法	7	(4) 髄液への移行性	11
IV-10 製剤中の有効成分の定量法	7	(5) その他の組織への移行性	11
IV-11 力価	7		

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

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

プロカインはEinhornらにより合成され、1905年Braunらにより薬理効果が確認された。

扶桑薬品では、1954年1月に日本薬局方品である塩酸プロカイン注射液を販売開始し、1974年11月公表の再評価結果に基づき効能・効果、用法・用量の変更を行った。

第十五改正日本薬局方が制定され、薬局方名が変更されたことにより、2007年6月改訂の添付文書より、薬局方日本名記載を塩酸プロカイン注射液からプロカイン塩酸塩注射液に変更した。

「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成12年9月19日医薬発第935号）により、2007年3月22日付で、ロカイン-1%、-2%からロカイン注1%、注2%へ販売名変更の承認を受けた。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

合成局所麻酔薬の原型であり、感覚・求心神経線維のNa⁺チャネルを遮断し、活動電位の伝導を抑制することにより局所麻酔作用を発現する。粘膜への浸透性が悪いので表面麻酔としては無効である。代謝産物が血管拡張作用を有し、プロカインの血中への吸収を促進するため、必要に応じて血管収縮薬であるアドレナリンを添加して使用する。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ロカイン® 注1%

ロカイン® 注2%

(2) 洋名

Rocain Injection 1%

Rocain Injection 2%

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

プロカイン塩酸塩 (JAN)

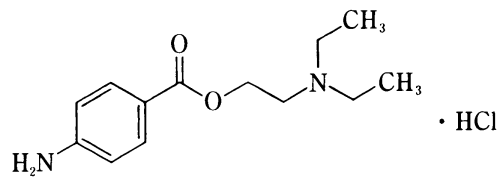
(2) 洋名(命名法)

Procaine Hydrochloride (JAN)

(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: $C_{13}H_{20}N_2O_2 \cdot HCl$

分子量: 272.77

5. 化学名(命名法)

2-(diethylamino)ethyl 4-aminobenzoate monohydrochloride

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

塩酸プロカイン

7. CAS登録番号

51-05-8

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質	
(1) 外観・性状	白色の結晶又は結晶性の粉末である。
(2) 溶解性	水に極めて溶けやすく、エタノール (95) にやや溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。
(3) 吸湿性	該当資料なし
(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点	融点: 155~158°C
(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	pH: 本品 1.0 g を水 20mL に溶かした液の pH は 5.0~6.0 である。
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	1) 紫外可視吸光度測定法 2) 赤外吸収スペクトル測定法 3) 塩化物の定性反応
4. 有効成分の定量法	亜硝酸ナトリウムによる電位差滴定法又は電流滴定法

IV. 製剤に関する項目（注射剤）

1. 剤形

(1) 剤形の区別，外観及び性状

剤形の区別：水性注射液

外観及び性状：アンプル入りの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	浸透圧比
ロカイン注 1%	3.3~6.0	1.1~1.3
ロカイン注 2%		1.4~1.6

(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

窒素

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

- ロカイン注 1%は 1 アンプル（管）1mL, 2mL 又は 5mL 中次の成分・分量を含有する。

	1mL	2mL	5mL
プロカイン塩酸塩	10mg	20mg	50mg

- ロカイン注 2%は 1 アンプル（管）1mL, 2mL 又は 5mL 中次の成分・分量を含有する。

	1mL	2mL	5mL
プロカイン塩酸塩	20mg	40mg	100mg

(2) 添加物

ロカイン注 1%： 1 アンプル（1, 2, 5mL）中
 等張化剤 塩化ナトリウム 9mg, 18mg, 45mg
 pH 調節剤 水酸化ナトリウム 適量
 pH 調節剤 塩酸 適量

ロカイン注 2%： 1 アンプル（1, 2, 5mL）中
 等張化剤 塩化ナトリウム 9mg, 18mg, 45mg
 pH 調節剤 水酸化ナトリウム 適量
 pH 調節剤 塩酸 適量

IV. 製剤に関する項目（注射剤）

(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 特になし

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

長期保存試験

	保存条件	保存期間	保存形態	結果
ロカイン注 1% 1mL	室温	3年	最終包装	変化なし
ロカイン注 1% 2mL				
ロカイン注 1% 5mL				
ロカイン注 2% 1mL	室温	3年	最終包装	変化なし
ロカイン注 2% 2mL				
ロカイン注 2% 5mL				

6. 溶解後の安定性 該当しない

IV. 製剤に関する項目（注射剤）

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

水溶液中アルカリで難溶性のプロカイン塩基の沈殿を生じる。ブドウ糖含溶液と長期保存した場合、プロカイン-N-グルコシドを生成し局所麻酔作用を低下するので注意を要する。またストレプトマイシン硫酸塩を分解させることも知られている。ベンジルペニシリン、ヨウ素類も配合不可とされている¹⁾。

<pH 変動スケール>

ロカイン注 1% 1mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)					0.3mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁			
	1.11				4.47 (試料 pH)				9.67					

ロカイン注 1% 2mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)					0.6mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁			
	1.19				4.45 (試料 pH)				9.65					

ロカイン注 1% 5mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)					1.6mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁			
	1.28				4.37 (試料 pH)				9.57					

ロカイン注 2% 1mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)					0.4mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁			
	1.10				4.31 (試料 pH)				9.09					

ロカイン注 2% 2mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)					0.8mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁			
	1.18				4.36 (試料 pH)				8.92					

ロカイン注 2% 5mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)					1.9mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁			
	1.37				4.37 (試料 pH)				8.97					

IV. 製剤に関する項目（注射剤）

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	1) 紫外可視吸光度測定法 2) 塩化物の定性反応
10. 製剤中の有効成分の定量法	液体クロマトグラフィー
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. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	VIII-14. の項 参照
14. その他	特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果	ロカイン注 1% : 伝達麻酔 ロカイン注 2% : 硬膜外麻酔、伝達麻酔
2. 用法及び用量	硬膜外麻酔 プロカイン塩酸塩として、通常成人 300～400mg を使用する（基準最高用量：1 回 600mg）。 伝達麻酔 プロカイン塩酸塩として、通常成人 10～400mg を使用する。 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。 必要に応じアドレナリン（通常濃度 1 : 10 万～20 万）を添加して使用する。
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	該当資料なし
(4) 探索的試験	該当資料なし
(5) 検証的試験	該当資料なし
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）	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	特になし

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

局所麻酔剤

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

プロカイン塩酸塩は神経幹に直接適用した場合や皮下投与ではコカインと同等の局所麻酔作用を示すが、粘膜適用した場合には1/16の作用しか認められない²⁾。したがって表面麻酔には適当でない。また、血管収縮作用に欠けるため作用持続時間が他剤に比して短いので³⁾、吸収を阻害し、作用を持続させる目的でアドレナリンが用いられる²⁾。

(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

VII-1. の項 参照

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 ⁴⁾	10～20分（皮下注の場合）。
(3) 臨床試験で確認された血中濃度 ⁴⁾	<p><参考></p> <p>健常成人に1%注射液をプロカイン塩酸塩として200mg皮下注射した場合、プロカインは注射5分後より血中に出現し、10～20分後に最高血中濃度（1.5μg/mL）に達し、60分後には血中から消失する。</p>
(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 ⁴⁾	約6%
3. 吸収 ⁴⁾	<p>非経口的に投与すると確実に吸収（血管内）され、注入局所で長く停滞しない。なお、皮膚からは吸収されず、粘膜からの吸収は緩慢である。</p>
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 ⁵⁾	<p>正常分娩で、胎盤に異常のない絨毛上皮ホモジネートの遠沈渣を局麻剤と培養し、その残存量の定量から、プロカインは胎盤で分解されるとしている。分娩時妊婦40例に1～10mg/kgを静注し、分娩後の臍帯静脈、母動脈中で測定した場合4mg以下では胎児血中にプロカインは見られない。</p>

VII. 薬物動態に関する項目

(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 ⁴⁾	<p>吸収されたプロカインは循環血液中で速やかに加水分解され、パラアミノ安息香酸と diethylaminoethanol になる。この分解酵素はプロカインエステラーゼといわれているが、肝におけるコリンエステラーゼと同じものと考えられている（同一でないとするものもある）。注）この加水分解は種差があり、血漿での分解速度はヒトでは、他の動物の 4～20 倍も速いといわれており、ヒトでのプロカインの加水分解は血漿が主体で肝では非常に低いとされている。</p>
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種	該当資料なし
(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 ⁴⁾	腎臓（一部は胆汁からも排泄されるらしい）
(2) 排泄率 ⁴⁾	<p>健常成人に 1%注射液を皮下注射した場合、プロカインは尿中に未変化体として 150mg 投与で平均 0.2%、200mg 投与で 0.26%、400mg 投与で 0.44%が排泄される。</p>
(3) 排泄速度 ⁴⁾	<p>尿中パラアミノ安息香酸の排泄は、相当の個人差が認められ、プロカイン投与量から換算して 24 時間後 30～60%、48 時間後 50～80% である。</p>
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	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

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)

1. 次の患者には投与しないこと

(1) 重篤な出血やショック状態の患者(硬膜外麻酔時)

(解説) 症状が悪化するおそれがある。

(2) 注射部位又はその周辺の炎症のある患者(硬膜外麻酔時)

(解説) 吸収が高まり、効果が急激に発現するおそれがある。

(3) 敗血症の患者(硬膜外麻酔時)

(解説) 敗血症性の髄膜炎が起こるおそれがある。

(4) メトヘモグロビン血症の患者

(解説) 症状が悪化するおそれがある。

(5) 本剤又は安息香酸エステル(コカインを除く)系局所麻酔剤に対し、過敏症の既往歴のある患者

2. 次の患者に投与する場合には、血管収縮剤(アドレナリン、ノルアドレナリン)を添加しないこと

(1) 血管収縮剤に対し、過敏症の既往歴のある患者

(2) 高血圧、動脈硬化のある患者

(解説) 急激に血圧が上昇し、脳出血が起こるおそれがある。

(3) 心不全のある患者

(解説) 血管収縮、心臓刺激の結果、症状が悪化するおそれがある。

(4) 甲状腺機能亢進のある患者

(解説) 血管収縮剤に対して反応しやすく、心悸亢進、胸痛等が起こるおそれがある。

(5) 糖尿病の患者

(解説) 血糖値が上昇するおそれがある。

(6) 血管痙攣のある患者

(解説) 阻血状態をきたし、局所壊死が起こるおそれがある。

(7) 耳、指趾又は陰茎の麻酔(伝達<脊椎麻酔を除く>麻酔)

(解説) 阻血状態をきたし、局所壊死が起こるおそれがある。

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

3. 効能又は効果に関連する
使用上の注意とその理由

添付文書に記載なし

4. 用法及び用量に関連する
使用上の注意とその理由

添付文書に記載なし

5. 慎重投与内容とその理由

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
（硬膜外麻酔時）

(1) 中枢神経系疾患（髄膜炎、灰白脊髄炎等）

（解説）血液、脳へ移行する可能性があり、症状が悪化するおそれがある。

(2) 妊産婦

（解説）妊娠末期は、麻酔範囲が広がり、仰臥性低血圧を起こすことがあるので注意すること。

(3) 高齢者

（Ⅷ-9. の項参照）

(4) 血液疾患や抗凝血剤治療中

（解説）出血しやすいので、血腫形成や脊髄への障害を起こすことがある。

(5) 重篤な高血圧症

（解説）急激な血圧低下が起こることがある。

(6) 脊柱の著明な変形

（解説）穿刺時、脊髄や神経根の損傷のおそれがある。

2. 血管収縮剤の添加－慎重投与

<次の患者に血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加して投与する場合には、慎重に投与すること>

(1) ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔剤使用中

（解説）血管収縮剤に対する心筋の感受性が高まり、不整脈が起こるおそれがある。

(2) 三環系抗うつ剤又はモノアミンオキシダーゼ阻害剤服用中

（解説）血管収縮剤による心血管作用が増強され、不整脈、高血圧等が起こるおそれがある。

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

(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、局所麻酔剤の使用に際しては、常時、ただちに救急処置のとれる準備が望ましい。

(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。

- 1) 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。
- 2) できるだけうすい濃度のものを用いること。
- 3) できるだけ必要最小量にとどめること。
- 4) 必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。
- 5) ショックあるいは中毒症状がみられた際に、迅速な処置が行えるように、原則として事前の静脈の確保が望ましい。(硬膜外麻酔時)
- 6) 血管の多い部位(頭部、顔面、扁桃等)に注射する場合には、吸収が早いので、できるだけ少ない量で使用する。(伝達<脊椎麻酔を除く>麻酔時)
- 7) 注射針が血管又はくも膜下腔(硬膜外麻酔時)に入っていないことを確かめること。
- 8) 注射の速度はできるだけ遅くすること。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

(2) 併用注意とその理由

添付文書に記載なし

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

下記の重大な副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

1) ショック：(初期症状：血圧低下、顔面蒼白、脈拍の異常、呼吸抑制等)

2) 振戦、痙れん等の中毒症状：[処置方法：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)の投与等]

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

(3) その他の副作用

副作用が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	頻 度 不 明
中枢神経 ^{注)}	ねむけ、不安、興奮、霧視、眩暈、悪心・嘔吐等
血 液	メトヘモグロビン血症
過 敏 症	じん麻疹、浮腫等

注) 観察を十分に行い、ショックあるいは中毒への移行に注意し、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

添付文書に記載なし

(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

添付文書に記載なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

Ⅷ-6. の項及びⅧ-8. (2)1) の項、(3)の項「過敏症」の欄 参照

9. 高齢者への投与

高齢者では、生理機能が低下していることが多く、副作用が発現しやすいので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

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まわると判断される場合にのみ投与すること。

(解説) 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

添付文書に記載なし

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

添付文書に記載なし

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

13. 過量投与⁴⁾

<参考>

大別して中枢神経系と心血管系への作用が考えられる。まず、中枢神経系では刺激症状がみられる。大脳皮質：不安、興奮、混乱、おしゃべりからはじまり、ついには全身けいれんを起こす。延髄：血圧の上昇、脈拍の増加、呼吸数増加、悪心、嘔吐。次いで中枢神経系の抑制に移行し、大脳皮質：意識消失、延髄：血圧下降、脈拍微弱、呼吸停止などをきたす。一方、心血管系への抹消作用として、心筋収縮力の低下、徐脈、血管拡張などをきたし、放置しておけば死亡する危険が極めて大である。

14. 適用上の注意

アンプルカット時：本剤にはアンプルカット時にガラス微小片混入の少ないクリーンカットアンプル（CCアンプル）を使用しているが、さらに安全に使用するため、従来どおりエタノール綿等で清拭することが望ましい。

15. その他の注意

添付文書に記載なし

16. その他

特になし

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

該当資料なし

(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

(3) 安全性薬理試験

(4) その他の薬理試験

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

プロカイン塩酸塩の LD₅₀ は次のように報告されている。

	ラット	マウス
皮下 ⁴⁾	2.1g/kg	339~800mg/kg
腹腔内 ⁶⁾	184mg/kg	180mg/kg

なお、特に皮下注射の場合、コカインに比して毒性が著しく低下するといわれている。

(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 処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること） 有効成分：劇薬
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）	くすりのしおり：有り
(3) 調剤時の留意点について	特になし
5. 承認条件等	該当しない
6. 包装	<p>ロカイン注1%： 1mL 10管 50管 2mL 10管 50管</p> <p style="padding-left: 100px;">5mL 10管 50管</p> <p>ロカイン注2%： 1mL 10管 50管 2mL 10管 50管</p> <p style="padding-left: 100px;">5mL 10管 50管</p>
7. 容器の材質	ガラス
8. 同一成分・同効薬	<p>同一成分薬：1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」（日新製薬）</p> <p style="padding-left: 20px;">2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」（日新製薬）</p> <p>同効薬：㊦リドカイン注射液</p> <p style="padding-left: 20px;">㊦メピバカイン塩酸塩注射液</p>

X. 管理的事項に関する項目

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：2007年3月22日（販売名変更による） 承認番号：ロカイン注1%：21900AMX00811 ロカイン注2%：21900AMX00817						
11. 薬価基準収載年月日	薬価基準収載日：1954年1月1日 発売年月日：1954年1月1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	X-13. の項 参照						
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 内容： <table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse; margin-top: 5px;"> <thead> <tr> <th style="width: 20%;"></th> <th style="text-align: center;">変更前</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td style="padding: 2px;">効能・効果</td> <td style="padding: 2px;">各科領域における局所麻酔および脊髄麻酔</td> </tr> <tr> <td style="padding: 2px;">用法・用量</td> <td style="padding: 2px;">通常手術時の麻酔に用いられ、浸潤麻酔にはエピネフリンを1:100,000～200,000の割に加えた0.5～2%液を、硬膜外麻酔（胸部手術）には2%液を、腰椎麻酔（産科）には1.5%食塩水溶液を、それぞれ用いますが、一般に手術に当ってその症状に即応して使用して下さい。なお、注射に際しては直接血管内へ入れることは避けて下さい。</td> </tr> </tbody> </table> <p style="margin-top: 5px;">変更後の効能・効果はV-1. の項、用法・用量はV-2. の項を参照。</p>		変更前	効能・効果	各科領域における局所麻酔および脊髄麻酔	用法・用量	通常手術時の麻酔に用いられ、浸潤麻酔にはエピネフリンを1:100,000～200,000の割に加えた0.5～2%液を、硬膜外麻酔（胸部手術）には2%液を、腰椎麻酔（産科）には1.5%食塩水溶液を、それぞれ用いますが、一般に手術に当ってその症状に即応して使用して下さい。なお、注射に際しては直接血管内へ入れることは避けて下さい。
	変更前						
効能・効果	各科領域における局所麻酔および脊髄麻酔						
用法・用量	通常手術時の麻酔に用いられ、浸潤麻酔にはエピネフリンを1:100,000～200,000の割に加えた0.5～2%液を、硬膜外麻酔（胸部手術）には2%液を、腰椎麻酔（産科）には1.5%食塩水溶液を、それぞれ用いますが、一般に手術に当ってその症状に即応して使用して下さい。なお、注射に際しては直接血管内へ入れることは避けて下さい。						
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、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。						

X. 管理的事項に関する項目

16. 各種コード

ロカイン注 1%

	HOT 番号	薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード
1mL	101642002	1211401A4016 (1211401A4067)	641210029 (620005863)
2mL	101643702	1211401A5012 (1211401A5071)	641210030 (620005864)
5mL	101644403	1211401A6019 (1211401A6078)	641210031 (620005865)

ロカイン注 2%

	HOT 番号	薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード
1mL	101646802	1211401A8011 (1211401A8070)	641210034 (620005866)
2mL	101647504	1211401A9018 (1211401A9085)	641210035 (620005867)
5mL	101648202	1211401H1015 (1211401H1074)	641210036 (620005868)

注) 統一名収載品において、
 薬価基準収載医薬品コード欄の () 内は個別医薬品コード、
 レセプト電算コード欄の () 内は銘柄名コードを示す。

17. 保険給付上の注意

特になし

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) 第十六改正 日本薬局方解説書, C-4216 (2011)
- 2) Sollmann, T., J. A. M. A., **70**, 216 (1918)
- 3) Defalque, R. J. et al., Anesth. Analg. Curr. Res., **46**, 311 (1967)
- 4) JP DI 2006, 1565, じほう (2006)
- 5) JP DI 2001, 532, じほう (2001)
- 6) Burgison, R. M. et al., Fed. Proc., **10**, 284 (1951)

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 | 海外では発売されていない（2014年 8月時点） |
| 2. 海外における臨床支援情報 | 該当資料なし |

XIII. 備考

その他の関連資料

該当資料なし