

## 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 プロカイン塩酸塩注射液

J・P Procaine Hydrochloride Injection

1%塩酸**プロカイン**注射液「ニッシン」  
2%塩酸**プロカイン**注射液「ニッシン」

剤形	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%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」： 1管5mL中 日本薬局方プロカイン塩酸塩 50mg 含有 2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」： 1管2mL中 日本薬局方プロカイン塩酸塩 40mg 含有
一般名	和名：プロカイン塩酸塩 洋名：Procaine Hydrochloride
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9月14日 薬価基準収載年月日：1958年10月1日 発売年月日：不明
開発・製造販売 （輸入）・提携・ 販売会社名	製造販売元：日新製薬株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	日新製薬株式会社 安全管理部 TEL：023-655-2131 FAX：023-655-3419 医療関係者向けホームページ： <a href="http://www.yg-nissin.co.jp/">http://www.yg-nissin.co.jp/</a>

本 I F は 2014 年 6 月改訂（第 6 版）の添付文書の記載に基づき作成した。

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 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、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新たな 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版の 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上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、 P D F 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. 開発の経緯…………… 1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性…………… 1

## II. 名称に関する項目

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

## III. 有効成分に関する項目

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

## IV. 製剤に関する項目

1. 剤形…………… 4
2. 製剤の組成…………… 4
3. 注射剤の調製法…………… 4
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意…………… 4
5. 製剤の各種条件下における安定性…………… 4
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）…………… 5
8. 生物学的試験法…………… 5
9. 製剤中の有効成分の確認試験法…………… 5
10. 製剤中の有効成分の定量法…………… 5
11. 力価…………… 5
12. 混入する可能性のある夾雑物…………… 5
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報…………… 5
14. その他…………… 5

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果…………… 6
2. 用法及び用量…………… 6
3. 臨床成績…………… 6

## 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…………… 7
2. 薬理作用…………… 7

## VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法…………… 8
2. 薬物速度論的パラメータ…………… 8
3. 吸収…………… 8
4. 分布…………… 8
5. 代謝…………… 8
6. 排泄…………… 9
7. トランスポーターに関する情報…………… 9
8. 透析等による除去率…………… 9

## 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	1 0
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	1 0
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	1 0
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	1 0
5. 慎重投与内容とその理由	1 0
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	1 1
7. 相互作用	1 1
8. 副作用	1 1
9. 高齢者への投与	1 2
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	1 2
11. 小児等への投与	1 2
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	1 2
13. 過量投与	1 2
14. 適用上の注意	1 2
15. その他の注意	1 2
16. その他	1 2

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	1 3
2. 毒性試験	1 3

## Ⅹ. 管理的事項に関する項目

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

## Ⅺ. 文献

1. 引用文献	1 6
2. その他の参考文献	1 6

## Ⅻ. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	1 6
2. 海外における臨床支援情報	1 6

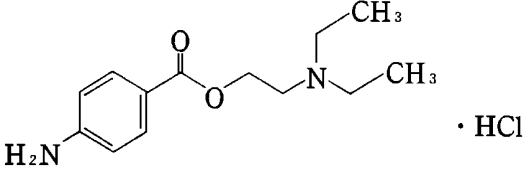
## ⅫⅢ. 備考

その他の関連資料	1 6
----------	-----

## I. 概要に関する項目

<b>1. 開発の経緯</b>	プロカインは、Eihorn らにより合成され、1905 年 Braun らにより薬理効果が確認され、局所麻酔薬として発売された。 日新製薬(株)は、1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」・2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」を後発医薬品として企画・開発し、1984年9月に承認を得て、製造・販売を行っている。
<b>2. 製品の治療学的・製剤学的特性</b>	プロカイン塩酸塩は合成局所麻酔薬の原型である。局所麻酔薬は次のような共通の機構で知覚神経の機能を抑制する。非解離型の中性分子として神経細胞膜を通過し、細胞内で解離しイオン型となる。イオン型の分子は神経細胞の内側から細胞膜のNa <sup>+</sup> チャンネルに結合し、これを抑制する。神経の活動電位は神経細胞膜のNa <sup>+</sup> チャンネルが開くことにより発生するので、これが抑制されると活動電位が発生しなくなる。即ち、知覚神経の求心性の伝導が抑制されるので、麻酔作用が発揮されることとなる。局所麻酔薬は、細い神経ほど、かつ無髄の神経の方が作用しやすいので、比較的選択的に痛覚神経に作用するが、高濃度になればその作用は他の神経にも及ぶ。プロカイン塩酸塩は粘膜への浸透性が悪いので表面麻酔には不適で、伝導麻酔などに用いられる。通常、吸収を抑制するためにアドレナリンを添加する。 重大な副作用として、ショック、振戦、痙攣等の中毒症状があらわれることがある。

## II. 名称に関する項目

<p>1. 販売名 (1) 和名 (2) 洋名 (3) 名称の由来</p>	<p>1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」 2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」 1% Procaine Hydrochloride Injection “nissin” 2% Procaine Hydrochloride Injection “nissin” 本剤の一般名の別名「塩酸プロカイン」に由来する。</p>
<p>2. 一般名 (1) 和名 (命名法) (2) 洋名 (命名法) (3) ステム</p>	<p>プロカイン塩酸塩 (JAN) Procaine Hydrochloride (JAN) 局所麻酔薬：-caine</p>
<p>3. 構造式又は示性式</p>	
<p>4. 分子式及び分子量</p>	<p>分子式：C<sub>13</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub> · HCl 分子量：272.77</p>
<p>5. 化学名 (命名法)</p>	<p>2-(Diethylamino)ethyl 4-aminobenzoate monohydrochloride (IUPAC)</p>
<p>6. 慣用名、別名、略号、 記号番号</p>	<p>別名：塩酸プロカイン</p>
<p>7. CAS登録番号</p>	<p>51-05-8</p>

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質 (1) 外観・性状 (2) 溶解性  (3) 吸湿性 (4) 融点(分解点)、沸点、凝固点 (5) 酸塩基解離定数 (6) 分配係数 (7) その他の主な示性値	白色の結晶又は結晶性の粉末である。 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。 該当資料なし 融点：155～158℃  pKa：8.8 該当資料なし pH：本品1.0g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	日本薬局方プロカイン塩酸塩の確認試験法による。 (1) 紫外可視吸光度測定法 (2) 赤外吸収スペクトル測定法(塩化カリウム錠剤法) (3) 塩化物の定性反応
4. 有効成分の定量法	日本薬局方プロカイン塩酸塩の定量法による。 0.1mol/L 亜硝酸ナトリウム液による滴定(電位差滴定法又は電流滴定法)



#### IV. 製剤に関する項目

<p>1. 剤形</p> <p>(1) 剤形の区別、外観及び性状</p> <p>(2) 溶液及び溶解時のpH、浸透圧比、粘度、比重、安定なpH域等</p> <p>(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類</p>	<p>剤形の区別：注射剤（溶液）</p> <p>性状：無色澄明の水性注射液</p> <p>pH：3.3～6.0</p> <p>浸透圧比（生理食塩液に対する比）：約0.3（1%）、約0.5（2%）</p> <p>窒素</p>																																															
<p>2. 製剤の組成</p> <p>(1) 有効成分（活性成分）の含量</p> <p>(2) 添加物</p> <p>(3) 電解質の濃度</p> <p>(4) 添付溶解液の組成及び容量</p> <p>(5) その他</p>	<p>1%注射液：1管5mL中に日本薬局方プロカイン塩酸塩50mg含有</p> <p>2%注射液：1管2mL中に日本薬局方プロカイン塩酸塩40mg含有</p> <p>pH調整剤</p> <p>該当しない</p> <p>該当しない</p> <p>該当しない</p>																																															
<p>3. 注射剤の調製法</p>	<p>該当しない</p>																																															
<p>4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意</p>	<p>該当しない</p>																																															
<p>5. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup></p>	<p>1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」は、最終包装製品を用いた長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における3年間の安定性が確認された。</p> <p><b>長期保存試験</b></p> <p>試験条件：最終包装製品（ガラスアンプルに充てんし、アンプル内は窒素で置換し、密封し、紙箱に入れたもの）の状態で、室温保存</p> <table border="1" data-bbox="491 1355 1425 1805"> <thead> <tr> <th colspan="2">項目及び規格</th> <th>開始時</th> <th>1年後</th> <th>2年後</th> <th>3年後</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td colspan="2">性状 (無色澄明の液)</td> <td>無色澄明の液</td> <td>無色澄明の液</td> <td>無色澄明の液</td> <td>無色澄明の液</td> </tr> <tr> <td rowspan="2">確認試験</td> <td>(1) 紫外可視吸光度測定法</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> </tr> <tr> <td>(2) 塩化物の定性反応(2)</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> </tr> <tr> <td colspan="2">pH (3.3～6.0)</td> <td>3.4</td> <td>3.4</td> <td>3.4</td> <td>3.4</td> </tr> <tr> <td colspan="2">不溶性異物</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> </tr> <tr> <td colspan="2">浸透圧比 (参考値)</td> <td>0.2</td> <td>0.2</td> <td>0.2</td> <td>0.2</td> </tr> <tr> <td colspan="2">定量法(%) (95～105)</td> <td>100</td> <td>99</td> <td>98</td> <td>97</td> </tr> </tbody> </table>	項目及び規格		開始時	1年後	2年後	3年後	性状 (無色澄明の液)		無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	確認試験	(1) 紫外可視吸光度測定法	適合	適合	適合	適合	(2) 塩化物の定性反応(2)	適合	適合	適合	適合	pH (3.3～6.0)		3.4	3.4	3.4	3.4	不溶性異物		適合	適合	適合	適合	浸透圧比 (参考値)		0.2	0.2	0.2	0.2	定量法(%) (95～105)		100	99	98	97
項目及び規格		開始時	1年後	2年後	3年後																																											
性状 (無色澄明の液)		無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液																																											
確認試験	(1) 紫外可視吸光度測定法	適合	適合	適合	適合																																											
	(2) 塩化物の定性反応(2)	適合	適合	適合	適合																																											
pH (3.3～6.0)		3.4	3.4	3.4	3.4																																											
不溶性異物		適合	適合	適合	適合																																											
浸透圧比 (参考値)		0.2	0.2	0.2	0.2																																											
定量法(%) (95～105)		100	99	98	97																																											

	<p>2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」は、最終包装製品を用いた長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における3年間の安定性が確認された。</p> <p><b>長期保存試験</b>  試験条件：最終包装製品（ガラスアンプルに充てんし、アンプル内は窒素で置換し、密封し、紙箱に入れたもの）の状態で、室温保存</p> <table border="1" data-bbox="491 405 1425 846"> <thead> <tr> <th>項目及び規格</th> <th>開始時</th> <th>1年後</th> <th>2年後</th> <th>3年後</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>性状 (無色澄明の液)</td> <td>無色澄明の液</td> <td>無色澄明の液</td> <td>無色澄明の液</td> <td>無色澄明の液</td> </tr> <tr> <td>確認試験 (1)紫外可視吸光度測定法</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> </tr> <tr> <td>(2)塩化物の定性反応(2)</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> </tr> <tr> <td>pH (3.3~6.0)</td> <td>3.4</td> <td>3.5</td> <td>3.5</td> <td>3.4</td> </tr> <tr> <td>不溶性異物</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> <td>適合</td> </tr> <tr> <td>浸透圧比 (参考値)</td> <td>0.5</td> <td>0.5</td> <td>0.5</td> <td>0.5</td> </tr> <tr> <td>定量法(%) (95~105)</td> <td>99</td> <td>98</td> <td>97</td> <td>97</td> </tr> </tbody> </table>	項目及び規格	開始時	1年後	2年後	3年後	性状 (無色澄明の液)	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	確認試験 (1)紫外可視吸光度測定法	適合	適合	適合	適合	(2)塩化物の定性反応(2)	適合	適合	適合	適合	pH (3.3~6.0)	3.4	3.5	3.5	3.4	不溶性異物	適合	適合	適合	適合	浸透圧比 (参考値)	0.5	0.5	0.5	0.5	定量法(%) (95~105)	99	98	97	97
項目及び規格	開始時	1年後	2年後	3年後																																					
性状 (無色澄明の液)	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液																																					
確認試験 (1)紫外可視吸光度測定法	適合	適合	適合	適合																																					
(2)塩化物の定性反応(2)	適合	適合	適合	適合																																					
pH (3.3~6.0)	3.4	3.5	3.5	3.4																																					
不溶性異物	適合	適合	適合	適合																																					
浸透圧比 (参考値)	0.5	0.5	0.5	0.5																																					
定量法(%) (95~105)	99	98	97	97																																					
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) <sup>2)</sup>	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。																																								
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	日本薬局方プロカイン塩酸塩注射液の確認試験法による。 (1)紫外可視吸光度測定法 (2)塩化物の定性反応(2)																																								
10. 製剤中の有効成分の 定量法	日本薬局方プロカイン塩酸塩注射液の定量法による。 液体クロマトグラフィー（内標準法）																																								
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	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	該当資料なし																																								
14. その他	該当しない																																								

## V. 治療に関する項目

<p>1. 効能又は効果</p>	<p>1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」：伝達麻酔 2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」：硬膜外麻酔、伝達麻酔</p>
<p>2. 用法及び用量</p>	<p><b>1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」</b> 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。</p> <p><b>2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」</b> 硬膜外麻酔： （基準最高用量：1回 600mg）プロカイン塩酸塩として、通常、成人 300～400mg を使用する。 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。</p>
<p>3. 臨床成績</p> <p>(1) 臨床データパッケージ</p> <p>(2) 臨床効果</p> <p>(3) 臨床薬理試験</p> <p>(4) 探索的試験</p> <p>(5) 検証的試験</p> <p>1) 無作為化並行用量反応試験</p> <p>2) 比較試験</p> <p>3) 安全性試験</p> <p>4) 患者・病態別試験</p> <p>(6) 治療的使用</p> <p>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）</p> <p>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</p>	<p>該当資料なし</p>

## VI. 薬効薬理に関する項目

<p>1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群</p>	<p>アミド型：          ブピバカイン塩酸塩水和物、メピバカイン塩酸塩、リドカイン(塩酸塩)、ロピバカイン塩酸塩水和物          安息香酸エステル型：          オキシプロカイン塩酸塩、テトラカイン塩酸塩          キノリン型：          ジブカイン塩酸塩</p>
<p>2. 薬理作用</p> <p>(1) 作用部位・作用機序<sup>2)</sup></p> <p>(2) 薬効を裏付ける試験成績</p> <p>(3) 作用発現時間・持続時間</p>	<p>プロカイン塩酸塩は合成局所麻酔薬の原型である。局所麻酔薬は次のような共通の機構で知覚神経の機能を抑制する。非解離型の中性分子として神経細胞膜を通過し、細胞内で解離しイオン型となる。イオン型の分子は神経細胞の内側から細胞膜のNa<sup>+</sup>チャンネルに結合し、これを抑制する。神経の活動電位は神経細胞膜のNa<sup>+</sup>チャンネルが開口することにより発生するので、これが抑制されると活動電位が発生しなくなる。即ち、知覚神経の求心性の伝導が抑制されるので、麻酔作用が発揮されることとなる。局所麻酔薬は、細い神経ほど、かつ無髄の神経の方が作用しやすいので、比較的選択的に痛覚神経に作用するが、高濃度になればその作用は他の神経にも及ぶ。プロカイン塩酸塩は粘膜への浸透性が悪いので表面麻酔には不適で、伝導麻酔などに用いられる。通常、吸収を抑制するためにアドレナリンを添加する。</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p>

## VII. 薬物動態に関する項目

<p>1. 血中濃度の推移、測定法</p> <p>(1) 治療上有効な血中濃度</p> <p>(2) 最高血中濃度到達時間</p> <p>(3) 臨床試験で確認された血中濃度</p> <p>(4) 中毒域</p> <p>(5) 食事・併用薬の影響</p> <p>(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</p>	<p>該当資料なし</p>
<p>2. 薬物速度論的パラメータ</p> <p>(1) 解析方法</p> <p>(2) 吸収速度定数</p> <p>(3) バイオアベイラビリティ</p> <p>(4) 消失速度定数</p> <p>(5) クリアランス</p> <p>(6) 分布容積</p> <p>(7) 血漿蛋白結合率<sup>2)</sup></p>	<p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>約6%</p>
<p>3. 吸収</p>	<p>該当資料なし</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>該当資料なし</p>
<p>5. 代謝</p> <p>(1) 代謝部位及び代謝経路<sup>2)</sup></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>主として血漿中</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p>

6. 排泄 (1) 排泄部位及び経路 (2) 排泄率 (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	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	該当記載事項なし
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	<p><b>1. 次の患者には投与しないこと</b></p> <p>(1) 重篤な出血やショック状態の患者（硬膜外麻酔時）[症状が悪化するおそれがある。]</p> <p>(2) 注射部位又はその周辺に炎症のある患者（硬膜外麻酔時）[吸収が高まり、効果が急激に発現するおそれがある。]</p> <p>(3) 敗血症の患者（硬膜外麻酔時）[敗血症性の髄膜炎が起こるおそれがある。]</p> <p>(4) メトヘモグロビン血症の患者[症状が悪化するおそれがある。]</p> <p>(5) 本剤の成分又は安息香酸エステル（コカインを除く）系局所麻酔薬に対し、過敏症の既往歴のある患者</p> <p><b>2. 次の患者に投与する場合には、血管収縮薬（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加しないこと</b></p> <p>(1) 血管収縮薬に対し過敏症の既往歴のある患者</p> <p>(2) 高血圧、動脈硬化のある患者[急激に血圧が上昇し、脳出血が起こるおそれがある。]</p> <p>(3) 心不全のある患者[血管収縮、心臓刺激の結果、症状が悪化するおそれがある。]</p> <p>(4) 甲状腺機能亢進のある患者[血管収縮薬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。]</p> <p>(5) 糖尿病の患者[血糖値が上昇するおそれがある。]</p> <p>(6) 血管痙攣のある患者[阻血状態を来し、局所壊死が起こるおそれがある。]</p> <p>(7) 耳、指趾又は陰茎の麻酔（伝達（脊椎麻酔を除く）麻酔時）[阻血状態を来し、局所壊死が起こるおそれがある。]</p>
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	<p><b>次の患者には慎重に投与すること</b></p> <p>(1) 硬膜外麻酔用剤として使用する場合</p> <p>1) 中枢神経系疾患（髄膜炎、灰白脊髄炎等）のある患者[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。]</p> <p>2) 妊婦、産婦（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）</p> <p>3) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）</p> <p>4) 血液疾患や抗凝血薬治療中の患者[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。]</p> <p>5) 重篤な高血圧症の患者[急激な血圧低下が起こることがある。]</p> <p>6) 脊柱に著明な変形のある患者 [穿刺時、脊髄や神経根の損傷のおそれがある。]</p>

	<p>(2)血管収縮薬（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</p> <p>1)ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔薬投与中の患者[血管収縮薬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。]</p> <p>2)三環系抗うつ薬又はモノアミン酸化酵素阻害薬投与中の患者[カテコールアミンの交感神経内への取り込み又は分解を阻害するので、血管収縮薬の作用が増強され、不整脈、高血圧等が起こるおそれがある。]</p>								
<p>6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法</p>	<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、局所麻酔薬の投与に際しては、常時、直ちに救急処置のとれる準備が望ましい。</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、下記の点に留意すること。</p> <p>1)患者の全身状態の観察を十分に行うこと。</p> <p>2)できるだけうす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薬の併用を考えること。</p> <p>5)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、できるだけ少ない量で使用する（伝達（脊椎麻酔を除く）麻酔時）。</p> <p>6)注射針が血管に入っていないことを確かめること（伝達（脊椎麻酔を除く）麻酔時）。</p> <p>7)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（硬膜外麻酔時）。</p> <p>8)注射の速度はできるだけ遅くすること。</p> <p>9)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）。</p>								
<p>7. 相互作用</p> <p>(1)併用禁忌とその理由</p> <p>(2)併用注意とその理由</p>	<p>該当記載事項なし</p>								
<p>8. 副作用</p> <p>(1)副作用の概要</p> <p>(2)重大な副作用と初期症状</p> <p>(3)その他の副作用</p>	<p>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。（頻度不明）</p> <p>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必要に応じ適切な処置を行うこと。</p> <p>(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）</p> <p>(2)振戦、痙攣等の中毒症状（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）</p> <p>下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ適切な処置を行うこと。</p> <table border="1" data-bbox="491 1686 1382 1854"> <thead> <tr> <th colspan="2">頻度不明</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>中枢神経系<sup>注)</sup></td> <td>眠気、不安、興奮、霧視、めまい、悪心・嘔吐</td> </tr> <tr> <td>血液</td> <td>メトヘモグロビン血症</td> </tr> <tr> <td>過敏症</td> <td>蕁麻疹、浮腫等</td> </tr> </tbody> </table> <p>注) ショックあるいは中毒への移行に注意すること。</p>	頻度不明		中枢神経系 <sup>注)</sup>	眠気、不安、興奮、霧視、めまい、悪心・嘔吐	血液	メトヘモグロビン血症	過敏症	蕁麻疹、浮腫等
頻度不明									
中枢神経系 <sup>注)</sup>	眠気、不安、興奮、霧視、めまい、悪心・嘔吐								
血液	メトヘモグロビン血症								
過敏症	蕁麻疹、浮腫等								



<p>(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧</p> <p>(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</p> <p>(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法</p>	<p>該当資料なし</p> <p>該当資料なし</p> <p>本剤の成分又は安息香酸エステル（コカインを除く）系局所麻酔薬に対し、過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。 血管収縮薬に対し過敏症の既往歴のある患者には血管収縮薬（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加しないこと。 ショックがあらわれることがある。（Ⅷ. 6. 及び 8. (2) を参照）</p>
<p>9. 高齢者への投与</p>	<p>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。また血管収縮薬（アドレナリン、ノルアドレナリン）の作用に対する感受性が高いことがあるので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。</p>
<p>10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与</p>	<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) 妊娠末期の婦人には慎重に投与すること。[麻酔範囲が広がり、仰臥性低血圧を起こすことがある。]</p>
<p>11. 小児等への投与</p>	<p>該当記載事項なし</p>
<p>12. 臨床検査結果に及ぼす影響</p>	<p>該当記載事項なし</p>
<p>13. 過量投与</p>	<p>該当記載事項なし</p>
<p>14. 適用上の注意</p>	<p>アンプルカット時：本剤はワンポイントアンプルであるが、アンプルカット部分をエタノール綿等で清拭し、カットすることが望ましい。</p>
<p>15. その他の注意</p>	<p>該当記載事項なし</p>
<p>16. その他</p>	<p>該当しない</p>

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

<p>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 (3) 安全性薬理試験 (4) その他の薬理試験</p>	該当資料なし
<p>2. 毒性試験 (1) 単回投与毒性試験 (2) 反復投与毒性試験 (3) 生殖発生毒性試験 (4) その他の特殊毒性</p>	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 (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） (3) 調剤時の留意点について	「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 14. 適用上の注意」を参照  特になし  特になし
5. 承認条件等	該当しない
6. 包装	1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」：5mL(50mg)×50管 2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」：2mL(40mg)×50管
7. 容器の材質	アンプル：無色ガラス 化粧箱：紙
8. 同一成分・同効薬	同一成分薬：ロカイン注1%・2%（扶桑） 同 効 薬：テトラカイン塩酸塩等
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：1984年9月14日 承認番号：1%注射液 15900AMZ00732000 2%注射液 15900AMZ00733000
11. 薬価基準収載年月日	1958年10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	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	1974年11月20日付再評価結果公示 「効能・効果」、「用法・用量」の変更
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、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード				
	販売名	HOT 番号 (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
	1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」	101644406	1211401A6027	641210065
	2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」	101647506	1211401A9026	641210078
17. 保険給付上の注意	本剤は診療報酬上の後発医薬品に該当しない。			

## XI. 文献

1. 引用文献	1) 日新製薬株式会社 社内資料 (安定性) 2) 第十六改正日本薬局方解説書
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	該当資料なし
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
----------	--------