

# 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 リドカイン注射液

**キシロカイン<sup>®</sup>注シリンジ 0.5%**

**キシロカイン<sup>®</sup>注シリンジ 1%**

**Xylocaine<sup>®</sup> Injection syringe 0.5%・1%**

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	キシロカイン注シリンジ (0.5%) (1%) 1シリンジ (10mL) 中リドカイン塩酸塩 50mg 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・発売年月日	製造販売承認年月日：2005年3月8日 薬価基準収載年月日：2005年7月8日 発売年月日：2005年9月26日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売：サンド株式会社 製造販売：ニプロ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	サンド株式会社 カスタマーケアグループ 〒105-6333 東京都港区虎ノ門 1-23-1 TEL 0120-982-001 FAX 03-6257-3633 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.sandoz.jp/medical">https://www.sandoz.jp/medical</a>

本 IF は 2021 年 9 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「医薬品に関する情報」

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認下さい。

# 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ホームページ「医薬品に関する情報」(<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) 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。

- ②IF 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、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。

(2013 年 4 月改訂・一部改変)

# 目 次

<p><b>I. 概要に関する項目</b> ..... 1</p> <p>1. 開発の経緯 ..... 1</p> <p>2. 製品の治療学的・製剤学的特性 ..... 1</p> <p><b>II. 名称に関する項目</b> ..... 2</p> <p>1. 販売名 ..... 2</p> <p>    (1) 和名 ..... 2</p> <p>    (2) 洋名 ..... 2</p> <p>    (3) 名称の由来 ..... 2</p> <p>2. 一般名 ..... 2</p> <p>    (1) 和名（命名法） ..... 2</p> <p>    (2) 洋名（命名法） ..... 2</p> <p>    (3) ステム ..... 2</p> <p>3. 構造式又は示性式 ..... 2</p> <p>4. 分子式及び分子量 ..... 2</p> <p>5. 化学名（命名法） ..... 2</p> <p>6. 慣用名、別名、略号、記号番号 ..... 2</p> <p>7. CAS 登録番号 ..... 2</p> <p><b>III. 有効成分に関する項目</b> ..... 3</p> <p>1. 物理化学的性質 ..... 3</p> <p>    (1) 外観・性状 ..... 3</p> <p>    (2) 溶解性 ..... 3</p> <p>    (3) 吸湿性 ..... 3</p> <p>    (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点 ..... 3</p> <p>    (5) 酸塩基解離定数 ..... 3</p> <p>    (6) 分配係数 ..... 3</p> <p>    (7) その他の主な示性値 ..... 3</p> <p>2. 有効成分の各種条件下における安定性 ..... 3</p> <p>3. 有効成分の確認試験法 ..... 3</p> <p>4. 有効成分の定量法 ..... 3</p> <p><b>IV. 製剤に関する項目</b> ..... 4</p> <p>1. 剤形 ..... 4</p> <p>    (1) 剤形の区別、外観及び性状 ..... 4</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 ..... 4</p> <p>    (3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類 ..... 4</p> <p>2. 製剤の組成 ..... 4</p> <p>    (1) 有効成分（活性成分）の含量 ..... 4</p> <p>    (2) 添加物 ..... 4</p> <p>    (3) 電解質の濃度 ..... 4</p> <p>    (4) 添付溶解液の組成及び容量 ..... 4</p> <p>    (5) その他 ..... 4</p> <p>3. 注射剤の調製法 ..... 4</p> <p>4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 ..... 4</p> <p>5. 製剤の各種条件下における安定性 ..... 5</p> <p>6. 溶解後の安定性 ..... 5</p> <p>7. 他剤との配合変化（物理化学的变化） ..... 5</p> <p>8. 生物学的試験法 ..... 5</p> <p>9. 製剤中の有効成分の確認試験法 ..... 5</p> <p>10. 製剤中の有効成分の定量法 ..... 5</p> <p>11. 力価 ..... 5</p> <p>12. 混入する可能性のある夾雑物 ..... 6</p>	<p>13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 ..... 6</p> <p>14. その他 ..... 6</p> <p><b>V. 治療に関する項目</b> ..... 7</p> <p>1. 効能又は効果 ..... 7</p> <p>2. 用法及び用量 ..... 7</p> <p>3. 臨床成績 ..... 7</p> <p>    (1) 臨床データパッケージ ..... 7</p> <p>    (2) 臨床効果 ..... 7</p> <p>    (3) 臨床薬理試験 ..... 7</p> <p>    (4) 探索的試験 ..... 7</p> <p>    (5) 検証的試験 ..... 8</p> <p>    (6) 治療的使用 ..... 8</p> <p><b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> ..... 9</p> <p>1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 ..... 9</p> <p>2. 薬理作用 ..... 9</p> <p>    (1) 作用部位・作用機序 ..... 9</p> <p>    (2) 薬効を裏付ける試験成績 ..... 9</p> <p>    (3) 作用発現時間・持続時間 ..... 9</p> <p><b>VII. 薬物動態に関する項目</b> ..... 10</p> <p>1. 血中濃度の推移・測定法 ..... 10</p> <p>    (1) 治療上有効な血中濃度 ..... 10</p> <p>    (2) 最高血中濃度到達時間 ..... 10</p> <p>    (3) 臨床試験で確認された血中濃度 ..... 10</p> <p>    (4) 中毒域 ..... 11</p> <p>    (5) 食事・併用薬の影響 ..... 11</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 ..... 11</p> <p>2. 薬物速度論的パラメータ ..... 11</p> <p>    (1) 解析方法 ..... 11</p> <p>    (2) 吸収速度定数 ..... 11</p> <p>    (3) バイオアベイラビリティ ..... 11</p> <p>    (4) 消失速度定数 ..... 12</p> <p>    (5) クリアランス ..... 12</p> <p>    (6) 分布容積 ..... 12</p> <p>    (7) 血漿蛋白結合率 ..... 12</p> <p>3. 吸収 ..... 12</p> <p>4. 分布 ..... 12</p> <p>    (1) 血液－脳関門通過性 ..... 12</p> <p>    (2) 血液－胎盤関門通過性 ..... 12</p> <p>    (3) 乳汁への移行性 ..... 12</p> <p>    (4) 髄液への移行性 ..... 12</p> <p>    (5) その他の組織への移行性 ..... 12</p> <p>5. 代謝 ..... 13</p> <p>    (1) 代謝部位及び代謝経路 ..... 13</p> <p>    (2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種 ..... 13</p> <p>    (3) 初回通過効果の有無及びその割合 ..... 13</p> <p>    (4) 代謝物の活性の有無及び比率 ..... 13</p> <p>    (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ ..... 13</p>
---	--

# 目 次

6. 排泄	14	X. 管理的事項に関する項目	23
(1) 排泄部位及び経路	14	1. 規制区分	23
(2) 排泄率	14	2. 有効期間又は使用期限	23
(3) 排泄速度	14	3. 貯法・保存条件	23
7. トランスポーターに関する情報	14	4. 薬剤取扱い上の注意点	23
8. 透析等による除去率	14	(1) 薬局での取扱い上の留意点について	23
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	<b>15</b>	(2) 薬剤交付時の取扱いについて	23
1. 警告内容とその理由	15	(患者等に留意すべき必須事項等)	23
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	15	(3) 調剤時の留意点について	23
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	15	5. 承認条件等	24
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	15	6. 包装	24
5. 慎重投与内容とその理由	15	7. 容器の材質	24
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16	8. 同一成分・同効薬	25
7. 相互作用	17	9. 国際誕生年月日	25
(1) 併用禁忌とその理由	17	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	25
(2) 併用注意とその理由	17	11. 薬価基準収載年月日	25
8. 副作用	18	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	25
(1) 副作用の概要	18	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	25
(2) 重大な副作用と初期症状	18	14. 再審査期間	25
(3) その他の副作用	18	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	25
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	18	16. 各種コード	25
(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	18	17. 保険給付上の注意	25
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	19	<b>X I. 文献</b>	<b>26</b>
9. 高齢者への投与	19	1. 引用文献	26
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19	2. その他の参考文献	26
11. 小児等への投与	19	<b>X II. 参考資料</b>	<b>27</b>
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19	1. 主な外国での発売状況	27
13. 過量投与	20	2. 海外における臨床支援情報	27
14. 適用上の注意	20	<b>X III. 備考</b>	<b>28</b>
15. その他の注意	20	その他の関連資料	28
16. その他	20		
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	<b>21</b>		
1. 薬理試験	21		
(1) 薬効薬理試験	21		
(2) 副次的薬理試験	21		
(3) 安全性薬理試験	21		
(4) その他の薬理試験	21		
2. 毒性試験	21		
(1) 単回投与毒性試験	21		
(2) 反復投与毒性試験	21		
(3) 生殖発生毒性試験	22		
(4) その他の特殊毒性	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実験を経て、1948年スウェーデンの Astra 社（現 AstraZeneca 社）がリドカイン塩酸塩の製品を発売するに至った。

2005年9月にこれまでのリドカイン塩酸塩注射剤の販売経験をもとに単回使用を目的とした、滅菌済みプレフィルドシリンジ製剤としてキシロカイン注シリンジ 0.5%、1%、2%\*を発売することとなった。

本剤は製造販売をニプロ株式会社、販売をサンド株式会社が行っている。

\*注) キシロカイン注シリンジ 2%は、2013年3月末経過措置終了

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) キシロカイン（一般名：リドカイン）はアミド型の局所麻酔薬であり、各国において各種形式の局所麻酔に広く用いられている。
- (2) 本剤は局所麻酔薬（リドカイン塩酸塩として基準最高用量 1回 200mg）として、表面麻酔（キシロカイン注シリンジ 1%）、浸潤麻酔、伝達麻酔及び硬膜外麻酔（キシロカイン注シリンジ 0.5%、1%）に用いる。
- (3) 本剤は保存剤を含まない単回使用のポリプロピレン製プレフィルドシリンジ製剤である。
- (4) 高圧蒸気滅菌済みのプリスター包装の為、清潔な取り扱いが可能である。
- (5) シリンジ充填済み製剤の為、薬液吸引の手間が省ける。
- (6) 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、悪性高熱があらわれることがある。（なお、使用成績調査等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。）

## Ⅱ. 名称に関する項目

### 1. 販売名

(1) 和名

キシロカイン注シリンジ 0.5%・1%

(2) 洋名

Xylocaine Injection syringe 0.5%・1%

(3) 名称の由来

不明

### 2. 一般名

(1) 和名（命名法）

リドカイン（JAN）

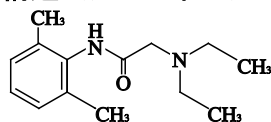
(2) 洋名（命名法）

Lidocaine（JAN、INN）

(3) ステム

-caine : local anaesthetics

### 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-*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

Lidocaine : 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

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

#### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：66～69℃

#### (5) 酸塩基解離定数

pKa：7.9（25℃）

#### (6) 分配係数

2.9（n-heptane/pH7.4 緩衝液）

#### (7) その他の主な示性値

吸光度  $E_{1\text{cm}}^{1\%}$ （262nm）：14.6（乾燥後、50mg、メタノール、100mL）

施光度：なし

### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

	保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
長期保存試験	25℃ 60%RH	褐色瓶密栓	36 ヶ月間	変化なし

### 3. 有効成分の確認試験法

日局「リドカイン」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

### 4. 有効成分の定量法

日局「リドカイン」による。

比色滴定法



## 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：注射剤

規格：1mL 中、リドカイン塩酸塩 5mg (0.5%)、10mg (1%) を含有

性状：無色澄明の液

(2) 溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

キシロカイン注シリンジ	0.5%	1%
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

キシロカイン注シリンジ	0.5%	1%
1mL 中リドカイン塩酸塩	5mg	10mg
1 シリンジ (10mL) 中リドカイン塩酸塩	50mg	100mg

(2) 添加物

キシロカイン注シリンジ	0.5%	1%
1mL 中 塩化ナトリウム	8mg	6mg
pH 調整剤	適量	適量

(3) 電解質の濃度

$$\text{Na 当量} = \begin{matrix} (0.5\%) & (1\%) \\ 0.1 \text{ mEq/mL} & 0.1 \text{ mEq/mL} \end{matrix}$$

(4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

(5) その他

該当資料なし

### 3. 注射剤の調製法

該当資料なし

### 4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

#### IV. 製剤に関する項目

##### 5. 製剤の各種条件下における安定性

(試験項目：性状、pH、確認試験、エンドトキシン試験、無菌試験、実容量、不溶性異物検査、不溶性微粒子試験、定量)

加 速 試 験			結 果
保存条件	保存容器	保存期間	
40°C/75%RH	ポリプロピレン製 シリンジを ブリスター包装	6 ヶ月間	各項目ともほとんど変化を認めず安定である。

##### 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）

(参考) キシロカイン注射液 0.5%、1%でのデータ

浸透圧比及び pH 変動試験値〔試験方法<sup>a)</sup>〕

商品名	一般名または成分 単位/容量	規格 pH	試料 pH	0.1mol/L HCl (A) 0.1mol/L NaOH (B) mL	最終 pH または 変化点 pH	移動 指数	変化所見	浸透圧比*
キシロカイン 注射液 0.5%	リドカイン塩酸塩 100mg/20mL	5.0~7.0	6.8	(A) 10.0	1.3	5.5	変化なし	約 1
				(B) 10.0	12.4	5.6	変化なし	
キシロカイン 注射液 1%	リドカイン塩酸塩 200mg/20mL	5.0~7.0	6.8	(A) 10.0	1.3	5.5	変化なし	約 1
				(B) 1.1	7.7	0.9	白濁	

\*生理食塩液に対する比

##### 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。

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」による。

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**

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

キシロカイン注シリンジ 0.5%：硬膜外麻酔、伝達麻酔、浸潤麻酔

キシロカイン注シリンジ 1%：硬膜外麻酔、伝達麻酔、浸潤麻酔、表面麻酔

### 2. 用法及び用量

通常、成人に対してリドカイン塩酸塩として、1回 200mg（0.5%液 40mL、1%液 20mL）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。

（ ）内は注射液としての用量である。

麻酔方法	キシロカイン注シリンジ 0.5%	キシロカイン注シリンジ 1%
硬膜外麻酔	25～150mg (5～30mL)	100～200mg (10～20mL)
硬膜外麻酔 [交感神経遮断]	25～100mg (5～20mL)	—
伝達麻酔	15～200mg (3～40mL)	30～200mg (3～20mL)
伝達麻酔 [指趾神経遮断]	15～50mg (3～10mL)	30～100mg (3～10mL)
伝達麻酔 [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)
表面麻酔	—	適量を塗布又は噴霧する

### 3. 臨床成績

リドカイン塩酸塩は局所麻酔薬として長年にわたって繁用されている。

#### (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：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

アミド型局所麻酔薬（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：局所の神経線維

作用機序：リドカイン塩酸塩は、神経膜のナトリウムチャンネルをブロックし、神経における活動電位の伝導を可逆的に抑制し、知覚神経及び運動神経を遮断する局所麻酔薬である。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

麻酔効果・作用時間

1) リドカイン塩酸塩の表面・浸潤・伝達麻酔効果は、プロカイン塩酸塩よりも強く、作用持続時間はプロカイン塩酸塩よりも長い<sup>1) 2) 3) 4) 5) 6)</sup>。

2) 麻酔効果：モルモット脊髄硬膜外にリドカイン塩酸塩を投与したとき、リドカイン塩酸塩は速やかに運動神経を遮断し、その作用持続時間はアドレナリン添加により、約 1.3 倍に延長した<sup>7)</sup>。

生物学的同等性試験

キシロカイン注シリンジ 0.5%、1%の生物学的同等性試験

試験項目	動物種	投与量 投与経路	結果/成績
表面麻酔作用	モルモット	50 $\mu$ L 両眼	キシロカイン注シリンジ製剤とキシロカインポリアンブ製剤は薬理的に有効な表面麻酔作用を認め、その作用は生物学的に同等であった。
伝達麻酔作用	マウス	100 $\mu$ L 尾根部	キシロカイン注シリンジ製剤とキシロカインポリアンブ製剤は、伝達麻酔において薬理効果を認め、その作用は生物学的に同等であった。
浸潤麻酔作用	モルモット	0.2mL 背部	キシロカイン注シリンジ製剤とキシロカインポリアンブ製剤は、薬理的に有効な浸潤麻酔作用を認め、その作用は生物学的に同等であった。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

作用発現時間：

1% 0.1~0.4mL (健康人／表面麻酔) 10~45 秒<sup>8)</sup>

1% 15mL (外国人患者／硬膜外麻酔) 12.8 分<sup>9)</sup>

作用持続時間：

1% 0.1~0.4mL (健康人／表面麻酔) 6~25 分<sup>8)</sup>

1% 15mL (外国人患者／硬膜外麻酔) 89 分<sup>9)</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

該当しない

#### (2) 最高血中濃度到達時間

[外国人データ、硬膜外麻酔、単回投与]

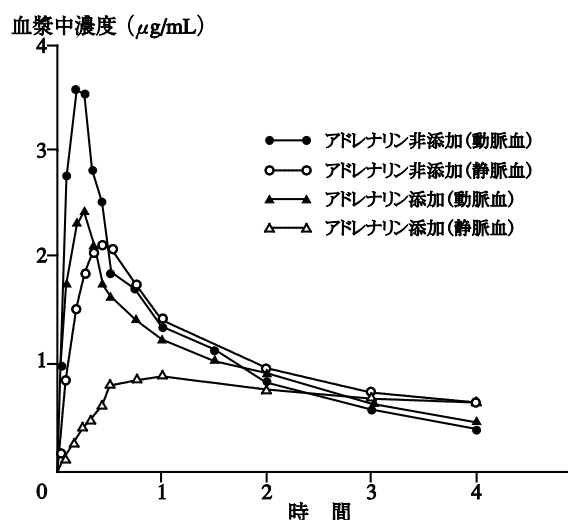
外国人健康成人に 2%リドカイン液 20mL (リドカイン塩酸塩として 400mg) \*を単独あるいはアドレナリンを添加 (1:200,000) して硬膜外投与したとき、動脈血における  $T_{max}$  は  $12 \pm 3$  分 (アドレナリン非添加)、 $25 \pm 4$  分 (アドレナリン添加) であった<sup>10)</sup>。

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 1) 単回投与

##### ① [外国人データ、硬膜外麻酔]

外国人健康成人に 2%リドカイン液 20mL (リドカイン塩酸塩として 400mg) \*を単独あるいはアドレナリンを添加 (1:200,000) して硬膜外投与したとき、アドレナリン添加時の血漿中濃度は、単独投与時に比べ最高濃度の有意な低下、最高濃度到達時間の有意な延長が認められた<sup>10)</sup>。



外国人健康成人に 2%リドカイン液 20mL を硬膜外投与したときの血漿中濃度 (n=5)

投与群	パラメータ	$C_{max}$ ( $\mu\text{g/mL}$ )	$T_{max}$ (min)	$AUC_{0\sim 4h}$ ( $\mu\text{g}\cdot\text{min/mL}$ )
アドレナリン非添加、動脈血		$3.7 \pm 0.5$	$12 \pm 3$	$274 \pm 19$
アドレナリン非添加、静脈血		$2.40 \pm 0.60$	$11 \pm 6$	$235 \pm 21$
アドレナリン添加、動脈血		$2.1 \pm 0.4$	$25 \pm 4$	$221 \pm 71$
アドレナリン添加、静脈血		$0.95 \pm 0.12$	$102 \pm 84$	$102 \pm 43$

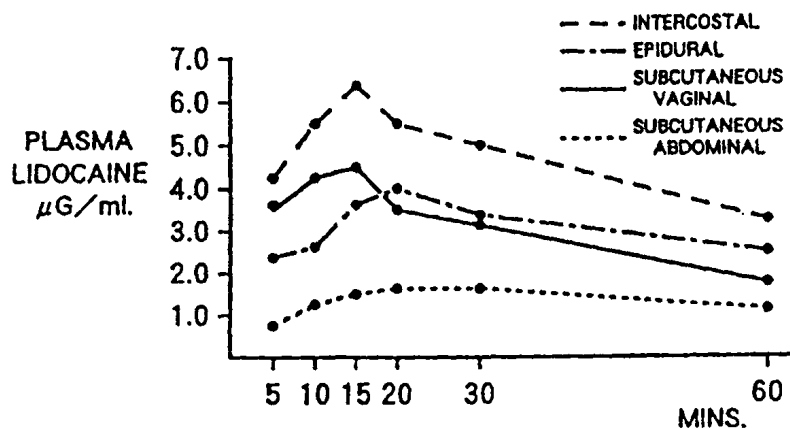
[平均値±標準偏差]

\*注) 本剤の用法及び用量は、「通常、成人に対してリドカイン塩酸塩として、1回 200mg 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。」である。  
キシロカイン注シリンジ 2%は、2013 年 3 月末経過措置終了

## VII. 薬物動態に関する項目

### ② [外国人データ、浸潤麻酔、伝達麻酔、硬膜外麻酔、単回投与]

患者にリドカイン塩酸塩 200mg を皮下注、硬膜外腔投与、あるいは肋間神経ブロックしたときの血漿中濃度は投与部位により差が認められた<sup>11)</sup>。



### 2) 高齢者 [外国人データ、静脈内投与]

高齢者にリドカイン塩酸塩 50mg を静脈内投与後の終末相半減期は 140 分を示し、若齢者の 81 分に比べて延長した<sup>12)</sup>。

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔 (キシロカイン注シリンジ 1%)、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔 (キシロカイン注シリンジ 0.5%、1%) である。

### 3) 臓器障害を有する患者 [外国人データ、静脈内投与]

外国人心不全患者及び腎不全患者にリドカイン塩酸塩 50mg を静脈内投与後の消失半減期は、健康人に比べ有意な変動はなく、肝機能低下患者では約 3 倍に延長した<sup>13)</sup>。

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔 (キシロカイン注シリンジ 1%)、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔 (キシロカイン注シリンジ 0.5%、1%) である。

### (4) 中毒域

5~10 μg/mL 以上

### (5) 食事・併用薬の影響

「VIII. -7. 相互作用」の項参照

### (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

[外国人データ、経口投与] 約 35%<sup>14)</sup>

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔 (キシロカイン注シリンジ 1%)、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔 (キシロカイン注シリンジ 0.5%、1%) である。



## (4) 消失速度定数

該当資料なし

## (5) クリアランス

[外国人データ、静脈内投与] 0.95 L/min<sup>15)</sup> 16)

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔（キシロカイン注シリンジ 1%）、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔（キシロカイン注シリンジ 0.5%、1%）である。

## (6) 分布容積

[外国人データ、静脈内投与] 91 L<sup>15)</sup> 16)

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔（キシロカイン注シリンジ 1%）、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔（キシロカイン注シリンジ 0.5%、1%）である。

## (7) 血漿蛋白結合率

[外国人データ]

リドカイン 2  $\mu$ g/mL の血漿蛋白結合率は約 65%で、 $\alpha_1$ -酸性糖蛋白及びアルブミンと結合する<sup>16)</sup>。なお、結合率は薬剤の血中濃度の上昇と pH の低下に伴い低下する<sup>17)</sup>。

## 3. 吸収

吸収部位：筋肉内、皮下、硬膜外腔、粘膜等

## 4. 分布

## (1) 血液－脳関門通過性

〈参考〉

イヌにリドカイン塩酸塩静脈内投与時の脳静脈、脳脊髄液中リドカイン濃度は、動脈血中濃度のピークに達する時間よりそれぞれ 2～4 分遅れてピークに達し、以後三者同様の減少経過をとり、血液－脳関門を容易に通過すると考えられる<sup>18)</sup>。

## (2) 血液－胎盤関門通過性

[外国人データ、硬膜外投与]

妊婦にリドカイン塩酸塩を硬膜外投与したとき、臍帯静脈血液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>15)</sup>。

## (3) 乳汁への移行性

[参考：硬膜外投与]

授乳期のヒト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 分後急速に低下した<sup>19)</sup>。

## (4) 髄液への移行性

〈参考〉

イヌにリドカイン塩酸塩を静脈内投与し、30 分後に動脈血と脳脊髄液を採取しガスクロマトグラフィーにより定量を行ったところ、脳脊髄液中濃度は血中濃度の 53.2±7.3%であった<sup>20)</sup>。

## (5) その他の組織への移行性

血球への分布 [外国人データ]

血液／血漿中濃度比は約 0.8 であることから、血球への分布は少ないと考えられる<sup>15)</sup>。

〈参考〉

- 1) (ラット 2mg/kg i.v.) 投与後速やかに血中から消失し、1分後には心、肺、脳、腎、脾、及び腸管に70%が存在し、3分後には筋肉にもかなり移行した。一方、臓器からの消失も速やかで、脂肪においても時間と共に蓄積する傾向は見られなかった<sup>21)</sup>。
- 2) (ラット 10mg/kg p.o.) 肝、腎などに高度に分布し、大部分の臓器では投与後30分に最高濃度を示すが、腸管では2~4時間後に最高となった<sup>22)</sup>。

## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

[外国人データ]

リドカインは、主として肝臓で N-脱エチル体 monoethyl glycinexylidide (MEGX) に代謝された後、芳香族の水酸化などにより glycinexylidide (GX)、2,6-xylidine に代謝され、投与量の約70%が4-hydroxy-2,6-xylidine として尿中に排泄される<sup>22)</sup>。

### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

主に CYP1A2、CY3A4 により代謝される<sup>23) 24) 25)</sup>。

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

[外国人データ] ヒト肝でのリドカインの初回通過効果は約70%である<sup>26)</sup>。

### (4) 代謝物の活性の有無及び比率

[外国人データ]

主な代謝物である monoethyl glycinexylidide (MEGX) はリドカインとほぼ同等の抗不整脈作用を示し、glycinexylidide (GX) の抗不整脈作用はリドカインの約1/10である<sup>27)</sup>。

[外国人データ]

外国人健康人に <sup>3</sup>H 標識リドカイン塩酸塩 250mg を経口投与し、0~24 時間集めた尿中代謝物及びその比率は下表のとおりであった<sup>22)</sup>。

リドカインとその代謝物	(%)
lidocaine	2.8
monoethyl glycinexylidide (MEGX)	3.7
glycinexylidide (GX)	2.3
3-hydroxylidocaine	1.1
3-hydroxy monoethyl glycinexylidide	0.3
2,6-xylidide	1.0
4-hydroxy-2,6-xylidine	72.6
合計	83.8

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔 (キシロカイン注シリンジ 1%)、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔 (キシロカイン注シリンジ 0.5%、1%) である。

### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

[外国人データ]

リドカイン塩酸塩 200mg 筋注時のリドカイン及び monoethyl glycinexylidide (MEGX) の C<sub>max</sub> 及び半減期は、それぞれ 1.25、0.18 μg/mL 及び 1.7、4.6 時間であった<sup>28)</sup>。

## 6. 排泄

### (1) 排泄部位及び経路

代謝物と極少量の未変化体が尿中へ排泄される<sup>22)</sup>。

### (2) 排泄率

[外国人データ]

<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>22)</sup>。

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔（キシロカイン注シリンジ 1%）、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔（キシロカイン注シリンジ 0.5%、1%）である。

### (3) 排泄速度

〈参考〉

ラット、モルモット、イヌにリドカイン塩酸塩を 10~20mg/kg 経口及び 5mg/kg 静脈内投与した結果、下表のとおり排泄された<sup>22)</sup>。

[－：測定データなし]

使用動物	投与経路、投与量	24hr 胆汁中	24hr 尿中	48hr 尿中
ラット	p.o. 10 mg/kg	28.5%	73.0%	90.0%
	i.v. 5 mg/kg	30.0%	65.2%	—
モルモット	p.o. 20 mg/kg	—	93.0%	96.7%
イヌ	p.o. 15 mg/kg	—	67.4%	71.0%
	i.v. 5 mg/kg	—	75.7%	80.9%

## 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

### (1) 腹膜透析

該当資料なし

### (2) 血液透析

透析でほとんど除去されない<sup>29) 30)</sup>。

### (3) 直接血液灌流

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	硬膜外 麻 酔	浸 潤 ・ 伝達麻酔	表 面 麻 酔
麻酔方法（○印は各麻酔方法での 該当する項目） [共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔）] 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	○	○	○
[硬膜外麻酔] (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。〕	○	—	—

### 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	硬膜外 麻 酔	浸 潤 ・ 伝達麻酔	表 面 麻 酔
麻酔方法（○印は各麻酔方法での 該当する項目） [共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔）] (1) 高齢者（「高齢者への投与」及び「重要な基本的注意」の項参 照） (2) 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） (3) 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。〕 (4) 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。〕	○	○	○
[硬膜外麻酔] (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患者〔硬膜外麻酔によ り病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。〕	○	—	—

項目	麻酔方法（○印は各麻酔方法での該当する項目）	硬膜外麻酔	浸潤・伝達麻酔	表面麻酔
(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。〕		○	—	—

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（○印は各麻酔方法での該当する項目）	硬膜外麻酔	浸潤・伝達麻酔	表面麻酔
[共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔）] (1) まれにショックあるいは中毒症状を起すことがあるので、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。 (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) できるだけ薄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) 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。 (3) 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。		○	○	○
[硬膜外麻酔] (1) 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) 必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。 2) 注射の速度はできるだけ遅くすること。 3) 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。 4) 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。 5) 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。		○	—	—

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

項 目	麻酔方法（○印は各麻酔方法での該当する項目）		
	硬膜外麻酔	浸潤・伝達麻酔	表面麻酔
(2) 注射針又はカテーテルが適切に位置していない等により、 <b>神経障害</b> 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。	○	—	—
<b>【伝達麻酔・浸潤麻酔】</b> (1) 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) 必要に応じて <b>血管収縮剤</b> の併用を考慮すること。 2) 注射の速度はできるだけ <b>遅く</b> すること。 3) 注射針が、 <b>血管又はくも膜下腔</b> に入っていないことを確かめること。 4) 血管の多い部位（頭部、顔面、扁桃等）に注射する場合には、 <b>吸収が速い</b> ので、できるだけ少量を投与すること。 (2) 注射針又はカテーテルが適切に位置していない等により、 <b>神経障害</b> 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。 (3) 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、必要最小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。	—	○	—
<b>【表面麻酔】</b> 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) 気道内表面麻酔の場合には <b>吸収が速い</b> ので、できるだけ少量を使用すること。 2) 外傷、びらん、潰瘍又は炎症部位への投与は <b>吸収が速い</b> ので注意すること。（「過量投与」の項参照）	—	—	○

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

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

使用成績調査等の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。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用		硬膜外麻酔	浸潤・伝達麻酔	表面麻酔
項目	麻酔方法（○印は各麻酔方法での該当する項目）			
[共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・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）				
[硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔]				
1) 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。		○	○	—
2) 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（ポルトワイン色尿）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
中枢神経 <sup>注1)</sup>	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈等	
消化器 <sup>注1)</sup>	悪心・嘔吐等	
過敏症	蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等	

注1) 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

使用成績調査等の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。

(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

使用成績調査等の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。

## VII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

本剤はアミド型局所麻酔薬に対し、過敏症の既往のある患者には投与しない。

（禁忌内容とその理由参照）

アナフィラキシーショック、蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等が現れることがある。

試験法：確立した方法はないが、局所麻酔薬投与前には十分に問診を行って投与することが重要である。

なお、一般的なアレルギーテスト方法として皮膚テスト（プリックテスト、スクラッチテスト、皮内テスト、パッチテスト）などがある。

### 9. 高齢者への投与

高齢者への投与				
項目	麻酔方法（○印は各麻酔方法での該当する項目）	硬膜外麻酔	浸潤・伝達麻酔	表面麻酔
	<b>[硬膜外麻酔]</b> 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等、慎重に投与すること。	○	—	—

### 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（○印は各麻酔方法での該当する項目）	硬膜外麻酔	浸潤・伝達麻酔	表面麻酔
	<b>[共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔）]</b> 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。〕	○	○	○
	<b>[硬膜外麻酔]</b> 妊産婦：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等、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）	○	—	—
	<b>[伝達麻酔]</b> 妊産婦：旁頸管ブロックにより胎児の徐脈を起こすおそれがある。	—	○ (伝達)	—

### 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

該当資料なし



### 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。

#### （解説）

- (1) ポルフィリン症患者において、薬剤投与によりポルフィリン症の急性症状（急性腹症、四肢麻痺、意識障害等）が誘発されることが報告されている。誘発要因となる薬剤として局所麻酔剤も報告されており<sup>31)</sup>、CCDS（Company Core Data Sheet：企業中核データシート）にポルフィリン症患者への投与に関する注意が追記されたため記載した。
- (2) 北米において、肩関節手術後にペインポンプを用いて局所麻酔薬を関節内に持続注入した患者において軟骨融解を発現した症例が集積されたことから、2009年にカナダ及び米国の規制当局（Health Canada、FDA）はそのリスクについて注意喚起を行い、さらに米国添付文書を改訂するよう指示を行った。これらの措置を受け、アストラゼネカ英国本社は、局所麻酔薬のCCDS（Company Core Data Sheet：企業中核データシート）にこれらの薬剤を関節内に持続投与することは適応外であるとの記載を追記した。国内においては、2011年4月末時点で関節内持続投与による軟骨融解の報告はない。また術後の軟骨融解発現には薬剤以外の複数の要因も考えられるため、これら局所麻酔薬と軟骨融解との因果関係は明らかではないが、軟骨融解は障害につながる病態であることから、日本国内においても注意喚起すべきと判断し、記載した。

### 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

家兎への静脈内投与において、リドカイン塩酸塩 0.1～1mg/kg の少量では血圧には変化を起こさないか軽度上昇で呼吸を興奮、5～10mg/kg の中等量では血圧下降と呼吸の抑制後興奮、大量では血圧下降、心臓抑制を起こす<sup>4)</sup>。

(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

投与経路	LD50 (mg/kg)			
	使用動物	マウス	ラット	ウサギ
i.v. <sup>2) 32) 33) 34)</sup>		25～48	約 25	25.6
s.c. <sup>2) 34)</sup>		270～390	—	—
p.o. <sup>2) 34)</sup>		520	—	—

中毒症状：(マウス i.v.) 死亡例の殆どは痙攣及び呼吸麻痺であった。

(2) 反復投与毒性試験

1) 亜急性毒性

雌雄のビーグル犬（1群各2匹）にリドカイン塩酸塩 2mg/kg、4mg/kg および 8mg/kg を1ヵ月間静脈内投与した。薬物投与後の全身状態は 2mg/kg 投与群では異常はなかったが、4mg/kg 以上の投与群では一過性の歩行障害および横臥、伏臥状態などがみられた。体重は 8mg/kg 投与群の1例でやや低下した以外には異常はみられなかった。薬物投与期間中の尿検査、血液学的検査、血液の臨床化学的検査および心電図、薬物投与終了後の剖検、臓器重量および病理組織学的検査では薬物によると思われる変化は認められなかった<sup>34)</sup>。

2) 慢性毒性

雌雄のビーグル犬（1群各3匹）にリドカイン塩酸塩 10mg/kg、30mg/kg および 50～60mg/kg を6ヵ月間経口投与した。なお、各群2匹は薬物投与終了後2ヵ月間飼育した。10mg/kg 投与群では薬物によると思われる異常所見は認められなかった。30mg/kg 以上の投与群では嘔吐および鎮静作用がみられ、摂餌量および体重の減少がみられた。血液学的検査および尿検査に異常はみられなかったが、肝機能検査で BSP 排泄の低下がみられ、また 50～60mg/kg 投与群では肝細胞の脂肪変性がみられた。しかし、薬物投与の中止により回復した。その他には薬物によると思われる異常所見は認められなかった<sup>34)</sup>。

(3) 生殖発生毒性試験

ラットにリドカイン塩酸塩 10mg/kg および 30mg/kg を 8 ヶ月間皮下投与した結果、リドカイン塩酸塩の投与により、その仔に奇形を惹起することはなかった<sup>34)</sup>。

(4) その他の特殊毒性

1) 溶血性

リドカイン注 0.5%、1%及び2%\*の3剤につき赤石らの法、ベンジジン法、溶血度測定法の3方法で溶血性をみた実験では、いずれの方法においても、3剤共溶血性は(－)であった<sup>35)</sup>。

2) 組織障害性、局所刺激性

生食を対照に、ラット大腿部にリドカイン塩酸塩筋注時の組織障害及び刺激性について、病理組織学的に検討した実験では、生食同様筋束の退化及び壊死はみられなかった<sup>36)</sup>。

in vitro で抗コリン、抗ヒスタミン作用を見た実験<sup>1)</sup>、及び結膜下滴下、皮内・皮下、前房内投与により局所刺激作用を見た実験<sup>37)</sup>では、殆どリドカインによる作用はみられなかった。

\*注) キシロカイン注シリンジ2%は、2013年3月末経過措置終了

## 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：製造後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) 薬局での取扱い上の留意点について

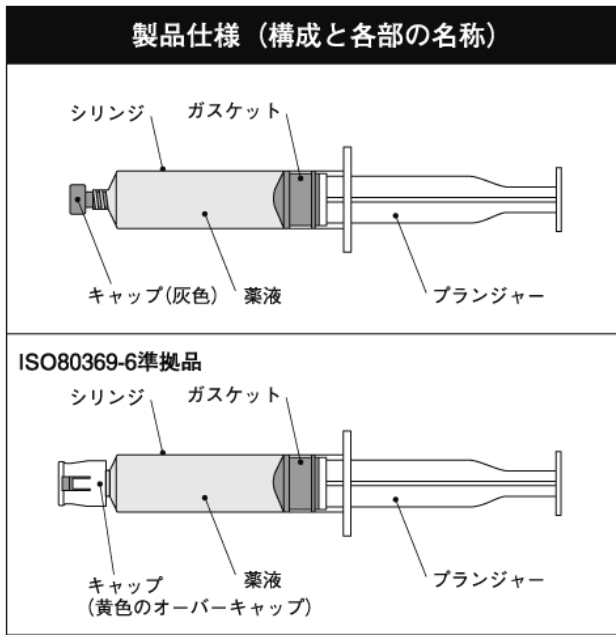
- ・ブリストア包装は高圧蒸気滅菌済みであるため、使用時まで開封しないこと。
- ・シリンジに破損等の異常が認められるときは使用しないこと。
- ・シリンジが破損するおそれがあるため、強い衝撃を避けること。
- ・開封後は直ちに使用し、残液は廃棄すること。また、シリンジの再滅菌・再使用はしないこと。

#### (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）

該当しない

#### (3) 調剤時の留意点について

- ・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。
- ・本シリンジを高圧自動注入装置及び極端な陰圧が発生する回路には使用しないこと。〔破損等のおそれがある。〕
- ・ISO80369-6 準拠品は、シリンジに貼付したラベル、ブリストア包装蓋部、個装箱に、ISO80369-6 準拠品の表示がある。
- ・本剤の使用にあたっては、接続する医療機器のコネクタ形状を確認すること。本剤の ISO 規格と医療機器の ISO 規格が一致した場合にのみ接続可能である。
- ・本剤の容器（シリンジ）の使用方法については下記「本剤の使用方法」を参照すること。



ISO80369-6準拠品はキャップの形状及び色が異なります。

#### 「本剤の使用方法」

1. ブリスター包装を開封する。  
2つの“開封口”からシールをゆっくり剥がしながら開封する。  
注意：ブリスター包装は使用時まで開封しないこと。
2. シリンジを取り出す。  
注意：プランジャーを持って引き出さないこと。〔ガスケットが変形し、プランジャーが外れたり、薬液が漏出するおそれがある。〕
3. シリンジ先端のゴムキャップをゆっくり回転させながら外す。〔薬液が飛び散るおそれがある。〕  
注意：キャップを外した後、シリンジ先端部に触れないこと。
4. 注射針等に接続し、シリンジ内の空気を除去後、薬液を注入する。  
カテーテルに接続する場合は、シリンジ内の空気を除去後、カテーテルに接続し、薬液を注入する。  
注意：プランジャーは回さないこと。〔外れるおそれがある。〕

#### 5. 承認条件等

該当しない

#### 6. 包装

キシロカイン注シリンジ 0.5%	10mL×10 シリンジ 10mL×10 シリンジ [ISO80369-6 準拠品]
キシロカイン注シリンジ 1%	10mL×10 シリンジ 10mL×10 シリンジ [ISO80369-6 準拠品]

#### 7. 容器の材質

ポリプロピレン

## X. 管理的事項に関する項目

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：キシロカイン注射液、キシロカイン注ポリアンプ

同効薬：メピバカイン塩酸塩、プロカイン塩酸塩、プロピトカイン塩酸塩  
ジブカイン塩酸塩、ブピバカイン塩酸塩、レボブピバカイン塩酸塩  
ロピバカイン塩酸塩

### 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

	製造販売承認年月日	承認番号
キシロカイン注シリンジ 0.5%	2005年3月8日	21700AMZ00410000
キシロカイン注シリンジ 1%	2005年3月8日	21700AMZ00411000

### 11. 薬価基準収載年月日

2005年7月8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。

### 16. 各種コード

販売名	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
キシロカイン注シリンジ 0.5%	116981203	1214400G1025	620002936
キシロカイン注シリンジ 1%	116982903	1214400G2021	620002937

### 17. 保険給付上の注意

特になし

# X I . 文 献

## 1. 引用文献

- 1) Wiedling, S.: Anaesthetist, 1 119 (1952)
- 2) Wiedling, S.: Acta Pharmacol. Toxicol., 8 117 (1952)
- 3) 円谷福男: 麻酔, 6 357 (1957)
- 4) 植木昭和ほか: 福岡医学雑誌, 51 1361 (1960)
- 5) Krantz, J.C.: J. Pharmacol. Exp. Ther., 111 224 (1954)
- 6) Truant, A.P.: Arch. Int. Pharmacodyn., 115 483 (1958)
- 7) Åkerman, B., et al.: Acta Anaesthesiol. Scand., 32 571 (1988)
- 8) 生井浩ほか: 眼科臨床医報, 50 129 (1956)
- 9) Eriksson, E.: Acta. Chir. Scand., (Suppl 358) 10 (1966)
- 10) Mather, L.E., et al.: Br. J. Anaesth., 48 989 (1976)
- 11) Ed. Scott, D.B. & Julian, D.G.: "Lidocaine in the treatment of ventricular arrhythmias" Livingstone Edinburgh, pp.153 (1971)
- 12) Nation, R.L., et al.: Br. J. Clin. Pharmacol., 4 439 (1977)
- 13) Thomson, P.D.: Ann. Intern. Med., 78 499 (1973)
- 14) MARTINDALE The Extra Pharmacopoeia 38<sup>th</sup> ed., pp.1988 (2014)
- 15) Burm, A.G.L.: Clin. Pharmacokinet., 16 283 (1989)
- 16) Tucker, G.T.: "Neural blockade in clinical anesthesia and management of pain 2<sup>nd</sup> ed." Philadelphia, pp.80 (1988)
- 17) 西村清司ほか: 麻酔, 24 245 (1975)
- 18) 坂部武史ほか: 麻酔, 23 1002 (1974)
- 19) 藤井文夫ほか: 臨床麻酔, 17 1387 (1993)
- 20) 西村清司ほか: 麻酔, 23 1003 (1974)
- 21) Katz, J.: Anesthesiology, 29 249 (1968)
- 22) Keenaghan, J.B., et al.: J. Pharmacol. Exp. Ther., 180 454 (1972)
- 23) Bargetzi, M.J.: Clin. Pharmacol. Ther., 46 521 (1989)
- 24) Orlando, R., et al.: Clinical Pharmacology and Therapeutics, 75 80 (2004)
- 25) Wang, J.S., et al.: Drug Metabolism and Disposition 28 (8) 959 (2000)
- 26) Stenson, R.E., et al.: Circulation, 43 205 (1971)
- 27) Burney, R.G., et al.: Am. Heart J., 88 765 (1974)
- 28) Adjepon-Yamoah, K.K., et al.: Br. J. Pharmacol, 47 672 (1973)
- 29) 吉本恵子ほか: 日本透析療法学会抄録, 286 (1988)
- 30) USP DI 19<sup>th</sup> ed., pp.1861 (1999)
- 31) Disler P.B. et al.: Clin. Dermatol., 3 (2) , 112 (1985)
- 32) Ulfendahl, H.R.: Acta Anaesthesiol. Scand., 1 81 (1957)
- 33) Hunter, A.R.: Br. J. Anaesthesia., 23 153 (1951)
- 34) 社内資料 (急性毒性試験, 亜急性及び慢性毒性試験, 催奇形作用)
- 35) 清水克祐ほか: 月刊薬事, 17 136 (1975)
- 36) Mannheim, W. et al.: JAMA, 154 29 (1954)
- 37) Tait, C.A., et al.: South. Med. J., 51 358 (1958)

## 2. その他の参考文献

- a) 幸保文吉: JNHPA 10 (2-3) (1974)

## X II. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

リドカインはイギリス、フランス、ドイツ、スウェーデン、カナダ、オーストラリア等で発売されている。  
(2017年6月現在)

### 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





販 売  
**サンド株式会社**  
東京都港区虎ノ門1-23-1  
URL:<https://www.sandoz.jp/>



製造販売 ニプロ株式会社  
大阪市北区本庄西3丁目9番3号