

2009年6月（改訂第8版）

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（1998年9月）に準拠して作成

劇薬、処方せん医薬品

脊椎麻酔剤

キシロカイン[®] 注射液「3%」

リドカイン塩酸塩注射剤

Xylocaine[®] Injection 3%

剤形	注射剤
規格・含量	1mL中 リドカイン塩酸塩 30mgを含有
一般名	和名：リドカイン（JAN） 洋名：Lidocaine（JAN、INN）
製造・輸入承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造承認年月日：1956年11月13日 薬価基準収載年月日：1958年4月1日 発売年月日：1957年2月
開発・製造・ 輸入・発売・提携・ 販売会社名	製造販売元：アストラゼネカ株式会社
担当者の連絡先 電話番号・FAX番号	

本 IF は 2009 年 6 月改訂の添付文書の改訂に基づき作成した。

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

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR と略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和 63 年日本病院薬剤師会（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）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成 10 年日病薬学術第 3 小委員会によって新たな位置付けと IF 記載要領が策定された。

2. IF とは

IF は「医療用医薬品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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報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。

3. IF の様式・作成・発行

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で記載し、印刷は一色刷りとす。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IF は日病薬が策定した「IF 記載要領」に従って記載するが、本 IF 記載要領は、平成 11 年 1 月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF 記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合には IF が改訂・発行される。

4. IF の利用にあたって

IF の策定の原点を踏まえ、MR へのインタビュー、自己調査のデータを加えて IF の内容を充実させ、IF の利用性を高めておく必要がある。

MR へのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆・整備する。そのための参考として、表紙の下段に IF 作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全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」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

目 次

I. 概要に関する項目	1	4. 分布	10
1. 開発の経緯	1	5. 代謝	11
2. 製品の特徴及び有用性	1	6. 排泄	12
II. 名称に関する項目	2	7. 透析等による除去率	13
1. 販売名	2	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 ..	14
2. 一般名	2	1. 警告内容とその理由	14
3. 構造式又は示性式	2	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） ..	14
4. 分子式及び分子量	2	3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理	14
5. 化学名（命名法）	2	由	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理	14
7. CAS登録番号	2	由	14
III. 有効成分に関する項目	3	5. 慎重投与内容とその理由	14
1. 有効成分の規制区分	3	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15
2. 物理化学的性質	3		15
3. 有効成分の各種条件下における安定性 ...	3	7. 相互作用	16
4. 有効成分の確認試験法	3	8. 副作用	17
5. 有効成分の定量法	3	9. 高齢者への投与	18
IV. 製剤に関する項目	4	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	18
1. 剤形	4	11. 小児等への投与	18
2. 製剤の組成	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	18
3. 製剤の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	19
4. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	5	14. 適用上の注意及び薬剤交付時の注意（患者等	19
5. 電解質の濃度	5	に留意すべき必須事項等）	19
6. 混入する可能性のある夾雑物	5	15. その他の注意	19
7. 製剤中の有効成分の確認試験法	5	16. その他	19
8. 製剤中の有効成分の定量法	5	IX. 非臨床試験に関する項目	20
9. 容器の材質	5	1. 一般薬理	20
V. 治療に関する項目	6	2. 毒性	20
1. 効能又は効果	6	X. 取扱い上の注意、包装、承認等に関する項目	22
2. 用法及び用量	6		22
3. 臨床成績	6	1. 有効期間又は使用期限	22
VI. 薬効薬理に関する項目	8	2. 貯法・保存条件	22
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 ..	8	3. 薬剤取扱い上の注意点	22
2. 薬理作用	8	4. 承認条件	22
VII. 薬物動態に関する項目	9	5. 包装	22
1. 血中濃度の推移・測定法	9	6. 同一成分・同効薬	22
2. 薬物速度論的パラメータ	10	7. 国際誕生年月日	22
3. 吸収	10		

8. 製造・輸入承認年月日・承認番号	22
9. 薬価基準収載年月日	22
10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	22
11. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	23
12. 再審査期間	23
13. 長期投与の可否	23
14. 厚生省薬価基準収載医薬品コード	23
15. 保険給付上の注意	23
XI. 文献	24
1. 引用文献	24
2. その他の参考文献	24
XII. 参考資料	25
XIII. 備考	26

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）がその製品を発売するに至った。

2. 製品の特徴及び有用性

- (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) 本剤は短時間作用型の高比重脊椎麻酔製剤である。
- (3) 重大な副作用として、ショック及び振戦、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。（尚、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、副作用の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®注射液「3%」

(2) 洋名

Xylocaine® Injection 3%

(3) 名称の由来

不明

2. 一般名

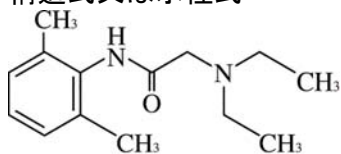
(1) 和名（命名法）

リドカイン（JAN）

(2) 洋名（命名法）

Lidocaine（JAN、INN）

3. 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

Lidocaine:137-58-6

Lidocaine hydrochloride:6108-05-0

III.有効成分に関する項目

1. 有効成分の規制区分

劇薬

2. 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/pH 7.4 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

3. 有効成分の各種条件下における安定性

(試験項目：外観、色調、含量)

保 存 条 件			結 果
室温	褐色瓶密栓	60 カ月間	各項目ともほとんど変化を認めず安定である。

4. 有効成分の確認試験法

日局「リドカイン」による。

(1)吸光度測定法

(2)赤外線吸収スペクトル測定法

5. 有効成分の定量法

日局「リドカイン」による。

非水滴定法

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：注射剤

規格：ガラスアンプル 1mL 中、リドカイン塩酸塩 30 mgを含有

性状：無色～微黄色澄明の液

(2)溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

pH : 6.2～6.7

浸透圧比（生理食塩液に対する比）：約 3

比重（ d_4^{20} ）：1.030～1.035

(3)注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

窒素置換

2. 製剤の組成

(1)有効成分（活性成分）の含量

1mL 中	リドカイン塩酸塩 30mg
1 管 3.5mL 中	リドカイン塩酸塩 105mg

（リドカインに塩酸を加え、リドカイン塩酸塩とする）

(2)添加物

1mL 中	ブドウ糖 82mg 炭酸水素 Na 0.03mg pH 調整剤 適量
1 管 3.5mL 中	ブドウ糖 287mg 炭酸水素 Na 0.105mg pH 調整剤 適量

3. 製剤の各種条件下における安定性

（試験項目：外観、pH、含量）

保 存 条 件			結 果
室内散光	無色透明アンプル 密 封	3 カ月間	各項目ともほとんど変化を認めず安定である。
40℃	無色透明アンプル 密 封	6 カ月間	外観がわずかに黄色を帯びる他は、ほとんど変化を認めない。
室 温	無色透明アンプル 密 封	36 カ月間	各項目ともほとんど変化を認めず安定である。

4. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

浸透圧比及び pH 変動試験値〔試験方法^{XI. 2-1)}〕

一般名または成分 単位/容量	規格 pH	試料 pH	1/10N HCl (A) 1/10N 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*
リトカイン塩酸塩 105mg/3.5mL	6.2～6.7	6.6	(A) 10.0	1.2	5.4	変化なし	約 3
			(B) 0.91	7.2	0.6	白 濁	

*生理食塩液に対する比

5. 電解質の濃度

Na 当量 = 0.0004 mEq/mL

6. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

7. 製剤中の有効成分の確認試験法

薄層クロマトグラフィー

8. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

9. 容器の材質

無色透明ガラスアンプル (ワンポイントカット)

V.治療に関する項目

1. 効能又は効果

脊椎麻酔（腰椎麻酔）

2. 用法及び用量

リドカイン塩酸塩として、通常成人中位麻酔には60～80mg（2.0～2.7mL）、高位麻酔には80～100mg（2.7～3.3mL）、鞍状麻酔には40～50mg（1.3～1.7mL）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。

〈使用方法〉（ ）内：リドカイン塩酸塩としての用量

領域	麻酔方法	用量（液量）	麻酔の上界	適 応
婦人科 領 域	鞍状麻酔	1.3～1.7mL (40～50mg)	仙髄節	会陰部等の手術、膣の手術等、 無痛分娩
外 科 領 域	高位麻酔	2.7～3.3mL (80～100mg)	T ₄ （乳嘴の高さ）	上腹部、すなわち胆嚢、胃等の 手術
	中位麻酔	2.0～2.7mL (60～80mg)	T ₆ （剣状突起の高さ）	イレウス、虫垂切除等の手術
	鞍状麻酔	1.3～1.7mL (40～50mg)	仙髄節	大腿内側及び会陰部等の局限 した部分、すなわち直腸、肛門、 陰嚢、陰茎等の手術

3. 臨床成績

(1)臨床効果

該当資料なし

(2)臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(3)探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(4)検証的試験

1)無作為化平行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

下腹部手術 59 例、肛門部手術 20 例について、0.3%ジブカイン高比重液を対照とし本剤の脊椎麻酔の効果を二重盲検法により比較した結果、ジブカインと比べ本剤は有意に麻酔の発現時間が早く十分な麻酔の広がりが見られた。また持続時間については有意差はなかったが本剤の方が短かった（平均値：リドカイン 74 分、ジブカイン 101 分）。総合判定では、本剤は 25 例全例に有効であったが、ジブカインで 28 例中 7 例に無効例がみられた¹⁾。

3) 安全性試験

[参考：外国人データ]

手術患者 10,440 症例に 5%リドカイン液*を用いて脊椎麻酔を施行した結果、クモ膜炎、馬尾症候群のような主要な中枢神経性障害はなく、頭痛（3.5%）、背部痛（2.7%）、一時的末梢神経症状、一時的外転麻痺などの脊椎麻酔に伴う副作用がみられた。これらの結果より、リドカインは他の脊椎麻酔薬と同様に安全に使用できることが確認された²⁾。

*注）国内で販売されている脊椎麻酔剤キシロカイン注射液は、3%リドカイン液である。

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(5) 治療的使用

1) 使用成績調査・特別調査・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

該当資料なし

VI.薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

アミド型局所麻酔剤（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

作用時間：マウス脊髄クモ膜下にリドカイン塩酸塩を投与したとき、リドカイン塩酸塩の作用発現時間は、メピバカイン塩酸塩よりも早く、その作用持続時間はメピバカイン塩酸塩とほぼ同程度であった³⁾。

(参考)

作用発現時間： 3分以内⁴⁾

作用持続時間： 50～140分⁴⁾

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

[参考：外国人データ、単回投与]

外国人手術患者に5%リドカイン液*1.5mL（リドカイン塩酸塩として75mg）を用い、脊椎麻酔したとき、血漿中濃度は投与後約15分で最高濃度に達した⁵⁾。

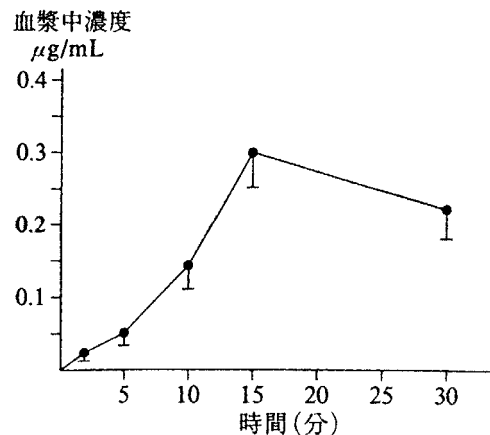
*注）国内で販売されている脊椎麻酔用キシロカイン注射液は、3%リドカイン液である。

(3)通常用量での血中濃度

1)単回投与 [参考：外国人データ]

外国人手術患者に5%リドカイン液*1.5mL（リドカイン塩酸塩として75mg）を用い脊椎麻酔したとき、血漿中濃度は投与後約15分で最高濃度（ $0.32 \pm 0.07 \mu\text{g/mL}$ ）に達し、その後消失した⁵⁾。

*国内で販売されている脊椎麻酔用キシロカイン注射液は、3%リドカイン液である。



(平均値±標準誤差, n=10)

2)高齢者 [参考：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分比べて延長した⁶⁾。

注）本剤の承認されている効能又は効果は、脊椎麻酔（腰椎麻酔）である。

3)臓器障害を有する患者 [参考：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⁷⁾。

注）本剤の承認されている効能又は効果は、脊椎麻酔（腰椎麻酔）である。

(4)中毒症状を発現する血中濃度

5～10 $\mu\text{g/mL}$ 以上

2. 薬物速度論的パラメータ

(1)吸収速度定数

該当資料なし

(2)バイオアベイラビリティ

[参考：外国人データ、経口投与] 約 35%⁸⁾

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、脊椎麻酔（腰椎麻酔）である。

(3)消失速度定数

該当資料なし

(4)クリアランス

[参考：外国人データ、静脈内投与] 0.95 L/min⁹⁾

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、脊椎麻酔（腰椎麻酔）である。

(5)分布容積

[参考：外国人データ、静脈内投与] 91 L⁹⁾

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、脊椎麻酔（腰椎麻酔）である。

(6)血漿蛋白結合率

[参考：外国人データ]

リドカイン 2 μ g/mL の血漿蛋白結合率は約 65% で、 α_1 -酸性糖蛋白 及び アルブミン と結合する⁸⁾。
なお、結合率は薬剤の血中濃度の増加と pH の低下に伴い低下する¹⁰⁾。

3. 吸収

吸収部位：くも膜下腔

4. 分布

(1)血液－脳関門通過性

〈参考〉

イヌにリドカインを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¹¹⁾。

(2)胎児への移行性

[参考：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⁹⁾。

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、脊椎麻酔（腰椎麻酔）である。

(3)乳汁中への移行性

[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¹²⁾。

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、脊椎麻酔（腰椎麻酔）である。

(4)髄液への移行性

〈参考〉

イヌにリドカインを静脈内投与し、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 $53.2 \pm 7.3\%$ であった¹³⁾。

(5)その他の組織への移行性

血球への分布 [参考：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⁸⁾。

〈参考〉

- 1) (ラット i. v. 2 mg/kg) 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¹⁴⁾。
- 2) (ラット p. o. 10 mg/kg) 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¹⁵⁾。

5. 代謝

(1)代謝部位及び代謝経路

[参考：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¹⁵⁾。

(2)代謝に関する酵素（CYP450）の分子種

主に CYP3A4 及び CYP1A2 により代謝される^{16) 25) 26)}。

(3)初回通過効果の有無及びその割合

[参考：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¹⁷⁾。

(4)代謝物の活性の有無及び比率

[参考：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¹⁸⁾。

[参考：外国人データ]

外国人健康人に³H標識リドカイン塩酸塩250mg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¹⁵⁾。

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、脊椎麻酔（腰椎麻酔）である。

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

(5)活性代謝物の速度論的パラメータ

[参考：外国人データ]

リドカイン塩酸塩 200 mg筋注時のリドカイン及び monoethyl glycinexylidide (MEGX) の C_{max} 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¹⁹⁾。

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、脊椎麻酔（腰椎麻酔）である。

6. 排泄

(1)排泄部位

代謝物と極少量の未変化体が尿中へ排泄される。

(2)排泄率

[参考：外国人データ]

³H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¹⁵⁾。

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、脊椎麻酔（腰椎麻酔）である。

(3)排泄速度

〈参考〉

ラット、モルモット、イヌにリドカインを10～20mg/kg経口及び5 mg/kg静脈内投与した結果、下表のとおり排泄された¹⁵⁾。

[－：測定データなし]

対 象	投与経路	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. 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²⁰⁾²¹⁾。

(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）

- (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。〕
- (4) 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
- (5) 中枢神経系疾患：髄膜炎、灰白脊髄炎、脊髄ろう等の患者〔脊椎麻酔により症状が悪化することがある。〕
- (6) 脊椎に結核、脊椎炎および転移性腫瘍等の活動性疾患のある患者〔脊椎麻酔により症状が悪化することがある。〕

3. 効能・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・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）

- (1) 脊柱管狭窄、又は外傷性の脊柱変形のある患者〔脊椎麻酔により神経障害があらわれることがある。〕（「重要な基本的注意」の項参照）
- (2) 高齢者（「高齢者への投与」及び「重要な基本的注意」の項参照）
- (3) 妊産婦（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」及び「重要な基本的注意」の項参照）
- (4) 若年者〔麻酔範囲が広がりやすいとの報告があるので、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。〕（「重要な基本的注意」の項参照）
- (5) 腹部腫瘍のある患者〔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。〕（「重要な基本的注意」の項参照）
- (6) 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。〕
- (7) 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〔脊椎麻酔により循環動態が急変しやすく、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。〕（「重要な基本的注意」の項参照）
- (8) 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。]
(「重要な基本的注意」の項参照)

(9) 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)

(10) 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。〕

(11) 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。〕

(12) 神経学的疾患：多発性硬化症、運動麻痺、神経筋疾患等のある患者〔症状が悪化することがある。〕

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

(1) 脊柱管狭窄、又は外傷性の脊柱変形のある患者においては、脊椎麻酔により神経障害があらわれることがあるので、治療上やむを得ないと判断される場合を除き、使用は避けること。

(2) 本剤の投与に際しては、全身麻酔と同様に患者の全身管理が必要であるので、検査、問診等により予め患者の全身状態を把握しておくこと。

(3) 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、本剤の投与に際しては、常時直ちに**救急処置**のとれる準備をしておくとともに、予め**静脈路の確保**を行うこと。

(4) 脊椎麻酔により血圧低下、徐脈等の副作用があらわれやすく、**麻酔範囲が高位**に及ぶと重篤な副作用につながるがあるので、本剤の投与に際しては、次の諸点に十分留意すること。

1) 麻酔範囲が高位に及んだ場合、過度の血圧低下、徐脈、呼吸抑制さらには心停止となるおそれがあるので、**必要最少量**を投与するとともに、**麻酔高**に十分注意すること。

2) 麻酔中は、連続的に**バイタルサイン**（血圧、心拍数、呼吸数等）及び**動脈血酸素飽和度**（パルスオキシメーター等）の測定を行うとともに、患者の全身状態の観察を十分に行い、さらに手術が終了しても**麻酔が完全に消失**するまでバイタルサイン及び患者の**全身状態の観察**を必要に応じて頻回に行うこと。異常が認められた場合は適切な処置を行うこと。

3) 本剤注入後に急激に体位を変換すると麻酔範囲が高位に及ぶことがあるので、**体位を変換**する場合はゆっくり行うこと。

4) 手術終了後の患者の帰室時には、少なくともバイタルサインが正常であることを確認するとともに、**帰室後**も麻酔の効果が完全に消失するまで患者の全身状態の観察を必要に応じて頻回に行うこと。

5) **臍部以上**の部位の手術に用いる必要がある場合は慎重に投与すること。

6) 本剤の比重は一定に調製されているが、患者の**脳脊髄液の比重**にはかなりの変動があることに留意すること。

(5) 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。

- (6) 脊椎麻酔により、まれに**知覚異常、膀胱直腸障害、麻痺等の脊髄神経障害**があらわれることがあるので、穿刺に際して患者が放散痛を訴えた場合、脳脊髄液が吸引しにくい場合又は血液混入を認めた場合は本剤を注入しないこと。
- (7) 髄液の流出を最小限にとどめるため、できるだけ**細い脊椎穿刺針**（25G程度）を用いること。
〔脊椎穿刺により脊椎麻酔後頭痛が、また、まれに一過性の外転神経麻痺等があらわれることがある。なお、このような症状があらわれた場合には輸液投与を行う等適切な処置を行うこと。〕

7. 相互作用

本剤は、主として肝代謝酵素 CYP 1A2 及び CYP 3A4 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

併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アミド型局所麻酔剤	中毒症状が相加的に起こるおそれがある。	他の局所麻酔剤との併用で中毒症状が相加的に起こることが考えられる。
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。	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。

1) 重大な副作用と初期症状

- 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**振戦、痙攣**：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は、直ちに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）の投与等の適切な処置を行うこと。（「過量投与」の項参照）
- ③**異常感覚、知覚・運動障害**：注射針の留置時に神経（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、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。
- ④**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 ^{注1)}	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈等
消化器 ^{注1)}	悪心・嘔吐等
循環器	血圧低下、徐脈等
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。

(2) 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。

該当資料なし

(3) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等の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。

該当資料なし

(4) 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剤に対し、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(4)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、局所麻酔剤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

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、「重要な基本的注意(3)」の項に示すとおり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

- (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。〕
- (2) 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。〕（「重要な基本的注意(3)」の項参照）

11. 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

一般的に局所麻酔剤の過量投与や血管内誤注入等による血中濃度の上昇に伴い、中毒症状が発現するとされている。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. 適用上の注意及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

適用上の注意

アンプルカット時：ガラス微小片の混入を避けるため、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

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

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³¹⁾、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。

16. その他

該当しない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 一般薬理

家兎への静脈内投与において、リドカイン塩酸塩0.1～1 mg/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²²⁾。

2. 毒性

(1) 単回投与毒性

急性毒性

LD ₅₀ (mg/kg)		[－；測定データなし]		
投与経路	使用動物	マウス	ラット	ウサギ
i. v. ^{23) 24) 30)}		25～48	約 25	25.6
s. c. ²³⁾		270～390	—	—
p. o. ²³⁾		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

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2 mg/kg、4 mg/kgおよび8 mg/kgを1か月間静脈内投与した。薬物投与後の全身状態は2 mg/kg投与群では異常はなかったが、4 mg/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8 mg/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。

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か月間経口投与した。なお、各群2匹は薬物投与終了後2か月間飼育した。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。

(3) 生殖発生毒性

ラットにリドカイン塩酸塩10mg/kgおよび30mg/kgを8か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。

(4)その他の特殊毒性

1)溶血性

リドカイン注射液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²⁷⁾。

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²⁸⁾。

in vitroで抗Ach、抗ヒスタミン作用を見た実験及び、点眼、皮内・皮下、前房内注により局所刺激作用を見た実験では、殆どリドカインによる作用はみられなかった²⁹⁾。

X. 取扱い上の注意、包装、承認等に関する項目

1. 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）

2. 貯法・保存条件

室温保存

3. 薬剤取扱い上の注意点

＜規制区分＞

劇薬

処方せん医薬品：注意－医師の処方せんにより使用すること。

＜取扱い上の注意＞

(1) 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。

(2) アンプルを開封後、直ちに使用し、残液は廃棄すること。

4. 承認条件

該当しない

5. 包装

3.5mL×10管（アンプル）

6. 同一成分・同効薬

同効薬：ブピバカイン塩酸塩、テトラカイン塩酸塩、ジブカイン塩酸塩

7. 国際誕生年月日

1952 年 7 月 27 日

8. 製造・輸入承認年月日・承認番号

製造承認年月日：1956年11月13日

承認番号：（阪薬）12817

9. 薬価基準収載年月日

1958 年 4 月 1 日

10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

11. 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 薬務局長通知 薬発第 1046 号「医薬品再評価における評価判定について―その 3」によって、総合評価判定として有用性が認められた。

12. 再審査期間

対象外

13. 長期投与の可否

該当しない

14. 厚生省薬価基準収載医薬品コード

1214 400A 4021

15. 保険給付上の注意

特になし

XI.文献

1. 引用文献

- 1) 081-000080 西邑信男ほか：現代の臨床, **3** 354 (1969)
- 2) 081-001072 Phillips, O. C. : Anesthesiology, **30** 284 (1966)
- 3) 081-200005 Åkerman, S. B. A. : Br. J. Anaesth., **57** 329 (1985)
- 4) 081-000060 野島元雄ほか：外科の領域, **5** 439 (1957)
- 5) 081-001462 Giasi, R. M. : Anesth. Analg., **58** 360 (1979)
- 6) 081-000524 Nation, R. L., et al. : Br. J. Clin. Pharmacol., **4** 439 (1977)
- 7) 081-000516 Thomson, P. D. : Ann. Intern. Med., **78** 499 (1973)
- 8) 081-201327 MARTINDALE The Extra Pharmacopoeia 31sted., pp.1333 (1996)
- 9) 081-004644 Burm, A. G. L. : Clin. Pharmacokin., **16** 283 (1989)
- 10) 081-000014 西村清司ほか：麻酔, **24** 245 (1975)
- 11) 081-001498 坂部武史ほか：麻酔, **23** 1002 (1974)
- 12) 081-000355 藤井文夫ほか：臨床麻酔, **17** 1387 (1993)
- 13) 081-000024 西村清司ほか：麻酔, **23** 1003 (1974)
- 14) 081-001276 Katz, J. : Anesthesiology, **29** 249 (1968)
- 15) 081-000213 Keenaghan, J. B., et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., **180** 454 (1972)
- 16) 081-004415 Bargetzi, M. J. : Clin. Pharmacol. Ther., **46** 521 (1989)
- 17) 081-000549 Stenson, R. E., et al. : Circulation, **43** 205 (1971)
- 18) 081-001505 Burney, R. G., et al. : Am. Heart. J., **88** 765 (1974)
- 19) 081-201323 Adjepon-Yamoah, K. K., et al. : Br. J. Pharmacol., **47** 672 (1973)
- 20) 081-004288 吉本恵子ほか：日本透析療法学会抄録, 286 (1988)
- 21) 081-201326 USP DI 19thed., pp.1861 (1999)
- 22) 081-001239 植木昭和ほか：福岡医学雑誌, **51** 1361 (1960)
- 23) 081-001273 Wiedling, S. : Acta Pharmacol. Toxicol., **8** 117 (1952)
- 24) 081-000657 Ulfendahl, H. R. : Acta Anaesthesiol. Scand., **1** 81 (1957)
- 25) 080-302499 Orlando, R : Clin. Pharmacol. Ther., **75** 80 (2004)
- 26) 080-304350 Wang, J. S. : Drug Metabo. Dispos., **28** 959 (2000)
- 27) 081-000032 清水克祐ほか：月刊薬事, **17** 136 (1975)
- 28) 081-001482 Mannheim, W., et al. : JAMA, **154** 29 (1954)
- 29) 081-002951 Tait, C. A., et al. : South. Med. J., **51** 358 (1958)
- 30) 081-000566 Hunter, A. R. : Br. J. Anaesth., **23** 153 (1951)
- 31) 080-307781 Disler P. B. et al. : Clin. Dermatol., **3** 112 (1985)

2. その他の参考文献

- 1) 幸保文吉：JNHPA **10**(2-3) (1974)

XII. 参考資料

特になし

XIII.備考

その他関連資料

特になし

