

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

キシロカイン[®]注射液「0.5%」
エピレナミン(1:100,000)含有

キシロカイン[®]注射液「1%」
エピレナミン(1:100,000)含有

キシロカイン[®]注射液「2%」
エピレナミン(1:80,000)含有

リドカイン塩酸塩・アドレナリン注射剤

Xylocaine[®] Injection 0.5%・1%・2% with Epinephrine

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	<p>1mL 中に下記成分を含有</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th>キシロカイン注射液 エピレナミン含有</th> <th>0.5% (1:100,000)</th> <th>1% (1:100,000)</th> <th>2% (1:80,000)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>リドカイン塩酸塩</td> <td>5mg</td> <td>10mg</td> <td>20mg</td> </tr> <tr> <td>アドレナリン</td> <td>0.01mg</td> <td>0.01mg</td> <td>0.0125mg</td> </tr> </tbody> </table>	キシロカイン注射液 エピレナミン含有	0.5% (1:100,000)	1% (1:100,000)	2% (1:80,000)	リドカイン塩酸塩	5mg	10mg	20mg	アドレナリン	0.01mg	0.01mg	0.0125mg
キシロカイン注射液 エピレナミン含有	0.5% (1:100,000)	1% (1:100,000)	2% (1:80,000)										
リドカイン塩酸塩	5mg	10mg	20mg										
アドレナリン	0.01mg	0.01mg	0.0125mg										
一般名	和名：リドカイン（JAN）、アドレナリン（JAN） 洋名：Lidocaine（JAN、INN）、Adrenaline（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：1956年2月1日* 薬価基準収載年月日：1956年9月1日 発売年月日：1956年3月												
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：サンドファーマ株式会社												
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 https://www.sandoz.jp/medical												

*旧許可年月日

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。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

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>I. 概要に関する項目 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>II. 名称に関する項目 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） 3</p> <p>6. 慣用名、別名、略号、記号番号 3</p> <p>7. CAS 登録番号 3</p> <p>III. 有効成分に関する項目 4</p> <p>1. 物理化学的性質 4</p> <p> (1) 外観・性状 4</p> <p> (2) 溶解性 4</p> <p> (3) 吸湿性 4</p> <p> (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点 4</p> <p> (5) 酸塩基解離定数 4</p> <p> (6) 分配係数 4</p> <p> (7) その他の主な示性値 4</p> <p>2. 有効成分の各種条件下における安定性 4</p> <p>3. 有効成分の確認試験法 5</p> <p>4. 有効成分の定量法 5</p> <p>IV. 製剤に関する項目 6</p> <p>1. 剤形 6</p> <p> (1) 剤形の区別、外観及び性状 6</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 6</p> <p> (3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類 6</p> <p>2. 製剤の組成 6</p> <p> (1) 有効成分（活性成分）の含量 6</p> <p> (2) 添加物 6</p> <p> (3) 電解質の濃度 6</p> <p> (4) 添付溶解液の組成及び容量 6</p> <p> (5) その他 6</p> <p>3. 注射剤の調製法 7</p> <p>4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 7</p> <p>5. 製剤の各種条件下における安定性 7</p> <p>6. 溶解後の安定性 7</p> <p>7. 他剤との配合変化（物理化学的变化） 7</p> <p>8. 生物学的試験法 7</p> <p>9. 製剤中の有効成分の確認試験法 7</p> <p>10. 製剤中の有効成分の定量法 8</p> <p>11. 力価 8</p> <p>12. 混入する可能性のある夾雑物 8</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 8</p> <p>14. その他 8</p> <p>V. 治療に関する項目 9</p> <p>1. 効能又は効果 9</p> <p>2. 用法及び用量 9</p> <p>3. 臨床成績 9</p> <p> (1) 臨床データパッケージ 9</p> <p> (2) 臨床効果 9</p> <p> (3) 臨床薬理試験 9</p> <p> (4) 探索的試験 9</p> <p> (5) 検証的試験 10</p> <p> (6) 治療的使用 10</p> <p>VI. 薬効薬理に関する項目 11</p> <p>1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 11</p> <p>2. 薬理作用 11</p> <p> (1) 作用部位・作用機序 11</p> <p> (2) 薬効を裏付ける試験成績 11</p> <p> (3) 作用発現時間・持続時間 11</p> <p>VII. 薬物動態に関する項目 12</p> <p>1. 血中濃度の推移・測定法 12</p> <p> (1) 治療上有効な血中濃度 12</p> <p> (2) 最高血中濃度到達時間 12</p> <p> (3) 臨床試験で確認された血中濃度 12</p> <p> (4) 中毒域 13</p> <p> (5) 食事・併用薬の影響 13</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 13</p> <p>2. 薬物速度論的パラメータ 13</p> <p> (1) 解析方法 13</p> <p> (2) 吸収速度定数 13</p> <p> (3) バイオアベイラビリティ 13</p> <p> (4) 消失速度定数 13</p> <p> (5) クリアランス 13</p> <p> (6) 分布容積 13</p> <p> (7) 血漿蛋白結合率 14</p> <p>3. 吸収 14</p> <p>4. 分布 14</p> <p> (1) 血液－脳関門通過性 14</p> <p> (2) 血液－胎盤関門通過性 14</p> <p> (3) 乳汁への移行性 14</p> <p> (4) 髄液への移行性 14</p> <p> (5) その他の組織への移行性 14</p> <p>5. 代謝 15</p> <p> (1) 代謝部位及び代謝経路 15</p> <p> (2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種 15</p> <p> (3) 初回通過効果の有無及びその割合 15</p> <p> (4) 代謝物の活性の有無及び比率 15</p> <p> (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ 15</p>
---	--

目 次

6. 排泄	16	X. 管理的事項に関する項目	30
(1) 排泄部位及び経路	16	1. 規制区分	30
(2) 排泄率	16	2. 有効期間又は使用期限	30
(3) 排泄速度	16	3. 貯法・保存条件	30
7. トランスポーターに関する情報	16	4. 薬剤取扱い上の注意点	30
8. 透析等による除去率	16	(1) 薬局での取扱い上の留意点について	30
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	17	(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）	30
1. 警告内容とその理由	17	(3) 調剤時の留意点について	30
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	17	5. 承認条件等	30
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意 とその理由	18	6. 包装	30
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意 とその理由	18	7. 容器の材質	30
5. 慎重投与内容とその理由	19	8. 同一成分・同効薬	31
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置 方法	20	9. 国際誕生日	31
7. 相互作用	21	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	31
(1) 併用禁忌とその理由	21	11. 薬価基準収載年月日	31
(2) 併用注意とその理由	22	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	31
8. 副作用	23	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	31
(1) 副作用の概要	23	14. 再審査期間	31
(2) 重大な副作用と初期症状	23	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	31
(3) その他の副作用	24	16. 各種コード	32
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値 異常一覧	24	17. 保険給付上の注意	32
(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	24	X I. 文献	33
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び 試験法	24	1. 引用文献	33
9. 高齢者への投与	24	2. その他の参考文献	33
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	25	X II. 参考資料	34
11. 小児等への投与	25	1. 主な外国での発売状況	34
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	25	2. 海外における臨床支援情報	34
13. 過量投与	26	X III. 備考	35
14. 適用上の注意	26	その他の関連資料	35
15. その他の注意	26		
16. その他	27		
IX. 非臨床試験に関する項目	28		
1. 薬理試験	28		
(1) 薬効薬理試験	28		
(2) 副次的薬理試験	28		
(3) 安全性薬理試験	28		
(4) その他の薬理試験	28		
2. 毒性試験	28		
(1) 単回投与毒性試験	28		
(2) 反復投与毒性試験	28		
(3) 生殖発生毒性試験	29		
(4) その他の特殊毒性	29		

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。

一方、1903年にBraunは、局所麻酔薬の溶液にアドレナリンを添加すると、麻酔作用が著しく増強し延長することを見いだした。また、アドレナリンは吸収速度を減少させ、局所麻酔薬を望む部位に局在させるばかりでなく、局所麻酔薬が体内で分解される速度と循環内へ吸収される速度をととのえることで局所麻酔薬の全身毒性を減少させる。こうした意味をもって創製させたのが血管収縮剤（アドレナリン）添加リドカイン製剤である。

なお、2017年7月に製造販売承認がアスペンジャパン株式会社（現サンドファーマ株式会社）に承継された。

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) 本剤はアドレナリン含有の局所麻酔薬（基準最高用量1回500mg）として、表面麻酔（注射液1%、2%）、浸潤麻酔、伝達麻酔及び硬膜外麻酔（注射液0.5%、1%、2%）に用いる。
- (3) 本剤に添加されている血管収縮薬アドレナリンにより、麻酔の作用を延長させ、局麻薬の血中への吸収を遅らせることで最高血中濃度を低く抑えることができる。
- (4) 本剤は保存剤を含んだバイアル製剤である。
- (5) 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

キシロカイン注射液「0.5%」 エピレナミン (1 : 100,000) 含有
キシロカイン注射液「1%」 エピレナミン (1 : 100,000) 含有
キシロカイン注射液「2%」 エピレナミン (1 : 80,000) 含有

(2) 洋名

Xylocaine Injection 0.5%・1%・2% with Epinephrine

(3) 名称の由来

不明

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

リドカイン (JAN)、アドレナリン (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

Lidocaine (JAN、INN)、Adrenaline (JAN)、Epinephrine (INN)

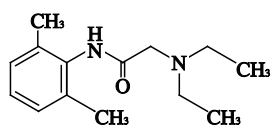
(3) ステム

-caine : local anaesthetics

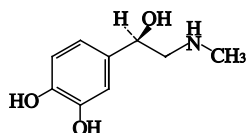
-frine : sympathomimetic, phenethyl derivatives

3. 構造式又は示性式

リドカイン :



アドレナリン (別名エピレナミン) :



4. 分子式及び分子量

リドカイン 分子式 : C₁₄H₂₂N₂O、分子量 : 234.34

アドレナリン 分子式 : C₉H₁₃NO₃、分子量 : 183.20

II. 名称に関する項目

5. 化学名（命名法）

リドカイン：2-Diethylamino-*N*-(2,6-dimethylphenyl)acetamide (IUPAC)

アドレナリン：4-[(1*R*)-1-Hydroxy-2-(methylamino)ethyl]benzene-1,2-diol (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名 アドレナリン：エピレナミン、エピネフリン

7. CAS 登録番号

Lidocaine：137-58-6

Adrenaline：51-43-4

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

リドカイン：白色～微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

アドレナリン：白色～灰白色の結晶性の粉末である。

空気又は光によって徐々に褐色となる。

(2) 溶解性

リドカイン：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。

アドレナリン：ギ酸又は酢酸（100）に溶けやすく、水に極めて溶けにくく、メタノール又はエタノール（99.5）にほとんど溶けない。希塩酸に溶ける。

(3) 吸湿性

リドカイン：吸湿しない

アドレナリン：該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点 リドカイン：66～69℃

アドレナリン：211～212℃

(5) 酸塩基解離定数

リドカイン：pKa7.9（25℃）

アドレナリン：該当資料なし

(6) 分配係数

リドカイン：2.9（n-heptane/pH7.4 緩衝液）

アドレナリン：該当資料なし

(7) その他の主な示性値

吸光度：

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

アドレナリン：該当資料なし

旋光度：

リドカイン：なし

アドレナリン： $[\alpha]_D^{20}$ ：-50.0～-53.5°（乾燥後、1g、1mol/L 塩酸試液、25mL、100 mm）

2. 有効成分の各種条件下における安定性

リドカイン：

	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 カ月間	変化なし

3. 有効成分の確認試験法

リドカイン：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

アドレナリン：日局「アドレナリン」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

リドカイン：日局「リドカイン」による。

比色滴定法

アドレナリン：日局「アドレナリン」による。

電位差滴定法

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 中以下の量を含有。

	(0.5%)	(1%)	(2%)
リドカイン塩酸塩	5mg	10mg	20mg
アドレナリン	0.01mg	0.01mg	0.0125mg

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

キシロカイン注射液エピレナミン含有	0.5%	1%	2%
pH	3.3～5.0		
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

炭酸ガス置換

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

キシロカイン注射液エピレナミン含有	0.5%	1%	2%	
成分・含量 (1mL 中)	リドカイン塩酸塩	5mg	10mg	20mg
	アドレナリン	0.01mg	0.01mg	0.0125mg

(2) 添加物

キシロカイン注射液エピレナミン含有	0.5%	1%	2%	
添加物 (1mL 中)	塩酸	0.1 μL	0.2 μL	0.4 μL
	塩化ナトリウム	8mg	6mg	6mg
	メチルパラベン	1mg	1mg	1mg
	ピロ亜硫酸ナトリウム	0.55mg	0.55mg	0.55mg
	pH 調整剤	適量	適量	適量

(3) 電解質の濃度

		(0.5%)		(1%)		(2%)
Na 当量	=	0.1 mEq/mL		0.1 mEq/mL		0.1 mEq/mL

(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

IV. 製剤に関する項目

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

5. 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 ガラスバイアル	3 カ月間	安定
15℃	無色透明 ガラスバイアル	30 カ月間	安定
室 温	無色透明 ガラスバイアル	18 カ月間	安定

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）

浸透圧比及び pH 変動試験値〔試験方法^{a)}〕

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*
キシカイン注射液 0.5% エピネフリン含有	リドカイン塩酸塩 100mg アドレナリン 0.2mg/20mL	3.3-5.0	3.8	(A) 10.0	1.3	2.5	変化なし	約 1
				(B) 7.9	12.1	8.3	(淡黄赤色 透明)	
キシカイン注射液 1% エピネフリン含有	リドカイン塩酸塩 200mg アドレナリン 0.2mg/20mL	3.3-5.0	4.1	(A) 10.0	1.4	2.7	変化なし	約 1
				(B) 3.6	8.1	4.0	白濁	
キシカイン注射液 2% エピネフリン含有	リドカイン塩酸塩 400mg アドレナリン 0.25mg/20mL	3.3-5.0	3.9	(A) 10.0	1.3	2.6	変化なし	約 1
				(B) 2.2	7.5	3.6	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

リドカイン塩酸塩：薄層クロマトグラフィー

アドレナリン：蛍光分析法

10. 製剤中の有効成分の定量法

リドカイン塩酸塩：液体クロマトグラフィー

アドレナリン：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

注射液 0.5% : 硬膜外麻酔、伝達麻酔、浸潤麻酔
 注射液 1%、2% : 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1回0.5%液100mL、1%液50mL、2%液25mL（リドカイン塩酸塩として500mg）を基準最高用量とする。

ただし、いずれの場合も年齢、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通りである。

（ ）内はリドカイン塩酸塩として、〈 〉内はアドレナリンとしての用量である。

麻酔方法	注射液 0.5%	注射液 1%	注射液 2%
硬膜外麻酔	5～30mL (25～150mg) 〈0.05～0.3mg〉	10～30mL (100～300mg) 〈0.1～0.3mg〉	10～20mL (200～400mg) 〈0.125～0.25mg〉
硬膜外麻酔 [交感神経遮断]	5～20mL (25～100mg) 〈0.05～0.2mg〉	—	—
伝達麻酔	3～40mL (15～200mg) 〈0.03～0.4mg〉	3～20mL (30～200mg) 〈0.03～0.2mg〉	2～20mL (40～400mg) 〈0.025～0.25mg〉
伝達麻酔 [肋間神経遮断]	5mL まで (25mg まで) 〈0.05mg〉	5mL まで (50mg まで) 〈0.05mg〉	—
浸潤麻酔	2～40mL (10～200mg) 〈0.02～0.4mg〉	2～40mL (20～400mg) 〈0.02～0.4mg〉	2～25mL (40～500mg) 〈0.025～0.3125mg〉
浸潤麻酔 [眼科領域麻酔]	—	—	0.5～2mL (10～40mg) 〈0.00625～0.025mg〉
表面麻酔	—	適量を塗布 又は噴霧する	適量を塗布 又は噴霧する

3. 臨床成績

本製剤は長年にわたって、表面麻酔、浸潤麻酔、伝達麻酔及び硬膜外麻酔に繁用されている。また、局所麻酔薬としての有効性及び安全性は、他剤との臨床比較試験によって確立している。

(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

該当資料なし

(4) 探索的試験

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

①伝達麻酔 [外国人データ]

1:100,000*アドレナリン添加2%リドカイン(154例、2mL投与)と1:40,000アドレナリン添加2%プロカイン(146例、2mL投与)の下顎骨神経ブロックに対する効果を二重盲検法により比較した結果、麻酔発現時間はリドカインがプロカインよりも速く、持続時間はリドカインよりも有意に長かった。また、手術時疼痛がなかった例は、リドカイン151例、プロカイン138例で両剤間の麻酔効果に有意差は認められなかった¹⁾。

②硬膜外麻酔

手術患者54例を対象に、リドカイン注射液1%、2%にそれぞれ1:200,000*アドレナリンを添加した薬剤20mLを無作為に硬膜外投与して比較した結果、麻酔発現時間、15分後の鎮痛域は、アドレナリンを添加した場合でも著明な変化は認められなかった²⁾。

[外国人データ]

外科手術症例100例を対象とし、2%リドカインおよび1:100,000*アドレナリン添加2%リドカインの硬膜外麻酔時の麻酔発現時間を二重盲検法により検討した。薬剤は2mLを試験的に注入し、1~2分後にさらに12~15mLを投与した。その結果、両剤間に有意差を認めず、アドレナリン添加によって麻酔発現時間が遅延することはなかった³⁾。

[外国人データ]

手術患者59例を対象に、1:100,000添加1%プロピトカインと1:100,000*添加または1:200,000*添加1%リドカイン(それぞれ20mL投与)の硬膜外麻酔効果を二重盲検法により比較し、さらに間接的にアドレナリン添加の有無による効果を検討した。麻酔発現時間はアドレナリン添加によっても変化を認めないが、持続時間は約2倍に延長した。なお、リドカインとプロピトカインの間には麻酔発現、持続時間のいずれについても差はみられなかった⁴⁾。

*本邦で販売しているキシロカイン注射液のアドレナリン添加濃度は以下の通りである。

キシロカイン注射液「0.5%」「1%」エピレナミン(1:100,000)含有

キシロカイン注射液「2%」エピレナミン(1:80,000)含有

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。また、アドレナリンの添加により、その作用は増強される^{5) 6) 7) 8) 9) 10)}。
- 2) 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¹¹⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

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]

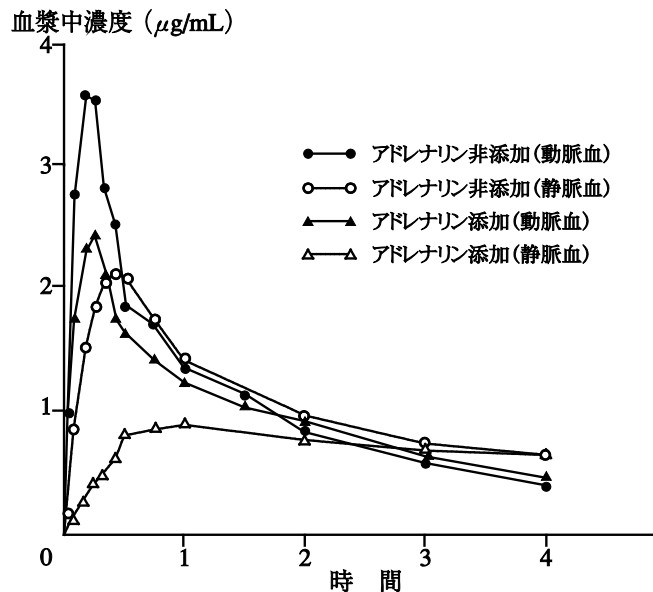
外国人健康成人に 2%リドカイン液 20mL (リドカイン塩酸塩として 400mg**) を単独あるいはアドレナリンを添加 (1:200,000*) して硬膜外投与したとき、動脈血における T_{max} は 12 ± 3 分 (アドレナリン非添加)、 25 ± 4 分 (アドレナリン添加) であった¹²⁾。

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

1) 単回投与

[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¹²⁾。



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 ± 0.5	12 ± 3	274 ± 19
アドレナリン非添加、静脈血		2.40 ± 0.60	11 ± 6	235 ± 21
アドレナリン添加、動脈血		2.1 ± 0.4	25 ± 4	221 ± 71
アドレナリン添加、静脈血		0.95 ± 0.12	102 ± 84	102 ± 43

[n=5、平均値±標準偏差]

*本邦で販売しているキシロカイン注射液「2%」エピレナミン含有製剤のアドレナリン濃度は (1:80,000) である。

**リドカイン注射液の基準最高用量は、リドカイン塩酸塩として1回 200mg (アドレナリン非添加)、500mg (アドレナリン添加) である。

VII. 薬物動態に関する項目

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¹³⁾。

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔 (注射液 1%、2%)、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔 (注射液 0.5%、1%、2%) 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¹⁴⁾。

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔 (注射液 1%、2%)、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔 (注射液 0.5%、1%、2%) である。

(4) 中毒域

5~10 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 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%¹⁵⁾

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔 (注射液 1%、2%)、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔 (注射液 0.5%、1%、2%) 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^{16) 17)}

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔 (注射液 1%、2%)、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔 (注射液 0.5%、1%、2%) である。

(6) 分布容積

[外国人データ、静脈内投与] 91 L^{16) 17)}

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔 (注射液 1%、2%)、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔 (注射液 0.5%、1%、2%) である。

(7) 血漿蛋白結合率

[外国人データ]

リドカイン $2\mu\text{g/mL}$ 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¹⁶⁾。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¹⁸⁾。

3. 吸 収

吸収部位：筋肉内、皮下、硬膜外腔、粘膜

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¹⁹⁾。

(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¹⁶⁾。

(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²⁰⁾。

(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 $53.2\pm 7.3\%$ であった²¹⁾。

(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¹⁶⁾。

〈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²²⁾。

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²³⁾。

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²³⁾。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

主に CYP3A4 及び CYP1A2 により代謝される^{24) 25) 26)}。

(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²⁷⁾。

(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²⁸⁾。

[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 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²³⁾。

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 (注射液 1%、2%)、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔 (注射液 0.5%、1%、2%) 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_{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²⁹⁾。

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²³⁾。

(2) 排泄率

[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²³⁾。

注) 本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔（注射液 1%、2%）、浸潤麻酔・伝達麻酔・硬膜外麻酔（注射液 0.5%、1%、2%）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 5mg/kg 静脈内投与した結果、下表のとおり排泄された²³⁾。

[—：測定データなし]

対 象	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

血液透析ではほとんど除去されない^{30) 31)}。

(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	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) 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 (2) 高血圧、動脈硬化、心不全、甲状腺機能亢進、糖尿病のある患者及び血管攣縮の既往のある患者〔これらの病状が悪化するおそれがある。〕 (3) 狭隅角や前房が浅いなど眼圧上昇の素因のある患者（眼科領域等の麻酔に用いる場合）〔アドレナリンにより、閉塞隅角緑内障患者の発作を誘発することがある。〕 (4) 次の薬剤を投与中の患者（「相互作用」の項参照） 1) ブチロフェノン系・フェノチアジン系等の抗精神病薬、α遮断薬 2) イソプロテレノール等のカテコールアミン製剤、アドレナリン作動薬	○	○	○	
【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。〕	○	—	—	
【伝達麻酔・浸潤麻酔】 陰茎の麻酔を目的とする患者〔壊死状態になるおそれがある。〕	—	○	—	

（解説）

【共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔）】

- (1) 一般に、薬剤に対し過敏反応を起こしたことのある患者では、再度投与するとアナフィラキシーショック等の重篤な過敏反応を起こすことがある。リドカイン塩酸塩も同様である。
このため、投与にあたっては十分な問診を行う必要がある。また、構造が類似している他のアミド型局所麻酔薬（メピバカイン塩酸塩、ブピバカイン塩酸塩、ロピバカイン塩酸塩等）に対し交差反応を示すことにより過敏反応を起こす可能性もある。
- (2) 本剤に添加されたアドレナリン（血管収縮剤）は、血管内に吸収され用量依存的に心血管系に影響を与え、心拍数増加、心拍出量増加、血圧上昇などを生じさせる。またインスリン分泌抑制等により血糖値を上昇させるため、循環器疾患、糖尿病の患者への使用は避ける必要がある。また、甲状腺機能亢進症の患者は、心臓の被刺激性が高まっているため、アドレナリンの使用は避ける必要がある。
- (3) アドレナリンにより、閉塞隅角緑内障患者の発作を誘発することがある。
- (4) ブチロフェノン系・フェノチアジン系等の抗精神病薬、α遮断薬
ブチロフェノン系薬剤（ハロペリドール等）及びフェノチアジン系薬剤（クロルプロマジン等）等の抗精神病薬は、α受容体遮断作用を有している。したがって、これらの薬剤やα遮断薬とアドレナリンとの併用により、β受容体刺激作用が優位になり、血圧低下を起こすことが考えられる。

イソプロテレノール等のカテコールアミン製剤、アドレナリン作動薬

これらの薬剤のβ受容体刺激作用により交感神経興奮作用が増強すると考えられており、不整脈、場合により心停止があらわれることがある。

〔硬膜外麻酔〕

- (1) 硬膜外麻酔では、交感神経遮断に伴い末梢血管が拡張するため血圧低下を来す。
大量出血やショック状態の患者では、血管の代償機能が低下しており、硬膜外麻酔を行うことで、過度の血圧低下が起こる可能性がある。
- (2) 注射部位またはその周辺に炎症のある患者では、硬膜外穿刺により髄膜を刺激し、髄膜炎などの炎症症状を起こすことがある。
- (3) 敗血症の患者は、硬膜外穿刺により病巣が拡大し、髄膜炎が生じるおそれがある。

〔伝達麻酔・浸潤麻酔〕

陰茎など終末動脈から血流を受けている組織では、アドレナリンの血管収縮作用により血流障害を起こし壊死状態になるおそれがある。陰茎の浸潤麻酔や伝達麻酔の場合は、血管収縮剤を添加しない局所麻酔剤を使用すること。

〔原則禁忌〕(次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)

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
<p>〔共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔）〕</p> <p>(1) 心室頻拍等の重症不整脈のある患者 [アドレナリンのβ刺激作用により、不整脈を悪化させるおそれがある。]</p> <p>(2) 交感神経系作動薬に対し過敏な反応を示す患者 [アドレナリン受容体が高い感受性を示すおそれがある。]</p> <p>(3) 精神神経症の患者 [一般に交感神経作動薬の中枢神経系の副作用として情緒不安、不眠、錯乱、易刺激性および精神病的状態等があるので悪化するおそれがある。]</p> <p>(4) コカイン中毒の患者 [コカインは、交感神経末端でのカテコールアミンの再取り込みを阻害するので、アドレナリンの作用が増強されるおそれがある。]</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

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）		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）			
	<p>[共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔）]</p> <p>(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）</p> <p>(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）</p> <p>(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。〕</p> <p>(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。〕</p> <p>(5) ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔薬を投与中の患者〔頻脈、不整脈等を起こすおそれがある。〕（「相互作用」の項参照）</p> <p>(6) 肺気腫のある患者〔アドレナリンにより、肺循環障害を増悪させ、右心系への負荷が過重となり、右心不全に陥るおそれがある。〕</p> <p>(7) 心疾患のある患者〔アドレナリンのβ刺激作用により、心疾患を悪化させるおそれがある。〕</p>	○	○	○
	<p>[硬膜外麻酔]</p> <p>(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ある患者〔硬膜外麻酔により病状が悪化するおそれがある。〕</p> <p>(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。〕</p> <p>(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。〕</p> <p>(4) 妊産婦（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）</p> <p>(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。〕</p> <p>(6) 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。〕</p>	○	—	—
	<p>[伝達麻酔・浸潤麻酔（耳、指趾へ投与する場合）]</p> <p>全身性又は末梢性の血行障害のある患者、複数の指趾へ同時投与を行う患者、小児〔壊死状態になるおそれがある。〕ので、投与の可否を慎重に検討すること。投与する場合は、必要に応じて減量など行うこと。〕</p>	—	○	—

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		
<p>[共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔）]</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、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。</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、次の諸点に留意すること。</p> <p>1) 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。</p> <p>2) できるだけ薄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) 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。</p> <p>(3) アドレナリンは、α受容体、β受容体それぞれに作用し、その作用は投与量、投与方法等に影響を受けやすいので注意すること。</p>				○	○	○
<p>[硬膜外麻酔]</p> <p>(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。</p> <p>1) 注射の速度はできるだけ遅くすること。</p> <p>2) 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。</p> <p>3) 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。</p> <p>4) 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。</p> <p>(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、神経障害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。</p>				○	—	—

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
<p>〔伝達麻酔・浸潤麻酔〕</p> <p>(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。</p> <p>1) 注射の速度はできるだけ遅くすること。</p> <p>2) 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。</p> <p>3) 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、できるだけ少量を投与すること。</p> <p>(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、神経障害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。</p> <p>(3) 眼科領域等の麻酔に用いる場合、隅角の所見が未確定のまま投与しないこと。</p> <p>(4) 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。</p> <p>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、本剤に含まれているアドレナリンにより障害を悪化させることがあるので、注意すること。</p> <p>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。</p>	—	○	—
<p>〔表面麻酔〕</p> <p>(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。</p> <p>1) 気道内表面麻酔の場合には吸収が速いので、できるだけ少量を使用すること。</p> <p>2) 外傷、びらん、潰瘍又は炎症部位への投与は吸収が速いので注意すること。（「過量投与」の項参照）</p> <p>(2) 眼科領域等の麻酔に用いる場合、隅角の所見が未確定のまま投与しないこと。</p>	—	—	○

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

(1) 併用禁忌（併用しないこと）		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
抗精神病薬（ブチロフェノン系、フェノチアジン系、イミノジベンジル系、ゾテピン、リスペリドン等） セレネース、トロペロン、ウインタミン、デフェクトン、ロドピン、リスパダール等 α遮断薬（プラゾシン等） ミニプレス等	過度の血圧低下を起こすことがある。	これらの薬剤のα受容体遮断作用により、アドレナリンのβ受容体刺激作用が優位になり、血圧低下があらわれる。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
カテコールアミン製剤、アドレナリン作動薬 プロタノール等	不整脈、場合により心停止があらわれることがある。	これらの薬剤のβ刺激作用により、交感神経興奮作用が増強すると考えられている。

(2) 併用注意とその理由

(2) 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
ハロゲン含有吸入麻酔薬 ハロタン ^{注1)} 、イソフルラン ^{注2)} 、セボフルラン ^{注3)}	頻脈、不整脈、場合によっては心停止を起こすことがある。	これらの薬剤は、心筋のアドレナリン受容体の感受性を亢進させる。
三環系抗うつ薬 イミプラミン等 セロトニン・ノルアドレナリン再取り込み阻害剤 (SNRI) ミルナシプラン等 その他の抗うつ薬 マプロチリン等 MAO阻害薬	血圧上昇を起こすことがある。	これらの薬剤は、アドレナリン作動性神経終末でのカテコールアミンの再取り込みを阻害し、受容体でのカテコールアミン濃度を上昇させ、アドレナリン作動性神経刺激作用を増強させる。
メチルフェニデート		
非選択性β遮断薬 プロプラノロール等	血管収縮、血圧上昇、徐脈を起こすことがある。	これらの薬剤のβ受容体遮断作用により、アドレナリンのα受容体刺激作用が優位になり、血管抵抗性を上昇させる。
分娩促進薬 オキシトシン等 麦角アルカロイド類 エルゴメトリン等	血圧上昇を起こすことがある。	併用により血管収縮作用が増強される。
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。
ジギタリス製剤	異所性不整脈があらわれることがある。	ともに異所性刺激能を有し、不整脈発現の可能性が高くなると考えられている。
キニジン	心室細動があらわれることがある。	相互に心筋に対する作用を増強すると考えられている。
甲状腺製剤 チロキシン等	冠不全発作があらわれることがある。	甲状腺ホルモンは心筋のβ受容体を増加させるため、カテコールアミン感受性が亢進すると考えられている。
プロモクリプチン	血圧上昇、頭痛、痙攣等があらわれることがある。	機序は明らかではないが、アドレナリンの血管収縮作用、血圧上昇作用に影響を及ぼすと考えられている。
利尿剤 チアジド系利尿剤 トリクロルメチアジド、ヒドロクロロチアジド等 チアジド系類似剤 インダパミド等 ループ利尿剤 フロセミド等 カリウム保持性利尿剤 スピロノラクトン	アドレナリンの作用が減弱することがある。手術前の患者に使用する場合、利尿剤の一時休薬等を行うこと。	併用によりアドレナリンの血管反応性を低下させることがある。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

注1) ハロタン麻酔中のヒトの50%に心室性期外収縮を誘発するアドレナリン量（粘膜下投与）は2.1 μg/kgと報告されている³²⁾。
この量は60kgのヒトの場合、キシロカイン注射液0.5%、1%（10万倍希釈アドレナリン含有）12.5mLに相当し、キシロカイン注射液2%（8万倍希釈アドレナリン含有）10mLに相当する。

注2) イソフルラン麻酔中のヒトの50%に心室性期外収縮を誘発するアドレナリン量（粘膜下投与）は6.7 μg/kgと報告されている³²⁾。
この量は60kgのヒトの場合、キシロカイン注射液0.5%、1%（10万倍希釈アドレナリン含有）40mLに相当し、キシロカイン注射液2%（8万倍希釈アドレナリン含有）32mLに相当する。

注3) セボフルラン麻酔中、5 μg/kg未満のアドレナリンを粘膜下に投与しても3回以上持続する心室性期外収縮は誘発されなかったが、5 μg/kg～14.9 μg/kgのアドレナリンを投与した場合、1/3の症例に3回以上持続する心室性期外収縮が誘発された³³⁾。
アドレナリン5 μg/kgは60kgのヒトの場合、キシロカイン注射液0.5%、1%（10万倍希釈アドレナリン含有）30mLに相当し、キシロカイン注射液2%（8万倍希釈アドレナリン含有）24mLに相当する。

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				
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）				
③肺水腫（初期症状：血圧異常上昇）：肺水腫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。				
④呼吸困難：呼吸困難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投与を中止するなど適切な処置を行うこと				
⑤心停止（初期症状：頻脈、不整脈、心悸亢進、胸内苦悶）：心停止があらわれることがあるので、初期症状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。				
【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。				

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
循環器	頻脈、期外収縮、血圧変動等
中枢神経 ^{注1)}	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈、頭痛等
消化器 ^{注1)}	悪心・嘔吐等
過敏症	蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等
その他	結膜充血、眼痛、熱感、発汗、胸内苦悶、顔面潮紅・蒼白等

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。

(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
[共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔）] 高齢者では本剤に含まれている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、患者の全身状態を観察しながら慎重に投与すること。		○	○	○

VII. 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
[硬膜外麻酔] 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
[共通（硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔）] 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。]		○	○	○
[硬膜外麻酔] 妊産婦： 1) 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） 2) アドレナリンにより、胎児の酸素欠乏、分娩遅延が発現するおそれがあるので、慎重に投与すること。		○	—	—
[伝達麻酔・浸潤麻酔] 妊産婦 1) 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。 2) アドレナリンにより、胎児の酸素欠乏、分娩遅延が発現するおそれがあるので、慎重に投与すること。		—	○	—

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。

アドレナリンの過量投与により、血圧上昇、頻脈、期外収縮、脳出血、腎血管の異常収縮等があらわれる。また、血中の乳酸濃度が上昇し、重篤な代謝性アシドーシスがあらわれるおそれがある。

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³⁴⁾、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が、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⁸⁾。

(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	LD ₅₀ (mg/kg)			[- ; 測定データなし]
	使用動物	マウス	ラット	
i.v. ^{6) 35) 36) 37)}		25～48	約 25	25.6
s.c. ^{6) 37)}		270～390	—	—
p.o. ^{6) 37)}		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カ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³⁷⁾。

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カ月間経口投与した。なお、各群2匹は薬物投与終了後2カ月間飼育した。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³⁷⁾。

(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 カ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³⁷⁾。

(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³⁸⁾。

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³⁹⁾。

in vitro で抗コリン、抗ヒスタミン作用を見た実験⁵⁾、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⁴⁰⁾では、殆どリドカインによる作用はみられなかった。

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 : リドカイン : 劇薬

アドレナリン : 毒薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限 : 製造後 2.5 年 (安定性試験結果に基づく)

3. 貯法・保存条件

遮光し、凍結を避けて 15℃以下に保存

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

該当しない

(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

1) 本剤使用前にゴム栓をアルコール綿等で清拭すること。

2) 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。

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

注射液 0.5% : [バイアル] 20mL

注射液 1% : [バイアル] 20mL、100mL

注射液 2% : [バイアル] 20mL

7. 容器の材質

無色ガラス製バイアル、ブチルゴム栓

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：歯科用キシロカインカートリッジ

同効薬：メピバカイン塩酸塩、プピバカイン塩酸塩、レボプピバカイン塩酸塩、ロピバカイン塩酸塩、プロカイン塩酸塩、ジブカイン塩酸塩

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	承認番号
キシロカイン注射液「0.5%」エピレナミン (1:100,000)含有	1956年2月1日*	13127KUZ01613004
キシロカイン注射液「1%」エピレナミン (1:100,000)含有	1956年2月1日*	13127KUZ01613007
キシロカイン注射液「2%」エピレナミン (1:80,000)含有	1956年2月1日*	13127KUZ01613003

*旧許可年月日

11. 薬価基準収載年月日

1956年9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

1978年3月24日 薬務局長通知 薬発第337号 「医薬品再評価における評価結果判定についてーその14」
によって、総合評価判定として有用性が認められた。

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
キシロカイン注射液「0.5%」エピレナミン (1:100,000) 含有	101657405	1214400A1022	641210003
キシロカイン注射液「1%」エピレナミン (1:100,000) 含有	101658105	1214400A2029	641210004
キシロカイン注射液「2%」エピレナミン (1:80,000) 含有	101659805	1214400A3025	641210005

17. 保険給付上の注意

特になし

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) Black,H.B. : J.Dent.Res., 32 541 (1953)
- 2) 福田俊郎ほか: 麻酔, 16 124 (1967)
- 3) Saying,J.M.,et al.: Anesth.Analg.Curr.Res., 38 438 (1959)
- 4) Eeiksson,E.: Acta Chir.Scand., (Suppl.358) 10 (1966)
- 5) Wiedling,S.: Anaesthesist, 1 119 (1952)
- 6) Wiedling,S.: Acta Pharmacol.Toxicol., 8 117 (1952)
- 7) 円谷福男: 麻酔, 6 357 (1957)
- 8) 植木昭和ほか: 福岡医学雑誌, 51 1361 (1960)
- 9) Krantz,J.C.: J.Pharmacol.Exp.Ther., 111 224 (1954)
- 10) Truant,A.P.: Arch.Int.Pharmacodyn., 115 483 (1958)
- 11) Åkerman,B.,et al.: Acta Anaesthesiol.Scand., 32 571 (1988)
- 12) Mather,L.E.,et al.: Br.J.Anaesth., 48 989 (1976)
- 13) Nation,R.L.,et al.: Br.J.Clin.Pharmacol., 4 439 (1977)
- 14) Thomson,P.D.: Ann.Intern.Med., 78 499 (1973)
- 15) MARTINDALE The Extra Pharmacopoeia 38thed, pp.1988 (2014)
- 16) Burm,A.G.L.: Clin.Pharmacokinet., 16 283 (1989)
- 17) Tucker,G.T.: "Neural blockade in clinical anesthesia and management of pain 2nd ed." Philadelphia, pp.80 (1988)
- 18) 西村清司ほか: 麻酔, 24 245 (1975)
- 19) 坂部武史ほか: 麻酔, 23 1002 (1974)
- 20) 藤井文夫ほか: 臨床麻酔, 17 1387 (1993)
- 21) 西村清司ほか: 麻酔, 23 1003 (1974)
- 22) Katz,J.: Anesthesiology, 29 249 (1968)
- 23) Keenaghan,J.B.,et al.: J.Pharmacol.Exp.Ther., 180 454 (1972)
- 24) Bargetzi,M.J.: Clin.Pharmacol.Ther., 46 521 (1989)
- 25) Stenson,R.E.,et al.: Circulation, 43 205 (1971)
- 26) Burney,R.G.,et al.: Am.Heart.J., 88 765 (1974)
- 27) Adjepon-Yamoah,K.K.,et al.: Br.J.Pharmacol., 47 672 (1973)
- 28) 吉本恵子ほか: 日本透析療法学会抄録, 286 (1988)
- 29) USP DI 19thed., pp.1861 (1999)
- 30) Ulfendahl,H.R.: Acta Anaesthesiol.Scand., 1 81 (1957)
- 31) Hunter,A.R.: Br.J.Anaesth., 23 153 (1951)
- 32) Johnston, R.R., et al.: Anesth. Analg., 55 (5) 709 (1976)
- 33) Navarro, R., et al.: Anesthesiology, 80 545 (1994)
- 34) Disler P.B.et al.: Clin.Dermatol., 3 (2) ,112 (1985)
- 35) Orlando,R: Clin.Pharmacol.Ther., 75 80 (2004)
- 36) Wang,J.S.: Drug Metabo.Dispos., 28 959 (2000)
- 37) 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)
- 38) 清水克祐ほか: 月刊薬事, 17 136 (1975)
- 39) Mannheim,W.,et al.: JAMA, 154 29 (1954)
- 40) 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
サンドファーマ株式会社
東京都港区虎ノ門1-23-1
URL:<https://www.sandoz.jp/>