

日本標準商品分類番号
871313

表面麻酔剤  
**キシロカイン<sup>®</sup>点眼液 4%**  
リドカイン塩酸塩点眼剤  
**Xylocaine<sup>®</sup>Ophthalmic Solution 4%**

承認番号	21800AMX10089000
薬価収載	2006年6月
販売開始	1957年1月
再評価結果	1977年10月

貯法: 遮光し、凍結を避けて15℃以下に保存  
使用期限: ケース等に表示(製造後3年)  
注意: 「取扱い上の注意」の項参照

**【禁忌】(次の患者には投与しないこと)**

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

**【組成・性状】**

1. 組成

販売名	キシロカイン点眼液4%
成分・含量(1mL中)	リドカイン塩酸塩 40mg
添加物	クロロブタノール、pH調整剤

2. 性状

販売名	キシロカイン点眼液4%
剤形	点眼剤
色・形状	無色澄明な無菌の液
pH	5.0~7.0

**【効能・効果】**

眼科領域における表面麻酔

**【用法・用量】**

通常、成人では1~5滴を点眼する。  
なお、年齢、体質により適宜増減する。

**【使用上の注意】**

1. 重要な基本的注意

- (1) 鎮痛のみの目的には使用しないこと。
- (2) まれにショック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。

2. 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。

**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
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。

3. 副作用

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

ショック(類薬): 他の点眼用局所麻酔剤で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、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。

(2) その他の副作用

過敏症: 過敏症状があらわれた場合には使用を中止すること。

4. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上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。]

5. 適用上の注意

(1) 投与時

- 1) 頻回には使用しないこと。
- 2) 本剤を患者には渡さないこと。

(2) 使用目的:

注射用として使用しないこと。

6. その他の注意

ポルフィリン症の患者に投与した場合、急性腹痛、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。

**【薬物動態】**

1. 吸収

リドカイン塩酸塩は眼球結膜・眼結膜から吸収される。

2. 分布<sup>1)</sup>

リドカイン2µg/mLの血漿蛋白結合率は約65%で、α<sub>1</sub>-酸性糖蛋白及びアルブミンと結合する。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。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。

3. 代謝<sup>2)</sup>

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、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。

4. 排泄<sup>2)</sup>

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。

5. 病態時における薬物動態<sup>3)</sup>

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。

**【薬効薬理】**

1. 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・運動神経を遮断する局所麻酔薬である。

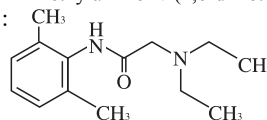
2. 麻酔効果・作用時間: リドカイン塩酸塩の表面・浸潤・伝達麻酔効果は、プロカイン塩酸塩よりも強く、作用持続時間はプロカイン塩酸塩よりも長い<sup>4),5),6),7),8),9)</sup>。

**【有効成分に関する理化学的知見】**

一般名: リドカイン(Lidocaine) (JAN) (日局)

化学名: 2-Diethylamino-N-(2,6-dimethylphenyl)acetamide

構造式:



分子式: C<sub>14</sub>H<sub>22</sub>N<sub>2</sub>O

分子量: 234.34

融点: 66~69℃

性状: リドカインは白色~微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。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。

**【取扱い上の注意】**

1. クロロブタノール(保存剤)は冷時安定であるが、加熱滅菌により分解して塩酸を放出し、液に刺激性を与える懸念があるので、本剤は無菌操作法により調製されている。したがって、本剤を加熱再滅菌して使用したり、また、希釈して加熱再滅菌のうえ用いることは絶対にしないこと。
2. リドカイン塩酸塩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、使用後十分に水洗すること。

### 【包装】

キシロカイン点眼液4%：[瓶] 20mL

### 【主要文献】

- 1) Burm, A.G.L.: Clin. Pharmacokinet., 16, 283, 1989
- 2) Keenaghan, J.B., et al.: J. Pharmacol. Exp. Ther., 180, 454, 1972
- 3) Thomson, P.D.: Ann. Intern. Med., 78, 499, 1973
- 4) Wiedling, S.: Anaesthetist, 1, 119, 1952
- 5) Wiedling, S.: Acta Pharmacol. Toxicol., 8, 117, 1952
- 6) 円谷福男: 麻酔, 6, 357, 1957
- 7) 植木昭和 他: 福岡医学雑誌, 51, 1361, 1960
- 8) Krantz, J.C.: J. Pharmacol. Exp. Ther., 111, 224, 1954
- 9) Truant, A.P.: Arch. Int. Pharmacodyn., 115, 483, 1958

### \*\*【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

アスペンジャパン株式会社

〒102-0073 東京都千代田区九段北一丁目8番10号

カスタマーセンター

TEL: 0120-161-576

FAX: 0120-788-654



製造販売元

**アスペンジャパン株式会社**

東京都千代田区九段北一丁目8番10号

<http://www.aspenpharma.co.jp>