

日本標準商品分類番号
871214

表面麻酔剤  
**キシロカイン®液「4%」**

リドカイン塩酸塩液  
**Xylocaine® Solution 4%**

承認番号	13127KUZ13901000
薬価収載	1958年4月
販売開始	1955年12月
再評価結果	1977年10月

貯法	室温保存
使用期限	ケース等に表示(製造後3年)
注意	「取扱上の注意」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	キシロカイン液「4%」
成分・含量(1mL中)	リドカイン塩酸塩 40mg
添加物	メチルパラベン、pH調整剤、黄色5号

2. 性状

販売名	キシロカイン液「4%」
剤形	液剤
色・形状	うすいだいだい色の澄明な液
pH	6.0~7.0

**【効能・効果】**

表面麻酔

**【用法・用量】**

リドカイン塩酸塩として、通常成人では80~200mg(2~5mL)を使用する。  
なお、年齢、麻酔領域、部位、組織、体質により適宜増減する。

**〈使用方法〉**

**耳鼻咽喉科領域**

鼻腔内、咽喉に刺激性薬物を塗布する前処置、耳管カテーテル挿入、下甲介切除、鼻中隔矯正、扁桃切除、咽喉頭鏡検査等の場合、本剤の適量(一時に5mL(リドカイン塩酸塩として200mg)以内)を塗布又は噴霧する。

**泌尿器科領域**

膀胱鏡検査、尿管カテーテル挿入、逆行性腎盂造影法、凝血除去、結石処置、経尿道式尿道乳頭腫切除等の場合、本剤を倍量に希釈し、その約10mL(リドカイン塩酸塩として200mg)を尿道内に注入し、男子では陰茎を箝搾子ではさみ、女子には綿栓を施して5~10分間、液を尿道内に貯留させる。

気管支鏡検査、全身麻酔時の挿管には本剤を倍量に希釈し、その適量(10mL(リドカイン塩酸塩として200mg)以内)を噴霧する。

**【使用上の注意】**

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (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。]
- (5) 幼児(「小児等への投与」の項参照)

2. 重要な基本的注意

- (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、常時準備しておくこと。
- (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) 麻酔部位に応じ、できるだけ必要最少量とすること。特に他

のリドカイン製剤と併用する場合には、総リドカイン量を考慮し過量投与とならないよう注意すること。

- (4) 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。
- (5) 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)
- (6) 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) 本剤の投与により、誤嚥・口腔内咬傷の危険性を増加させるおそれがあるので注意すること。
- (4) 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。

3. 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。

4. 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

- 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)

(2) 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。

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では、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、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。

6. 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。]

7. 小児等への投与

幼児(特に3歳以下)では麻酔効果の把握が困難なため高用量又は頻回投与されやすく、中毒を起こすことがあるので、低用量から投与を開始する等、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

## 8. 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。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。

## 9. 適用上の注意

### 使用目的：

- (1) 眼科(点眼)用として使用しないこと。
- (2) 注射用として使用しないこと。

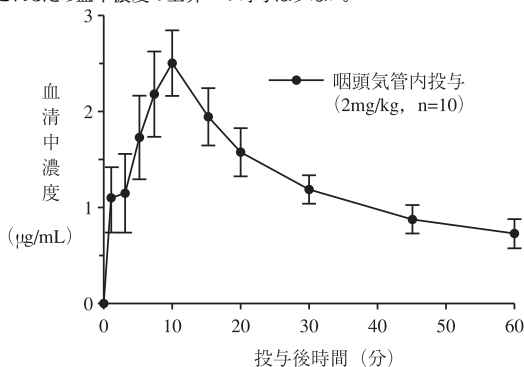
## 10. その他の注意

- (1) 含嗽による表面麻酔において、粘膜からの吸収が速いことによる過量投与と考えられる症状が発現したとの報告がある。（「過量投与」の項参照）
- (2) 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。

### 【薬物動態】

#### 1. 吸収及び血中動態

咽頭・気管内への投与後の吸収は速く、手術患者に4%リドカイン液（リドカイン塩酸塩2mg/kg）を咽頭・気管内に投与したとき、血清中濃度は投与後約10分で最高濃度に達し、その後消失したり、消化管からは吸収されるが、吸収後に肝臓で代謝されるため血中濃度の上昇への寄与は少ない。



手術患者に4%リドカイン液を咽頭・気管内投与したときの血清中濃度推移 (平均値±標準偏差)

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<sup>2)</sup>。

#### 2. 分布<sup>3)</sup>

リドカイン2µg/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。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>4)</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、約70%が4-hydroxy-2,6-xylidineとして尿中に排泄される。

#### 4. 排泄<sup>4)</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>5)</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】

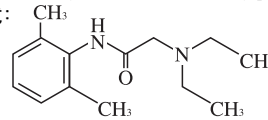
1. **作用機序：**リドカイン塩酸塩は、神経膜のナトリウムチャネルをブロックし、神経における活動電位の伝導を可逆的に抑制し、知覚神経及び運動神経を遮断する局所麻酔薬である。
2. **麻酔効果・作用時間：**リドカイン塩酸塩の表面・浸潤・伝達麻酔効果は、プロカイン塩酸塩よりも強く、作用持続時間はプロカイン塩酸塩よりも長い<sup>6),7),8),9),10),11)</sup>。

### 【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】

本剤は金属を侵す性質があるので、長時間金属器具(匙等)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】

キシロカイン液「4%」：[瓶] 20mL、100mL

### 【主要文献】

- 1) 延原弘明 他：臨床麻酔, 11, 353, 1987
- 2) Nation, R.L., et al.: Br. J. Clin. Pharmacol., 4, 439, 1977
- 3) Burm, A.G.L.: Clin. Pharmacokinetics, 16, 283, 1989
- 4) Keenaghan, J.B., et al.: J. Pharmacol. Exp. Ther., 180, 454, 1972
- 5) Thomson, P.D.: Ann. Intern. Med., 78, 499, 1973
- 6) Wiedling, S.: Anaesthesist, 1, 119, 1952
- 7) Wiedling, S.: Acta Pharmacol. Toxicol., 8, 117, 1952
- 8) 円谷福男：麻酔, 6, 357, 1957
- 9) 植木昭和 他：福岡医学雑誌, 51, 1361, 1960
- 10) Krantz, J.C., et al.: J. Pharmacol. Exp. Ther., 111, 224, 1954
- 11) 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

\*\*  aspen

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>