

**2017年7月改訂(第10版)
*2015年1月改訂

局所麻酔剤

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%

日本標準商品分類番号
871214

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

	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%
承認番号	21700AMZ 00410000	21700AMZ 00411000
薬価収載	2005年7月	
販売開始	2005年9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

日本薬局方 リドカイン注射液
Xylocaine[®]Injection syringe 0.5%・1%

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 【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】**
- 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。]
 - 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。]
 - 敗血症の患者[敗血症性の髄膜炎を生じるおそれがある。]

【組成・性状】

1. 組成

1mLあたりの成分含量

販売名	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%
成分・含量(1mL中)	リドカイン塩酸塩 5mg	リドカイン塩酸塩 10mg
添加物(1mL中)	塩化ナトリウム 8mg pH調整剤 適量	塩化ナトリウム 6mg pH調整剤 適量

1シリンジあたりの有効成分含量

販売名	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%
1シリンジ10mL中	リドカイン塩酸塩 50mg	リドカイン塩酸塩 100mg

2. 性状

販売名	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%
剤形	注射剤	
色・形状	無色澄明の液	
容器	ポリプロピレン製シリンジ	
pH	5.0~7.0	
浸透圧比(生理食塩液に対する比)	約1	

【効能・効果】

注シリンジ0.5%：硬膜外麻酔、伝達麻酔、浸潤麻酔
注シリンジ1%：硬膜外麻酔、伝達麻酔、浸潤麻酔、表面麻酔

【用法・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

【使用上の注意】

- 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)**
【共通(硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔)】
 - 高齢者(「高齢者への投与」及び「重要な基本的注意」の項参照)
 - 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)
 - 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。]
 - 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】

 - 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。]
 - 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。]
 - 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。]
 - 妊産婦(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
 - 腹部腫瘤のある患者[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ため、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**
【共通(硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔)】
 - 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。なお、事前の静脈路確保が望ましい。
 - 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。
 - 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。
 - できるだけ薄い濃度のものを用いること。
 - できるだけ必要最小量にとどめること。
 - 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。
 - 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】

 - 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。
 - 必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。
 - 注射の速度はできるだけ遅くすること。
 - 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。
 - 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。

- (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。

【伝達麻酔・浸潤麻酔】

- (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) 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。

- (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。

- (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。

【表面麻酔】

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**吸収が速い**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**吸収が速い**ので注意すること。(「過量投与」の項参照)

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

【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
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

【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。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

【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: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)

【伝達麻酔】

妊産婦:旁頸管ブロックにより胎児の徐脈を起すおそれがある。

7. 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。

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。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。

9. 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。

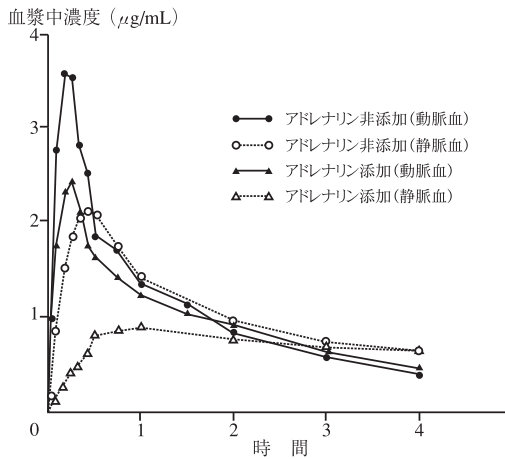
10. その他の注意

- (1) ボ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。
- (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。

【薬物動態】

1. 吸収及び血中動態

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¹⁾。



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	Cmax (μg/mL)	Tmax (min)	AUC _{0-4h} (μg·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

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分に比べて延長した²⁾。

2. 分布³⁾

リドカイン2μg/mLの血漿蛋白結合率は約65%で、α₁-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⁴⁾

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⁴⁾

リドカイン塩酸塩250mgを外国人健康成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⁵⁾

外国人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。

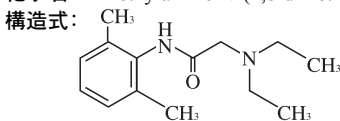
2. 麻酔効果・作用時間:

- 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^{6,7,8,9,10,11)}。
- 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¹²⁾。

【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



分子式:C₁₄H₂₂N₂O

分子量:234.34

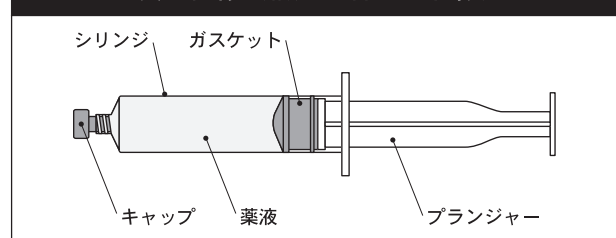
融点:66～69°C

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】

- 安定性試験¹³⁾**
最終包装製品を用いた加速試験(40°C、相対湿度75%、6カ月)の結果、本剤は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。
- プリスター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。
- 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、使用後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。]
- 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。

製品仕様(構成と各部の名称)



【本剤の使用方法】

- プ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:プリスター包装は使用時まで開封しないこと。
- 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。]
- 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。
- 注射針に接続し、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。]

【包装】

キシロカイン注シリンジ0.5%:10mL×10シリンジ

キシロカイン注シリンジ1%:10mL×10シリンジ

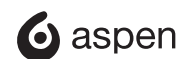
【主要文献】

- Mather, L.E., et al.:Br. J. Anaesth., 48, 989, 1976
- Nation, R.L., et al.:Br. J. Clin. Pharmacol., 4, 439, 1977
- Burm, A.G.L.:Clin. Pharmacokinet., 16, 283, 1989
- Keenaghan, J.B., et al.:J. Pharmacol. Exp. Ther., 180, 454, 1972
- Thomson, P.D.:Ann. Intern. Med., 78, 499, 1973
- Wiedling, S.:Anaesthesist, 1, 119, 1952
- Wiedling, S.:Acta Pharmacol. Toxicol., 8, 117, 1952
- 日谷福男:麻酔, 6, 357, 1957
- 植木昭和 他:福岡医学雑誌, 51, 1361, 1960
- Krantz, J.C.:J. Pharmacol. Exp. Ther., 111, 224, 1954
- Truant, A.P.:Arch. Int. Pharmacodyn., 115, 483, 1958
- Åkerman, B., et al.:Acta Anaesthesiol. Scand., 32, 571, 1988
- 社内資料(ニプロ(株)):キシロカイン注シリンジの安定性, 2007)

****【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】**

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

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



販売
**** 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>



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