



日本標準商品分類番号
871214

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**

	注射液0.5%	注射液1%	注射液2%
承認番号	13127KUZ 01613004	13127KUZ 01613007	13127KUZ 01613003
薬価収載	1956年9月		
販売開始	1956年3月		
再評価結果	1978年3月		

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

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2.5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)**

**【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) プチロフェノン系・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。]

**【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)**

**【共通(硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔)】**

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。]
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。]
3. 精神神経症の患者[一般に交感神経作動薬の中樞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。]
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。]

**【組成・性状】**

**1. 組成**

販売名	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
成分・含量(1mL中)	リドカイン塩酸塩 5mg	リドカイン塩酸塩 10mg	リドカイン塩酸塩 20mg
成分・含量(1mL中)	アドレナリン 0.01mg	アドレナリン 0.01mg	アドレナリン 0.0125mg
添加物(1mL中)	塩酸 0.1μL 塩化ナトリウム 8mg メチルパラベン 1mg ピロ亜硫酸ナトリウム 0.55mg pH調整剤 適量	塩酸 0.2μL 塩化ナトリウム 6mg メチルパラベン 1mg ピロ亜硫酸ナトリウム 0.55mg pH調整剤 適量	塩酸 0.4μL 塩化ナトリウム 6mg メチルパラベン 1mg ピロ亜硫酸ナトリウム 0.55mg pH調整剤 適量

**2. 性状**

販売名	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
剤形	注射液		
色・形状	無色澄明の液		
pH	3.3~5.0		
浸透圧比(生理食塩液に対する比)	約1		

**【効能・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

**【用法・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とおりである。( )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

**【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)**

**【共通(硬膜外麻酔・伝達麻酔・浸潤麻酔・表面麻酔)】**

- (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) 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)
- (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。]

- (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。]

**【硬膜外麻酔】**

- (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患者[硬膜外麻酔により病状が悪化するおそれがある。]
- (2) 血液凝固障害や抗凝薬投与中の患者[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。]
- (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。]
- (4) 妊産婦(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」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。]
- (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。]

**\*\*【伝達麻酔・浸潤麻酔(耳、指趾へ投与する場合)】**

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。]

**2. 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)】**

- (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。
- (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) できるだけ**必要最小量**にとどめること。
  - 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。
- (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。

**【硬膜外麻酔】**

- (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) 注射の速度はできるだけ**遅く**すること。
  - 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。
  - 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。
  - 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。

- (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) 注射の速度はできるだけ**遅く**すること。
  - 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。
  - 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。
- (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) 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。
- (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。
- 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。
  - 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。

**【表面麻酔】**

- (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) 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)
- (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。

**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。

**(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、イミゾベンジル系、ゾテピン、リスパリドン等) 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。
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、場合により心アドレナリン作動薬がある。	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(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 <sup>(注1)</sup> 、イソフルラン <sup>(注2)</sup> 、セボフルラン <sup>(注3)</sup>	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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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 トリクロメチアジド、 ヒドロクロチアジド等 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は、利尿剤の一時休業等を行うこと。	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。

- 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 $\mu$ g/kgと報告されている<sup>1)</sup>。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 $\mu$ g/kgと報告されている<sup>1)</sup>。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 $\mu$ g/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 $\mu$ g/kg～14.9 $\mu$ g/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<sup>2)</sup>。アドレナリン5 $\mu$ g/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。

#### 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。
- 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(ポットワイン色尿)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
循環器	頻脈、期外収縮、血圧変動等
中枢神経 <sup>注1)</sup>	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈、頭痛等
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
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。

#### 5. 高齢者への投与

**[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。

**[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:**

- 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。**

#### 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、心室頻拍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。

#### 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

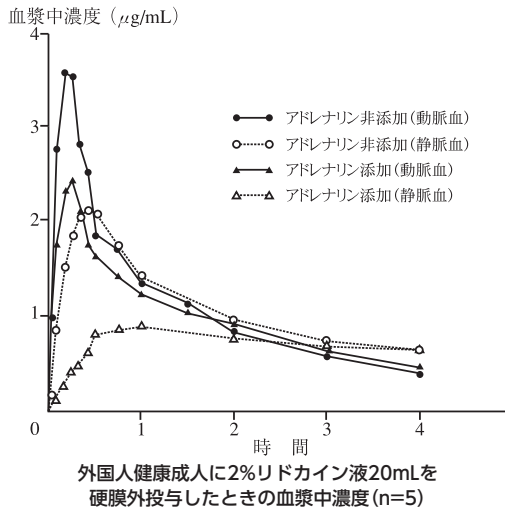
- (1) ポルフィリン症の患者に投与した場合、急性腹症、四肢麻痺、意識障害等の急性症状を誘発するおそれがある。**

- (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。

### 【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<sup>3)</sup>。



投与群	Cmax (µg/mL)	Tmax (min)	AUC <sub>0-4h</sub> (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分比べて延長した<sup>4)</sup>。

#### 2. 分布<sup>5)</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>6)</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>6)</sup>

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>7)</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:

(1) 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<sup>8)</sup>。

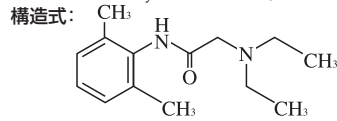
- (2) リドカイン塩酸塩の表面・浸潤・伝達麻酔作用は、プロカイン塩酸塩よりも強く、作用持続時間はプロカイン塩酸塩よりも長い。また、アドレナリン添加により、その作用は増強される<sup>9),10),11),12),13),14)</sup>。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

#### 【リドカイン】

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

分子量:234.34

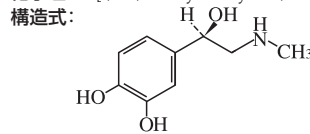
融点:66~69°C

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。

#### 【アドレナリン】

一般名:アドレナリン(Adrenaline) (JAN) (日局)

化学名:4-[(1R)-1-Hydroxy-2-(methylamino)ethyl]benzene-1,2-diol



分子式:C<sub>9</sub>H<sub>13</sub>NO<sub>3</sub>

分子量:183.20

性状:アドレナリンは白色~灰白色の結晶性の粉末である。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。空気又は光によって徐々に褐色となる。

### 【取扱い上の注意】

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、使用後十分に水洗すること。

### 【包装】

キシロカイン注射液[0.5%]エピレナミン含有:[バイアル]20mL  
キシロカイン注射液[1%]エピレナミン含有:[バイアル]20mL、100mL  
キシロカイン注射液[2%]エピレナミン含有:[バイアル]20mL

### 【主要文献】

- 1) Johnston, R.R., et al.:Anesth. Analg., 55(5), 709, 1976
- 2) Navarro, R., et al.:Anesthesiology, 80, 545, 1994
- 3) Mather, L.E., et al.:Br. J. Anaesth., 48, 989, 1976
- 4) Nation, R.L., et al.:Br. J. Clin. Pharmacol., 4, 439, 1977
- 5) Burn, A.G.L.:Clin. Pharmacokinetic., 16, 283, 1989
- 6) Keenaghan, J.B., et al.:J. Pharmacol. Exp. Ther., 180, 454, 1972
- 7) Thomson, P.D.:Ann. Intern. Med., 78, 499, 1973
- 8) Åkerman, B., et al.:Acta Anaesthesiol. Scand., 32, 571, 1988
- 9) Wiedling, S.:Anaesthesist, 1, 119, 1952
- 10) Wiedling, S.:Acta Pharmacol. Toxicol., 8, 117, 1952
- 11) 円谷福男:麻酔, 6, 357, 1957
- 12) 植木昭和 他:福岡医学雑誌, 51, 1361, 1960
- 13) Krantz, J.C.:J. Pharmacol. Exp. Ther., 111, 224, 1954
- 14) 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>