

火気に注意

定量噴霧式表面麻酔剤

劇薬

\*\* **リドカイン** ポンプスプレー8%「日新」

Lidocaine Pump Spray 8%「NISSIN」

** 承認番号	22600AMX00823000
** 薬価収載	2014年12月
** 販売開始	

貯法：室温保存  
使用期限：3年（外箱に記載）  
注意：【取扱上の注意】の項参照

（リドカイン製剤）

【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】

販売名	リドカインポンプスプレー8%「日新」
有効成分・含量 (1mL中)	日本薬局方リドカイン80mg
添加物	マクロゴール400、サッカリンナトリウム水和物、エタノール、l-メントール、pH調整剤
性状	無色～微黄色澄明な液で、定量噴霧式製剤である。
pH	8.5～9.5

【効能・効果】

表面麻酔

【用法・用量】

リドカインとして、通常成人では8～40mg（1～5回の噴霧）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＞

- 添付のノズルを装着し、ノズル内に溶液が充満するよう、患部に噴霧する前に火気に注意して、少なくとも5回空噴霧した後に麻酔部位に噴霧する。麻酔部位に噴霧する際には溶液が霧状となるようノズルを強く押すこと。
- ノズルを1回押すごとに溶液0.1mL（リドカインとして8mg含有）が噴霧される。通常1～5回の噴霧（溶液0.1～0.5mL：リドカインとして8～40mg）で十分である。広範な部位を麻酔する場合及び麻酔効果をさらに長時間持続させる場合には、噴霧回数を適宜調節する。ただし一時に25回（リドカインとして200mg）以上の噴霧は避けること。
- 小児に使用する場合や、扁桃炎等で充血している場合には十分注意して使用すること。
- 残液量が少なくなった場合はチューブの先端が下側になるようにして使用すること。

【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）

- 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。〕
- 幼児（「小児等への投与」の項参照）

2. 重要な基本的注意

- 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。
- 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。
  - 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。
  - 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。

- 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）。
  - 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。
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

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用（頻度不明）

- 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。
- 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)</sup>	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈等
消化器 <sup>(注)</sup>	悪心・嘔吐等
過敏症	蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等

注) 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。

(1) 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。

#### (2) 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) 気管内チューブには噴霧しないこと（【取扱い上の注意】の項参照）。

### 10. その他の注意

- (1) 本剤の投与により、気管内挿管後の咽頭痛、嘔声等の発現を増加させたとの報告がある。
- (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。

### 【薬効薬理】

#### \*\* 1. 生物学的同等性試験<sup>1)</sup> 局所（表面）麻酔作用

- (1) リドカインポンプスプレー8%「日新」と標準製剤について、モルモットの角膜表面にそれぞれ50 $\mu$ L適用し、刺激毛による刺激に対する瞬目反射反応の有無を測定したところ、生理食塩液及びリドカインポンプスプレー8%「日新」の基剤と比較して両製剤とも有意に反応回数を減少させ、同様の表面麻酔作用が認められた。また、統計解析を行った結果、両製剤の効果に有意差は認められず、両製剤の生物学的同等性が確認された。
- (2) リドカインポンプスプレー8%「日新」と標準製剤について、ラットの肛門括約筋部にそれぞれ100 $\mu$ L擦り込み、刺激毛による刺激に対する肛門括約筋の収縮反射反応の有無を測定したところ、生理食塩液及びリドカインポンプスプレー8%「日新」の基剤と比較して両製剤とも有意に反応回数を減少させ、同様の表面麻酔作用が認められた。また、統計解析を行った結果、両製剤の効果に有意差は認められず、両製剤の生物学的同等性が確認された。

#### \*\* 2. 薬理作用<sup>2)</sup>

リドカインは神経細胞膜のNa<sup>+</sup>チャネルを抑制することによって神経の活動電位発生を抑制するという局所麻酔薬共通的作用により、知覚神経の求心性伝導を抑制する。

### 【有効成分に関する理化学的見聞】

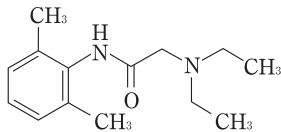
一般名：リドカイン（Lidocaine）

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

構造式：



**性状：**本品は白色～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。本品は、希塩酸に溶ける。

**融点：**66～69℃

### 【取扱い上の注意】

#### \* 1. ノズルの取り扱いについて

- (1) ボトルの初回開封時は、製品添付の新しいノズルを使用すること。
- (2) ノズル接合部に緩みがあると、噴霧時にノズル管又はノズル先端部が脱落又は飛び出す可能性があるため、以下の点に注意すること。
  - 1) ノズルを曲げる等、ノズル根元及び先端部に無理な力を加えないこと。
  - 2) 使用前には、ノズルの両端を軽く引っ張り、根元及び先端部に緩みのないことを確認すること。
  - 3) 使用直前に空噴霧する際には、噴霧状態とノズル先端部に緩みのないことも確認すること。
  - 4) 2)、3)の確認において緩んだノズル、変形・変色したノズル、噴霧できないノズルは廃棄すること。
- (3) 使用後のノズルの取扱いは、以下の点に注意すること。
  - 1) ノズルのクリーニング  
ノズルは使用後そのまま放置しておく、薬液がノズルの中で結晶化し目詰まりを起こすことがあるため、使用後にエタノール（消毒用エタノールなど）で浸漬すること。
  - 2) ノズルの消毒  
患者に使用した後、別の患者に使用する場合には消毒したノズルを使用すること。
  - 4) ノズルの先端を切ると噴射パターンが変わるので、切らないこと。

#### 2. 本剤は、エタノール及びマクロゴール400を含有しているため、以下の点に注意すること。

- (1) 炎に向けて使用しないこと。
  - (2) ストープやコンロ等、火気の付近で使用しないこと。
- 【火気に注意】
- (3) 火の中に入れていないこと。
  - (4) 内容液を使いきった後廃棄すること。

#### 3. 本剤を気管内チューブに噴霧することにより、気管内チューブのカフ部分の破損（ピンホール）、及びチューブのマーキングが消失することがあるため、気管内チューブに噴霧しないこと。

#### 4. 本品は、ガラス容器を用いた製品であるため、衝撃を与えないよう取扱いには注意すること。

#### \*\* 5. 安定性試験<sup>3)</sup>

リドカインポンプスプレー8%「日新」は、最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、室温保存において3年間安定であることが推測された。また、最終包装製品を用いた長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における3年間の安定性が確認された。

#### \*\*【包装】

リドカインポンプスプレー8%「日新」 80g

#### 【主要文献】

- 1) 日新製薬株式会社 社内資料：生物学的同等性に関する資料
- \*2) 第十六改正日本薬局方解説書
- 3) 日新製薬株式会社 社内資料：安定性に関する資料

#### 【文献請求先】

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下さい。  
日新製薬株式会社 安全管理部  
〒994-0069 山形県天童市清池東二丁目3番1号  
TEL 023-655-2131 FAX 023-655-3419  
E-mail：d-info@yg-nissin.co.jp

製造販売元

 **日新製薬株式会社**

山形県天童市清池東二丁目3番1号