

日本標準商品分類番号	
871211	
承認番号	22000AMX01638
薬価収載	2008年11月
販売開始	2008年11月
再評価結果	1974年11月

貯 法：室温保存

使用期限：3年（ラベルに表示の使用期限を参照すること。）

局所麻酔剤

劇薬

プロカイン塩酸塩原末「マルイシ」

日本薬局方 プロカイン塩酸塩

【禁 忌】

1. 次の患者には投与しないこと

- (1) 重篤な出血やショック状態の患者（脊椎、硬膜外麻酔時）[症状が悪化するおそれがある。]
- (2) 注射部位またはその周辺に炎症のある患者（脊椎、硬膜外麻酔時）[吸収が高まり、効果が急激に発現するおそれがある。]
- (3) 敗血症の患者（脊椎、硬膜外麻酔時）[敗血症性の髄膜炎が起こるおそれがある。]
- (4) メトヘモグロビン血症の患者（硬膜外、浸潤、伝達（脊椎麻酔用剤を除く）麻酔時）[症状が悪化するおそれがある。]
- (5) 本剤または安息香酸エステル（コカインを除く）系局所麻酔剤に対し、過敏症の既往歴のある患者

2. 次の患者に投与する場合には、血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加しないこと

- (1) 血管収縮剤に対し、過敏症の既往歴のある患者（硬膜外、浸潤、伝達（脊椎麻酔用剤を除く）麻酔時）
- (2) 高血圧、動脈硬化のある患者（硬膜外、浸潤、伝達（脊椎麻酔用剤を除く）麻酔時）[急激に血圧が上昇し、脳出血が起こるおそれがある。]
- (3) 心不全のある患者（硬膜外、浸潤、伝達（脊椎麻酔用剤を除く）麻酔時）[血管収縮、心臓刺激の結果、症状が悪化するおそれがある。]
- (4) 甲状腺機能亢進のある患者（硬膜外、浸潤、伝達（脊椎麻酔用剤を除く）麻酔時）[血管収縮剤に対して反応しやすく、心悸亢進、胸痛等が起こるおそれがある。]
- (5) 糖尿病の患者（硬膜外、浸潤、伝達（脊椎麻酔用剤を除く）麻酔時）[血糖値が上昇するおそれがある。]
- (6) 血管痙攣のある患者（硬膜外、浸潤、伝達（脊椎麻酔用剤を除く）麻酔時）[阻血状態をきたし、局所壊死が起こるおそれがある。]
- (7) 耳、指趾または陰茎の麻酔（浸潤、伝達（脊椎麻酔用剤、歯科用にのみ用いる製剤を除く）麻酔時）[阻血状態をきたし、局所壊死が起こるおそれがある。]

【組成・性状】

1. 組成 本品1g中 日局プロカイン塩酸塩1g含有。
2. 性状 白色の結晶または結晶性の粉末である。水に極めて溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。本品1.0gを水20mLに溶かした液のpHは5.0～6.0である。

【効能・効果】【用法・用量】

使用に際し、目的濃度の水性注射液として使用する。

効能・効果	用法・用量	
	注射液濃度	プロカイン塩酸塩量(通常、成人)
脊椎麻酔 (腰椎麻酔)	5～10%	低位麻酔 50～100mg 高位麻酔 150～200mg
硬膜外麻酔	1.5～2%	200～400mg (基準最高用量：1回600mg)
伝達麻酔	1～2%	10～400mg
浸潤麻酔	0.25～0.5%	1回1000mgの範囲内 (基準最高用量：1回1000mg)
歯科領域における伝達麻酔・浸潤麻酔	2% (アドレナリン添加)	10～100mg

但し、年齢、麻酔領域、部位、組織、症状、体質により適宜増減する。

必要に応じ、アドレナリン（通常濃度1：10万～20万）を添加して使用する。

【使用上の注意】

1. 脊椎麻酔用剤として使用する場合

- (1) 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
 - 1) 中枢神経系疾患（髄膜炎、灰白脊髄炎等）のある患者 [血液、脳へ移行する可能性があり、症状が悪化するおそれがある。]
 - 2) 妊婦、産婦 [「(5) 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照]
 - 3) 高齢者 [「(4) 高齢者への投与」の項参照]
 - 4) 血液疾患や抗凝固剤治療中の患者 [出血しやすいので、血腫形成や脊髄への障害を起こすことがある。]
 - 5) 重篤な高血圧症の患者 [急激な血圧低下が起こることがある。]
 - 6) 脊柱の著明な変形のある患者 [穿刺時、脊髄や神経根の損傷のおそれがある。]
- (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、局所麻酔剤の投与に際しては、常時、ただちに救急処置のとれる準備が望ましい。
- 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、下記の点に留意すること。
 - ア. 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。
 - イ. ショックあるいは中毒症状がみられた際に、迅速な処置が行えるように、原則として事前の静脈の確保が望ましい。
 - ウ. 臍部以上の部位の手術に用いる必要がある場合には、慎重に投与すること。
 - エ. 患者の脳脊髄液の比重にはかなりの変動があることに留意すること。

(3) 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

下記の重大な副作用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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

ア. ショック（初期症状：血圧低下、顔面蒼白、脈拍の異常、呼吸抑制等）

イ. 振戦、痙攣等の中毒症状（処置方法：ジアゼパムまた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）の投与等）

2) その他の副作用

	頻度不明
精神神経系 ^(注)	眠気、不安、興奮、霧視、めまい、悪心・嘔吐
過敏症	蕁麻疹、浮腫等

(注) ショックあるいは中毒への移行に注意し、必要に応じて適切な処置を行うこと。

(4) 高齢者への投与

高齢者では、生理機能が低下していることが多く、副作用が発現しやすい。また血管収縮薬（アドレナリン、ノルアドレナリン）の作用に対する感受性が高いことがあるので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

(5) 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

1) 妊婦また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。]

2) 妊娠末期の婦人には慎重に投与すること。[麻酔範囲が広がり、仰臥性低血圧を起こすことがある。]

(6) 適用上の注意

使用時：

1) 髄液の漏出を最少に防ぐために、脊椎穿刺針は、できるだけ細いものを用いること。(脊椎穿刺により脊髄後頭痛が、また、まれに一過性の外転神経麻痺等があらわれることがある。)なお、必要に応じて輸液を行うこと。

2) 脊椎麻酔により、まれに脊髄神経障害があらわれることがあるので、穿刺に際して患者が放散痛をうったえた場合、脳脊髄液が出にくい場合または血液混入を認めた場合には、本剤を注入しないこと。

2. 硬膜外麻酔用剤として使用する場合

(1) 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

1) 中枢神経系疾患（髄膜炎、灰白脊髄炎等）のある患者 [血液、脳へ移行する可能性があり、症状が悪化するおそれがある。]

2) 妊婦、産婦 [(5) 妊婦、産婦、授乳婦等への投与] の項参照]

3) 高齢者 [(4) 高齢者への投与] の項参照]

4) 血液疾患や抗凝血剤治療中の患者 [出血しやすいので、血腫形成や脊髄への障害を起こすことがある。]

5) 重篤な高血圧症の患者 [急激な血圧低下が起こることがある。]

6) 脊柱の著明な変形のある患者 [穿刺時、脊髄や神経根の損傷のおそれがある。]

7) 血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加して投与する場合

ア. ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔剤投与中の患者 [血管収縮剤に対する心筋の感受性が高まり、不整脈が起こるおそれがある。]

イ. 三環系抗うつ剤またはMAO阻害剤投与中の患者 [カテコールアミンの交感神経

内への取り込みを阻害するので、血管収縮剤の作用が増強され、不整脈、高血圧等が起こるおそれがある。]

(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、局所麻酔剤の投与に際しては、常時、ただちに救急処置のとれる準備が望ましい。

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、下記の点に留意すること。

ア. 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。

イ. できるだけうすい濃度のものを用いること。

ウ. できるだけ必要最小量にとどめること。

エ. 必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。

オ. ショックあるいは中毒症状がみられた際に、迅速な処置が行えるように、原則として事前の静脈の確保が望ましい。

カ. 注射針が血管またはくも膜下腔に入っていないことを確かめること。

キ. 注射の速度はできるだけおそくすること。

(3) 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

下記の重大な副作用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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

ア. ショック（初期症状：血圧低下、顔面蒼白、脈拍の異常、呼吸抑制等）

イ. 振戦、痙攣等の中毒症状（処置方法：ジアゼパムまた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）の投与等）

2) その他の副作用

	頻度不明
精神神経系 ^(注)	眠気、不安、興奮、霧視、めまい、悪心・嘔吐
血液	メトヘモグロビン血症
過敏症	蕁麻疹、浮腫等

(注) ショックあるいは中毒への移行に注意し、必要に応じて適切な処置を行うこと。

(4) 高齢者への投与

高齢者では、生理機能が低下していることが多く、副作用が発現しやすい。また血管収縮薬（アドレナリン、ノルアドレナリン）の作用に対する感受性が高いことがあるので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

(5) 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

1) 妊婦また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。]

2) 妊娠末期の婦人には慎重に投与すること。[麻酔範囲が広がり、仰臥性低血圧を起こすことがある。]

3. 浸潤、伝達（脊椎麻酔用剤を除く）麻酔用剤として使用する場合

(1) 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加して投与する場合

ア. ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔剤投与中の患者 [血管収縮剤に対する心筋の感受性が高まり、不整脈が起こるおそれがある。]

イ. 三環系抗うつ剤またはMAO阻害剤投与中の患者 [カテコールアミンの交感神経内への取り込みを阻害するので、血管収縮剤の作用が増強され、不整脈、高血圧等が起こるおそれがある。]

(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、局所麻酔剤の投与に際しては、常時、ただちに救急処置のとれる準備が望ましい。
- 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、下記の点に留意すること。
 - ア. 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。
 - イ. できるだけけうすい濃度のものを用いること。
 - ウ. できるだけ必要最小量にとどめること。
 - エ. 必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。
 - オ. 血管の多い部位(頭部、顔面、扁桃等)に注射する場合には、吸収が早いのでできるだけ少ない量で使用する。
 - カ. 注射針が血管に入っていないことを確かめること。
 - キ. 注射の速度はできるだけおそくすること。

(3) 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

下記の重大な副作用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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- ア. ショック (初期症状：血圧低下、顔面蒼白、脈拍の異常、呼吸抑制等)
- イ. 振戦、痙攣等の中毒症状 (処置方法：ジアゼパムまた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) の投与等)

2) その他の副作用

	頻度不明
精神神経系 ^(注)	眠気、不安、興奮、霧視、めまい、悪心・嘔吐
血液	メトヘモグロビン血症
過敏症	蕁麻疹、浮腫等

(注) ショックあるいは中毒への移行に注意し、必要に応じて適切な処置を行うこと。

(4) 高齢者への投与

高齢者では、生理機能が低下していることが多く、副作用が発現しやすい。また血管収縮薬 (アドレナリン、ノルアドレナリン) の作用に対する感受性が高いことがあるので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

(5) 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 妊婦また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。]
- 2) 妊娠末期の婦人には慎重に投与すること。[麻酔範囲が広がり、仰臥性低血圧を起こすことがある。]

【薬効薬理】^{1)~3)}

1. 知覚神経末梢及び神経幹に直接作用し、神経線維を麻痺させ、求心性インパルスの伝導を遮断することにより局所麻酔作用をあらわす。
2. コカインに比べ粘膜からの吸収が弱く、表面麻酔には不適當である。
3. 血管拡張作用を有するため、アドレナリン等の血管収縮剤を併用することにより、効力は持続される。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：プロカイン塩酸塩 (Procaine Hydrochloride)

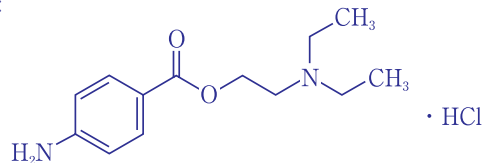
化学名：2-(Diethylamino)ethyl 4-aminobenzoate monohydrochloride

分子式：C₁₃H₂₀N₂O₂·HCl

分子量：272.77

融点：155~158℃

構造式：



【包装】

25g 500g

【主要文献】

- 1) L. S. Goodman & A. Gilman : The Pharmacological Basis of Therapeutics (4th. Ed.), 371 (1970)
- 2) 熊谷 洋他 : 臨床薬理学大系, 第2巻, 3 (1972)
- 3) 羽野 壽他 : 新しい薬理学, 第2版, 190 (1983)

【文献請求先】

丸石製薬株式会社 学術情報部
〒538-0042 大阪市鶴見区今津中2-4-2
TEL.0120-014-561

製造販売元

Ⓢ 丸石製薬株式会社

大阪市鶴見区今津中2-4-2