

貯法：室温保存

有効期間：3年

承認番号	16100AMZ01679000
販売開始	1978年6月

局所麻酔剤  
日本薬局方 リドカイン注射液  
**キシロカイン®0.5%**筋注用溶解液  
**Xylocaine® 0.5% for Intramuscular Injection**

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)

## 2. 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

## 3. 組成・性状

### 3.1 組成

販売名	キシロカイン 0.5%筋注用溶解液
有効成分	1管 (3mL) 中、リドカイン塩酸塩 15mg
添加剤	pH調整剤 適量

### 3.2 製剤の性状

販売名	キシロカイン 0.5%筋注用溶解液
剤形	注射剤
性状	無色澄明の液
pH	5.0～7.0
浸透圧比	約 0.1 (生理食塩液に対する比)

## 4. 効能又は効果

抗生物質製剤の筋注時の疼痛緩和

## 6. 用法及び用量

抗生物質製剤を筋注する場合の疼痛緩和のための溶解液として用いる。

リドカイン塩酸塩として、通常、成人 10～15mg (2～3mL) を使用する。

静注には使用しないこと。

## 8. 重要な基本的注意

8.1 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。

8.2 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、以下の点に留意すること。

8.2.1 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。

8.2.2 できるだけ必要最小量にとどめること。

8.2.3 注射の速度はできるだけ遅くすること。

8.2.4 注射針が、血管に入っていないことを確かめること。

8.2.5 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。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。

### 9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。ヒト乳汁中への移行が報告されている。

## 10. 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。

## 10.2 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
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。

## 11. 副作用

次の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投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

### 11.1 重大な副作用

#### 11.1.1 ショック（頻度不明）

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。

#### 11.1.2 振戦、痙攣（いずれも頻度不明）

振戦、痙攣等の中毒症状があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には、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）の投与等の適切な処置を行うこと。

#### 11.1.3 悪性高熱（頻度不明）

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（ポークワイン色尿）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。

### 11.2 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。

## 14. 適用上の注意

### 14.1 薬剤投与後の注意

14.1.1 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、使用后十分に水洗すること。

14.1.2 本剤は防腐剤を含んでいないため、使用残液は廃棄すること。

## 15. その他の注意

### 15.1 臨床使用に基づく情報

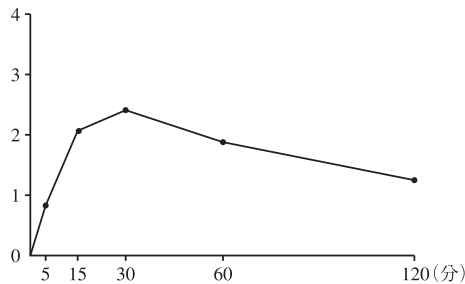
ボルフィリン症の患者に投与した場合、急性腹症、四肢麻痺、意識障害等の急性症状を誘発するおそれがある。

## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

患者にリドカイン塩酸塩 200mg<sup>注1)</sup>を筋肉内投与したとき、血漿中濃度は注入後 15～30分で最高濃度（約 2μg/mL）に達し、その後約 2時間の半減期で減少した<sup>1)</sup>（外国人データ）。

血漿中濃度 (μg/mL)



外国人患者にリドカイン塩酸塩 200mg を筋肉内注入後の血漿中濃度 (平均値、n=30)

### 16.3 分布

リドカイン 2 μg/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<sup>注2)</sup>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<sup>2)</sup>。

### 16.4 代謝

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-xylylidine に代謝され、約 70% が 4-hydroxy-2,6-xylylidine として尿中に排泄されると考えられている<sup>3)</sup>。

### 16.5 排泄

リドカイン塩酸塩 250mg<sup>注1)</sup> を健康人に経口投与<sup>注2)</sup>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<sup>3)</sup> (外国人データ)。

### 16.6 特定の背景を有する患者

#### 16.6.1 高齢者

高齢者にリドカイン塩酸塩 50mg<sup>注1)</sup> を静脈内投与後<sup>注2)</sup>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<sup>4)</sup> (外国人データ)。

#### 16.6.2 心不全患者、腎不全患者及び肝機能低下患者

心不全患者及び腎不全患者にリドカイン塩酸塩 50mg<sup>注1)</sup> を静脈内投与後<sup>注2)</sup>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<sup>5)</sup> (外国人データ)。

注 1) 本剤の承認された用量は、通常、成人 10~15mg (2~3mL) である。

注 2) 本剤の投与経路は筋肉内である。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 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。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

### 一般的名称

リドカイン (Lidocaine) (JAN)

### 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

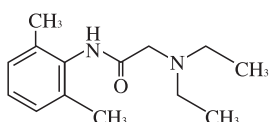
### 分子量

234.34

### 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。

### 化学構造式



### 融点

66~69°C

®登録商標

## 22. 包装

3mL×10 アンプル

## 23. 主要文献

- 1) Ed. Scott, D.B. & Julian, D.G.: Lidocaine in the treatment of ventricular arrhythmias. 1971 : 153-160
- 2) Burm, A.G.L.: Clin. Pharmacokinet. 1989 ; 16 : 283-311
- 3) Keenaghan, J.B. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther. 1972 ; 180 : 454-463
- 4) Nation, R.L. et al. : Br. J. Clin. Pharmacol. 1977 ; 4 : 439-448
- 5) Thomson, P.D. et al. : Ann. Intern. Med. 1973 ; 78 : 499-508

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

サンド株式会社 カスタマーケアグループ

〒105-6333 東京都港区虎ノ門1-23-1

TEL 0120-982-001

FAX 03-6257-3633

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売

## サンドファーマ株式会社

東京都港区虎ノ門1-23-1

URL: <https://www.sandoz.jp/>

### 26.2 販売

## サンド株式会社

東京都港区虎ノ門1-23-1

URL: <https://www.sandoz.jp/>