2021 年 9 月改訂（第 10 版）

日本標準商品分類番号　871214

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のＩＦ記載要領 2013 に準拠して作成

経口表面麻酔剤

キシロカイン®ビスカス2%

リドカイン塩酸塩ビスカス

Xylocaine® Viscous 2%

剤形	ビスカス
製剤の規制区分	劇薬
規格・含量	1mL 中　リドカイン塩酸塩 20mg を含有
一般名	和名：リドカイン（JAN） 洋名：Lidocaine（JAN、INN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載･発売年月日	製造販売承認年月日：2006 年 1 月 30 日 薬価基準収載年月日：2006 年 6 月 9 日 発　売　年　月　日：2006 年 6 月 **【医薬発第 935 号（平成 12 年 9 月 19 日付）に係る販売名変更前】** 旧販売名：キシロカインビスカス 製造販売承認年月日：1962 年 3 月 31 日 薬価基準収載年月日：1963 年 1 月 1 日 発　売　年　月　日：1962 年 8 月
開発･製造販売（輸入）･提携・販売会社名	販　　売：サンド株式会社 製造販売：サンドファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	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 医療関係者向けホームページ https://www.sandoz.jp/medical

本 IF は 2021 年 9 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html にてご確認下さい。

IF 利用の手引きの概要

―日本病院薬剤師会―

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」（http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

［IF の様式］

①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

［IF の作成］

①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

［IF の発行］

①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることがあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

（2013 年 4 月改訂・一部改変）

目　　次

Ⅰ．概要に関する項目 …… 1
1. 開発の経緯 …… 1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 …… 1

Ⅱ．名称に関する項目 …… 2
1. 販売名 …… 2
(1) 和名 …… 2
(2) 洋名 …… 2
(3) 名称の由来 …… 2
2. 一般名 …… 2
(1) 和名（命名法） …… 2
(2) 洋名（命名法） …… 2
(3) ステム …… 2
3. 構造式又は示性式 …… 2
4. 分子式及び分子量 …… 2
5. 化学名（命名法） …… 2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 …… 2
7. CAS 登録番号 …… 2

Ⅲ．有効成分に関する項目 …… 3
1. 物理化学的性質 …… 3
(1) 外観・性状 …… 3
(2) 溶解性 …… 3
(3) 吸湿性 …… 3
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点 …… 3
(5) 酸塩基解離定数 …… 3
(6) 分配係数 …… 3
(7) その他の主な示性値 …… 3
2. 有効成分の各種条件下における安定性 …… 3
3. 有効成分の確認試験法 …… 3
4. 有効成分の定量法 …… 3

Ⅳ．製剤に関する項目 …… 4
1. 剤形 …… 4
(1) 剤形の区別、規格及び性状 …… 4
(2) 製剤の物性 …… 4
(3) 識別コード …… 4
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等 …… 4
2. 製剤の組成 …… 4
(1) 有効成分（活性成分）の含量 …… 4
(2) 添加物 …… 4
(3) その他 …… 4
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 …… 4
4. 製剤の各種条件下における安定性 …… 4
5. 調製法及び溶解後の安定性 …… 4
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 5
7. 溶出性 …… 5
8. 生物学的試験法 …… 5
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 …… 5
10. 製剤中の有効成分の定量法 …… 5
11. 力価 …… 5
12. 混入する可能性のある夾雑物 …… 5
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 …… 5
14. その他 …… 5

Ⅴ．治療に関する項目 …… 6
1. 効能又は効果 …… 6
2. 用法及び用量 …… 6
3. 臨床成績 …… 6
(1) 臨床データパッケージ …… 6
(2) 臨床効果 …… 6
(3) 臨床薬理試験 …… 6
(4) 探索的試験 …… 6
(5) 検証的試験 …… 6
(6) 治療的使用 …… 6

Ⅵ．薬効薬理に関する項目 …… 7
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …… 7
2. 薬理作用 …… 7
(1) 作用部位・作用機序 …… 7
(2) 薬効を裏付ける試験成績 …… 7
(3) 作用発現時間・持続時間 …… 7

Ⅶ．薬物動態に関する項目 …… 8
1. 血中濃度の推移・測定法 …… 8
(1) 治療上有効な血中濃度 …… 8
(2) 最高血中濃度到達時間 …… 8
(3) 臨床試験で確認された血中濃度 …… 8
(4) 中毒域 …… 9
(5) 食事・併用薬の影響 …… 9
(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因 …… 9
2. 薬物速度論的パラメータ …… 9
(1) 解析方法 …… 9
(2) 吸収速度定数 …… 9
(3) バイオアベイラビリティ …… 9
(4) 消失速度定数 …… 9
(5) クリアランス …… 9
(6) 分布容積 …… 9
(7) 血漿蛋白結合率 …… 9
3. 吸収 …… 9
4. 分布 …… 10
(1) 血液－脳関門通過性 …… 10
(2) 血液－胎盤関門通過性 …… 10
(3) 乳汁への移行性 …… 10
(4) 髄液への移行性 …… 10
(5) その他の組織への移行性 …… 10
5. 代謝 …… 10
(1) 代謝部位及び代謝経路 …… 10
(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種 …… 10
(3) 初回通過効果の有無及びその割合 …… 11
(4) 代謝物の活性の有無及び比率 …… 11
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ …… 11
6. 排泄 …… 11
(1) 排泄部位及び経路 …… 11
(2) 排泄率 …… 11
(3) 排泄速度 …… 11

目　　次

7. トランスポーターに関する情報 ····· 12
8. 透析等による除去率 ····· 12

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 ·· 13
1. 警告内容とその理由 ····· 13
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） ····· 13
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 ····· 13
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 ····· 13
5. 慎重投与内容とその理由 ····· 13
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 ····· 13
7. 相互作用 ····· 14
(1) 併用禁忌とその理由 ····· 14
(2) 併用注意とその理由 ····· 14
8. 副作用 ····· 14
(1) 副作用の概要 ····· 14
(2) 重大な副作用と初期症状 ····· 14
(3) その他の副作用 ····· 14
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧 ····· 14
(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度 ····· 14
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法 ····· 15
9. 高齢者への投与 ····· 15
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 ····· 15
11. 小児等への投与 ····· 15
12. 臨床検査結果に及ぼす影響 ····· 15
13. 過量投与 ····· 15
14. 適用上の注意 ····· 16
15. その他の注意 ····· 16
16. その他 ····· 16

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目 ····· 17
1. 薬理試験 ····· 17
(1) 薬効薬理試験 ····· 17
(2) 副次的薬理試験 ····· 17
(3) 安全性薬理試験 ····· 17
(4) その他の薬理試験 ····· 17
2. 毒性試験 ····· 17
(1) 単回投与毒性試験 ····· 17
(2) 反復投与毒性試験 ····· 17
(3) 生殖発生毒性試験 ····· 18
(4) その他の特殊毒性 ····· 18

Ⅹ. 管理的事項に関する項目 ····· 19
1. 規制区分 ····· 19
2. 有効期間又は使用期限 ····· 19
3. 貯法・保存条件 ····· 19
4. 薬剤取扱い上の注意点 ····· 19
(1) 薬局での取扱い上の留意点について ····· 19
(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等） ····· 19
(3) 調剤時の留意点について ····· 19
5. 承認条件等 ····· 19
6. 包装 ····· 19
7. 容器の材質 ····· 19
8. 同一成分・同効薬 ····· 19
9. 国際誕生年月日 ····· 20
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 ····· 20
11. 薬価基準収載年月日 ····· 20
12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容 ····· 20
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 ····· 20
14. 再審査期間 ····· 20
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 ····· 20
16. 各種コード ····· 20
17. 保険給付上の注意 ····· 20

ⅩⅠ. 文献 ····· 21
1. 引用文献 ····· 21
2. その他の参考文献 ····· 21

ⅩⅡ. 参考資料 ····· 22
1. 主な外国での発売状況 ····· 22
2. 海外における臨床支援情報 ····· 22

ⅩⅢ. 備考 ····· 23
その他の関連資料 ····· 23

Ⅰ．概要に関する項目

1. 開発の経緯

1935 年スウェーデンの Löfgren 及び Lundquist は植物塩基 gramine の合成異性体が麻酔性を有することを発見し、この種の多数の誘導体について研究した結果、1943 年リドカインの合成に成功した。その後、Björn、Goldberg、Gordh を始めとする研究者による極めて多数の基礎並びに臨床実験を経て、1948 年スウェーデンの Astra 社（AstraZeneca 社）がその製品を発売するに至った。

なお､2017 年 7 月に製造販売承認がアスペンジャパン株式会社(現サンドファーマ株式会社)に承継された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

（1）キシロカイン（一般名：リドカイン）はアミド型の局所麻酔薬であり、各国において各種形式の局所麻酔に広く用いられている。

（2）本剤は、カルメロースナトリウムを加えて適度の粘性を与えた、経口表面麻酔剤である。

（3）重大な副作用として、ショック、意識障害、振戦、痙攣があらわれることがある。
（なお、使用成績調査等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。）

Ⅱ．名称に関する項目

1．販売名

（1）和名

キシロカインビスカス 2%

（2）洋名

Xylocaine Viscous 2%

（3）名称の由来

不明

2．一般名

（1）和名（命名法）

リドカイン（JAN）

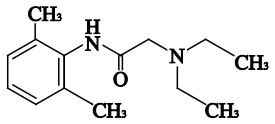
（2）洋名（命名法）

Lidocaine（JAN、INN）

（3）ステム

-caine：local anaesthetics

3．構造式又は示性式



4．分子式及び分子量

分子式：$C_{14}H_{22}N_2O$

分子量：234.34

5．化学名（命名法）

2-Diethylamino-*N*-(2,6-dimethylphenyl)acetamide（IUPAC）

6．慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

7．CAS 登録番号

Lidocaine：137-58-6

Ⅲ．有効成分に関する項目

1．物理化学的性質

（1）外観・性状

白色～微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

（2）溶解性

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。

（3）吸湿性

該当資料なし

（4）融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：66～69℃

（5）酸塩基解離定数

pKa：7.9（25℃）

（6）分配係数

2.9（n-heptane/pH 7.4 緩衝液）

（7）その他の主な示性値

吸光度 $E^{1\%}_{1cm}$（262nm）：14.6（乾燥後、50mg、メタノール、100mL）

施光度：なし

2．有効成分の各種条件下における安定性

	保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
長期保存試験	25℃ 60%RH	褐色瓶密栓	36 ヵ月	変化なし

3．有効成分の確認試験法

日局「リドカイン」による。

（1）紫外可視吸光度測定法

（2）赤外吸収スペクトル測定法

4．有効成分の定量法

日局「リドカイン」による。

比色滴定法

Ⅳ．製剤に関する項目

1．剤形

（1）剤形の区別、外観及び性状

剤形：ビスカス
規格：1mL 中、リドカイン塩酸塩として 20mg を含有
性状：無色～微黄色澄明の粘性の液で芳香がある

（2）製剤の物性

該当資料なし

（3）識別コード

なし

（4）pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

pH：6.2～6.8
粘度：160～380　ミリパスカル秒（mPa･s）
本剤は無菌製剤ではない。

2．製剤の組成

（1）有効成分（活性成分）の含量

1mL 中　リドカイン塩酸塩として 20mg を含有

（2）添加物

メチルパラベン、プロピルパラベン、サッカリンナトリウム水和物、カルメロースナトリウム、pH 調整剤、香料

（3）その他

該当資料なし

3．懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4．製剤の各種条件下における安定性

	保存条件	保存形態	保存期間	試験結果
長期保存試験	25℃ 60%RH	無色ガラス瓶 密栓	24 ヵ月間	粘度が低下傾向を示す他は変化なし。
加速試験	40℃ 75%RH	無色ガラス瓶 密栓	3 ヵ月間	粘度が低下傾向を示す他は変化なし。

5．調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

7. 溶出性

該当資料なし

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

該当資料なし

Ⅴ．治療に関する項目

1．効能又は効果

表面麻酔

2．用法及び用量

リドカイン塩酸塩として、通常成人では1回100～300mg（5～15mL：添付の匙でほぼ1～3杯又は注射筒に吸引して使用する）を1日1～3回経口的に投与する。

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〉

○内視鏡検査、その他咽喉頭・食道部の麻酔には、本剤を一気に嚥下することなく徐々に飲み込ませる。

○口腔内麻酔には、不必要部の麻酔を避ける目的で嚥下させることなく、口腔内に拡げるだけにとどめさせる。

○胃部麻酔を目的とする場合（ダンピング症候群、幽門痙攣等）は、速やかに嚥下させ、コップ半分の水で洗い落とさせる。

3．臨床成績

（1）臨床データパッケージ

該当資料なし

（2）臨床効果

該当資料なし

（3）臨床薬理試験

該当資料なし

（4）探索的試験

該当資料なし

（5）検証的試験

1）無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2）比較試験

該当資料なし

3）安全性試験

該当資料なし

4）患者・病態別試験

該当資料なし

（6）治療的使用

1）使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

2）承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

アミド型局所麻酔薬（ブピバカイン、メピバカイン、プロピトカイン、ロピバカイン）

2. 薬理作用

（1）作用部位・作用機序

作用部位：局所の神経線維

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）薬効を裏付ける試験成績

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[1) 2) 3) 4) 5) 6)]。

（3）作用発現時間・持続時間

作用発現時間：15 分以内[7)]

［胃カメラ検査時の前処置でリドカイン塩酸塩として 100～200mg（5～10mL）投与］

作用持続時間：約 1～2 時間[8)]

［内視鏡前処置でリドカイン塩酸塩として 100～300mg（5～15mL）投与］

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

（1）治療上有効な血中濃度

該当しない

（2）最高血中濃度到達時間

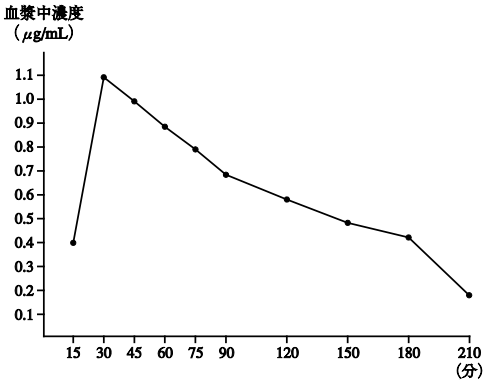
［参考：外国人データ、単回投与］

患者にリドカイン液（500mg*）を単回経口投与したとき、血漿中濃度は投与後約 30 分で最高濃度（約 1 μg/mL）に達した[9]。

（3）臨床試験で確認された血中濃度

1）単回投与［参考：外国人データ］

患者にリドカイン液（500mg*）を単回経口投与したとき、血漿中濃度は投与後約 30 分で最高濃度（約 1 μg/mL）に達し、その後約 2 時間の消失半減期で減少した[9]。



外国人患者にリドカイン 500mg を単回経口投与後の血漿中濃度（平均値、ｎ＝5）

＊注）本剤の承認されている用法及び用量は、「リドカイン塩酸塩として、通常成人では 1 回 100～300mg を 1 日 1～3 回経口的に投与する。なお、年齢、麻酔領域、部位、組織、体質により適宜増減する。」である。

2）高齢者［参考：外国人データ、静脈内投与］

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、若年者の 81 分に比べて延長した[10]。

注）本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔である。

3）臓器障害を有する患者［参考：外国人データ、静脈内投与］

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[11]。

注）本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔である。

（4）中毒域
5～10μg/mL 以上

（5）食事・併用薬の影響
「Ⅷ. -7. 相互作用」の項参照

（6）母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因
該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

（1）解析方法
該当資料なし

（2）吸収速度定数
該当資料なし

（3）バイオアベイラビリティ
［参考：外国人データ、経口投与］
約 35%[12)]

（4）消失速度定数
該当資料なし

（5）クリアランス
［参考：外国人データ、静脈内投与］　0.95 L/min [13) 14)]
注）本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔である。

（6）分布容積
［参考：外国人データ、静脈内投与］　91 L [13) 14)]
注）本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔である。

（7）血漿蛋白結合率
［参考：外国人データ］
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 [13)]。なお、結合率は薬剤の血中濃度の上昇と pH の低下に伴い低下する [15)]。

3. 吸　収

吸収部位：胃、口腔、咽喉頭粘膜
消化管からの吸収率は高いが、吸収後に肝臓で代謝されるために血中濃度の上昇への寄与は少ない。

4. 分　布

(1) 血液－脳関門通過性

〈参考〉

イヌにリドカイン塩酸塩を静脈内投与時の脳静脈、脳脊髄液中リドカイン濃度は、動脈血中濃度のピークに達する時間よりそれぞれ 2～4 分遅れてピークに達し、以後三者同様の減少経過をとり、血液－脳関門を容易に通過すると考えられる[16)]。

(2) 血液－胎盤関門通過性

［参考：外国人データ、硬膜外投与］

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[13)]。

注）本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔である。

(3) 乳汁への移行性

［参考：硬膜外投与］

授乳期のヒトにリドカイン塩酸塩を 50mg 硬膜外投与し乳汁中への移行を調査したところ、乳汁中濃度は血清中濃度の約 30%であった。乳汁中で投与後 30 分で最大となり、60 分後急速に低下した[17)]。

注）本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔である。

(4) 髄液への移行性

〈参考〉

イヌにリドカイン塩酸塩を静脈内投与し、30 分後に動脈血と脳脊髄液を採取しガスクロマトグラフィーにより定量を行ったところ、脳脊髄液中濃度は血中濃度の 53.2±7.3%であった[18)]。

(5) その他の組織への移行性

血球への分布［参考：外国人データ］

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[13)]。

〈参考〉

1)（ラット 2mg/kg i.v.）投与後速やかに血中から消失し、1 分後には心、肺、脳、腎、脾、及び腸管に 70%が存在し、3 分後には筋肉にもかなり移行した。一方、臓器からの消失も速やかで、脂肪においても時間と共に蓄積する傾向は見られなかった[19)]。

2)（ラット 10mg/kg p.o.）肝、腎などに高度に分布し、大部分の臓器では投与後 30 分に最高濃度を示すが、腸管では 2～4 時間後に最高となった[20)]。

5. 代　謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

［参考：外国人データ］

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、芳香族の水酸化などにより glycinexylidide（GX）、2,6-xylidine に代謝され、投与量の約 70％が 4-hydroxy-2,6-xylidine として尿中に排泄される[20)]。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

主に CYP3A4 及び CYP1A2 により代謝される[21) 22) 23)]。

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

［参考：外国人データ］

ヒト肝でのリドカインの初回通過効果は約 70%である [24]。

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

［参考：外国人データ］

主な代謝物である monoethyl glycinexylidide（MEGX）はリドカインとほぼ同等の抗不整脈作用を示し、glycinexylidide（GX）の抗不整脈作用はリドカインの約 1/10 である [25]。

［参考：外国人データ］

外国人健康人に ^{3}H 標識リドカイン塩酸塩 250mg を経口投与し、0～24 時間集めた尿中代謝物及びその比率は下表のとおりであった [20]。

リドカインとその代謝物	(%)
lidocaine	2.8
monoethyl glycinexylidide（MEGX）	3.7
glycinexylidide（GX）	2.3
3-hydroxylidocaine	1.1
3-hydroxy monoethyl glycinexylidide	0.3
2,6-xylidide	1.0
4-hydroxy-2,6-xylidine	72.6
合　　計	83.8

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

［参考：外国人データ］

リドカイン塩酸塩 200mg 筋注時のリドカイン及び monoethyl glycinexylidide（MEGX）の C_{max} 及び半減期は、それぞれ 1.25、0.18 μg/mL 及び 1.7、4.6 時間であった [26]。

注）本剤の承認されている効能又は効果は、表面麻酔である。

6. 排　泄

(1) 排泄部位及び経路

代謝物と極少量の未変化体が尿中へ排泄される [20]。

(2) 排泄率

［参考：外国人データ］

^{3}H 標識リドカイン塩酸塩 250mg を外国人健康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 [20]。

(3) 排泄速度

〈参考〉

ラット、モルモット、イヌにリドカイン塩酸塩を 10～20mg/kg 経口及び 5mg/kg 静脈内投与した結果、下表のとおり排泄された [20]。

［－：測定データなし］

対　象	投与経路	24hr 胆汁中	24hr 尿中	48hr 尿中
ラット	p.o. 10 mg/kg	28.5%	73.0%	90.0%
	i.v. 5 mg/kg	30.0%	65.2%	－
モルモット	p.o. 20 mg/kg	－	93.0%	96.7%
イヌ	p.o. 15 mg/kg	－	67.4%	71.0%
	i.v. 5 mg/kg	－	75.7%	80.9%

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

（1）腹膜透析

該当資料なし

（2）血液透析

血液透析でほとんど除去されない[27) 28)]。

（3）直接血液灌流

該当資料なし

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【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. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
（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）幼児（「小児等への投与」の項参照）

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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、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。
（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）麻酔部位に応じ、含嗽に留める等できるだけ**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。
3）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）
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）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。

7. 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) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

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。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用

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) その他の副作用

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。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

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。

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

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。

（6）薬物アレルギーに対する注意及び試験法

本剤はアミド型局所麻酔薬に対し、過敏症の既往のある患者には投与しない。(禁忌内容とその理由を参照)
アナフィラキシー、蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等が現れることがある。
試験法：確立した方法はないが、局所麻酔薬投与前には十分に問診を行って投与することが重要である。
なお、一般的なアレルギーテスト方法として皮膚テスト（プリックテスト、スクラッチテスト、皮内テスト、パッチテスト）などがある。

9. 高齢者への投与

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ので、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。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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。〕

11. 小児等への投与

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。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

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。

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。

14. 適用上の注意

適用上の注意
使用目的：眼科用として投与しないこと。

15. その他の注意

その他の注意
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。

（解説）

ポルフィリン症患者において、薬剤投与によりポルフィリン症の急性症状（急性腹症、四肢麻痺、意識障害等）が誘発されることが報告されている。誘発要因となる薬剤として局所麻酔剤も報告されており[29]、CCDS（Company Core Data Sheet：企業中核データシート）にポルフィリン症患者への投与に関する注意が追記されたため記載した。

16. その他

該当資料なし

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照）

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

家兎への静脈内投与において、リドカイン塩酸塩 0.1～1mg/kg の少量では血圧には変化を起こさないか軽度上昇で呼吸を興奮、5～10mg/kg の中等量では血圧下降と呼吸の抑制後興奮、大量では血圧下降、心臓抑制を起こす[4)]。

(4) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

急性毒性 LD_{50}（mg/kg）　［－；測定データなし］

使用動物 / 投与経路	マウス	ラット	ウサギ
i.v.[2) 30) 31) 32)]	25～48	約 25	25.6
s.c.[2) 32)]	270～390	—	—
p.o.[2) 32)]	520	—	—

中毒症状：（マウス　i.v.）死亡例の殆どは痙攣及び呼吸麻痺であった。

(2) 反復投与毒性試験

1）亜急性毒性

雌雄のビーグル犬（1 群各 2 匹）にリドカイン塩酸塩 2mg/kg、4mg/kg および 8mg/kg を 1 ヵ月間静脈内投与した。薬物投与後の全身状態は 2mg/kg 投与群では異常はなかったが、4mg/kg 以上の投与群では一過性の歩行障害および横臥、伏臥状態などがみられた。体重は 8mg/kg 投与群の 1 例でやや低下した以外には異常はみられなかった。薬物投与期間中の尿検査、血液学的検査、血液の臨床化学的検査および心電図、薬物投与終了後の剖検、臓器重量および病理組織学的検査では薬物によると思われる変化は認められなかった[32)]。

2）慢性毒性

雌雄のビーグル犬（1 群各 3 匹）にリドカイン塩酸塩 10mg/kg、30mg/kg および 50～60mg/kg を 6 ヵ月間経口投与した。なお、各群 2 匹は薬物投与終了後 2 ヵ月間飼育した。10mg/kg 投与群では薬物によると思われる異常所見は認められなかった。30mg/kg 以上の投与群では嘔吐および鎮静作用がみられ、摂餌量および体重の減少がみられた。血液学的検査および尿検査に異常はみられなかったが、肝機能検査で BSP 排泄の低下がみられ、また 50～60mg/kg 投与群では肝細胞の脂肪変性がみられた。しかし、薬物投与の中止により回復した。その他には薬物によると思われる異常所見は認められなかった[32)]。

(3) 生殖発生毒性試験

ラットにリドカイン塩酸塩 10mg/kg および 30mg/kg を 8 ヵ月間皮下投与した結果、リドカイン塩酸塩の投与により、その仔に奇形を惹起することはなかった[32]。

(4) その他の特殊毒性

局所刺激性

in vitro で抗コリン、抗ヒスタミン作用を見た実験[1]、及び結膜下滴下、皮内・皮下、前房内投与により局所刺激作用を見た実験[33]では、殆どリドカインによる作用はみられなかった。

Ⅹ．管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製　　剤：劇薬
有効成分：劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：製造後 2 年　（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

（1）薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

（2）薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

該当しない

（3）調剤時の留意点について

本剤は金属を侵す性質があるので、長時間金属器具（匙等）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。

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

キシロカインビスカス 2%：〔瓶〕100mL

7. 容器の材質

ガラス製瓶、ポリエチレン製樹脂キャップ

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アネトカインビスカス 2%等

9. 国際誕生年月日

1949 年 11 月 23 日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2006 年 1 月 30 日
承認番号：21800AMX10182000

＜旧販売名：キシロカインビスカス＞
製造承認年月日：1962 年 3 月 31 日
承認番号：(37A) 1283

11. 薬価基準収載年月日

2006 年 6 月 9 日

＜旧販売名：キシロカインビスカス＞
1963 年 1 月 1 日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

1977 年 10 月 28 日　薬務局長通知 薬発第 1226 号「医薬品再評価における評価判定について－その 13」によって、総合評価判定として有用性が認められた。

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT（9 桁）番号	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード
キシロカインビスカス 2%	101656704	1214001S1054	620003539

17. 保険給付上の注意

特になし

ＸＩ．文献

1. 引用文献

1）Wiedling,S.: Anaesthesist, 1 119（1952）
2）Wiedling,S.: Acta Pharmacol.Toxicol., 8 117（1952）
3）円谷福男: 麻酔, 6 357（1957）
4）植木昭和ほか: 福岡医学雑誌, 51 1361（1960）
5）Krantz,J.C.: J.Pharmacol.Exp.Ther., 111 224（1954）
6）Truant,A.P.: Arch.Int.Pharmacodyn., 115 483（1958）
7）増田正典ほか: 消化器病の臨床, 5 526（1963）
8）小川常二ほか: 耳鼻咽喉科, 34 1079（1962）
9）Ed.Scott,D.B.&Julian,D.G.: "Lidocaine in the treatment of ventricular arrhythmias" Livingstone Edinburgh, pp.153（1971）
10）Nation,R.L,et al.: Br.J.Clin.Pharmacol., 4 439（1977）
11）Thomson,P.D.: Ann.Intern.Med., 78 499（1973）
12）MARTINDALE The Extra Pharmacopoeia 38sted., pp.1988（2014）
13）Burm,A.G.L.: Clin.Pharmacokinet., 16 283（1989）
14）Tucker,G.T.: ”Neural blockade in clinical anesthesia and management of pain 2nded.” Philadelphia, pp.80（1988）
15）西村清司ほか: 麻酔, 24 245（1975）
16）坂部武史ほか: 麻酔, 23 1002（1974）
17）藤井文夫ほか: 臨床麻酔, 17 1387（1993）
18）西村清司ほか: 麻酔, 23 1003（1974）
19）Katz,J.: Anesthesiology, 29 249（1968）
20）Keenaghan,J.B.,et al.: J.Pharmacol.Exp.Ther., 180 454（1972）
21）Bargetzi,M.J.: Clin.Pharmacol.Ther., 46 521（1989）
22）Orlando,R: Clin.Pharmacol.Ther., 75 80（2004）
23）Wang,J.S.: Drug Metabo.Dispos., 28 959（2000）
24）Stenson,R.E.,et al.: Circulation, 43 205（1971）
25）Burney,R.G.,et al.: Am.Heart.J., 88 765（1974）
26）Adjepon-Yamoah,K.K.,et al.: Br.J.Pharmacol, 47 672（1973）
27）吉本恵子ほか: 日本透析療法学会抄録, 286（1988）
28）USP DI 19thed., pp.1861（1999）
29）Disler, P.B.et al.: Clin.Dermatol., 3 112（1985）
30）Ulfendahl,H.R. : Acta Anaesthiol.Scand., 1 81（1957）
31）Hunter,A.R.: Br.J.Amaesth., 23 153（1951）
32）社内資料（急性毒性試験,亜急性及び慢性毒性試験,催奇形作用）
33）Tait,C.A.,et al.: South.Med.J., 51 358（1958）

2. その他の参考文献

該当資料なし

ⅩⅡ．参考資料

1. 主な外国での発売状況

リドカインはイギリス、フランス、ドイツ、スウェーデン、カナダ、オーストラリア等で発売されている。（2017 年 6 月現在）

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

ⅩⅢ．備考

その他の関連資料

該当資料なし

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/

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/

XYV02IF-D2109N