

※※2013年6月改訂（第6版）  
 ※2009年6月改訂（第5版，指定医薬品の記載削除）

日本標準品分類番号  
 871211

貯法：室温保存  
 使用期限：容器，外箱に表示の使用  
 期限内に使用すること

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）

日本薬局方

## プロカイン塩酸塩注射液

Procaine Hydrochloride Injection

ロカイン® 注1%  
 ロカイン® 注2%

	1%(1mL)	1%(2mL)	1%(5mL)
承認番号	21900AMX00811		
薬価収載	1954年1月	1954年1月	1954年1月
販売開始	1954年1月	1954年1月	1954年1月
再評価結果	1974年11月		
	2%(1mL)	2%(2mL)	2%(5mL)
承認番号	21900AMX00817		
薬価収載	1954年1月	1954年1月	1954年1月
販売開始	1954年1月	1954年1月	1954年1月
再評価結果	1974年11月		

### 【禁忌】

- 次の患者には投与しないこと
  - 重篤な出血やショック状態の患者（硬膜外麻酔時）〔症状が悪化するおそれがある。〕
  - 注射部位又はその周辺の炎症のある患者（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。〕
  - 敗血症の患者（硬膜外麻酔時）〔敗血症性の髄膜炎が起るおそれがある。〕
  - メトヘモグロビン血症の患者〔症状が悪化するおそれがある。〕
  - 本剤又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
- 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
  - 血管収縮剤に対し，過敏症の既往歴のある患者
  - 高血圧，動脈硬化のある患者〔急激に血圧が上昇し，脳出血が起るおそれがある。〕
  - 心不全のある患者〔血管収縮，心臓刺激の結果，症状が悪化するおそれがある。〕
  - 甲状腺機能亢進のある患者〔血管収縮剤に対して反応しやすく，心悸亢進，胸痛等が起るおそれがある。〕
  - 糖尿病の患者〔血糖値が上昇するおそれがある。〕
  - 血管痙攣のある患者〔阻血状態をきたし，局所壊死が起るおそれがある。〕
  - 耳，指趾又は陰茎の麻酔（伝達＜脊椎麻酔を除く＞麻酔）〔阻血状態をきたし，局所壊死が起るおそれがある。〕

### 【組成・性状】

#### ※※1. 組成

- ロカイン注1%は1アンプル（管）1mL，2mL又は5mL中次の成分・分量を含有する。

	1mL	2mL	5mL
プロカイン塩酸塩	10mg	20mg	50mg

添加物として塩化ナトリウム，pH調節剤を含有する。

- ロカイン注2%は1アンプル（管）1mL，2mL又は5mL中次の成分・分量を含有する。

	1mL	2mL	5mL
プロカイン塩酸塩	20mg	40mg	100mg

添加物として塩化ナトリウム，pH調節剤を含有する。

#### 2. 製剤の性状

ロカイン注1%はアンプル入りの無色澄明の水性注射液である。

ロカイン注2%はアンプル入りの無色澄明の水性注射液である。

	pH	浸透圧比
ロカイン注1%	3.3～6.0	1.1～1.3
ロカイン注2%		1.4～1.6

### 【効能・効果】

ロカイン注1%：伝達麻酔

ロカイン注2%：硬膜外麻酔，伝達麻酔

### 【用法・用量】

#### 硬膜外麻酔

プロカイン塩酸塩として，通常成人300～400mgを使用する（基準最高用量：1回600mg）。

#### 伝達麻酔

プロカイン塩酸塩として，通常成人10～400mgを使用する。ただし，年齢，麻酔領域，部位，組織，症状，体質により適宜増減する。

必要に応じてアドレナリン（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. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

##### （硬膜外麻酔時）

- 中枢神経系疾患（髄膜炎，灰白脊髄炎等）〔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。〕
- 妊産婦〔妊娠末期は，麻酔範囲が広がり，仰臥性低血圧を起すことがあるので注意すること。〕
- 高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕
- 血液疾患や抗凝血剤治療中〔出血しやすいので，血腫形成や脊髄への障害を起すことがある。〕
- 重篤な高血圧症〔急激な血圧低下が起る可能性がある。〕
- 脊柱の著明な変形〔穿刺時，脊髄や神経根の損傷のおそれがある。〕

#### 2. 血管収縮剤の添加－慎重投与（次の患者に血管収縮剤（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には，慎重に投与すること）

- ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔剤使用中〔血管収縮剤に対する心筋の感受性が高まり，不整脈が起るおそれがある。〕
- 三環系抗うつ剤又はモノアミンオキシダーゼ阻害剤服用中〔血管収縮剤による心血管作用が増強され，不整脈，高血圧等が起るおそれがある。〕

#### 3. 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すことがあるので，局所麻酔剤の使用に際しては，常時，ただちに救急処置のとれる準備が望ましい。
- 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。

- 2)できるだけ濃い濃度のものを用いること。
- 3)できるだけ必要最少量にとどめること。
- 4)必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。
- 5)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。(硬膜外麻酔時)
- 6)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。(伝達<脊椎麻酔を除く>麻酔時)
- 7)注射針が血管又はくも膜下腔(硬膜外麻酔時)に入っていないことを確かめること。
- 8)注射の速度はできるだけ遅くすること。

#### 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

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投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- 1) **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)
- 2) **振戦、痙れん等の中毒症状**：[処置方法：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]

##### (2) その他の副作用

副作用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。

	頻度不明
中枢神経 <sup>(注)</sup>	ねむけ、不安、興奮、霧視、眩暈、悪心・嘔吐等
血液	メトヘモグロビン血症
過敏症	じん麻疹、浮腫等

注) 観察を十分に行い、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。

#### 5. 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ので、患者の状態を観察しながら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まわ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。]

#### 7. 適用上の注意

**アンプルカット時**：本剤にはアンプルカット時にガラス微小片混入の少ないクリーンカットアンプル(CCアンプル)を使用しているが、さらに安全に使用するため、従来どおりエタノール綿等で清拭することが望ましい。

#### 【薬効薬理】

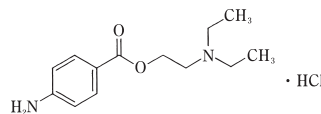
プロカイン塩酸塩は神経幹に直接適用した場合や皮下投与ではコカインと同等の局所麻酔作用を示すが、粘膜適用した場合には1/16の作用しか認められない<sup>1)</sup>。したがって表面麻酔には適当でない。また、血管収縮作用に欠けるため作用持続時間が他剤に比して短いので<sup>2)</sup>、吸収を阻害し、作用を持続させる目的でアドレナリンが用いられる<sup>1)</sup>。

#### 【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(塩酸プロカイン)

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

構造式：



分子式：C<sub>13</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>·HCl

分子量：272.77

融点：155～158℃

性状：白色の結晶又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。

#### 【包装】

ロカイン注1%	1mL	10管	50管	2mL	10管	50管
	5mL	10管	50管			
ロカイン注2%	1mL	10管	50管	2mL	10管	50管
	5mL	10管	50管			

#### 【主要文献及び文献請求先】

1) Sollmann, T., J.A.M.A., **70**, 216 (1918)

2) Defalque, R.J. et al., Anesth.Analg.Curr.Res., **46**, 311 (1967)

**【文献請求先】** 扶桑薬品工業株式会社 研究開発センター 学術部門  
〒536-8523 大阪市城東区森之宮二丁目3番30号  
TEL06-6964-2763 FAX06-6964-2706  
(9:00～17:30/土日祝日を除く)

製造販売元



**扶桑薬品工業株式会社**

大阪市城東区森之宮二丁目3番11号

SK-911-911E