



※2018年7月改訂(第8版)
 ※2015年1月改訂

劇薬 麻薬 処方箋医薬品^{注1)}

日本標準商品分類番号 878121

貯法：室温保存。開封後も光を遮り保存すること。
使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること。(使用期限内であっても開封後はなるべく速やかに使用すること。)

日本薬局方 コカイン塩酸塩
コカイン塩酸塩「タケダ」原末
 COCAINE HYDROCHLORIDE

承認番号	薬価収載	販売開始
22000AMX02384	1950年9月	1948年

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

表面麻酔用剤(口腔、咽頭、咽喉、気道、尿道等粘膜用剤)として用いる場合

- (1)本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
 2)高血圧、動脈硬化、心不全、甲状腺機能亢進、糖尿病、血管痙攣等の患者[症状を悪化するおそれがある。]

眼科用剤として用いる場合には次の点にも注意すること
 緑内障患者[抗コリン作用により症状が悪化するおそれがある。]

【組成・性状】

本剤は日本薬局方コカイン塩酸塩で、無色の結晶又は白色の結晶性の粉末である。

【効能・効果】

表面麻酔

【用法・用量】

通常、粘膜には、5～10%溶液、点眼には、0.5～4%溶液、外用には、1～5%の軟膏として使用する。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、アドレナリン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)

- (1)シクロプロパン、ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔剤使用患者[心疾患患者ではこれらの麻酔薬は交感神経興奮性作用に対する心筋の感受性を高めることがある。]
 (2)三環系抗うつ剤服用中の患者[心血管作用の増強がみられることがある。]

2. 重要な基本的注意

- (1)**精神依存**を生じ、**中枢興奮**(陶酔感等)、**幻覚**(全身蟻走感等)、**妄想**等があらわれるので観察を十分に行い、慎重に投与すること。
 (2)まれに**ショック**を起こすことがあるので、局所麻酔剤の使用に際しては、常時、直ちに**救急処置**のとれる準備が望ましい。
 (3)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**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)できるだけ**薄い濃度**のものを用いること。
 3)できるだけ**必要最小量**にとどめること。
 4)**気道内表面麻酔**の場合には、吸収が速いので、できるだけ**少ない量**で使用する。

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。(再審査対象外)

表面麻酔用剤(口腔、咽頭、咽喉、気道、尿道等粘膜用剤)として用いる場合

- (1)**重大な副作用**(いずれも頻度不明)
 1)**ショック**を起こすことがあるので、観察を十分に行い、血圧降下、顔面蒼白、脈拍の異常、呼吸抑制等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。
 2)**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、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。

(2)**その他の副作用**(いずれも頻度不明)

1)中枢神経 ^{注2)}	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈、悪心、嘔吐
2)過敏症 ^{注3)}	過敏症状

注2)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。
 注3)投与を中止すること。

眼科用剤として用いる場合には下記の点にも注意すること

- (1)**重大な副作用**
 長期投与により、**糜爛、混濁、剝離等の角膜障害**(頻度不明)があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止すること。
 (2)**その他の副作用**
 長期投与：**結膜充血**(頻度不明)等があらわれることがあるので、慎重に投与すること。

外用剤として用いる場合には下記の点にも注意すること

過敏症：**皮膚の刺激感**(頻度不明)等があらわれることがあるので、このような場合には使用を中止すること。

4. 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。[動物試験(マウス、ラット)で催奇形作用が報告されている。]

5. 適用上の注意(外用剤として用いる場合)

投与経路：眼科用として使用しないこと。
 (眼科用に用いない製剤について)

注1) 処方箋医薬品：注意—医師等の処方箋により使用すること

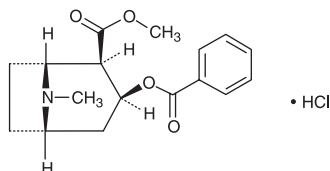
【薬効薬理】

局所作用：本剤は、粘膜への適用により、知覚神経末梢を速やかに麻痺させ局所麻酔作用をあらわす。また、血管収縮作用を有するアドレナリンを併用すると局所麻酔作用が持続する。

中枢作用：本剤は、中枢神経系に対し、初め刺激作用、のち抑制作用を示す。すなわち、初めに快活・雄弁となり、疲労感を消失させる。延髄の呼吸・血管運動中枢を興奮させて血圧上昇・呼吸興奮をもたらし、また、種々の交感神経刺激症状をあらわす。過量では、間代性痙攣・呼吸麻痺等をもたらす。

【有効成分に関する理化学的知見】

化学構造式：



一般名：コカイン塩酸塩 (Cocaine Hydrochloride) [JAN]

化学名：(1R, 2R, 3S, 5S)-2-Methoxycarbonyl-8-methyl-8-azabicyclo[3.2.1]oct-3-yl benzoate monohydrochloride

分子式：C₁₇H₂₁NO₄ · HCl

分子量：339.81

性状：コカイン塩酸塩は無色の結晶又は白色の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)又は酢酸(100)に溶けやすく、無水酢酸に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

【包装】

5 g

**【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

武田薬品工業株式会社 くすり相談室

〒103-8668 東京都中央区日本橋本町二丁目1番1号

フリーダイヤル 0120-566-587

受付時間 9:00~17:30(土日祝日・弊社休業日を除く)

製造販売元

武田薬品工業株式会社

〒540-8645 大阪市中央区道修町四丁目1番1号