

貯 法：室温保存
使用期限：外箱等に表示(3年)

| | |
|------|---------------|
| 承認番号 | 23000AMX00542 |
| 薬価収載 | 2018年12月 |
| 販売開始 | 1999年7月 |

抗不整脈剤

劇薬
処方箋医薬品

** **リドカイン点滴静注液1%「タカタ」**

(注意-医師等の処方箋により使用すること)

* **日本薬局方 リドカイン注射液**

LIDOCAINE



前
回
改
訂
⇒

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

1. 重篤な刺激伝導障害(完全房室ブロック等)のある患者[心停止を起こすおそれがある。]
2. 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

【組成・性状】

1. 組成

| | |
|-------|--|
| 品 名 | リドカイン点滴静注液1%「タカタ」 |
| 成分・分量 | 1袋(200mL)中 リドカイン 1.73g (リドカイン塩酸塩として2g) |
| 添加物 | 塩化ナトリウム [1.8g(Na:154mEq/L)] |

2. 製剤の性状

| | |
|----------------------|-------------------|
| 品 名 | リドカイン点滴静注液1%「タカタ」 |
| 性 状 | 無色澄明の水性注射液 |
| pH | 5.0~7.0 |
| 浸透圧比 (生理食塩液に対する比) | 1.2~1.3 |

【効能・効果】

期外収縮(心室性)、発作性頻拍(心室性)、急性心筋梗塞時及び手術に伴う心室性不整脈の予防

期外収縮(上室性)、発作性頻拍(上室性)

【用法・用量】

点滴静脈内投与法

静脈内1回投与が有効で、効果の持続を期待する場合には、心電図の連続監視下に点滴静脈内注射を行う。

通常、リドカイン塩酸塩として、1分間に1~2mg(0.1~0.2mL)の速度で静脈内注射する。必要な場合には投与速度を増してもよいが、1分間に4mg(0.4mL)以上の速度では重篤な副作用があらわれるので、4mgまでにとどめること。

必要に応じて24時間あるいはそれ以上連続投与しても差し支えないが、過量投与を避けるため、心電図の連続監視と頻回の血圧測定が必要である。

【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)
 - (1) 著明な洞性徐脈、刺激伝導障害のある患者[症状を悪化させるおそれがある。]
 - (2) 循環血流量が減少している患者、ショック状態にある患者、あるいは心不全のある患者[心停止を起こすおそれがある。]
 - (3) 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。]
 - (4) 高齢者(「5. 高齢者への投与」の項参照)
2. 重要な基本的注意
過量投与を避けるため、必ず頻回の血圧測定及び心電図の連続監視下で投与すること。
3. 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。
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 |
|--|---|---|
| シメチジン | リドカインの血中濃度が上昇したとの報告がある。 | シメチジンの肝代謝酵素阻害作用により、リドカインの代謝が抑制されると考えられる。 |
| メトプロロール、プロプラノロール、ナドロール | リドカインの血中濃度が上昇することがある。 | これらの薬剤の心拍量、肝血流量減少作用により、リドカインの代謝が遅延すると考えられる。 |
| リトナビル、ホスアンプレナビルカルシウム水和物、アタザナビル硫酸塩 | リドカインのAUCが上昇することが予想される。 | 肝代謝酵素に対する競合的阻害作用により、リドカインの代謝が遅延すると考えられる。 |
| セイヨウオトギリソウ(St. John's Wort, セント・ジョーンズ・ワート)含有食品 | リドカインの代謝が促進され血中濃度が低下するおそれがあるため、リドカイン投与時はセイヨウオトギリソウ含有食品を摂取しないよう注意すること。 | 肝代謝酵素誘導作用により、リドカインの代謝が促進され、血中濃度が低下すると考えられる。 |

| 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。 | 併用により血中濃度が上昇し、作用が増強することが考えられる。 |

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(頻度不明)

- 1) 刺激伝導系抑制、ショック PQ間隔の延長又はQRS幅増大等の刺激伝導系抑制、あるいは徐脈、血圧低下、ショック、意識障害等を生じ、心停止を来すことがある。また、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。〔8. 過量投与〕の項参照)
- 3) 悪性高熱 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(ポートワイン色尿)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。

(2) その他の副作用

| | 頻度不明 |
|---------------------|-------------------------|
| 中枢神経 ^(注) | せん妄、めまい、眠気、不安、多幸感、しびれ感等 |
| 消化器 ^(注) | 嘔吐等 |
| 過敏症 | 蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等 |

注)症状があらわれた場合には、投与を中止又は減量し、必要に応じて適切な処置を行うこと。(太字)

5. 高齢者への投与

本剤は主として肝臓で代謝されるが、高齢者では肝機能が低下していることが多いため血中濃度が高くなりすぎ、振戦、痙攣等の中毒症状を起こすおそれがある。本剤を持続点滴で投与する場合には、用量に留意して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。〕

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

8. 過量投与

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。

9. 適用上の注意

- (1) 投与経路：点滴静脈内投与にのみ使用すること。
- (2) 投与时：高度の洞性徐脈、あるいは房室ブロック等の徐拍性不整脈とともに心室性不整脈(期外収縮、頻拍)が認められる場合には、人工ペースメーカーによって心拍数を増加させ、本剤を用いること。
- (3) 調製時：本剤中のリドカインは塩酸塩であり、アルカリ性注射液(炭酸水素ナトリウム液等)との配合により、リドカインが析出するので配合しないこと。

10. その他の注意

- (1) 本剤の投与により、新生児にメトヘモグロビン血症があらわれたとの報告がある。
- (2) 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。

【臨床成績】

一般臨床試験での有効率は次のとおりであった。¹⁾

| 疾患名 | 有効例数/有効性評価対象例数 | 有効率(%) |
|--------|----------------|--------|
| 心室性不整脈 | 37/41 | 90.2 |

【薬効薬理】

リドカインは、心筋細胞膜のNa⁺チャネルを抑制することで心筋の活動電位発生を抑制する作用を持った第Ⅰ群の抗不整脈薬である。

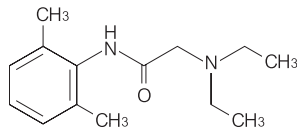
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：リドカイン〔日局〕

Lidocaine

化学名：2-Diethylamino-*N*-(2,6-dimethylphenyl)acetamide

構造式：



分子式：C₁₄H₂₂N₂O

分子量：234.34

性状：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。

融点：66～69℃

【取扱い上の注意】

安定性試験²⁾

リドカイン点滴静注液1%〔タカタ〕の旧包装製品(ガラス瓶)は、長期保存試験(室温、36ヵ月)の結果、3年間安定であることが確認されている。

現包装製品(ポリエチレン製バッグ)は、旧包装製品(ガラス瓶)との相対比較試験(40℃、75%RH、3ヵ月)の結果、安定性に差は認められず、3年間安定であることが推測された。

【包装】

リドカイン点滴静注液1%〔タカタ〕

200mL×10袋(ソフトバッグ)

【主要文献】

- 1) 土師一夫他：医学と薬学, 41(5)：941, 1999.
- 2) 高田製薬(株)社内資料(安定性)

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

高田製薬株式会社 学術部
〒336-8666 さいたま市南区沼影1丁目11番1号
電話 0120-989-813
FAX 048-816-4183

製造販売

高田製薬株式会社

さいたま市西区宮前町203番地1

