

* 劇薬
処方せん医薬品(注意-医師等の
処方せん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
J・P Procaine Hydrochloride Injection

	1%	2%
承認番号	15900AMZ00732000	15900AMZ00733000
薬価収載	1958年10月	
販売開始	不明	
再評価結果	1974年11月	

貯法: 室温保存
使用期限: 3年(外箱に記載)

1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」
2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」

【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に炎症のある患者(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こるおそれがある。]
 - 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。]
 - 本剤の成分又は安息香酸エステル(コカインを除く)系局所麻酔薬に対し、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、血管収縮薬(アドレナリン、ノルアドレナリン)を添加しないこと
 - 血管収縮薬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、脳出血が起こるおそれがある。]
 - 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[血管収縮薬に対して反応しやすく、心悸亢進、胸痛等が起こるおそれがある。]
 - 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[阻血状態を来し、局所壊死が起こるおそれがある。]
 - 耳、指趾又は陰茎の麻酔(伝達(脊椎麻酔を除く)麻酔時)[阻血状態を来し、局所壊死が起こるおそれがある。]

【組成・性状】

1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」及び2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」は、1管中に日本薬局方プロカイン塩酸塩を含有する無色澄明の水性注射液で、1管中の含量等は次のとおりである。

	容量	日本薬局方プロカイン塩酸塩	pH	浸透圧比(生理食塩液に対する比)
1%注射液	5mL	50mg	3.3~6.0	約0.3
2%注射液	2mL	40mg	3.3~6.0	約0.5

添加物として、pH調整剤を含有する。

【効能・効果】

- 1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」: 伝達麻酔
2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」: 硬膜外麻酔、伝達麻酔

【用法・用量】

- 1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」
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。
- 2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」
硬膜外麻酔: (基準最高用量: 1回600mg) プロカイン塩酸塩として、通常、成人300~400mgを使用する。
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】

- 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)
 - 硬膜外麻酔剤として使用する場合
 - 中枢神経系疾患(髄膜炎、灰白脊髄炎等)のある患者
[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。]
 - 妊婦、産婦(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
 - 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)
 - 血液疾患や抗凝薬治療中の患者[出血しやすいので、血腫形成や脊髄への障害を起こすことがある。]
 - 重篤な高血圧症の患者[急激な血圧低下が起こることがある。]
 - 脊柱に著明な変形のある患者[穿刺時、脊髄や神経根の損傷のおそれがある。]
 - 血管収縮薬(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
 - ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔薬投与中の患者
[血管収縮薬に対する心筋の感受性が高まり、不整脈が起こるおそれがある。]
 - 三環系抗うつ薬又はモノアミン酸化酵素阻害薬投与中の患者[カテコールアミンの交感神経内への取り込み又は分解を阻害するので、血管収縮薬の作用が増強され、不整脈、高血圧等が起こるおそれがある。]
- 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こすことがあるので、局所麻酔薬の投与に際しては、常時、直ちに救急処置のとれる準備が望ましい。
 - 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、下記の点に留意すること。
 - 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。
 - できるだけ薄い濃度のものを用いること。
 - できるだけ必要最少量にとどめること。
 - 必要に応じて血管収縮薬の併用を考えること。
 - 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、できるだけ少ない量で使用する(伝達(脊椎麻酔を除く)麻酔時)。
 - 注射針が血管に入っていないことを確かめること(伝達(脊椎麻酔を除く)麻酔時)。
 - 注射針が血管又はくも膜下腔に入っていないことを確かめること(硬膜外麻酔時)。
 - 注射の速度はできるだけ遅くすること。
 - 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)。
- 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。

 - 重大な副作用(頻度不明)

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必要に応じ適切な処置を行うこと。

 - 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)
 - 振戦、痙攣等の中毒症状(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)
 - その他の副作用

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ適切な処置を行うこと。

	頻度不明
中枢神経系 ^{注)}	眠気、不安、興奮、霧視、めまい、悪心・嘔吐
血液	メトヘモグロビン血症
過敏症	蕁麻疹、浮腫等

注) ショックあるいは中毒への移行に注意すること。

4. 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。また血管収縮薬（アドレナリン、ノルアドレナリン）の作用に対する感受性が高いことがあるので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 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。〕
- (2) 妊娠末期の婦人には慎重に投与すること。〔麻酔範囲が広がり、仰臥性低血圧を起こすことがある。〕

6. 適用上の注意

アンプルカット時：本剤はワンポイントアンプルであるが、アンプルカット部分をエタノール綿等で清拭し、カットすることが望ましい。

**【薬効薬理】¹⁾

プロカイン塩酸塩は合成局所麻酔薬の原型である。局所麻酔薬は次のような共通の機構で知覚神経の機能を抑制する。非解離型の中性分子として神経細胞膜を通過し、細胞内で解離しイオン型となる。イオン型の分子は神経細胞の内側から細胞膜のNa⁺チャネルに結合し、これを抑制する。神経の活動電位は神経細胞膜のNa⁺チャネルが開くことにより発生するので、これが抑制されると活動電位が発生しなくなる。即ち、知覚神経の求心性の伝導が抑制されるので、麻酔作用が発揮されることとなる。局所麻酔薬は、細い神経ほど、かつ無髄の神経の方が作用しやすいので、比較的選択的に痛覚神経に作用するが、高濃度になればその作用は他の神経にも及ぶ。プロカイン塩酸塩は粘膜への浸透性が悪いので表面麻酔には不適で、伝導麻酔などに用いられる。通常、吸収を抑制するためにアドレナリンを添加する。

【有効成分に関する理化学的知見】

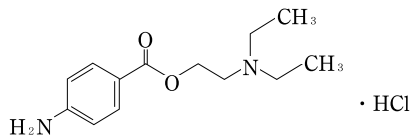
一般名：プロカイン塩酸塩(Procaine Hydrochloride)

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

分子式：C₁₃H₂₀N₂O₂·HCl

分子量：272.77

構造式：



性状：本品は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。

融点：155～158℃

【取扱い上の注意】

安定性試験²⁾

1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」及び2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」は、最終包装製品を用いた長期保存試験(室温保存、3年)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における3年間の安定性が確認された。

**【包装】

1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」 5 mL(50mg) 50管
2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」 2 mL(40mg) 50管

【主要文献】

- **1) 第十六改正日本薬局方解説書
- 2) 日新製薬株式会社 社内資料：安定性に関する資料

【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。

- ** 日新製薬株式会社 安全管理部
〒994-0069 山形県天童市清池東二丁目3番1号
TEL 023-655-2131 FAX 023-655-3419
E-mail : d-info@yg-nissin.co.jp

製造販売元

 日新製薬株式会社

山形県天童市清池東二丁目3番1号