

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2008に準拠して作成

粘滑・表面麻酔剤

アネトカイン[®]ゼリー2%

ANETOCAINE Jelly 2%

塩酸リドカインゼリー

剤形	ゼリー
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1mL中、塩酸リドカイン20mg含有
一般名	和名：リドカイン(JAN) 洋名：Lidocaine(JAN) Lidocaine(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：2008年3月7日(販売名変更による) 薬価基準収載年月日：2008年6月20日(販売名変更による) 発売年月日：1999年10月8日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：小林化工株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	小林化工株式会社 安全管理部 TEL：0776-73-0911 FAX：0776-73-0821 医療関係者向けホームページ： http://www.kobayashikako.co.jp

本IFは2008年6月改訂(第6版)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、医薬品医療機器情報提供ホームページ

<http://www.info.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

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 年が経過した現在、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新たな IF 記載要領が策定された。

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]

規格は A4 判、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。

IF 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。

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]

IF 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。

IF 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。

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。

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。

「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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]

「IF 記載要領 2008」は、平成 21 年 4 月以降に承認された新医薬品から適用となる。上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2008」による作成・提供は強制されるものではない。

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 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、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、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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。

（2008 年 9 月）

目次

概要に関する項目	
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
名称に関する項目	
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
有効成分に関する項目	
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
製剤に関する項目	
1. 剤形	4
(1)投与経路	4
(2)剤形の区別、規格及び性状	4
(3)製剤の物性	4
(4)識別コード	4
(5)pH、浸透圧比、粘度、比重、 安定なpH域等	4
(6)無菌の有無	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)添付溶解液の組成及び容量	4
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	4
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4
5. 製剤の各種条件下における安定性	5
6. 溶解後の安定性	5
7. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	5
8. 溶出性	5
9. 生物学的試験法	5
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	5
11. 製剤中の有効成分の定量法	6
12. 力価	6
13. 混入する可能性のある夾雑物	6
14. 治療上注意が必要な容器に関する情報	6
15. 刺激性	6
16. その他	6
治療に関する項目	
1. 効能又は効果	7
2. 用法及び用量	7
3. 臨床成績	7
(1)臨床データパッケージ (2009年4月以降承認品目)	7
(2)臨床効果	7
(3)臨床薬理試験:忍容性試験	7
(4)探索的試験:用量反応探索試験	7
(5)検証的試験	7
1)無作為化並行用量反応試験	7
2)比較試験	7
3)安全性試験	7
4)患者・病態別試験	7
(6)治療の使用	7
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)	7
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	7
薬効薬理に関する項目	
1. 薬理的に関連ある化合物又は 化合物群	8
2. 薬理作用	8
(1)作用部位・作用機序	8
(2)薬効を裏付ける試験成績	8
(3)作用発現時間・持続時間	8
薬物動態に関する項目	
1. 血中濃度の推移・測定法	9
(1)治療上有効な血中濃度	9
(2)最高血中濃度到達時間	9
(3)臨床試験で確認された血中濃度	9
(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)コンパートメントモデル	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	10
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)代謝に關与する酵素(CYP450等)の分子種	10	3. 貯法・保存条件	17
(3)初回通過効果の有無及びその割合	10	4. 薬剤取扱い上の注意点	17
(4)代謝物の活性の有無及び比率	11	(1)薬局での取り扱いについて	17
(5)活性代謝物の速度論的パラメータ	11	(2)薬剤交付時の注意	17
6. 排泄	11	(患者等に留意すべき必須事項等)	17
(1)排泄部位及び経路	11	5. 承認条件等	17
(2)排泄率	11	6. 包装	17
(3)排泄速度	11	7. 容器の材質	17
7. 透析等による除去率	11	8. 同一成分・同効薬	18
		9. 国際誕生年月日	18
		10. 製造販売承認年月日及び承認番号	18
. 安全性(使用上の注意等)に関する項目		11. 薬価基準収載年月日	18
1. 警告内容とその理由	12	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	18
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	12	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	18
3. 効能又は効果に關連する使用上の注意とその理由	12	14. 再審査期間	18
4. 用法及び用量に關連する使用上の注意とその理由	12	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	18
5. 慎重投与内容とその理由	12	16. 各種コード	18
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	12	17. 保険給付上の注意	18
7. 相互作用	13		
(1)併用禁忌とその理由	13	. 文献	
(2)併用注意とその理由	13	1. 引用文献	19
8. 副作用	13	2. その他の参考文献	19
(1)副作用の概要	13		
(2)重大な副作用と初期症状	13	. 参考資料	
(3)その他の副作用	13	1. 主な外国での発売状況	20
(4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	13	2. 海外における臨床支援情報	20
(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	13		
(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法	14	XIII. 備考	
9. 高齢者への投与	14	その他の関連資料	21
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	14	付表	22
11. 小児等への投与	14		
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	14		
13. 過量投与	14		
14. 適用上の注意	15		
15. その他の注意	15		
16. その他	15		
. 非臨床試験に関する項目			
1. 薬理試験	16		
(1)薬効薬理試験	16		
(「. 薬効薬理に関する項目」参照)	16		
(2)副次的薬理試験	16		
(3)安全性薬理試験	16		
(4)その他の薬理試験	16		
2. 毒性試験	16		
(1)単回投与毒性試験	16		
(2)反復投与毒性試験	16		
(3)生殖発生毒性試験	16		
(4)その他の特殊毒性	16		
. 管理的事項に関する項目			
1. 規制区分	17		
2. 有効期間又は使用期限	17		

．概要に関する項目

1 ．開発の経緯

塩酸リドカインは、1935年スウェーデンでの麻薬性の植物塩基 gramine の発見以来、この種の多数の誘導体について研究がなされ、1943年に合成されたものである。その後、多数の基礎及び臨床試験を経て、1948年にスウェーデンにて製品化された。

アネトカインゼリー2%(旧アネトカインゼリー)は、小林化工(株)が後発医薬品として開発を企画し、薬発第698号通知(昭和55年5月30日付)に基づき規格及び試験方法の設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、1999年(平成11年)3月に承認を得て、同年7月の薬価収載を経て発売に至った(付表参照)。

その後、医療事故防止対策に基づく販売名の変更(薬食審査発第0922001号通知)により、製品名を「アネトカインゼリー」から「アネトカインゼリー2%」に改め、2008年(平成20年)3月に承認を取得し、同年6月に薬価収載された。

2 ．製品の治療学的・製剤学的特性

Na⁺チャンネル抑制により局所麻酔作用を示す。

速やかに作用し、持続時間も長く、表面麻酔作用を有する。

副作用(頻度不明)

重大な副作用として、ショック、意識障害・振戦・痙攣があらわれたとの報告がある。

．名称に関する項目

1．販売名

(1)和名

アネトカイン[®]ゼリー2%

(2)洋名

ANETOCAINE Jelly 2%

(3)名称の由来

特になし

2．一般名

(1)和名(命名法)

リドカイン(JAN)

(2)洋名(命名法)

Lidocaine(JAN)

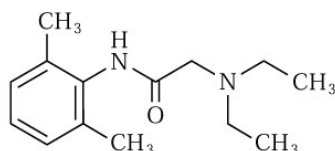
lidocaine(INN)

(3)ステム¹⁾

局所麻酔薬：-caine

3．構造式又は示性式

構造式：



4．分子式及び分子量

分子式：C₁₄H₂₂N₂O

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

記号番号：KLID(治験薬コード)

7．CAS登録番号

137-58-6(Lidocaine)

6108-05-0(Lidocaine hydrochloride)

．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

各種溶媒における溶解度

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²⁾

吸湿しない。

(4)融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：66～69

(5)酸塩基解離定数²⁾

$pK_a = 7.9(25)$

(6)分配係数

該当資料なし

(7)その他の主な示性値³⁾

紫外外部吸収スペクトル：本品の塩酸塩性溶液につき、紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、263nm 付近に吸収の極大を示す。また、270nm 付近に吸収の肩を示すが、測定機種によっては極大ピークを示すことがある。

2．有効成分の各種条件下における安定性²⁾

本品を室温褐色瓶密栓で 60 ヲ月保存するとき、外観、含量とも変化を認めない。

3．有効成分の確認試験法³⁾

(日局リドカインの確認試験による。)

(1)紫外可視吸光度測定法

(2)赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

4．有効成分の定量法³⁾

(日局リドカインの定量法による。)

本品を乾燥し、その約 0.5g を精密に量り、酢酸(100)20mL に溶かし、0.1mol/L 過塩素酸で滴定する（指示薬：クリスタルバイオレット試液 1 滴）。ただし、滴定の終点は液の紫色が青色を経て青緑色に変わるときとする。同様の方法で空試験を行い、補正する。

0.1mol/L 過塩素酸 1mL = 23.43mg $C_{14}H_{22}N_2O$

・製剤に関する項目

1 . 剤形

(1)投与経路

経皮

(2)剤形の区別、規格及び性状

製 品 名	有効成分の名称・含量	剤 形	性 状
アネトカインゼリー2%	1mL中、塩酸リドカイン20mg含有	ゼリー	無色～微黄色澄明な 無菌の粘性の液

(3)製剤の物性

該当資料なし

(4)識別コード

アルミ製チューブ
KN 148

(5)pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

粘度：284～504mPa・S（本品 102g に水 75mL を加えて混和した液の 25 における粘度）
pH：6.2～6.6

(6)無菌の有無

無菌製剤である。

2 . 製剤の組成

(1)有効成分（活性成分）の含量

1mL 中、塩酸リドカイン 20mg（2%）を含有する。

(2)添加物

添加物として、カルメロースナトリウム、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、塩酸、水酸化ナトリウムを含有する。

(3)添付溶解液の組成及び容量

該当しない

3 . 用時溶解して使用する製剤の調製法

該当しない

4 . 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性⁴⁾

試験方法	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	試験結果	
					試験開始時	試験終了時
加速試験	40、75%RH	ガラスビン入り包装品 (最終包装品)	6ヵ月	性状、確認試験	*1、*2	*1、*2
				pH	6.40～6.41	6.39～6.42
				無菌試験	*3	*3
				定量試験(対表示量%)	99.8～100.1	99.7～100.2
		アルミ製チューブ入り包装品 (最終包装品)		性状、確認試験	*1、*2	*1、*2
				pH	6.40～6.41	6.39～6.42
				無菌試験	*3	*3
				定量試験(対表示量%)	99.8～100.1	99.6～100.0
長期保存試験	室内自然条件下	アルミ製チューブ入り包装品 (最終包装品)	36ヵ月	性状	*1	*1
				pH	6.25～6.40	6.24～6.40
				定量試験(対表示量%)	99.5～102.7	98.8～101.7

*1：無色～微黄色澄明な無菌の粘性の液

*2：「.製剤に関する項目 9.製剤中の有効成分の確認試験法」に適合した。

*3：菌の発育を認めなかった。

最終包装製品を用いた加速試験(40、75%RH、6ヵ月)の結果、アネトカインゼリー2%は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

6. 溶解後の安定性

該当資料なし

7. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当資料なし

8. 溶出性

該当しない

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1)第三アミンの呈色沈殿反応
- (2)コバルト塩の生成反応
- (3)紫外可視吸光度測定法
- (4)薄層クロマトグラフィー

11. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー（内標準法）

検出器：紫外吸光光度計

測定波長：263nm

12. 力価

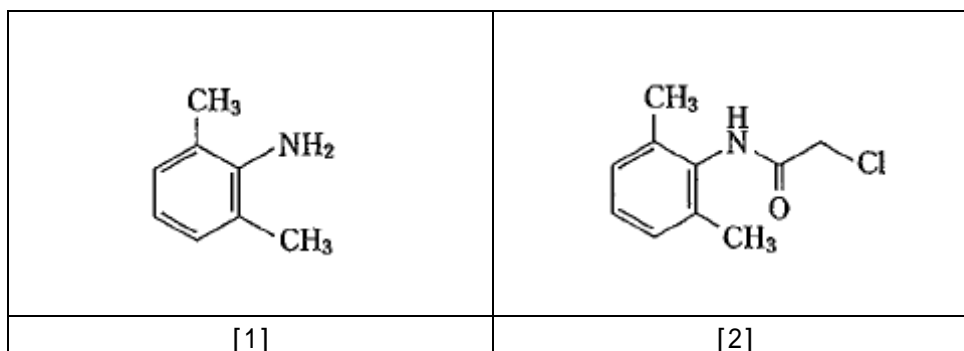
該当しない

13. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

以下の報告がある。³⁾

混在が予想される類縁物質には、2,6-dimethylaniline[1]とそのアシル体である2,6-dimethylmonochloroacetanilide[2]がある。リドカイン、[1]及び[2]の R_f 値はそれぞれ約0.4、0.85 及び 0.95 であり、検出限度はそれぞれ $2\mu\text{g}$ 、 $0.2\mu\text{g}$ 及び $1\mu\text{g}$ である。標準溶液は試料溶液を 100 倍に希釈したものであるため、これら類縁物質の許容量はリドカインとして 1%以下であるが、その検出感度を考慮すれば[1]は 0.1%以下、[2]は 0.5%以下になる。



14. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

15. 刺激性

該当資料なし

16. その他

該当しない

・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

塩酸リドカインとして、尿道麻酔には通常成人では男子は 200～300mg、女子は 60～100mg を使用する。気管内挿管には適当量を使用する。

なお、年齢、麻酔領域、部位、組織、体質により適宜増減する。

3 . 臨床成績

(1)臨床データパッケージ（2009年4月以降承認品目）

該当しない

(2)臨床効果

該当資料なし

(3)臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4)探索的試験：用量反応探索試験

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

・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⁵⁾

局所麻酔剤

アミド型：ジブカイン塩酸塩、メピバカイン塩酸塩、プピバカイン塩酸塩水和物、プリロカイン塩酸塩

2. 薬理作用

(1)作用部位・作用機序³⁾

作用部位：細胞膜

作用機序：一次感覚神経の無髄(C)神経線維、細い有髄(A)神経線維のNa⁺チャネル内の特異的結合部位に結合してイオンの細胞内への流入を阻止し、活動電位の発生を抑制(神経伝導を遮断)することにより局所麻酔作用を発現する。プロカインより作用の発現が速やか、局所刺激作用が弱い、麻酔効果が強い、作用持続が長い、などの特長を持ち、すべての局所麻酔によく用いられる。更に、心筋細胞のNa⁺チャネル機能も抑制し(一般的には、膜安定化作用と呼ばれる)、活動電位の最大立ち上がり速度の低下、興奮伝導の遅延をもたらす、異所性自動能を抑制するので抗不整脈薬としても用いられる。

(2)薬効を裏付ける試験成績⁶⁾

<生物学的同等性試験>

医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱い等について(生物学的同等性試験に関する試験基準) 薬審第718号(昭和55年5月30日付)

表面麻酔作用：

ウサギ角膜での表面麻酔作用を検討したところ、本剤投与群のまばたき抑制率は97.2%(滴下5分後)であり、基剤対照群に比し極めて有意であった(表1)。

ウサギ鼻粘膜での表面麻酔作用を検討したところ、本剤投与群のくしゃみ抑制率は94.5%(注入1分後)であり、基剤対照群に比し極めて有意であった(表2)。

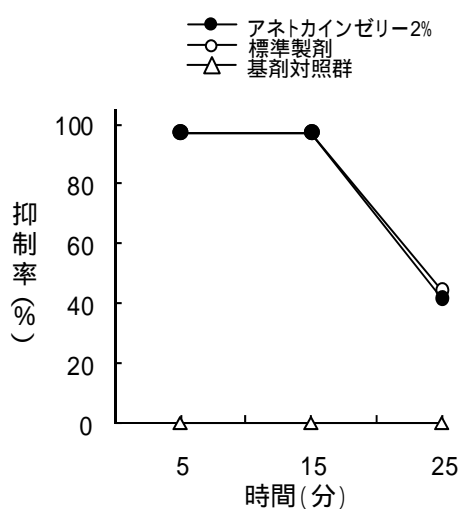


表1 ウサギ角膜での表面麻酔作用(n=12)

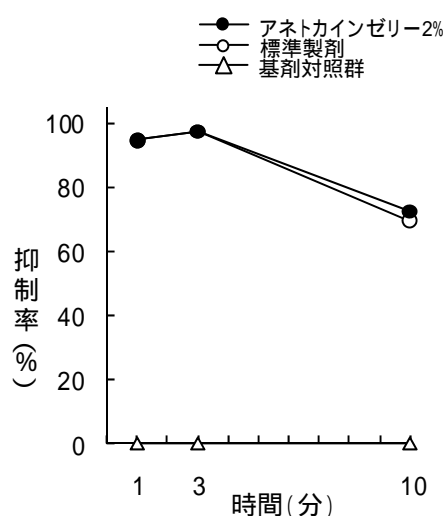


表2 ウサギ鼻粘膜での表面麻酔作用(n=12)

(3)作用発現時間・持続時間

該当資料なし

・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

該当資料なし

(2)最高血中濃度到達時間

該当資料なし

(3)臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(4)中毒域

該当資料なし

(5)食事・併用薬の影響

「 .安全性(使用上の注意等)に関する項目 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)コンパートメントモデル

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

該当資料なし

(4)消失速度定数

該当資料なし

(5)クリアランス

該当資料なし

(6)分布容積

該当資料なし

(7)血漿蛋白結合率

該当資料なし

治療域濃度での結合率は約 70%との報告がある。²⁾

3 . 吸収

該当資料なし

以下の報告がある。²⁾

投与方法、投与部位等により大きく異なる。なお、健康な皮膚からはほとんど吸収されない。

4 . 分布

(1)血液 - 脳関門通過性

該当資料なし

リドカインは血液脳関門を通過するとの報告がある。²⁾

(2)血液 - 胎盤関門通過性

該当資料なし

妊婦に塩酸リドカインを硬膜外投与したとき、臍帯静脈血中濃度と母体血漿中濃度の比は0.5~0.7で、胎盤を通過するとの報告がある。²⁾

(3)乳汁への移行性

該当資料なし

以下の報告がある。²⁾

授乳婦に塩酸リドカインを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分後で最大となり、60分後に急速に低下した。

(4)髄液への移行性

該当資料なし

(5)その他の組織への移行性

該当資料なし

5 . 代謝

(1)代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

以下の報告がある。²⁾

代謝部位：肝

代謝経路：主としてCYP1A2及びCYP3A4により、*N*-脱エチル化、芳香核の水酸化や酸アミドの解裂等の経路で急速に代謝される。

(2)代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種

該当資料なし

CYP1A2及びCYP3A4との報告がある。²⁾

(3)初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

肝でのリドカインの初回通過効果は約70%であるとの報告がある。²⁾

(4)代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

Monoethylglycinexylidide(MEGX)と glycinexylidide(GX)はリドカインとほぼ同等か
やや弱い薬理的 / 毒性学的利用を有しているとの報告がある。²⁾

(5)活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1)排泄部位及び経路

該当資料なし

以下の報告がある。²⁾

排泄部位：主として尿中排泄

(2)排泄率

該当資料なし

以下の報告がある。²⁾

塩酸リドカイン 250mg を健康成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。

(3)排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

該当資料なし

以下の報告がある。²⁾

血液透析：血中濃度にほとんど影響ない。

．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)重症の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、できるだけ必要最小量とすること。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)気道内表面麻酔の場合には、吸収が速いので、できるだけ少量を使用すること。
4)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）
5)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)

製剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
クラス 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

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。

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用(頻度不明)

- 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)}	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈等
消化器 ^{注)}	悪心・嘔吐等
過敏症	蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等

注)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

該当資料なし

(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

該当資料なし

(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法

【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

その他の副作用	
	頻度不明
過敏症	蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等

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ため、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ため、低用量から投与を開始するなど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
局所麻酔薬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
(1)本剤の投与により、気管内挿管後の咽頭痛、嘔声等の発現を増加させたとの報告がある。
(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。

16. その他

該当しない

・非臨床試験に関する項目

1 . 薬理試験

(1)薬効薬理試験（「 . 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

該当資料なし

(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

該当資料なし

以下の報告がある。²⁾

		L D ₅₀ (mg/kg)		
動物 投与経路	マウス	ラット	ウサギ	
静脈内	25 ~ 48	約25	25.6	
皮下	270 ~ 390	-	-	
経口	520	-	-	

(2)反復投与毒性試験

該当資料なし

(3)生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4)その他の特殊毒性

該当資料なし

・ 管理的事項に関する項目

1 . 規制区分

製 剤：アネトカインゼリー2% 該当しない

有効成分：リドカイン 劇薬

2 . 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（外箱及びチューブに表示）（安定性試験結果に基づく）

3 . 貯法・保存条件

貯法：室温保存

4 . 薬剤取扱い上の注意点

(1)薬局での取り扱いについて

【取扱い上の注意】

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、使用后十分に水洗すること。

金属に対する腐食作用：

保存条件	薬匙(ステンレス製) 接触時間	24h	48h	120h
	50 恒温	変化なし	変化なし	薬匙表面白変

(2)薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

該当しない

5 . 承認条件等

該当しない

6 . 包 装

アルミ製チューブ入り：50mL×5

ピン入り：100mL

7 . 容器の材質

アルミ製チューブ(内面をエポキシ樹脂でラミネートしたもの)：

キャップ：ポリエチレン(PE)

チューブ：アルミ箔(金属)

箱・トレイ：紙

ピン：

キャップ：ポリプロピレン(PP)

パッキン：エラストマー(SB-E)

瓶：ガラス(透明)

箱：紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：キシロカインゼリー2%（アストラゼネカ株式会社）

同効薬：ジブカイン塩酸塩

9. 国際誕生年月日

該当資料なし

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
アネトカインゼリー2% (旧 アネトカインゼリー)	2008年3月7日 (1999年3月15日)	22000AMX00425000 ((11AM)298)

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日
アネトカインゼリー2% (旧 アネトカインゼリー)	2008年6月20日 (1999年7月9日)

注) 旧：アネトカインゼリー 経過措置期間終了：2009年3月31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

該当しない

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

製品名	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
アネトカインゼリー2%	101678902	1214700P1062	620007571

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品である。

. 文 献

1 . 引用文献

- 1) 医薬品製造指針 追補 2004
- 2) 日本公定書協会編：日本薬局方医薬品情報 2006(JPDI)
- 3) 第十五改正日本薬局方解説書
- 4) 小林化工株式会社・社内資料（安定性試験）
- 5) JAPAN DRUGS 編：日本医薬品総覧 2008～2009
- 6) 小林化工株式会社・社内資料（生物学的同等性試験）

2 . その他の参考文献

．参考資料

1．主な外国での発売状況

Xylocaine（スウェーデン、米国、英国）

Anestacon（米国）

2．海外における臨床支援情報

該当資料なし

. 備 考

その他の関連資料

承認申請に際し、準拠又は参考とした通知名

- ・医薬品の承認申請について 薬発第 698 号(昭和 55 年 5 月 30 日付)
- ・医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱い等について(生物学的同等性試験に関する試験基準) 薬審第 718 号(昭和 55 年 5 月 30 日付)
- ・医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について 薬食審査発第 0922001 号(平成 17 年 9 月 22 日付)

付表

薬発第 698 号(昭和 55 年 5 月 30 日付)に基づく承認申請時に添付する資料

別表 1 及び別表 2- (1) 医療用医薬品より改変

		新有効成分含有医薬品(先発医薬品)	その他の医薬品(後発医薬品)	剤型追加に係る医薬品(後発医薬品)
イ起原又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料	1 起原又は発見の経緯		×	
	2 外国における使用状況		×	
	3 特性及び他の医薬品との比較検討等		×	
ロ物理的・化学的性質並びに規格及び試験方法等に関する資料	1 構造決定		×	×
	2 物理的・化学的性質等		×	×
	3 規格及び試験方法			
ハ安定性に関する資料	1 長期保存試験		×	×
	2 苛酷試験		×	×
	3 加速試験	×		
ニ急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料	1 急性毒性		×	×
	2 亜急性毒性		×	×
	3 慢性毒性		×	×
	4 生殖に及ぼす影響		×	×
	5 依存性		×	×
	6 抗原性		×	×
	7 変異原性		×	×
	8 がん原性		×	×
	9 局所刺激		×	×
ホ薬理作用に関する資料	1 効力を裏付ける試験成績		×	×
	2 一般薬理		×	×
ヘ吸収、分布、代謝、排泄に関する資料	1 吸収		×	×
	2 分布		×	×
	3 代謝		×	×
	4 排泄		×	×
	5 生物学的同等性	×		
ト臨床試験の試験成績に関する資料	臨床試験の試験成績		×	

：添付、×：添付不要、 ：個々の医薬品により判断される

製造販売元



小林化工株式会社

〒919-0603 福井県あわら市矢地5-15