

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のI F記載要領 2018(2019年更新版)に準拠して作成

局所麻酔剤
日本薬局方

劇薬
処方箋医薬品

プロカイン塩酸塩注射液

ロカイン[®]注1%

ロカイン[®]注2%

ROCAIN[®] Injection

剤形	水性注射剤
製剤の規制区分	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）
規格・含量	ロカイン注1%：日局 プロカイン塩酸塩 1w/v%（10mg/mL） ロカイン注2%：日局 プロカイン塩酸塩 2w/v%（20mg/mL）
一般名	和名：プロカイン塩酸塩（JAN、局方名） 洋名：Procaine Hydrochloride（JAN、局方名）
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2007年3月22日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：1954年1月1日 販売開始年月日：1954年1月1日
製造販売（輸入）・提携・ 販売会社名	製造販売元：扶桑薬品工業株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	扶桑薬品工業株式会社 研究開発センター 学術室 TEL 06-6964-2763 FAX 06-6964-2706（9:00～17:30/土日祝日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.fuso-pharm.co.jp/cnt/seihin/

本I Fは2023年10月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の電子添文情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ <https://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がI Fの位置付け、I F記載様式、I F記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がI F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I FはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したI Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI Fは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ

(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のI Fの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のI Fが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、「I F記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. I Fとは

I Fは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はI F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I Fは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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。

I Fの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I Fの利用にあたって

電子媒体の I F は、PMDA の医療用医薬品情報検索の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 I F を作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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利用者自らが内容を充実させ、I F 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、I F が改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMDA の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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

I F を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いただきたい。I F は日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR 等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らが I F の内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I F を活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020 年 4 月)

目次

I. 概要に関する項目	1	(1) 注意が必要な容器・包装，外観が特殊な容器・包装に関する情報	7
I-1 開発の経緯	1	(2) 包装	7
I-2 製品の治療学的特性	1	(3) 予備容量	7
I-3 製品の製剤学的特性	1	(4) 容器の材質	7
I-4 適正使用に関して周知すべき特性	1	IV-11 別途提供される資材類	7
I-5 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	IV-12 その他	7
(1) 承認条件	1		
(2) 流通・使用上の制限事項	1		
I-6 RMP の概要	1		
II. 名称に関する項目	2	V. 治療に関する項目	8
II-1 販売名	2	V-1 効能又は効果	8
(1) 和名	2	V-2 効能又は効果に関連する注意	8
(2) 洋名	2	V-3 用法及び用量	8
(3) 名称の由来	2	(1) 用法及び用量の解説	8
II-2 一般名	2	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠	8
(1) 和名(命名法)	2	V-4 用法及び用量に関連する注意	8
(2) 洋名(命名法)	2	V-5 臨床成績	8
(3) ステム	2	(1) 臨床データパッケージ	8
II-3 構造式又は示性式	2	(2) 臨床薬理試験	8
II-4 分子式及び分子量	2	(3) 用量反応探索試験	8
II-5 化学名(命名法)又は本質	2	(4) 検証的試験	8
II-6 慣用名，別名，略号，記号番号	2	1) 有効性検証試験	8
		2) 安全性試験	8
		(5) 患者・病態別試験	9
		(6) 治療的使用	9
		1) 使用成績調査(一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査)，製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容	9
		2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要	9
		(7) その他	9
III. 有効成分に関する項目	3	VI. 薬効薬理に関する項目	10
III-1 物理化学的性質	3	VI-1 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	10
(1) 外観・性状	3	VI-2 薬理作用	10
(2) 溶解性	3	(1) 作用部位・作用機序	10
(3) 吸湿性	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	10
(4) 融点(分解点)，沸点，凝固点	3	(3) 作用発現時間・持続時間	10
(5) 酸塩基解離定数	3	VII. 薬物動態に関する項目	11
(6) 分配係数	3	VII-1 血中濃度の推移	11
(7) その他の主な示性値	3	(1) 治療上有効な血中濃度	11
III-2 有効成分の各種条件下における安定性	3	(2) 臨床試験で確認された血中濃度	11
III-3 有効成分の確認試験法，定量法	3	(3) 中毒域	11
		(4) 食事・併用薬の影響	11
		VII-2 薬物速度論的パラメータ	11
		(1) 解析方法	11
		(2) 吸収速度定数	11
		(3) 消失速度定数	11
		(4) クリアランス	11
		(5) 分布容積	11
		(6) その他	11
		VII-3 母集団(ポピュレーション)解析	11
		(1) 解析方法	11
		(2) パラメータ変動要因	11
		VII-4 吸収	12
IV. 製剤に関する項目	4		
IV-1 剤形	4		
(1) 剤形の区別	4		
(2) 製剤の外観及び性状	4		
(3) 識別コード	4		
(4) 製剤の物性	4		
(5) その他	4		
IV-2 製剤の組成	4		
(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤	4		
(2) 電解質等の濃度	4		
(3) 熱量	5		
IV-3 添付溶解液の組成及び容量	5		
IV-4 力価	5		
IV-5 混入する可能性のある夾雑物	5		
IV-6 製剤の各種条件下における安定性	5		
IV-7 調製法及び溶解後の安定性	5		
IV-8 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6		
IV-9 溶出性	6		
IV-10 容器・包装	7		

VII-5 分布	12	(7)その他の特殊毒性	18
(1)血液-脳関門通過性	12		
(2)血液-胎盤関門通過性	12		
(3)乳汁への移行性	12		
(4)髄液への移行性	12		
(5)その他の組織への移行性	12		
(6)血漿蛋白結合率	12		
VII-6 代謝	12		
(1)代謝部位及び代謝経路	12		
(2)代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種, 寄与率	12		
(3)初回通過効果の有無及びその割合	12		
(4)代謝物の活性の有無及び活性比, 存在比率	12		
VII-7 排泄	13		
VII-8 トランスポーターに関する情報	13		
VII-9 透析等による除去率	13		
VII-10 特定の背景を有する患者	13		
VII-11 その他	13		
VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	14		
VIII-1 警告内容とその理由	14		
VIII-2 禁忌内容とその理由	14		
VIII-3 効能又は効果に関連する注意とその理由	14		
VIII-4 用法及び用量に関連する注意とその理由	14		
VIII-5 重要な基本的注意とその理由	15		
VIII-6 特定の背景を有する患者に関する注意	15		
(1)合併症・既往歴等のある患者	15		
(2)腎機能障害患者	16		
(3)肝機能障害患者	16		
(4)生殖能を有する者	16		
(5)妊婦	16		
(6)授乳婦	16		
(7)小児等	16		
(8)高齢者	16		
VIII-7 相互作用	16		
(1)併用禁忌とその理由	16		
(2)併用注意とその理由	16		
VIII-8 副作用	16		
(1)重大な副作用と初期症状	17		
(2)その他の副作用	17		
VIII-9 臨床検査結果に及ぼす影響	17		
VIII-10 過量投与	17		
VIII-11 適用上の注意	17		
VIII-12 その他の注意	17		
(1)臨床使用に基づく情報	17		
(2)非臨床試験に基づく情報	17		
IX. 非臨床試験に関する項目	18		
IX-1 薬理試験	18		
(1)薬効薬理試験	18		
(2)安全性薬理試験	18		
(3)その他の薬理試験	18		
IX-2 毒性試験	18		
(1)単回投与毒性試験	18		
(2)反復投与毒性試験	18		
(3)遺伝毒性試験	18		
(4)がん原性試験	18		
(5)生殖発生毒性試験	18		
(6)局所刺激性試験	18		
X. 管理的事項に関する項目	19		
X-1 規制区分	19		
X-2 有効期間	19		
X-3 包装状態での貯法	19		
X-4 取扱い上の注意	19		
X-5 患者向け資材	19		
X-6 同一成分・同効薬	19		
X-7 国際誕生年月日	19		
X-8 製造販売承認年月日及び承認番号, 薬価基準収載年月日, 販売開始年月日	19		
X-9 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	19		
X-10 再審査結果, 再評価結果公表年月日及び その内容	20		
X-11 再審査期間	20		
X-12 投薬期間制限に関する情報	20		
X-13 各種コード	20		
X-14 保険給付上の注意	20		
XI. 文献	21		
XI-1 引用文献	21		
XI-2 その他の参考文献	21		
XII. 参考資料	22		
XII-1 主な外国での発売状況	22		
XII-2 海外における臨床支援情報	22		
XIII. 備考	23		
XIII-1 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うに あたっての参考情報	23		
(1)粉碎	23		
(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	23		
XIII-2 その他の関連資料	23		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

プロカインは Einhorn らにより合成され、1905 年 Braun らにより薬理効果が確認された。

扶桑薬品では、1954 年 1 月に日本薬局方品である塩酸プロカイン注射液を販売開始し、1974 年 11 月公表の再評価結果に基づき効能・効果、用法・用量の変更を行った。

第十五改正日本薬局方が制定され、薬局方名が変更されたことにより、2007 年 6 月改訂の添付文書より、薬局方日本名記載を塩酸プロカイン注射液からプロカイン塩酸塩注射液に変更した。

「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成 12 年 9 月 19 日医薬発第 935 号）により、2007 年 3 月 22 日付で、ロカイン-1%、-2%からロカイン注 1%、注 2%へ販売名変更の承認を受けた。

2. 製品の治療学的特性

合成局所麻酔薬の原型であり、感覚・求心神経線維の Na⁺チャンネルを遮断し、活動電位の伝導を抑制することにより局所麻酔作用を発現する。粘膜への浸透性が悪いので表面麻酔としては無効である。代謝産物が血管拡張作用を有し、プロカインの血中への吸収を促進するため、必要に応じて血管収縮薬であるアドレナリンを添加して使用する。

3. 製品の製剤学的特性

該当資料なし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料，最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

特になし

(2) 流通・使用上の制限事項

特になし

6. RMP の概要

該当しない（RMP 策定対象外の事例）

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ロカイン[®]注1%

ロカイン[®]注2%

(2) 洋名

ROCAIN[®] Injection

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

プロカイン塩酸塩 (JAN、局方名)

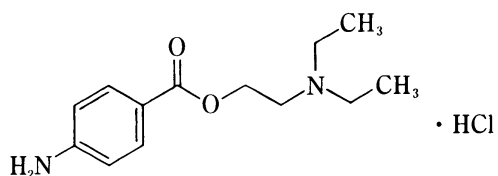
(2) 洋名(命名法)

Procaine Hydrochloride (JAN、局方名)

(3) ステム

局所麻酔剤：-caine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₃H₂₀N₂O₂·HCl

分子量：272.77

5. 化学名(命名法)又は本質

2-(Diethylamino)ethyl 4-aminobenzoate monohydrochloride

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

特になし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点），沸点，凝固点

融点：155～158℃

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

本品 1.0g を水 20mL に溶かした液の pH は 5.0～6.0 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法，定量法

確認試験法

紫外可視吸光度測定法

赤外吸収スペクトル測定法

塩化物の定性反応

定量法

亜硝酸ナトリウムによる電位差滴定法又は電流滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

水性注射剤

(2) 製剤の外観及び性状

無色澄明の液

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

販売名	pH	浸透圧比 (生理食塩液に対する比)
ロカイン注 1%	3.3~6.0	1.1~1.3
ロカイン注 2%	3.3~6.0	1.4~1.6

(5) その他

注射剤の容器内の特殊な気体：窒素

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

販売名	ロカイン注 1%		
容量	1mL	2mL	5mL
有効成分	1 管中 日局 プロカイン塩酸塩 10mg	1 管中 日局 プロカイン塩酸塩 20mg	1 管中 日局 プロカイン塩酸塩 50mg
添加剤	1 管中 塩化ナトリウム pH 調節剤	1 管中 塩化ナトリウム pH 調節剤	1 管中 塩化ナトリウム pH 調節剤

販売名	ロカイン注 2%		
容量	1mL	2mL	5mL
有効成分	1 管中 日局 プロカイン塩酸塩 20mg	1 管中 日局 プロカイン塩酸塩 40mg	1 管中 日局 プロカイン塩酸塩 100mg
添加剤	1 管中 塩化ナトリウム pH 調節剤	1 管中 塩化ナトリウム pH 調節剤	1 管中 塩化ナトリウム pH 調節剤

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

(3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

長期保存試験¹⁾

ロカイン注1%

	保存条件	保存期間	保存形態	結果
1mL	25°C±2°C 60%RH±5%RH	3年	最終包装	変化なし
2mL				
5mL				

ロカイン注2%

	保存条件	保存期間	保存形態	結果
1mL	25°C±2°C 60%RH±5%RH	3年	最終包装	変化なし
2mL				
5mL				

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

水溶液中アルカリで難溶性のプロカイン塩基の沈殿を生じる。ブドウ糖含溶液と長期保存した場合、プロカイン-N-グルコシドを生成し局所麻酔作用を低下するので注意を要する。またストレプトマイシン硫酸塩を分解させることも知られている。ベンジルペニシリン、ヨウ素類も配合不可とされている²⁾。

<pH変動スケール>

ロカイン注1% 1mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)				0.3mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁				
	1.11				4.47 (試料 pH)					9.67				

ロカイン注1% 2mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)				0.6mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁				
	1.19				4.45 (試料 pH)					9.65				

ロカイン注1% 5mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)				1.6mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁				
	1.28				4.37 (試料 pH)					9.57				

ロカイン注2% 1mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)				0.4mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁				
	1.10				4.31 (試料 pH)					9.09				

ロカイン注2% 2mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)				0.8mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁				
	1.18				4.36 (試料 pH)					8.92				

ロカイン注2% 5mL

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
	←10.0mL (0.1mol/L HCl)				1.9mL→ (0.1mol/L NaOH)					白濁				
	1.37				4.37 (試料 pH)					8.97				

9. 溶出性

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装, 外観が特殊な容器・包装に関する情報
該当資料なし

(2) 包装

〈ロカイン注 1%〉

1mL 10 管 ガラスアンプル

1mL 50 管 ガラスアンプル

2mL 10 管 ガラスアンプル

2mL 50 管 ガラスアンプル

5mL 10 管 ガラスアンプル

5mL 50 管 ガラスアンプル

〈ロカイン注 2%〉

1mL 10 管 ガラスアンプル

1mL 50 管 ガラスアンプル

2mL 10 管 ガラスアンプル

2mL 50 管 ガラスアンプル

5mL 10 管 ガラスアンプル

5mL 50 管 ガラスアンプル

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ガラス

11. 別途提供される資材類

特になし

12. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

〈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

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

〈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) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

(5) 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（一般使用成績調査，特定使用成績調査，使用成績比較調査），製造販売後データベース調査，製造販売後臨床試験の内容

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

特になし

VI. 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

局所麻酔剤

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

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⁺チャンネルに結合し、これを抑制する。神経の活動電位は神経細胞膜のNa⁺チャンネルが開口する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。本薬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²⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

VII-1. の項 参照

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

<参考>³⁾

健常成人に1%注射液をプロカイン塩酸塩として200mg皮下注射した場合、プロカインは注射5分後より血中に出現し、10～20分後に最高血中濃度(1.5 μ g/mL)に達し、60分後には血中から消失する。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当しない

3. 母集団(ポピュレーション)解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

4. 吸収

非経口的に投与すると確実に吸収（血管内）され、注入局所で長く停滞しない。なお、皮膚からは吸収されず、粘膜からの吸収は緩慢である³⁾。

5. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液-胎盤関門通過性

正常分娩で、胎盤に異常のない絨毛上皮ホモジネートの遠沈渣を局麻剤と培養し、その残存量の定量から、プロカインは胎盤で分解されるとしている。分娩時妊婦 40 例に 1~10mg/kg を静注し、分娩後の臍帯静脈、母動脈中で測定した場合 4mg 以下では胎児血中にプロカインは見られない⁴⁾。

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(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

(6) 血漿蛋白結合率

約 6%³⁾

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

吸収されたプロカインは循環血液中で速やかに加水分解され、パラアミノ安息香酸と diethylaminoethanol になる。この分解酵素はプロカインエステラーゼといわれているが、肝におけるコリンエステラーゼと同じものと考えられている（同一でないとするものもある）。

注)この加水分解は種差があり、血漿での分解速度はヒトでは、他の動物の 4~20 倍も速いといわれており、ヒトでのプロカインの加水分解は血漿が主体で肝では非常に低いとされている³⁾。

(2) 代謝に関与する酵素(CYP 等)の分子種、寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

7. 排泄

排泄部位³⁾：腎臓（一部は胆汁からも排泄されるらしい）

排泄率³⁾：健常成人に1%注射液を皮下注射した場合、プロカインは尿中に未変化体として150mg投与で平均0.2%、200mg投与で0.26%、400mg投与で0.44%が排泄される。

排泄速度³⁾：尿中パラアミノ安息香酸の排泄は、相当の個人差が認められ、プロカイン投与量から換算して24時間後30～60%、48時間後50～80%である。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当しない

Ⅷ. 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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

〈効能共通〉

2.1 本剤の成分又は安息香酸エステル（コカインを除く）系局所麻酔剤に対し、過敏症の既往歴のある患者

2.2 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。]

2.3 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。

2.3.1 血管収縮剤に対し、過敏症の既往歴のある患者

2.3.2 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。]

2.3.3 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。]

2.3.4 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、胸痛等が起こるおそれがある。]

2.3.5 糖尿病の患者 [血糖値が上昇するおそれがある。]

2.3.6 血管痙攣のある患者 [阻血状態をきたし、局所壊死が起こるおそれがある。]

〈硬膜外麻酔〉

2.4 重篤な出血やショック状態の患者 [症状が悪化するおそれがある。]

2.5 注射部位又はその周辺の炎症のある患者 [吸収が高まり、効果が急激に発現するおそれがある。]

2.6 敗血症の患者 [敗血症性の髄膜炎が起こるおそれがある。]

〈伝達麻酔〉

2.7 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。

2.7.1 耳、指趾又は陰茎の麻酔 [阻血状態をきたし、局所壊死が起こるおそれがある。]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 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、常時、ただちに救急処置のとれる準備が望ましい。[11.1.1、11.1.2 参照]

8.2 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、次の点に注意すること。[11.1.1、11.1.2 参照]

〈効能共通〉

8.2.1 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。

8.2.2 できるだけ薄い濃度のものを用いること。

8.2.3 できるだけ必要最少量にとどめること。

8.2.4 必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。

8.2.5 注射針が血管に入っていないことを確かめること。

8.2.6 注射の速度はできるだけ遅くすること。

〈硬膜外麻酔〉

8.2.7 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。

8.2.8 注射針がくも膜下腔に入っていないことを確かめること。

〈伝達麻酔〉

8.2.9 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。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

〈効能共通〉

9.1.1 血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）の併用に対して注意が必要な患者
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) ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔剤投与中の患者

血管収縮剤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。

(2) 三環系抗うつ剤又はモノアミン酸化酵素阻害剤投与中の患者

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、血管収縮剤による心血管作用が増強され、不整脈、高血圧等が起こるおそれがある。

〈硬膜外麻酔〉

9.1.2 中枢神経系疾患（髄膜炎、灰白脊髄炎等）の患者

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。

9.1.3 血液疾患のある患者、抗凝固剤投与中の患者

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。

9.1.4 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。

9.1.5 脊柱の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。

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

9.5.1 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。

9.5.2 妊娠末期の女性では、麻酔範囲が広がり、仰臥性低血圧を起こすことがある。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。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、血管収縮剤（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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

11. 副作用

次の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するなど適切な処置を行うこと。

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック (頻度不明)

初期症状として血圧低下、顔面蒼白、脈拍の異常、呼吸抑制等があらわれることがある。[8.1、8.2 参照]

11.1.2 振戦、痙攣 (いずれも頻度不明)

振戦、痙攣等の中毒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。
[8.1、8.2 参照]

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	頻度不明
中枢神経 ^{注)}	ねむけ、不安、興奮、霧視、眩暈、悪心・嘔吐
血液	メトヘモグロビン血症
過敏症	じん麻疹、浮腫

注) ショックあるいは中毒への移行に注意すること。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

<参考>³⁾

大別して中枢神経系と心血管系への作用が考えられる。まず、中枢神経系では刺激症状がみられる。大脳皮質：不安、興奮、混乱、おしゃべりからはじまり、ついには全身けいれんを起こす。延髄：血圧の上昇、脈拍の増加、呼吸数増加、悪心、嘔吐。次いで中枢神経系の抑制に移行し、大脳皮質：意識消失、延髄：血圧下降、脈拍微弱、呼吸停止などをきたす。一方、心血管系への抹消作用として、心筋収縮力の低下、徐脈、血管拡張などをきたし、放置しておけば死亡する危険が極めて大である。

11. 適用上の注意

設定されていない

<参考>

アンプルカット時：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。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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

プロカイン塩酸塩のLD₅₀は次のように報告されている。

	ラット	マウス
皮下 ³⁾	2.1g/kg	339~800mg/kg
腹腔内 ⁵⁾	184mg/kg	180mg/kg

なお、特に皮下注射の場合、コカインに比して毒性が著しく低下するといわれている。

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：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）

有効成分：劇薬

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

くすりのしおり：あり

患者向医薬品ガイド：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」（日新製薬）

2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」（日新製薬）

同 効 薬：日局 リドカイン注射液

日局 メピバカイン塩酸塩注射液

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号，薬価基準収載年月日，販売開始年月日

製造販売承認年月日：2007年3月22日（販売名変更による）

承 認 番 号：ロカイン注1%：21900AMX00811

ロカイン注2%：21900AMX00817

薬価基準収載年月日：1954年1月1日

販 売 開 始 年 月 日：1954年1月1日

9. 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

X-10. の項 参照

X. 管理的事項に関する項目

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果公表年月日：1974年11月20日

内容：

	変更前
効能・効果	各科領域における局所麻酔および脊髄麻酔
用法・用量	通常手術時の麻酔に用いられ、浸潤麻酔にはエピネフリンを1:100,000~200,000の割に加えた0.5~2%液を、硬膜外麻酔（胸部手術）には2%液を、腰椎麻酔（産科）には1.5%食塩水溶液を、それぞれ用いますが、一般に手術に当ってその症状に即応して使用して下さい。なお、注射に際しては直接血管内へ入れることは避けて下さい。

変更後の効能・効果はV-1.の項、用法・用量はV-3.の項を参照。

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

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。

13. 各種コード

ロカイン注1%

	HOT 番号	薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	レセプト電算コード
1mL	101642002	1211401A4016	1211401A4067	641210029 (620005863)
2mL	101643702	1211401A5012	1211401A5071	641210030 (620005864)
5mL	101644403	1211401A6019	1211401A6078	641210031 (620005865)

ロカイン注2%

	HOT 番号	薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	レセプト電算コード
1mL	101646802	1211401A8011	1211401A8070	641210034 (620005866)
2mL	101647504	1211401A9018	1211401A9085	641210035 (620005867)
5mL	101648202	1211401H1015	1211401H1074	641210036 (620005868)

注) 統一名収載品において、レセプト電算コード欄の()内は銘柄名コードを示す。

14. 保険給付上の注意

特になし

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) 扶桑薬品工業株式会社（長期保存試験）社内資料
- 2) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店. 2021 : C-4970-4974
- 3) JPDI 2006 じほう. 2006 : 1565-1568
- 4) JPDI 2001 じほう. 2001 : 532-535
- 5) Burgison, R.M. et al. : Fed. Proc. 1951 ; 10 : 284-285

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II . 参考資料

1. 主な外国での発売状況

- (1) 本剤と同一製剤は外国で発売されていない。
- (2) プロカイン塩酸塩注射液としては、各国で発売されている。(2024年1月時点)

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備 考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

該当資料なし