

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 2013 に準拠して作成

局所麻酔剤

日本薬局方 プロカイン塩酸塩注射液

プロカニン注 0.5%

プロカニン注 1%

Procaine Inj. 0.5%

Procaine Inj. 1%

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	プロカニン注 0.5%：1 管（5mL）中プロカイン塩酸塩 25mg 含有 プロカニン注 1%：1 管（5mL）中プロカイン塩酸塩 50mg 含有
一般名	和名：プロカイン塩酸塩（JAN） 洋名：Procaine Hydrochloride（JAN）
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： プロカニン注 0.5%：2008 年 3 月 6 日（販売名変更による） プロカニン注 1%：2008 年 3 月 6 日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日： プロカニン注 0.5%：2008 年 6 月 3 日（販売名変更による） プロカニン注 1%：2008 年 6 月 3 日（販売名変更による） 発売年月日： プロカニン注 0.5%：1949 年 1 月 24 日 プロカニン注 1%：1949 年 1 月 24 日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：光製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	光製薬株式会社 医薬情報部 TEL.03-3874-9351 FAX.03-3871-2419 受付時間：8 時 30 分～17 時 30 分 （土、日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ http://www.hikari-pharm.co.jp/product/

本 IF は 2017 年 5 月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.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、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IF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、（独）医薬品医療機器総合機構ホームページ（<http://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品医療機器総合機構ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

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]

①規格はA4版、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。

②IF 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。

③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]

①IF 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。

②IF 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。

③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。

④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。

⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」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]

①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。

②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。

③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 2013」においては、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ある。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構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総合機構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もあり、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、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。

(2013 年 4 月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	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
III. 有効成分に関する項目	3
1. 物理化学的性質	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
IV. 製剤に関する項目	4
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	4
3. 注射剤の調製法	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（物理化学的変化）	5
8. 生物学的試験法	5
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	5
10. 製剤中の有効成分の定量法	5
11. 力価	6
12. 混入する可能性のある夾雑物	6
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6
14. その他	6
V. 治療に関する項目	7
1. 効能又は効果	7
2. 用法及び用量	7
3. 臨床成績	7
VI. 薬効薬理に関する項目	9
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	9
2. 薬理作用	9

VII. 薬物動態に関する項目	10
1. 血中濃度の推移・測定法	10
2. 薬物速度論的パラメータ	10
3. 吸 収	11
4. 分 布	11
5. 代 謝	11
6. 排 泄	12
7. トランスポーターに関する情報	12
8. 透析等による除去率	12
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	13
1. 警告内容とその理由	13
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	13
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	14
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	14
5. 慎重投与内容とその理由	14
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15
7. 相互作用	15
8. 副作用	16
9. 高齢者への投与	17
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	17
11. 小児等への投与	17
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	17
13. 過量投与	17
14. 適用上の注意	18
15. その他の注意	18
16. その他	18
IX. 非臨床試験に関する項目	19
1. 薬理試験	19
2. 毒性試験	19

X. 管理的事項に関する項目	21
1. 規制区分	21
2. 有効期間又は使用期限	21
3. 貯法・保存条件	21
4. 薬剤取扱い上の注意点	21
5. 承認条件等	21
6. 包装	21
7. 容器の材質	21
8. 同一成分・同効薬	21
9. 国際誕生年月日	21
10. 製造販売承認年月日 及び承認番号	22
11. 薬価基準収載年月日	22
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	22
13. 再審査結果、再評価 結果公表年月日及び その内容	22
14. 再審査期間	22
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	22
16. 各種コード	22
17. 保険給付上の注意	22
XI. 文献	23
1. 引用文献	23
2. その他の参考文献	23
XII. 参考資料	24
1. 主な外国での発売状況	24
2. 海外における 臨床支援情報	24
XIII. 備考	25
その他の関連資料	25

I. 概要に関する項目

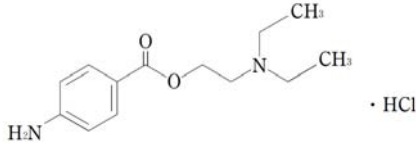
1. 開発の経緯

該当資料なし

2. 製品の治療学的・
製剤学的特性

麻酔作用はコカインに類似し、知覚神経組織を麻痺させ、伝導機能の消失をきたす。また中枢神経系を刺激あるいは抑制して興奮作用を示すが、この作用は経時的に弱化し、中枢神経麻痺作用に移行する。粘膜への浸透力は弱く、鼻、眼等の表面麻酔には不適である。血管収縮作用はないので効力持続と吸収防止の目的にアドレナリンを加える。¹⁾

II. 名称に関する項目

1. 販売名	
(1) 和名	プロカニン注 0.5% プロカニン注 1%
(2) 洋名	Procanine Inj. 0.5% Procanine Inj. 1%
(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)
(2) 洋名 (命名法)	Procaine Hydrochloride (JAN)
(3) ステム	-caine
3. 構造式又は示性式	
4. 分子式及び分子量	$C_{13}H_{20}N_2O_2 \cdot HCl$: 272.77
5. 化学名 (命名法)	2-(Diethylamino)ethyl 4-aminobenzoate monohydrochloride
6. 慣用名、別名、略号、 記号番号	該当資料なし
7. CAS 登録番号	51-05-8

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 ²⁾	25℃ RH75%条件下で、6 ヶ月間試験において特に問題はなかった。
(4) 融点 (分解点)、 沸点、凝固点	融点 : 155~158℃
(5) 酸塩基解離定数 ²⁾	pKa : 8.8
(6) 分配係数	該当資料なし
(7) その他の 主な示性値	pH : 5.0~6.0 (プロカイン塩酸塩 1g を水に溶かして 20mL とした液)
2. 有効成分の各種条件下 における安定性	室温保存で 4 年間、外観、含量ともほとんど変化は認められなかった ²⁾ 。 プロカイン塩酸塩水溶液は pH3.3 で最も安定で、pH が高くなると加水分解 が起こり、4-アミノ安息香酸を生じ、また酸化により黄色となる。また、pH5.0 ~5.5 では分解が速い。 ³⁾
3. 有効成分の確認試験法	日局「プロカイン塩酸塩」の確認試験法による。
4. 有効成分の定量法	日局「プロカイン塩酸塩」の定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

剤形：水性注射剤

規格：○プロカニン注 0.5% (ガラスアンプル)

1 管 (5mL) 中プロカイン塩酸塩 25mg

○プロカニン注 1% (ガラスアンプル)

1 管 (5mL) 中プロカイン塩酸塩 50mg

性状：無色澄明の液

(2) 溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

pH：3.3~6.0 (実測値 約 4.0)

浸透圧比：約 1 (生理食塩液に対する比)

(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

窒素充填

2. 製剤の組成

(1) 有効成分 (活性成分) の含量

		プロカイン塩酸塩
0.5%	5mL	25mg
1%	5mL	50mg

(2) 添加物

		塩化ナトリウム	塩酸、水酸化ナトリウム (pH 調整剤)
0.5%	5mL	40mg	適量
1%	5mL	35mg	適量

(3) 電解質の濃度

(mEq/100mL)

	Na ⁺	Cl ⁻
プロカニン注 0.5%	13.7	13.7
プロカニン注 1%	12.0	12.0

(4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

(5) その他

該当資料なし

3. 注射剤の調製法

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

加速試験⁴⁾

規格	保存条件		試験項目	保存期間	結果
	温度	容器			
0.5% 1%	40℃	ガラス アンプル	性状、確認試験、pH、採取容量、不溶性異物、不溶性微粒子、無菌、定量法	6ヵ月	全て規格に適合

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化
(物理化学的变化)

(1) pH変動試験表

<プロカニン注0.5%>

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
		←10mL									10mL→			
				1.43		4.01							12.40	

<プロカニン注1%>

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
		←10mL			2.83mL→				白濁					
				1.51		4.05				9.62				

(2) 配合変化試験⁵⁾

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。ブドウ糖含有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、局所麻酔作用が低下するので注意を要する。また、硫酸ストレプトマイシンを分解させることも知られている。ベンジルペニシリン、ヨード類も配合不可とされている。

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日局「プロカイン塩酸塩注射液」の確認試験による。

10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「プロカイン塩酸塩注射液」の定量法による。

11. 力 価	該当しない
12. 混入する可能性のある 夾雑物	該当資料なし
13. 注意が必要な容器・外 観が特殊な容器に関する情報	該当資料なし
14. その他	該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果	<p>プロカニン注 0.5% : 浸潤麻酔 プロカニン注 1% : 伝達麻酔</p>
2. 用法及び用量	<p>プロカニン注 0.5% [浸潤麻酔] : (基準最高用量、1回 1,000mg) プロカイン塩酸塩として、通常成人 1回 1,000mg の範囲内で使用する。 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。</p> <p>プロカニン注 1% [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。</p>
3. 臨床成績	
(1) 臨床データ パッケージ	該当資料なし
(2) 臨床効果	該当資料なし
(3) 臨床薬理試験	該当資料なし
(4) 探索的試験	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 |

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	リドカイン塩酸塩、テトラカイン塩酸塩、ジブカイン塩酸塩、ブピバカイン塩酸塩水和物、メピバカイン塩酸塩、ロピバカイン塩酸塩水和物
2. 薬理作用	
(1) 作用部位・作用機序	<p>合成局所麻酔薬の原型。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。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。³⁾</p> <p>作用部位⁶⁾</p> <p>神経組織：知覚神経末梢線維、神経幹は容易に麻痺されるが、運動神経は侵され難い。</p> <p>知覚神経では、痛覚、寒冷、温熱の順に侵され易い。知覚神経線維は細いものが先に侵される。</p> <p>作用機序⁶⁾</p> <p>神経の刺激によって生じる脱分極の際、神経線維膜の通過口を塞いで、ナトリウムイオンの自由な出入りを防ぐためといわれている。</p>
(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	作用発現時間：投与後約2分 ^{7) 8)} 作用持続時間：約1時間 ^{7) 8)}

VII. 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 ²⁾	10～20分（皮下注の場合）
(3) 臨床試験で確認された血中濃度 ²⁾	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した。
(4) 中毒域	該当資料なし
(5) 食事・併用薬の影響	該当資料なし
(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) 解析方法	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

3. 吸 収	プロカインは、皮膚から吸収されず、粘膜からの吸収もコカインに比べると緩慢であるが、注射により容易に吸収され、長く注入部位にとどまらない。吸収を遅らせるために血管収縮剤が適用される。 ⁶⁾
4. 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	該当資料なし
(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
5. 代 謝	
(1) 代謝部位及び 代謝経路 ⁹⁾	プロカインは体内で非常に不安定で、ヒトの場合速やかに加水分解され、p-アミノ安息香酸と diethylaminoethanol になる。加水分解はおもに血漿で行われる。
(2) 代謝に関与する 酵素 (CYP450 等) の分子種 ²⁾	プロカインエステラーゼ
(3) 初回通過効果の 有無及びその割合	該当しない
(4) 代謝物の活性の 有無及び比率	該当資料なし
(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 ²⁾	腎臓（一部は胆汁から排出されるといわれる）
(2) 排泄率 ⁶⁾	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% が排泄された。また、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%であった。
(3) 排泄速度	該当資料なし
7. トランスポーターに関する情報	該当資料なし
8. 透析等による除去率	該当資料なし

VII. 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)

1. 次の患者には投与しないこと

1) 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) 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. 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。]

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。]

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。]

5) 糖尿病の患者

[血糖値が上昇するおそれがある。]

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。]

7) 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。]

(解説)

1.1) 本剤の副作用として、メトヘモグロビン血症が発現することが報告されているため、症状を悪化させるおそれがある¹⁰⁾。

1.2) 安息香酸エステル（コカインを除く）系の薬剤は構造式が類似している。そのため、本剤と異なる安息香酸エステル系薬剤の投与で、重篤な副作用や中毒が出現した患者に本剤を投与すると、同様の重篤な副作用を起こす可能性がある¹¹⁾。

2. アドレナリン、ノルアドレナリンの作用のため、本剤に対して過敏症の既往歴のある患者、及び心血管系疾患のある患者では、血圧上昇、心悸亢進、不整脈をきたし、症状を悪化させるおそれがある。

また、甲状腺機能亢進症患者では頻脈、息苦しさ、胸痛などの症状を起こすことがある。

血管収縮作用により、血流障害を起こし壊死状態になるおそれがある。糖尿病患者のように末梢血管に疾患のある場合にも、壊死を起こすことがあり、また血糖上昇作用もあるので禁忌である。¹¹⁾

<p>3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由</p>	<p>「V. 治療に関する項目」を参照すること。</p>
<p>4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由</p>	<p>「V. 治療に関する項目」を参照すること。</p>
<p>5. 慎重投与内容とその理由</p>	<div style="border: 1px solid black; padding: 5px;"> <p>慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）</p> <p>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</p> <p>1) ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔剤投与中の患者</p> <p style="padding-left: 20px;">[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。]</p> <p>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</p> <p style="padding-left: 20px;">[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。]</p> </div>

6. 重要な基本的注意と
その理由及び
処置方法

- 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、局所麻酔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。
- 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、下記の点に留意すること。
 - ①患者の全身状態の観察を十分に行うこと。
 - ②できるだけうす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必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。
 - ⑤血管の多い部位（頭部、顔面、扁桃等）に注射する場合には、吸収が早いので、できるだけ少ない量で使用する。
 - ⑥注射針が血管に入っていないことを確かめること。
 - ⑦注射の速度はできるだけ遅くすること。

(解説)

局所麻酔剤ショックの成因としては、中毒説、体質異常説、アレルギー説、自律神経過剰刺激症候説などがあげられている。局麻剤を中毒量以下の量及び濃度で使用してショックをみた場合、これを特異体質として取り扱う場合が多いが、体質の異常として問題になるのはアレルギー体質、脈管系不全体質、胸腺リンパ体質、自律神経失調状態、副腎皮質機能不全、起立性低血圧、肝臓等の器質的な異常が問題になっている。これらは事前の問診が必要であると共に、検査等で確かめるより他にない。¹¹⁾

7. 相互作用

- (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

該当しない

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）

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投与を中止し、適切な処置を行うこと。

① 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）

② 振戦、痙れん等の中毒症状

〔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〕

(3) その他の副作用

副作用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。

	頻 度 不 明
中枢神経系 ^{注)}	眠気、不安、興奮、霧視、めまい、悪心・嘔吐等
血液	メトヘモグロビン血症
過 敏 症	じん麻疹、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。

（解説）

処置方法を次に示す⁷⁾。

- ・ ショック：直ちに人工呼吸や酸素吸入をする。電解質輸液等で循環血液量を維持する。
チアノーゼには炭酸水素ナトリウム、血圧低下には昇圧剤を投与する。適切な体位を取る。
- ・ メトヘモグロビン血症：1%メチレンブルー液 1～4mg/kg を静注する。
- ・ 過敏症：投与中止、抗ヒスタミン剤を投与する。
剥奪性皮膚炎にはステロイドを用いる。

(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	<p>1) 禁忌：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には投与しないこと。</p> <p>2) 副作用：その他の副作用 過敏症（じん麻疹、浮腫等） 副作用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。</p>
9. 高齢者への投与	<p>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ので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。</p>
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	<p>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まわ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。]</p> <p>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。]</p>
11. 小児等への投与	<p>該当資料なし</p>
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	<p>該当資料なし</p>
13. 過量投与	<p><症状></p> <p>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見られる。大脳皮質：不安、興奮、混乱、おしゃべりから始まり、ついには全身痙攣を起こす。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、心血管系への末梢作用として、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。²⁾</p>

14. 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、異物混入を避けるため、アンプルカット部分をエタノール綿等で清拭したのちカットすることが望ましい。

15. その他の注意

該当資料なし

16. その他

該当資料なし

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」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⁶⁾

プロカインは体内で分解して、p-アミノ安息香酸を生じるため、スルファミン剤と拮抗し、その効果を減弱させる。

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験⁹⁾

動物種	投与方法	投与量 (mg/kg)	備考
マウス	皮下	339.1±42.4	LD ₅₀
〃	〃	800	〃
〃	筋肉	630	〃
〃	腹腔	123.8±7.1	〃
〃	静脈	56.9±1.5	〃
ラット	皮下	2100	〃
〃	腹腔	184	〃
〃	〃	269.4±5.8	〃
〃	静脈	38.3±1.6	〃
ウサギ	皮下	460	MLD
〃	〃	450	LD
〃	静脈	57	LD ₅₀
ネコ	皮下	450	MLD
〃	静脈	40~45	〃
イヌ	皮下	250	〃

(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

抗原性試験⁶⁾

局所麻酔剤は反復投与を行うと、しばしばアレルギー症状を呈する。発現頻度は、内服または注射した場合より局所適用の場合が多い。

局所刺激性試験¹¹⁾

ウサギに本剤と対照薬として生理食塩液を 1mL 筋肉内注射したとき、局所障害は全く認められなかった。

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. 有効期間又は使用期限	使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）
3. 貯法・保存条件	室温保存
4. 薬剤取扱い上の注意点	
（1）薬局での取り扱い上の留意点について	該当資料なし
（2）薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）	該当資料なし
（3）調製時の留意点について	内容液に着色又は混濁等の異常が認められる場合は、使用しないこと。 「V.-2. 用法及び用量」の項参照 「VIII.-14. 適用上の注意」の項参照
5. 承認条件等	該当しない
6. 包 装	プロカニン注 0.5%：5mL×50管（ガラスアンプル） プロカニン注 1%：5mL×50管（ガラスアンプル）
7. 容器の材質	無色透明のガラスアンプル
8. 同一成分・同効薬	同一成分薬：0.5%塩酸プロカイン注射液「トーワ」（東和薬品） 1%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」（日新製薬） 塩プロ 1%注「小林」（共和クリティケア） ロカイン注 1%（扶桑＝アルフレッサファーマ） 同 効 薬：2%塩酸プロカイン注射液「ニッシン」（日新製薬） ロカイン注 2%（扶桑＝アルフレッサファーマ）
9. 国際誕生年月日	該当しない

10. 製造販売承認年月日
及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
プロカニン注 0.5%	2008年3月6日	22000AMX00376
プロカニン注 1%	2008年3月6日	22000AMX00375

注：旧販売名：プロカニン 0.5% 承認年月日：1985年12月26日

プロカニン 1% 承認年月日：1985年12月26日

11. 薬価基準記載年月日

プロカニン注 0.5%/1%：2008年6月3日

旧販売名：プロカニン 0.5%/1%

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

再評価結果：1974年11月20日

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

販売名	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
プロカニン注 0.5%	101641301	1211401A3010	620008387
プロカニン注 1%	101644402	1211401A6019	620008389

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文 献

- | | |
|-------------|---|
| 1. 引用文献 | 1) 島本 他：薬理学 医学書院, 246 (1970)
2) 日本薬剤師研修センター：日本薬局方医薬品情報 2006, じほう
3) 廣川書店：第十七改正日本薬局方 解説書
4) 光製薬 (株)：安定性に関する資料 (社内資料)
5) 森 潔 他：注射剤の配合変化 (1982)
6) 塩酸プロカイン再評価資料
7) 森 潔：注射剤ハンドブック (1989)
8) Defalque R. J. et al. : <i>Analg. Curr. Res.</i> , 46 (3), 311 (1967)
9) 常用医薬品事典 廣川書店 (1985)
10) 熊本県病院薬剤師会学術委員会：医薬品の使用禁忌とその理由 (1987)
11) 光製薬 (株)：社内資料 |
| 2. その他の参考文献 | 該当資料なし |

XII. 参考資料

- | | |
|---------------------|--------|
| 1. 主な外国での発売状況 | 該当資料なし |
| 2. 海外における
臨床支援情報 | 該当資料なし |

XIII. 備 考

その他の関連資料

該当資料なし