

貯法：冷所保存

有効期間：3年

表面麻酔剤

リドカイン塩酸塩点眼剤

キシロカイン[®]点眼液 4%Xylocaine[®] ophthalmic Solution 4%

承認番号	21800AMX10089000
販売開始	1957年1月

2. 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. 組成・性状

3.1 組成

販売名	キシロカイン点眼液 4%
有効成分	1mL 中、リドカイン塩酸塩 40mg
添加剤	クロロブタノール、pH 調整剤

3.2 製剤の性状

販売名	キシロカイン点眼液 4%
剤形	点眼剤
性状	無色澄明な無菌の液
pH	5.0~7.0

4. 効能又は効果

眼科領域における表面麻酔

5. 効能又は効果に関連する注意

鎮痛のみの目的には使用しないこと。

6. 用法及び用量

通常、成人では1~5滴を点眼する。

なお、年齢、体質により適宜増減する。

8. 重要な基本的注意

まれにショック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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

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。

9.6 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。

10. 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。

10.2 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
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。	作用が増強することが考えられる。

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。

11.1 重大な副作用

ショック（頻度不明）

アナフィラキシーショックを起こすおそれがある。

11.2 その他の副作用

頻度不明
過敏症

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

クロロブタノール（保存剤）は冷時安定であるが、加熱滅菌により分解して塩酸を放出し、液に刺激性を与える懸念があるので、本剤は無菌操作法により調製されている。したがって、本剤を加熱再滅菌して使用したり、また、希釈して加熱再滅菌のうえ用いることは絶対にしないこと。

14.2 薬剤投与時の注意

14.2.1 頻回に使用しないこと。

14.2.2 本剤を患者には渡さないこと。

14.2.3 他の点眼剤を併用する場合には、少なくとも5分以上間隔をあけてから点眼すること。

14.3 薬剤投与後の注意

リドカイン塩酸塩は金属を侵す性質があるので、長時間金属器具（カニューレ、注射針等）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、使用後十分に水洗すること。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

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. 薬物動態

16.2 吸収

リドカイン塩酸塩は眼球結膜・眼瞼結膜から吸収される。

16.3 分布

リドカイン 2 μ g/mL の血漿蛋白結合率は約 65% で、 α_1 -酸性糖蛋白及びアルブミンと結合する。血液/血漿中濃度比は約 0.8 であることから、血球への分布は少ないと考えられる。妊婦にリドカイン塩酸塩を硬膜外投与^{注1)}したとき、臍帯静脈血液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¹⁾。

16.4 代謝

リドカインは、主として肝臓で N-脱エチル体 monoethyl glycinexylidide (MEGX) に代謝された後、glycinexylidide (GX)、2,6-xylidine に代謝され、投与量の約 70% が 4-hydroxy-2,6-xylidine として尿中に排泄される²⁾。

16.5 排泄

リドカイン塩酸塩 250mg を健康人に経口投与^{注1)}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²⁾（外国人データ）。

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 心不全患者、腎不全患者及び肝機能低下患者

心不全患者及び腎不全患者にリドカイン塩酸塩 50mg を静脈内投与後^{注1)}の消失半減期は、健康人に比べ有意な変動はなく、肝機能低下患者では約 3 倍に延長した³⁾（外国人データ）。

注 1) 本剤の承認された投与経路は点眼である。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

リドカイン塩酸塩は、神経膜のナトリウムチャネルをブロックし、神経における活動電位の伝導を可逆的に抑制し、知覚神経・運動神経を遮断する局所麻酔薬である。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名称

リドカイン (Lidocaine) (JAN)

化学名

2-Diethylamino-N-(2,6-dimethylphenyl) acetamide

分子式

C₁₄H₂₂N₂O

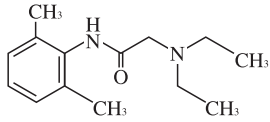
分子量

234.34

性状

リドカインは白色～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。

化学構造式



融点

66～69℃

20. 取扱い上の注意

外箱開封後は、遮光して保存すること。

22. 包装

[瓶] 20mL

23. 主要文献

- 1) Burm,A.G.L. : Clin.Pharmacokinet. 1989 ; 16 : 283-311
- 2) Keenaghan,J.B. et al. : J.Pharmacol.Exp.Ther. 1972 ; 180 : 454-463
- 3) Thomson,P.D. et al. : Ann.Intern.Med. 1973 ; 78 : 499-508

24. 文献請求先及び問い合わせ先

サンド株式会社 カスタマーケアグループ
〒105-6333 東京都港区虎ノ門1-23-1
TEL 0120-982-001
FAX 03-6257-3633

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売

サンドファーマ株式会社

東京都港区虎ノ門1-23-1
URL:<https://www.sandoz.jp/>

26.2 販売

サンド株式会社

東京都港区虎ノ門1-23-1
URL:<https://www.sandoz.jp/>