

貯 法：室温保存

有効期間：3年

承認番号 16100AMZ01569

販売開始 1961年1月

局所麻酔剤

日本薬局方 プロカイン塩酸塩注射液

劇薬、処方箋医薬品^{注)}

塩プロ1%注「小林」

PROCAINE HYDROCHLORIDE Injection

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 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。〕
- 2.2 本剤の成分又は安息香酸エステル（コカインを除く）系局所麻酔薬に対し、過敏症の既往歴のある患者
- 2.3 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
 - 2.3.1 血管収縮薬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。〕
 - 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〔阻血状態を来し、局所壊死が起こるおそれがある。〕
 - 2.3.7 耳、指趾又は陰茎の麻酔〔阻血状態を来し、局所壊死が起こるおそれがある。〕

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名		塩プロ1%注「小林」		
容 量		1 mL	2 mL	5 mL
有効成分 (1管中)	日局プロカイン塩酸塩	10mg	20mg	50mg
	添加剤			
	塩化ナトリウム	7 mg	14mg	35mg
	1 mol/L塩酸	1.5 μ L	3 μ L	7.5 μ L

3.2 製剤の性状

販売名	塩プロ1%注「小林」
剤 形	水性注射剤
色 調	無色澄明の液
pH	3.3～6.0
浸透圧比	約1（生理食塩液に対する比）

4. 効能又は効果

伝達麻酔

6. 用法及び用量

プロカイン塩酸塩として、通常、成人1回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。

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、局所麻酔薬の投与に際しては、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、次の点に留意すること。〔11.1.1、11.1.2 参照〕
 - 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薬の併用を考慮すること。
 - 8.2.5 血管の多い部位（頭部、顔面、扁桃等）に注射する場合には、吸収が速いので、できるだけ少ない量で使用すること。
 - 8.2.6 注射針が血管に入っていないことを確かめること。
 - 8.2.7 注射の速度はできるだけ遅くすること。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 血管収縮薬（アドレナリン、ノルアドレナリン）の併用に対する注意が必要な患者

次の患者に血管収縮薬（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。〕
- (2) 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。〕

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。

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。

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。

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。

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

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、痙攣等の中毒症状（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]

11.2 その他の副作用

	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

注) ショックあるいは中毒への移行に注意すること。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

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。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¹⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：プロカイン塩酸塩（Procaine Hydrochloride）

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

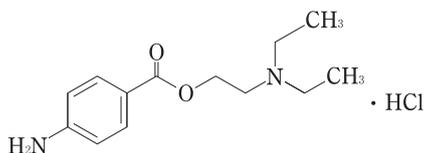
分子式：C₁₃H₂₀N₂O₂・HCl

分子量：272.77

性状：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。

化学構造式：



融点：155～158℃

22. 包装

1 mL×50管

2 mL×50管

5 mL×50管

23. 主要文献

1) 第十八改正日本薬局方解説書：廣川書店、2021：C4970-C4974

24. 文献請求先及び問い合わせ先

ネオクリティケア製薬株式会社 学術情報フリーダイヤル
〒112-0006 東京都文京区小日向4-2-8
TEL 0120-265-321
FAX 03-5840-5145

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

ネオクリティケア製薬株式会社

神奈川県厚木市旭町四丁目18番29号