

◎静注用キシロカイン2% [注]

【重要度】★【TDM】 【一般製剤名】リドカイン塩酸塩 (U) Lidocaine Hydrochloride 【分類】不整脈治療剤 [クラス Ib]

【単位】◎100mg/A [5mL]

【常用量】1回1~2mg/kgを1~2分間で緩徐に静脈内注射。効果が認められない場合には5分後に同量を投与。効果の持続を期待する時には10~20分間隔で同量を追加投与してもさしつかえないが、1時間内の基準最高投与量は300mg [2%注射液:15mL]

■静脈内注射の効果は通常10~20分で消失

【用法】1~2minかけて静注

【透析患者への投与方法】減量の必要なし (3,4)

【その他の報告】状態に応じて投与するが長期使用時に代謝物の蓄積に注意し1/2を目安に減量する (5)

【保存期CKD患者への投与方法】減量の必要なし (3,10,12)

【その他の報告】Ccr 30mL/min未満の患者では消失が障害されているため、長期投与時には減量を考慮する必要があるかもしれない (De Martin S, et al: Clin Pharmacol Ther 80: 597-606, 2006)

【特徴】Ib族に分類されるためNaイオンの細胞内への急速流入を抑制し活動電位持続時間を延長。虚血性心筋層に対して優先的に作用する。最大効果は低K血症がないときに得られる。

【主な副作用・毒性】精神錯乱、傾眠、呼吸抑制、痙攣、PQ・QRS延長、血圧下降、ショックなど

【F】35%、肝硬変・加齢により延長 (13)

【代謝】肝代謝率90% (U) 主として肝代謝酵素CYP1A2およびCYP3A4で代謝される (1) CYP3A4によって代謝 (N-脱メチル化) される (9) 代謝物monoethylglycinexylidide, glycinexylidideに弱い活性があり、投与後24hr以上経過して作用・毒性を表すことがある (U) CYP3A4によって生じる代謝物monoethylglycinexylidideの活性はリドカインの60~80% (13) 活性代謝物glycinexylidideには痙攣などの中枢障害作用がある。肝代謝時には肝血流量の影響を受けやすい。腎機能低下により定常状態の代謝物の血中濃度は、腎機能正常時に比べ2倍高値になる (De Martin S, et al: Clin Pharmacol Ther 2006 PMID: 17178261)

【排泄】尿中未変化体排泄率5%以下 (15) 10% (U,12) 2% (13)

【CL】9.2mL/min/kg、心不全・肝硬変・肥満・加齢により低下 (13) 667mL/min (10) 腎機能正常者11.87±2.97mL/min/kg, Ccr 30mL/minで透析を要しない高度腎機能低下患者6.01±2.54mL/min/kg (De Martin S, et al: Clin Pharmacol Ther 80: 597-606, 2006) 【非腎CL/総CL】95% (10)

【t1/2】1.8hr (13) 肝硬変・心筋梗塞・肥満により延長 (13) 1.6hr (11) 1~2hr (平均100min) 用量依存性で、注射時間が24hr以上になると3hr以上になる (U) CHF 1.2~6.1hr, AMI 2.4~6hr, CHF+AMI 5.3~10.3hr, 慢性肝疾患 2.0~10.3hr, 起立性低血圧 2.1~2.4hr (TDMポケットガイド, 薬局新聞社1998) 10~15min (2) 2~2.2hr (12) 若年者80min, 高齢者で140minに延長 (1)

【透析患者のt1/2】やや延長 (2) 腎疾患 1.1~2.4hr (TDMポケットガイド, 薬局新聞社1998) 1.3~3hr (12) 腎機能正常者 2.24±0.55hrでCcr 30mL/minで透析を要しない高度腎機能低下患者 4.55±1.71hrと2倍に延長 (De Martin S, et al: Clin Pharmacol Ther 80: 597-606, 2006)

【蛋白結合率】60% (10) 64% (11) 70%, 心筋梗塞・加齢・腎障害により上昇 (13) 60~66% (12) 60~80%で薬物濃度依存的 (U)

【Vd】1.1L/kg、心不全により低下、肝硬変により上昇 (13) 1.3L/kg (11) 0.7~1.5L/kg (15) 3.0L/kg (10) 心不全では初期Vdが低下するため負荷量を減量する 1.3~2.2L/kg (12) 1L/kg, 心不全患者で低下 (U)

【MW】234.34

【透析性】除去率0% (15) わずかに除去される (U)

【TDMのポイント】有効濃度1.5μg/mL以上 (1) 治療濃度1.5~5μg/mL (U) 有効血中濃度:1.5~5.0μg/mLであり、6~10μg/mLでは時に、10μg/mLでは頻回に中毒症状が発現する (13) 基準値1.2~5.0μg/mL (SRL検査案内) 静注では投与2時間後に、点滴静注では投与後6~12時間に採血する【OW係数】42 (11) 65 (TDMの実際 293-313, 薬業時報社,1993) 2.9 [1-ヘプタン/buffer, pH7.4] (1)

【相互作用】CYP1A2, 3A4を介する相互作用発現に注意。フルボキサミン併用により肝機能正常時には代謝物MEGXへの変換が阻害されるが、代謝能の低下した肝硬変ではこの変化が認められない (Orlando R, et al: Clin Pharmacol Ther 75: 80, 2004) リファンピシム併用によっても静注時の体内動態への影響は小さい (AUC11%低下) (Reichel C, et al: Br J Clin Pharmacol 46: 535-9, 1998)

【効果発現時間】45~90sec (静注)、5~15min (筋注)

【効果持続時間】10~20min (静注)、60~90min (筋注)

【更新日】20221105

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、

直接または間接的に生じた一切の問題について、当院ではいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。