

貯 法：室温保存
有効期間：5年

局所麻酔剤

劇薬 処方箋医薬品注)

注射用テトラカイン塩酸塩

テトカイン® 注用20mg「杏林」

TETOCAINE® Injection 20mg KYORIN

日本標準商品分類番号

871211

承認番号	22000AMX01923000
販売開始	1959年8月

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）

〈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

〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）及び硬膜外麻酔〉

2.2 重篤な出血やショック状態の患者〔重篤な低血圧が起こることがある。〕

2.3 注射部位又はその周辺の炎症部位〔化膿性髄膜炎症状を起こすおそれがある。〕

2.4 敗血症の患者〔敗血症性の髄膜炎を生ずるおそれがある。〕

2.5 中枢神経系疾患（髄膜炎、脊髄瘍、灰白脊髄炎等）の患者〔脊髄麻酔により症状が悪化するおそれがある。〕

〈硬膜外麻酔、浸潤麻酔、伝達麻酔及び表面麻酔〉

2.6 次の患者には血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加しないこと。

2.6.1 血管収縮剤に対し、過敏症の既往歴のある患者

2.6.2 高血圧、動脈硬化、心不全、甲状腺機能亢進、糖尿病、血管痙攣等のある患者〔これらの症状が悪化するおそれがある。〕

〈浸潤麻酔及び伝達麻酔〉

2.7 耳、指趾又は陰茎の麻酔には血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）を添加しないこと。〔壊死状態になるおそれがある。〕

3. 組成・性状

3.1 組成

有効成分 (1バイアル中)	日局 テトラカイン塩酸塩20mg
------------------	------------------

3.2 製剤の性状

剤形	注射剤（用時溶解）
色調・性状	白色の粉末又は塊

表 各種溶解液を使用して本剤を溶解したときの性状

溶解液	テトラカイン塩酸塩の濃度	pH	浸透圧比※	溶血性	比重		
					20℃	25℃	37℃
5%ブドウ糖注射液	0.1%	6.0±1.0	約1	/	1.0194	1.0190	1.0190
	0.5%	5.7±1.0	約1		1.0199	1.0197	1.0197
	1%	5.5±1.0	約1		1.0205	1.0202	1.0202
10%ブドウ糖注射液	0.1%	5.5±1.0	約2	(-)	1.0339	1.0330	/
	0.5%	5.5±1.0	約2		1.0353	1.0334	
	1%	5.5±1.0	約2		1.0369	1.0353	
20%ブドウ糖注射液	0.1%	5.9±1.0	約5	/	1.0764	1.0759	1.0757
	0.5%	5.5±1.0	約5		1.0764	1.0761	1.0757
	1%	5.4±1.0	約5		1.0769	1.0765	1.0758
注射用蒸留水	0.1%	5.5±1.0	約0.0	(+)	0.9987	0.9984	/
生理食塩液	0.1%	5.5±1.0	約1	(+)	/	/	/
	0.2%	5.5±1.0	約1				
	2%	5.5±1.0	約1				

※：生理食塩液に対する比。

4. 効能又は効果

脊椎麻酔（腰椎麻酔）、浸潤麻酔、硬膜外麻酔、伝達麻酔、表面麻酔

6. 用法及び用量

使用に際し、目的濃度の水性注射液または水性液として、使用する。

〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）〉

テトラカイン塩酸塩として、通常成人には下記量を使用する。

高比重溶液：0.1～0.5%注射液とし、6～15mg

低比重溶液：0.1%注射液とし、6～15mg

〈浸潤麻酔〉

（基準最高用量：1回100mg）0.1%注射液とし、テトラカイン塩酸塩として、通常成人20～30mgを使用する。

〈硬膜外麻酔〉

0.15～0.2%注射液とし、テトラカイン塩酸塩として、通常成人30～60mgを使用する。

〈伝達麻酔〉

（基準最高用量：1回100mg）0.2%注射液とし、テトラカイン塩酸塩として、通常成人10～75mgを使用する。

〈表面麻酔〉

0.25～2%液とし、テトラカイン塩酸塩として通常成人5～80mg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。必要に応じてアドレナリン（通常濃度1：1万～2万）を添加して使用する。

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 まれにショック様症状を起こすことがあるので、局所麻酔剤の使用に際しては、患者の全身状態の観察を十分に行い、常時、直ちに救急処置のとれる準備が望ましい。〔8.2、8.3、8.10、11.1.1参照〕

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、ショック様症状をできるだけ避けるために、以下の点に留意すること。〔8.1、8.3、8.10、11.1.1参照〕

〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）〉

8.3 ショック様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路の確保を行うこと。〔8.1、8.2、11.1.1参照〕

8.4 一般に血圧が下降しやすいので、次の測定基準により血圧管理を十分に行い、必要に応じて適切な処置を行うこと。

・薬液を注入してから1分後に血圧を測定する。

・それ以降14分間は、2分に1回血圧を測定する。必要があれば（例えば血圧が急速に下降傾向を示すような場合）連続的に血圧を測定する。

・薬液注入後15分以上経過した後は、2.5～5分に1回血圧を測定する。必要があれば（例えば血圧が急速に下降傾向を示すような場合）連続的に血圧を測定する。

8.5 バイタルサイン（血圧、心拍数、呼吸、意識レベル）及び麻酔高に注意し、必要に応じて適切な処置を行うこと。

8.6 臍部以上の部位の手術に用いる必要がある場合には、慎重に投与すること。

8.7 本剤の比重は一定に調製されているが、患者の脳脊髄液の比重にはかなりの変動があることに留意すること。

8.8 髄液の漏出を最少に防ぐために、脊椎穿刺針は、できるだけ細いものを用いること。脊椎穿刺により脊麻後頭痛が、また、まれに一過性の外転神経麻痺等があらわれることがある。なお、必要に応じて輸液を行うこと。

8.9 まれに脊髄神経障害があらわれることがあるので、穿刺に際して患者が放散痛を訴えた場合、脳脊髄液が出にくい場合又は血液混入を認めた場合には、本剤を注入しないこと。

〈硬膜外麻酔〉

- 8.10 ショック様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路の確保を行うこと。[8.1、8.2、11.1.1参照]
- 8.11 できるだけ薄い濃度のものを用いること。
- 8.12 できるだけ必要最少量にとどめること。
- 8.13 注射の速度はできるだけ遅くすること。
- 8.14 必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。
- 8.15 注射針が、血管又はくも膜下腔に入っていないことを確かめること。

〈浸潤麻酔、伝達麻酔〉

- 8.16 できるだけ薄い濃度のものを用いること。
- 8.17 できるだけ必要最少量にとどめること。
- 8.18 注射の速度はできるだけ遅くすること。
- 8.19 必要に応じて血管収縮剤の併用を考慮すること。
- 8.20 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こと。
- 8.21 注射針が、血管に入っていないことを確かめること。

〈表面麻酔〉

- 8.22 できるだけ薄い濃度のものを用いること。
- 8.23 できるだけ必要最少量にとどめること。

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

〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）及び硬膜外麻酔〉

- 9.1.1 血液疾患や抗凝血剤治療中の患者
血腫形成や脊髄への障害を起こすことがある。出血しやすい。
- 9.1.2 重篤な高血圧症の患者
低血圧が起こりやすい。
- 9.1.3 脊柱の著明な変形のある患者
脊髄や神経根の損傷のおそれがあり、また麻酔の高さの予測も困難である。

〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）〉

- 9.1.4 若年者
一般に麻酔範囲が拡がりやすい。
- ### 〈浸潤麻酔、硬膜外麻酔、伝達麻酔及び表面麻酔〉

9.1.5 血管収縮剤（カテコールアミン）の併用に対する注意が必要な患者

- 次の患者には血管収縮剤（アドレナリン、ノルアドレナリン）との併用を慎重にすること。

(1) ハロタン等のハロゲン含有吸入麻酔剤使用中の患者

- 心筋の被刺激性が高まって不整脈が発現しやすい。

(2) 三環系抗うつ剤服用中の患者

- 心血管作用の増強がみられることがある。

9.5 妊婦

〈効能共通〉

- 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。

〈脊椎麻酔（腰椎麻酔）及び硬膜外麻酔〉

- 9.5.2 妊娠末期は、麻酔範囲が拡がり、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。

9.8 高齢者

- 患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。一般に生理機能が低下している。

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）

- 血圧降下、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。[8.1-8.3、8.10参照]

11.1.2 中枢神経障害（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。

11.2 その他の副作用

	頻度不明
中枢神経	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈、悪心・嘔吐
過敏症	蕁麻疹、浮腫

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

〈表面麻酔〉

14.1.1 投与部位

- 眼科用として投与しないこと。

16. 薬物動態

16.4 代謝

- テトラカインは血漿中でプロカインエステラーゼによって加水分解されて *p*-butylaminobenzoic acid (C₄H₉NHC₆H₄COOH) と dimethylaminoethanol (HOCH₂CH₂N(CH₃)₂) を生じるが、その分解速度はプロカインより4~5倍遅い¹⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

- 神経細胞の細胞膜の興奮時及び静止時のイオン透過性をいずれも抑制して、神経興奮に必要な脱分極を阻止することにより、神経遮断作用を示す²⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

- 一般名：テトラカイン塩酸塩 (Tetracaine Hydrochloride)

[JAN]

化学名：2-(Dimethylamino)ethyl 4-(butylamino)benzoate monohydrochloride

分子式：C₁₅H₂₄N₂O₂・HCl

分子量：300.82

融点：約148℃

性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味はわずかに苦く、舌を麻痺させる。

本品はギ酸に極めて溶けやすく、水に溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けにくく、無水酢酸に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

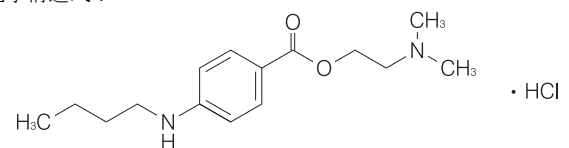
本品の水溶液(1→10)は中性である。

分配係数：

有機溶媒相	水相	分配係数
クロロホルム	pH7.0 Britton Robinson緩衝液	2.1

(24℃)

化学構造式：



20. 取扱い上の注意

- 沸騰、加圧滅菌に耐えるが、アルカリに合うと、Free Baseが析出するので注射器具等のアルカリ性煮沸滅菌を行ってはならない。

22. 包装

10バイアル

23. 主要文献

- 1) 日本薬局方解説書編集委員会：第十八改正日本薬局方解説書，廣川書店，東京，2021：C-3371-3373
- 2) 田中潔：現代の薬理学 改訂第15版，金原出版，東京，1988：163-166

24. 文献請求先及び問い合わせ先

杏林製薬株式会社 くすり情報センター
〒101-8311 東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地
電話 0120-409341
受付時間 9:00~17:30 (土・日・祝日を除く)

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

杏林製薬株式会社

東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地

杏林製薬株式会社
東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地