

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

局所麻酔剤

リドカイン塩酸塩・アドレナリン注射液

* **エピリド[®]** 配合注歯科用カートリッジ 1.0mL
エピリド[®] 配合注歯科用カートリッジ 1.8mL
EPILIDO[®] Combination Injection Dental Cartridges

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	有効成分	1 管(1mL)中	1 管中(1.8mL)中
	(日局)リドカイン (リドカイン塩酸塩として)	20mg	36mg
	(日局)アドレナリン	0.0125mg	0.0225mg
一般名	和名：リドカイン（JAN） 洋名：Lidocaine（JAN） 和名：アドレナリン（JAN） 洋名：Adrenaline（JAN）		
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2015 年 8 月 17 日（1.0mL） 2014 年 2 月 14 日（1.8mL） 薬価基準収載年月日：2025 年 6 月 12 日（1.0mL） 2014 年 6 月 20 日（1.8mL） 販売開始年月日：2025 年 9 月 8 日（1.0mL） 2014 年 8 月 6 日（1.8mL）		
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ニプロ株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社ファーマパッケージング事業部 TEL:06-6310-6571 FAX: 050-3204-7012 医療関係者向けホームページ https://www.nipro.co.jp/		

本 I F は 2026 年 3 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 ―日本病院薬剤師会―

(2020年4月改訂)

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、「IF記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その

取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

I. 概要に関する項目	5. 臨床成績	10
1. 開発の経緯	1	
2. 製品の治療学的特性	1	
3. 製品の製剤学的特性	1	
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	
6. RMPの概要	2	
II. 名称に関する項目	VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 販売名	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	12
2. 一般名	2. 薬理作用	12
3. 構造式又は示性式	VII. 薬物動態に関する項目	
4. 分子式及び分子量	1. 血中濃度の推移	14
5. 化学名（命名法）又は本質	2. 薬物速度論的パラメータ	14
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3. 母集団（ポピュレーション）解析	14
III. 有効成分に関する項目	4. 吸収	15
1. 物理化学的性質	5. 分布	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	6. 代謝	16
3. 有効成分の確認試験法，定量法	7. 排泄	16
IV. 製剤に関する項目	8. トランスポーターに関する情報	16
1. 剤形	9. 透析等による除去率	16
2. 製剤の組成	10. 特定の背景を有する患者	17
3. 添付溶解液の組成及び容量	11. その他	17
4. 力価	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	
5. 混入する可能性のある夾雑物	1. 警告内容とその理由	18
6. 製剤の各種条件下における安定性	2. 禁忌内容とその理由	18
7. 調製法及び溶解後の安定性	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	18
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	18
9. 溶出性	5. 重要な基本的注意とその理由	18
10. 容器・包装	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	19
11. 別途提供される資材類	7. 相互作用	20
12. その他	8. 副作用	21
V. 治療に関する項目	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	21
1. 効能又は効果	10. 過量投与	22
2. 効能又は効果に関連する注意	11. 適用上の注意	22
3. 用法及び用量	12. その他の注意	23
4. 用法及び用量に関連する注意	IX. 非臨床試験に関する項目	
	1. 薬理試験	24
	2. 毒性試験	24

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	25
2. 有効期間	25
3. 包装状態での貯法	25
4. 取扱い上の注意	25
5. 患者向け資材	25
6. 同一成分・同効薬	25
7. 国際誕生年月日	25
8. 製造販売承認年月日及び承認番号， 薬価基準収載年月日，販売開始年月日	26
9. 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	26
10. 再審査結果，再評価結果公表年月日及び その内容	26
11. 再審査期間	26
12. 投薬期間制限に関する情報	26
13. 各種コード	26
14. 保険給付上の注意	27

XI. 文献

1. 引用文献	28
2. その他の参考文献	28

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	29
2. 海外における臨床支援情報	29

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行う にあたっての参考情報	30
2. その他の関連資料	30

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

リドカインは、局所麻酔薬であり、本邦では歯科用局所麻酔剤として 1963 年に上市されている。
リドカイン塩酸塩を 36mg、アドレナリンを 0.0225mg 含有するエピリド配合注歯科用カートリッジ 1.8mL は、ニプロ(株)が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 日)に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2014 年 2 月に承認を取得、2014 年 6 月薬価収載に至った。
その後、医療機関からの要望を受け、薬液の組成は同じで容量を 1.0mL としたエピリド配合注歯科用カートリッジ 1.0mL を開発、長期保存試験を実施し、2025 年 9 月に販売を開始した。

2. 製品の治療学的特性

- リドカインは、神経細胞膜の Na^+ チャンネルを抑制することによって神経の活動電位発生を抑制するという局所麻酔薬共通の作用により、知覚神経の求心性伝導を抑制する。
- 臨床的には、歯科領域における浸潤麻酔又は伝達麻酔に有用性が認められている。
- 重大な副作用としては、ショック、意識障害、振戦、痙攣、異常感覚、知覚・運動障害、悪性高熱が報告されている(頻度不明)。(「VIII.8.(1)重大な副作用と初期症状」の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

- 本剤は、メチルパラベン無添加である。
- 歯科治療の麻酔領域及び部位別等における使用量を考慮し、1.8mL 製剤に加えて 1.0mL 製剤を展開した。

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、 最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無	
最適使用推進ガイドライン	無	
保険適用上の留意事項通知	無	

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

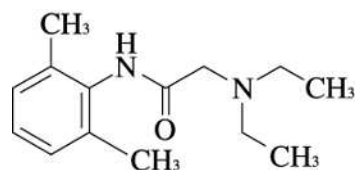
- (1) 和名：エピリド®配合注歯科用カートリッジ 1.0mL
エピリド®配合注歯科用カートリッジ 1.8mL
- (2) 洋名：EPILIDO® Combination Injection Dental Cartridges
- (3) 名称の由来：有効成分であるリドカイン Lidocaine 及びアドレナリン
(別名：エピネフリン) Epinephrin から命名した。

2. 一般名

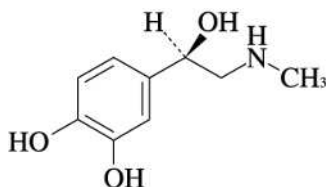
- (1) 和名 (命名法)：リドカイン (JAN)
アドレナリン (JAN)
- (2) 洋名 (命名法)：Lidocaine (JAN)
Adrenaline (JAN)
- (3) ステム (stem)：リドカイン 局所麻酔薬：-caine
アドレナリン 該当しない

3. 構造式又は示性式

リドカイン：



アドレナリン：



4. 分子式及び分子量

分子式：リドカイン	：	C ₁₄ H ₂₂ N ₂ O
アドレナリン	：	C ₉ H ₁₃ NO ₃
分子量：リドカイン	：	234.34
アドレナリン	：	183.20

5. 化学名 (命名法) 又は本質

リドカイン：2-Diethylamino-*N*-(2,6-dimethylphenyl)acetamide (IUPAC)
アドレナリン：4-[(1*R*)-1-Hydroxy-2-(methylamino)ethyl] benzene-1,2-diol (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

アドレナリン：別名 エピネフリン

Ⅲ．有効成分に関する項目

1．物理化学的性質

(1) 外観・性状

リドカイン

白色～微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

アドレナリン

白色～灰白色の結晶性の粉末である。空気又は光によって徐々に褐色となる。

(2) 溶解性

リドカイン

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。

アドレナリン

ギ酸又は酢酸 (100) に溶けやすく、水に極めて溶けにくく、メタノール又はエタノール (99.5) にほとんど溶けない。希塩酸に溶ける。

(3) 吸湿性

リドカイン

該当資料なし

アドレナリン

該当資料なし

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

リドカイン

融点：66～69℃

アドレナリン

分解点：約 210℃

(5) 酸塩基解離定数

リドカイン

pKa=7.9 (25℃) ¹⁾

アドレナリン

該当資料なし

(6) 分配係数

リドカイン

該当資料なし

アドレナリン

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

リドカイン

紫外吸収スペクトル：本品の塩酸酸性溶液は 263nm 付近に吸収の極大を示す。また、270nm 付近に吸収の肩を示すが、測定機種によっては極大ピークを示すことがある。

アドレナリン

旋光度： $[\alpha]_D^{20}$ ：-50.0~-53.5°（乾燥後、1g、1mol/L 塩酸試液、25mL、100mm）

2. 有効成分の各種条件下における安定性

リドカイン

本品を室温褐色瓶密栓で 60 ヶ月保存するとき、外観、含量とも変化を認めない。²⁾

アドレナリン

空気または光によって徐々に褐色となる。³⁾

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

リドカイン

日本薬局方の医薬品各条の「リドカイン」確認試験法による。

アドレナリン

日本薬局方の医薬品各条の「アドレナリン」確認試験法による。

定量法

リドカイン

日本薬局方の医薬品各条の「リドカイン」定量法による。

アドレナリン

日本薬局方の医薬品各条の「アドレナリン」定量法による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

水性注射剤

(2) 製剤の外観及び性状

外観：無色ガラス製カートリッジ

性状：無色澄明の液

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

pH：3.1～5.0

浸透圧比：約 1（生理食塩液に対する比）

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販 売 名	有 効 成 分	添 加 剤
エピリド配合注歯科用 カートリッジ 1.0mL	1管（1.0mL）中 日本薬局方 リドカイン （リドカイン塩酸塩として） 20mg 日本薬局方 アドレナリン 0.0125mg	1 管（1.0mL）中 塩酸 0.4 μ L ピロ亜硫酸ナトリウム 0.55mg 塩化ナトリウム 6mg 塩酸 適量 水酸化ナトリウム 適量
エピリド配合注歯科用 カートリッジ 1.8mL	1管（1.8mL）中 日本薬局方 リドカイン （リドカイン塩酸塩として） 36mg 日本薬局方 アドレナリン 0.0225mg	1 管（1.8mL）中 塩酸 0.72 μ L ピロ亜硫酸ナトリウム 0.99mg 塩化ナトリウム 10.8mg 塩酸 適量 水酸化ナトリウム 適量

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性⁴⁾

販売名	試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
エピリド 配合注歯科用 カートリッジ 1.0mL	長期保存試験	15℃、 湿度なりゆき	ガラス製 カートリッジ	24 箇月	pH 及びアドレナリン 含量において、経時的 な変化を認めたが、規 格の範囲内であった。 その他は、ほとんど変 化を認めず安定であっ た。
エピリド 配合注歯科用 カートリッジ 1.8mL	加速試験	30℃、 75%RH	ガラス製 カートリッジ	6 箇月	

試験項目：性状、確認試験、浸透圧比、pH、純度試験、不溶性異物、採取容量、
不溶性微粒子、無菌、リドカイン塩酸塩含量、アドレナリン含量

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

（1）注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

1. 凍結するとゴム栓の飛び出し又はカートリッジの破損が起こることがあるので注意すること。
2. 使用前に頭部（アルミキャップ）メンブランをアルコール綿等で軽く消毒すること。
3. 本剤は金属を侵す性質があるので、長時間注射針に接触させないことが望ましい。
4. 廃棄の際は感染防止に配慮すること。

(2) 包装

22. 包装

〈エピリド配合注歯科用カートリッジ 1.0mL〉

1.0mL × 50 管 [カートリッジ]

〈エピリド配合注歯科用カートリッジ 1.8mL〉

1.8mL × 50 管 [カートリッジ]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

アルミニウム、ガラス、ゴム

1 1 . 別途提供される資材類

該当しない

1 2 . その他

カートリッジには、過圧時等の割れによるガラス片飛散防止のため、透明のフィルムが貼付してある。

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効果・効能

歯科領域における浸潤麻酔又は伝達麻酔

2. 効能又は効果に関連する注意

該当しない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法・用量

浸潤麻酔又は伝達麻酔には、通常成人 0.3～1.8mL を使用する。口腔外科領域の麻酔には、3～5mL を使用する。

なお、年齢、麻酔領域、部位、組織、症状、体質により適宜増減するが、増量する場合には注意すること。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

該当資料なし

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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(一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

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	アドレナリン
アミド型局所麻酔薬 (ブピバカイン、メピバカイン、アルチカイン、 プロピトカイン、ロピバカイン)	カテコールアミン系薬剤、交感神経作動薬

注意：関連ある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

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ンネルをブロックし、神経における活動電位の伝導を可逆的に抑制し、知覚神経及び運動神経を遮断する局所麻酔薬である³⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績⁵⁾

エピリド配合注歯科用カートリッジと標準製剤の局所麻酔効果を浸潤麻酔作用及び伝達遮断作用を指標に比較した。

(1) モルモットへの皮内投与による浸潤麻酔作用

雄性モルモットを用いて、エピリド配合注歯科用カートリッジの皮内投与による浸潤麻酔作用を陰性対照物質である日本薬局方生理食塩液および標準製剤と比較検討した。

Steel-Dwass 検定による比較の結果、エピリド配合注歯科用カートリッジの麻酔の程度および麻酔効果持続時間は陰性対照物質に対し、有意に高値であり、標準製剤に対して有意差はみられなかった。

以上より、皮内投与により生じた丘疹の針刺激による皮膚収縮反応の有無を指標とした浸潤麻酔作用の検討において、エピリド配合注歯科用カートリッジは標準製剤とほぼ同程度の麻酔の程度、麻酔の程度の合計および麻酔効果持続時間を示し、統計学的有意差もみられないことから、同等の浸潤麻酔作用を有していると考えられた。

(2) ラット坐骨神経に対する伝達遮断作用

雄性ラットを用いて、エピリド配合注歯科用カートリッジの伝達遮断作用を忌避反応による知覚機能評価と位置認識反応による運動機能評価を指標に、陰性対照物質である日本薬局方生理食塩液および標準製剤と比較検討した。

ラット後脚へ投与液を 0.1 mL 投与することにより伝達麻酔作用を比較検討した結果、陰性対照物質では麻酔効果はまったくみられなかった。

Steel-Dwass 検定の結果、知覚ブロックの持続時間および運動ブロックの持続時間、累積スコアは陰性対照物質に対し、統計学的有意に高値であり、標準製剤群に対し、統計学的有意差はみられなかった。

以上より、ラットの坐骨神経に対する知覚機能および運動機能を指標とした伝達遮断作用の検討において、エピリド配合注歯科用カートリッジは標準製剤とほぼ同程度に知覚機能、運動機能の伝達を遮断し、統計学的有意差もみられないことから、同等の伝達遮断作用を有していると考えられた。

(3) 作用発現時間・持続時間

18.2 麻酔効果・作用時間

リドカイン塩酸塩の表面・浸潤・伝達麻酔作用は、プロカイン塩酸塩よりも強く、作用持続時間はプロカイン塩酸塩よりも長い。また、アドレナリン添加により、その作用は増強される^{6) -11)}。

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

健康成人に2%リドカイン液2mL又は4mL(リドカイン塩酸塩40mg又は80mg)を単独あるいはアドレナリンを添加(1:80,000)して下顎孔伝達麻酔・頬側浸潤麻酔に用いたとき、アドレナリン添加時の血漿中濃度は、単独投与時に比べ最高濃度の有意な低下、最高濃度到達時間の有意な延長が認められた¹²⁾。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

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) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

リドカイン²⁾

投与方法、投与部位によって大きく異なる。なお、健康な皮膚からはほとんど吸収されない。

アドレナリン²⁾

吸収部位 皮下組織

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

リドカイン²⁾

血液脳関門を通過するとの報告がある。

アドレナリン¹²⁾

通過しにくい、一部通過して中枢神経系へ移行する。

(2) 血液－胎盤関門通過性

リドカイン²⁾

妊婦にリドカイン塩酸塩を硬膜外投与した時、臍帯静脈血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。

アドレナリン¹²⁾

胎盤を通過し、胎児の循環血中に入る。

(3) 乳汁への移行性

リドカイン²⁾

授乳婦にリドカイン塩酸塩を 50mg 硬膜外投与し乳汁中への移行を調査したところ、乳汁中で投与後 30 分後で最大となり、60 分後に急速に低下した。

アドレナリン

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

リドカイン²⁾

リドカインを 20mg/kg、静注 30 分後の髄液中濃度は血中濃度の $53.2 \pm 7.3\%$ であった。

アドレナリン

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

リドカイン^{1), 2), 13)}

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。

リドカインを 2mg/kg 静注後速やかに血中から消失し、心、肺、脳、腎、脾及び腸管に 70% が移行し、臓器からの消失も速やかであった。

アドレナリン

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率^{1), 2), 13)}

リドカイン：約 65%、アドレナリン：約 50%

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

リドカインは、主として肝臓で N-脱エチル体 monoethylglycinexylidide (MEGX) に代謝された後、glycinexylidide (GX)、2,6-xylidine に代謝され、約 70%が 4-hydroxy-2,6-xylidine として尿中に排泄される¹⁴⁾。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

リドカイン²⁾

CYP1A2 及び CYP3A4 の報告がある。

アドレナリン

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

リドカイン²⁾

肝でのリドカインの初回通過効果は約 70%であるとの報告がある。

アドレナリン

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

リドカイン²⁾

Monoethylglycinexylidide(MEGX)と glycinexylidide(GX)はリドカインとほぼ同等かやや弱い薬理学的／毒性学的利用を有しているとの報告がある。

アドレナリン

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

リドカイン塩酸塩 250mg^{注1)}を健康人に経口投与^{注2)}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¹⁴⁾ (外国人データ)。

注 1) 本剤の基準最高用量は 100mg である。

注 2) 本剤の効能・効果は歯科領域における浸潤麻酔又は伝達麻酔である。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

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2)}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¹⁵⁾ (外国人データ)。

16.6.2 高齢者

高齢者にリドカイン塩酸塩 50mg を静脈内投与後^{注2)}の終末相半減期は 140 分を示し、若齢者の 81 分に比べて延長した¹⁶⁾ (外国人データ)。

注 2) 本剤の効能・効果は歯科領域における浸潤麻酔又は伝達麻酔である。

11. その他

該当資料なし

VIII. 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

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 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. 効能又は効果に関連する注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

該当しない

5. 重要な基本的注意とその理由

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、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。

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、以下の点に留意すること。

8.2.1 患者の全身状態の観察を十分に行うこと。

8.2.2 できるだけ必要最小量にとどめること。

8.2.3 血管の多い部位（顔面等）に注射する場合には、吸収が速いので、できるだけ少量を投与すること。

8.2.4 注射針が、血管に入っていないことを確かめること。

8.2.5 注射の速度はできるだけ遅くすること。

8.2.6 前投薬や術中に投与した鎮静薬、鎮痛薬等による呼吸抑制が発現することがあるので、これらの薬剤を使用する際は少量より投与し、必要に応じて追加投与することが望ましい。なお、高齢者、小児、全身状態が不良な患者、肥満者、呼吸器疾患を有する患者では特に注意し、異常が認められた際には、適切な処置を行うこと。[9.1.3、9.7、9.8 参照]

8.3 注射針が適切に位置していないなどにより、神経障害が生じることがあるので、穿刺に際し異常を認めた場合には本剤の注入を行わないこと。

8.4 本剤の投与により、誤嚥・口腔内咬傷の危険性を増加させるおそれがあるので注意すること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 次の患者には治療上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しないこと。これらの症状が悪化するおそれがある。

- (1) 高血圧のある患者
- (2) 動脈硬化のある患者
- (3) 心不全のある患者
- (4) 甲状腺機能亢進のある患者
- (5) 糖尿病のある患者
- (6) 血管攣縮の既往のある患者

9.1.2 心刺激伝導障害のある患者

症状を悪化させることがある。

9.1.3 全身状態が不良な患者

生理機能の低下により麻酔に対する忍容性が低下していることがある。[8.2.6 参照]

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重症の腎機能障害のある患者

中毒症状が発現しやすくなる。

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重症の肝機能障害のある患者

中毒症状が発現しやすくなる。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

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。

(6) 授乳婦

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。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。[8.2.6 参照]

(8) 高齢者

9.8 高齢者

患者の全身状態を観察しながら慎重に投与すること。生理機能の低下により麻酔に対する忍容性が低下していることがある。また、本剤に含まれているアドレナリンの作用に対する感受性が高いことがある。[8.2.6 参照]

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

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。

(2) 併用注意とその理由

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
ハロゲン含有吸入麻酔薬 ハロタン等	頻脈、不整脈、場合によっては心停止を起こすことがある。	これらの薬剤は、心筋のアドレナリン受容体の感受性を亢進させる。
三環系抗うつ薬 イミプラミン等 MAO 阻害薬	血圧上昇を起こすことがある。	これらの薬剤は、アドレナリン作動性神経終末でのカテコールアミンの再取り込みを阻害し、受容体でのカテコールアミン濃度を上昇させ、アドレナリン作動性神経刺激作用を増強させる。
非選択性β遮断薬 プロプラノロール等	血管収縮、血圧上昇、徐脈を起こすことがある。	これらの薬剤のβ受容体遮断作用により、アドレナリンのα受容体刺激作用が優位になり、血管抵抗性を上昇させる。
抗精神病薬（ブチロフェノン系、フェノチアジン系等） ハロペリドール クロルプロマジン等 α遮断薬	過度の血圧低下を起こすことがある。	これらの薬剤のα受容体遮断作用により、アドレナリンのβ受容体刺激作用が優位になり、血圧低下があらわれる。
分娩促進薬 オキシトシン等 麦角アルカロイド類 エルゴメトリン等	血圧上昇を起こすことがある。	併用により血管収縮作用が増強される。
クラス III 抗不整脈薬 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。	作用が増強することが考えられる。

8. 副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック（頻度不明）

徐脈、不整脈、血圧低下、呼吸抑制、チアノーゼ、意識障害等を生じ、まれに心停止を来すことがある。また、まれにアナフィラキシーショックを起こしたとの報告がある。

11.1.2 意識障害、振戦、痙攣（いずれも頻度不明）

意識障害、振戦、痙攣等の中毒症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。[13. 参照]

11.1.3 異常感覚、知覚・運動障害（いずれも頻度不明）

注射針の留置時に神経に触れることにより一過性の異常感覚が発現することがある。また、神経が注射針や薬剤あるいは虚血によって障害を受けると、まれに持続的な異常感覚、疼痛、知覚障害、運動障害等の神経学的疾患があらわれることがある。

11.1.4 悪性高熱（頻度不明）

まれに原因不明の頻脈・不整脈・血圧変動、急激な体温上昇、筋強直、血液の暗赤色化（チアノーゼ）、過呼吸、発汗、アシドーシス、高カリウム血症、ミオグロビン尿（ポートワイン色尿）等を伴う重篤な悪性高熱があらわれることがある。本剤を投与中、悪性高熱に伴うこれらの症状を認めた場合は、直ちに投与を中止し、ダントロレンナトリウムの静注、全身冷却、純酸素による過換気、酸塩基平衡の是正等、適切な処置を行うこと。また、本症は腎不全を続発することがあるので、尿量の維持を図ること。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	頻度不明
中枢神経 ^{注)}	眠気、不安、興奮、霧視、眩暈、頭痛等
循環器	動悸、頻脈、血圧上昇等
消化器 ^{注)}	悪心・嘔吐等
過敏症	蕁麻疹等の皮膚症状、浮腫等
投与部位	潰瘍、壊死等

注) このような症状があらわれた場合は、ショックあるいは中毒へ移行することがあるので、患者の全身状態の観察を十分に行い、必要に応じて適切な処置を行うこと。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. 過量投与

局所麻酔薬の血中濃度の上昇に伴い、中毒が発現する。特に誤って血管内に投与した場合には、数分以内に発現することがある。その症状は、主に中枢神経系及び心血管系の症状としてあらわれる。[11.1.2 参照]

13.1 症状

13.1.1 中枢神経系の症状

初期症状として不安、興奮、多弁、口周囲の知覚麻痺、舌のしびれ、ふらつき、聴覚過敏、耳鳴、視覚障害、振戦等があらわれる。症状が進行すると意識消失、全身痙攣があらわれ、これらの症状に伴い低酸素血症、高炭酸ガス血症が生じるおそれがある。より重篤な場合には呼吸停止を来すこともある。

13.1.2 心血管系の症状

血圧低下、徐脈、心筋収縮力低下、心拍出量低下、刺激伝導系の抑制、心室性頻脈及び心室細動等の心室性不整脈、循環虚脱、心停止等があらわれる。

13.2 処置

振戦や痙攣が著明であれば、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）を投与する。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 使用回数

本品は一回限り使用のディスポーザブル製剤であるので、再度の使用は避けること。

14.2 薬剤投与時の注意

14.2.1 使用前にカートリッジの頭部（アルミキャップ）メンブランをアルコールで軽く消毒すること。

14.2.2 本剤は、金属を侵す性質があるので、長時間注射針に接触させないことが望ましい。

14.2.3 強圧をかけずにできるだけゆっくり注射すること。骨膜下への強圧注射は組織の損傷又はガラスチューブの破折につながるおそれがある。

カートリッジのシリンジへの装填方法

- (1) 注射針を取り付ける前にシリンジの押しレバーを一杯に引き、カートリッジを後部（ゴム栓側）から装填します。
- (2) カートリッジを指で固定しながら注射針を取り付けます。
- (3) 薬液が出ることを確認後、注射を行います。
- (4) 注射が完了したら針をはずし、押しレバーを一杯に引き、カートリッジを取り出します。
※カートリッジ、注射針は患者ごとに交換してください。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

本剤は添加剤として亜硫酸塩を含有している。喘息患者では非喘息患者よりも亜硫酸塩に対する過敏症が多く認められるとの報告がある。

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

リドカイン

LD₅₀ 270～390mg/kg (マウス、皮下注)

LD₅₀ 25～48mg/kg (マウス、静脈内)

LD₅₀ 520mg/kg (マウス、経口)

LD₅₀ 約 25mg/kg (ラット、静脈内)

LD₅₀ 25.6mg/kg (ウサギ、静脈内)

アドレナリン

LD₅₀ 5～6mg/kg (イヌ、皮下注)

LD₅₀ 0.1～0.2mg/kg (イヌ、静脈内)

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：エピリド配合注歯科用カートリッジ 1.0mL 劇薬、処方せん医薬品^{注)}

エピリド配合注歯科用カートリッジ 1.8mL 劇薬、処方せん医薬品^{注)}

有効成分：リドカイン：劇薬

アドレナリン：毒薬

注) 注意-医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間

24 箇月 (1.0mL)

3 年 (1.8mL)

3. 包装状態での貯法

凍結を避けて 15℃以下に保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

20.1 凍結するとゴム栓の飛び出し又はカートリッジの破損が起こることがあるので注意すること。

20.2 外箱開封後は遮光して保存すること。

20.3 廃棄の際は感染防止に配慮すること。

5. 患者向け資材

該当資料なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：歯科用キシロカインカートリッジ (デンツプライシロナ)

キシレステシン A 注射液 (カートリッジ) (白水貿易)

同効薬：オーラ注歯科用カートリッジ 1.0mL、同 1.8mL (ジーシー昭和薬品)

スキャンドネストカートリッジ 3% (日本歯科薬品)

歯科用シタネスト-オクタプレシンカートリッジ (デンツプライシロナ)

セプトカイン配合注カートリッジ (ジーシー昭和薬品)

7. 国際誕生年月日

該当しない

８．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

製造販売承認年月日：

2015 年 8 月 17 日（1.0mL）

2014 年 2 月 14 日（1.8mL）

承認番号：

エピリド配合注歯科用カートリッジ 1.0mL：22700AMX00956000

エピリド配合注歯科用カートリッジ 1.8mL：22600AMX00376000

薬価基準収載年月日：

2025 年 6 月 12 日（1.0mL）

2014 年 6 月 20 日（1.8mL）

販売開始年月日：

2025 年 9 月 8 日（1.0mL）

2014 年 8 月 6 日（1.8mL）

９．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

１０．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

１１．再審査期間

該当しない

１２．投薬期間制限に関する情報

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。

１３．各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT（9 桁）番号	レセプト 電算処理 システム用 コード
エピリド配合注歯科用 カートリッジ 1.0mL	2710806U3024	2710806U3024	183118401	628311801
エピリド配合注歯科用 カートリッジ 1.8mL	2710806U1056	2710806U1056	183111501	628311101

14. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 日本薬局方医薬品情報 2021 : 29-31, 822-825 (JPDI)
- 2) 日本薬局方医薬品情報 2006 : 66-70, 1980-1988 (JPDI)
- 3) 第十八改正日本薬局方解説書. 2021 : C-6065-C-6069 (L20230900)
- 4) ニプロ(株)社内資料：長期保存試験・加速試験
- 5) ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性試験
- 6) Wiedling, S. : Anaesthesist.1952 ; 1(4) : 119-126 (L20220454)
- 7) Wiedling, S. : Acta Pharmacol. Toxicol.1952 ; 8 : 117-133 (L20220455)
- 8) 円谷福男：麻酔 1957 ; 6(5) : 357-366 (L20220456)
- 9) 植木昭和ほか：福岡医学雑誌 1960 ; 51(12) : 1361-1374 (L20220457)
- 10) Krantz, J.C. : J. Pharmacol. Exp. Ther.1954 ; 111 : 224-228 (L20220458)
- 11) Truant, A.P. : Arch. Int. Pharmacodyn.1958 ; 115(4) : 483-497 (L20220459)
- 12) 伊東哲ほか：日本歯科麻酔学会雑誌 1979 ; 7(2) : 212-234 (L20220449)
- 13) Burm, A.G.L. : Clin. Pharmacokinet. 1989 ; 16 : 283-311 (L20220451)
- 14) Keenaghan, J.B. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther. 1972 ; 180 : 454-463 (L20220452)
- 15) Thomson, P.D. et al. : Ann. Intern. Med. 1973 ; 78 : 499-508 (L20220453)
- 16) Nation, R.L. et al. : Br. J. Clin. Pharmacol. 1977 ; 4 : 439-448 (L20220450)

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

該当しない（本剤は外国で発売されていない）

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

該当資料なし