

# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領（1998年9月）に準拠して作成

劇薬、処方箋医薬品<sup>※</sup>

昇圧剤

## エホチール<sup>®</sup> 注 10mg

### Effortil<sup>®</sup>

エチレフリン塩酸塩製剤

注）注意-医師等の処方箋により使用すること

® = 登録商標

剤	形	注 射 剤
規 格 ・ 含 量	1 管（1mL）中エチレフリン塩酸塩 10mg 含有	
一 般 名	和 名：エチレフリン塩酸塩 洋 名：Etilefrine Hydrochloride	
製造販売承認年月日	2008年9月5日	
薬価基準収載年月日	2008年12月19日	
発売年月日	1961年7月1日	
開発・製造販売・ 発売・提携・販売会社名	製造販売：サノフィ株式会社	
医薬情報担当者の連絡先		
問 い 合 わ せ 窓 口	サノフィ株式会社 医薬品関連：くすり相談室（平日9:00～17:00） TEL:0120-109-905 FAX:(03)6301-3010 医療関係者向け製品情報サイト：サノフィ e-MR <a href="http://e-mr.sanofi.co.jp/">http://e-mr.sanofi.co.jp/</a>	

本 IF は 2019 年 7 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。

## IF 利用の手引きの概要 – 日本病院薬剤師会 –

### 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR と略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和 63 年日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成 10 年日病薬学術第 3 小委員会によって新たな位置付けと IF 記載要領が策定された。

### 2. IF とは

IF は「医療用医薬品添付文書等の情報を補完し、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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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薬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。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。

### 3. IF の様式・作成・発行

規格は A4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IF は日病薬が策定した「IF 記載要領」に従って記載するが、本 IF 記載要領は、平成 11 年 1 月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF 記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合には IF が改訂・発行される。

### 4. IF の利用にあたって

IF 策定の原点を踏まえ、MR へのインタビュー、自己調査のデータを加えて IF の内容を充実させ、IF の利用性を高めておく必要がある。

MR へのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段に IF 作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

# 目 次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の特徴及び有用性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
(1) 和名	2
(2) 洋名	2
(3) 名称の由来	2
2. 一般名	2
(1) 和名 (命名法)	2
(2) 洋名 (命名法)	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名 (命名法)	2
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	2
7. CAS 登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 有効成分の規制区分	3
2. 物理化学的性質	3
(1) 外観・性状	3
(2) 溶解性	3
(3) 吸湿性	3
(4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点	3
(5) 酸塩基解離定数	3
(6) 分配係数	3
(7) その他の主な示性値	3
3. 有効成分の各種条件下における安定性	3
4. 有効成分の確認試験法	4
5. 有効成分の定量法	4
IV. 製剤に関する項目	5
1. 剤形	5
(1) 剤形の区別, 規格及び性状	5
(2) 溶液及び溶解時の pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 安定な pH 域等	5
(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類	5

2. 製剤の組成	5
(1) 有効成分（活性成分）の含量	5
3. 製剤の各種条件下における安定性	5
4. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	6
5. 製剤中の有効成分の確認試験法	6
6. 製剤中の有効成分の定量法	6
7. 容器の材質	6
<b>V. 治療に関する項目</b>	<b>7</b>
1. 効能又は効果	7
2. 用法及び用量	7
3. 臨床成績	7
(1) 臨床効果	7
(2) 臨床薬理試験：忍容性試験	7
(3) 探索的試験：用量反応探索試験	7
(4) 検証的試験	8
(5) 治療的使用	8
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b>	<b>9</b>
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	9
2. 薬理作用	9
(1) 作用部位・作用機序	9
(2) 薬効を裏付ける試験成績	9
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b>	<b>10</b>
1. 血中濃度の推移・測定法	10
(1) 治療上有効な血中濃度	10
(2) 最高血中濃度到達時間	10
(3) 通常用量での血中濃度	10
(4) 中毒症状を発現する血中濃度	10
2. 薬物速度論的パラメータ	11
(1) 吸収速度定数	11
(2) バイオアベイラビリティ	11
(3) 消失速度定数	11
(4) クリアランス	11
(5) 分布容積	11
(6) 血漿蛋白結合率	11
3. 吸    収	11
4. 分    布	12
(1) 血液－脳関門通過性	12

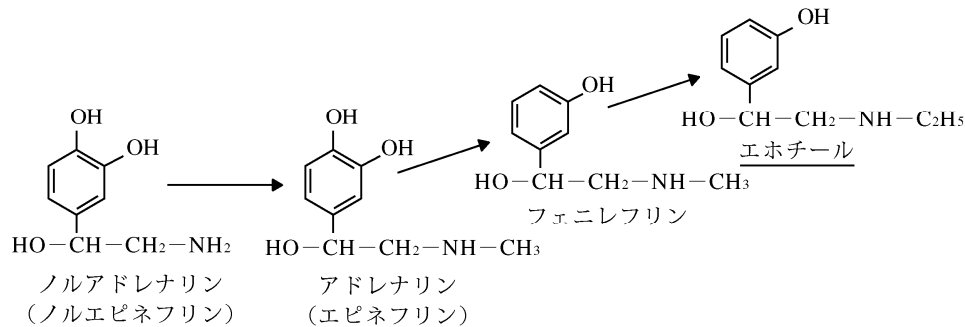
(2) 胎児への移行性	12
(3) 乳汁中への移行性	12
(4) 髄液への移行性	12
(5) その他の組織への移行性	12
5. 代 謝	12
(1) 代謝部位及び代謝経路	12
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種	12
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	12
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	12
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	12
6. 排 泄	13
(1) 排泄部位	13
(2) 排 泄 率	13
(3) 排泄速度	13
7. 透析等による除去率	13
(1) 腹膜透析	13
(2) 血液透析	13
(3) 直接血液灌流	13
<b>VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目</b>	<b>14</b>
1. 警告内容とその理由	14
2. 禁忌内容とその理由	14
3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	14
4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	14
5. 慎重投与内容とその理由	14
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15
7. 相互作用	15
(1) 併用禁忌とその理由	15
(2) 併用注意とその理由	16
8. 副 作 用	16
(1) 副作用の概要	16
(2) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	17
(3) 基礎疾患, 合併症, 重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度	17
(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	17
9. 高齢者への投与	17
10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与	17
11. 小児等への投与	17
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	18
13. 過量投与	18
14. 適用上及び薬剤交付時の注意 (患者等に留意すべき必須事項等)	18

15. その他の注意	18
16. その他	18
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	<b>19</b>
1. 一般薬理	19
2. 毒性	19
(1) 単回投与毒性試験	19
(2) 反復投与毒性試験	19
(3) 生殖発生毒性試験	19
(4) その他の特殊毒性	19
<b>X. 取扱い上の注意等に関する項目</b>	<b>20</b>
1. 有効期間又は使用期限	20
2. 貯法・保存条件	20
3. 薬剤取扱い上の注意点	20
4. 承認条件	20
5. 包装	20
6. 同一成分・同効薬	20
7. 国際誕生年月日	20
8. 製造販売承認年月日及び承認番号	20
9. 薬価基準収載年月日	21
10. 効能・効果追加，用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	21
11. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	21
12. 再審査期間	21
13. 長期投与の可否	21
14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	21
15. 保険給付上の注意	21
<b>XI. 文 献</b>	<b>22</b>
1. 引用文献	22
2. その他の参考文献	22
<b>XII. 参考資料</b>	<b>23</b>
主な外国での発売状況	23
<b>XIII. 備 考</b>	<b>24</b>
その他の関連資料	24

## I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

エホチールの主成分であるエチレフリン塩酸塩は、フェニレフリンのN-アルキル誘導体の薬理作用を系統的に研究した結果、開発された薬剤である。



国内においては、1960年12月に承認を受け、1961年7月に発売した（田辺製薬株式会社）。1979年には、第15次再評価結果が通知された。日本ベーリンガーインゲルハイム株式会社としては、1981年9月から製造販売承認を受けている。

また、「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について」（平成16年6月2日付薬食発第0602009号）による事故防止対策の観点から名称変更品（エホチール注10mg）が新たに承認され、2008年12月に薬価基準に収載された。

## 2. 製品の特徴及び有用性

本剤は交感神経刺激作用（ $\alpha$ 、 $\beta$ 刺激）により、心拍出量を増加させる。また静脈緊張度の改善により、循環血流量を増加させ、血圧を上昇させる。

## II. 名称に関する項目

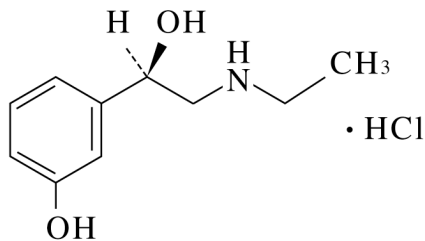
### 1. 販売名

- (1) 和 名 エホチール<sup>®</sup>注 10mg
- (2) 洋 名 Effortil<sup>®</sup> Injection 10mg
- (3) 名称の由来 Effort から来ている。血液循環を改善することに通じる。

### 2. 一般名

- (1) 和 名 (命名法) エチレフリン塩酸塩 (JAN)
- (2) 洋 名 (命名法) Etilefrine Hydrochloride (JAN)  
Etilefrine (INN)

### 3. 構造式又は示性式



及び鏡像異性体

### 4. 分子式及び分子量

$C_{10}H_{15}NO_2 \cdot HCl$  : 217.69

### 5. 化学名 (命名法)

(英 名) (1R)-2-Ethylamino-1-(3-hydroxyphenyl) ethanol monohydrochloride (IUPAC)

(日本名) (1R)-2-エチルアミノ-1-(3-ヒドロキシフェニル) エタノール塩酸塩

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

別 名 : 塩酸エチレフリン

記号番号 : MI36

### 7. CAS 登録番号

943-17-9



### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 有効成分の規制区分

劇薬

#### 2. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

水に極めて溶けやすく、エタノール（99.5）に溶けやすく、酢酸（100）にやや溶けにくい。

##### (3) 吸湿性

示さない。

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：118～122℃

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

本品の水溶液（1→20）は旋光性を示さない。

#### 3. 有効成分の各種条件下における安定性

室温に36ヵ月保存しても含量に変化なく、安定であった。

光によって徐々に黄褐色に着色する。

#### 4. 有効成分の確認試験法

- (1) 本品 5mg を薄めた塩酸（1→1000）100mLに溶かした液につき，紫外可視吸光度速度測定法<2.24>により吸収スペクトルを測定し，本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき，両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。
- (2) 本品を乾燥し，赤外吸収スペクトル測定法<2.25>の塩化カリウム錠剤法により試験を行い，本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき，両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。
- (3) 本品の水溶液（1→1000）は塩化物の定性反応（2）<1.09>を呈する。

#### 5. 有効成分の定量法

本品を乾燥し，その約 0.15g を精密に量り，酢酸（100）20mL に溶かし，無水酢酸 50mL を加え，0.1mol/L 過塩素酸で滴定<2.50>する（電位差滴定法）。同様の方法で空試験を行い，補正する。

0.1mol/L 過塩素酸 1mL=21.77mg  $C_{10}H_{15}NO_2 \cdot HCl$

## IV. 製剤に関する項目

## 1. 剤 形

(1) 剤形の区別, 規格及び性状

- ・区 別 : 溶 液
- ・規 格 : 1 管 (1mL) 中エチレフリン塩酸塩 10mg  
褐色アンプル入り注射剤
- ・性 状 : 無色注射液

(2) 溶液及び溶解時の pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 安定な pH 域等

- ・pH : 5.5~6.5
- ・浸透圧比 : 約 0.3
- ・粘 度 : 該当資料なし
- ・比 重 : 該当資料なし
- ・安定な pH 域 : 1.22~12.29

(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

酸化防止のため窒素ガス充填

## 2. 製剤の組成

(1) 有効成分 (活性成分) の含量

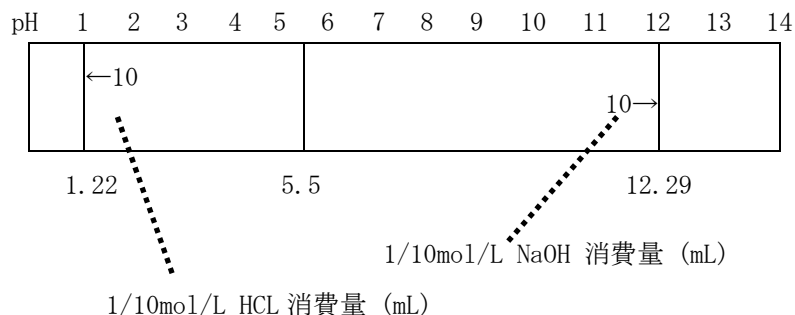
1 管 (1mL) 中エチレフリン塩酸塩 10mg 含有

## 3. 製剤の各種条件下における安定性

室温・散光 保 存	室温・室内散光下で 36 ヶ月保存する時, 諸試験において変化を認めず安定であった。 (褐色アンプル)
加 温 保 存	40° で 3 ヶ月保存する時, 諸試験において変化を認めず, 温度に対して安定であった。 (褐色アンプル, 暗所)
曝 光 保 存	キセノンランプ照射下 (褐色アンプル : 20, 40, 60 時間, 無色アンプル : 10, 20, 40 時間 : 60 時間照射は太陽光線照射 30 日に相当, 40 時間照射は 20 日に相当) に保存する時, 無色アンプル, 20 時間で微黄色に着色した以外は, 諸試験において変化を認めず安定であった。 (褐色アンプル, 無色アンプル)

## 4. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

pH 変動試験



本剤 1 管と配合注射剤 1 管又は 1 バイアルを配合し、24 時間まで pH 値を測定し、あわせて外観を肉眼的に観察した。

次の製剤との配合変化が認められた。

ホリゾン注射液，10%フェノパール，モダシン静注用

## 5. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) 本品 0.5mL に水を加えて 25mL とし、試料溶液とする。この液 1mL に新たに製した 2,6-ジブロムキノクロロイミドのエタノール溶液（1→4000）1mL 及びアンモニア試液 5 滴を加えるとき、液は青色を呈する。
- (2) (1) の試料溶液 5mL をとり、水を加えて 20mL とする。この液 5mL に *p*-ニトロベンゼンジアゾニウムフルオルボレート溶液（1→2000）2mL，pH9.2 のホウ酸・塩化カリウム・水酸化ナトリウム緩衝液 5mL 及びアセトン 5mL を加えるとき、液は赤色を呈する。
- (3) 定量法の項で得た試料溶液につき、吸光度測定法により吸収スペクトルを測定するとき、波長 271～275nm に吸収の極大を示す。
- (4) 本品は塩化物の定性反応を呈する。

## 6. 製剤中の有効成分の定量法

本品のエチレフリン塩酸塩約 0.01g に対応する用量を正確に量り、水を加えて正確に 200mL とし、試料とする。別に、定量用エチレフリン塩酸塩約 0.05g を精密に量り、水を加えて正確に 1000mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液につき、水を対照として、吸光度測定法により試験を行う。試料溶液及び標準溶液から得たそれぞれの液の波長 273nm における吸光度  $A_T$  及び  $A_S$  を測定する。

エチレフリン塩酸塩の量 (mg)

= 乾燥物に換算した定量用エチレフリン塩酸塩の量 (mg)  $\times (A_T/A_S) \times (1/5)$

## 7. 容器の材質

褐色のガラス

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

起立性低血圧，各種疾患若しくは状態に伴う急性低血圧又はショック時の補助治療

### 2. 用法及び用量

通常成人には1回0.2～1mL（エチレフリン塩酸塩として2～10mg）を皮下注射，筋肉内注射又は静脈内注射する。なお，年齢，症状により適宜増減する。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床効果

国内で実施された臨床試験の結果，承認された効能・効果に対する本剤の臨床効果が認められた。

疾患別有効率（国内文献，皮下注射，筋肉内注射又は静脈内注射）

疾患別	症例数	有効例数	有効率
本態性低血圧	10例	10例	100.0%
起立性低血圧	21	21	100.0
症候性低血圧	42	38	90.5
手術時の低血圧	796	708	88.9
循環不全	21	15	71.4
虚脱及びショック	16	16	100.0
視神経及び網膜の動脈灌流障害	5	5	100.0
合計	911	813	89.2

（1979年2月 社内集計）

#### (2) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

#### (3) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 無作為化平行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(5) 治療的使用

1) 使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験

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試験の概要

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

アドレナリン, エフェドリン

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### ・作用部位

心臓及び血管系

##### ・作用機序

本剤は $\alpha$ -、及び $\beta$ -アドレナリン受容体刺激作用を有し、内服によっても発効する。タキフィラキシー現象は認められない。心拍出量及び分時拍出量を増大させて血圧を上昇させるが、心拍数には影響しない。末梢血管抵抗を減弱してその循環を改善する<sup>1)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 動物での試験

###### ① 心筋収縮力増強作用

心筋の収縮力を増し、心拍出量及び分時拍出量を増加させる（イヌ心肺標本<sup>2, 3)</sup>）。

###### ② 血圧上昇作用

用量依存的に血圧を上昇させる（イヌ<sup>3)</sup>）。

##### 2) 臨床薬理

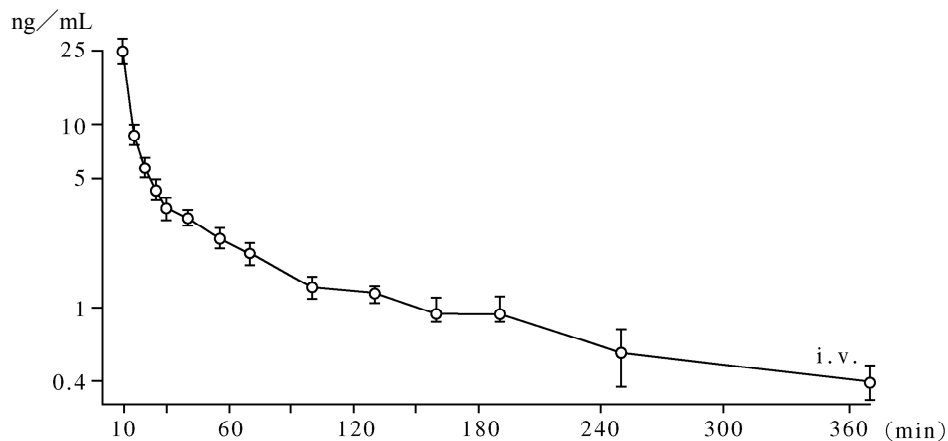
低血圧患者に皮下注射した場合、心拍出量の増加、血圧の上昇がみられる。<sup>4)</sup> 末梢血管抵抗は減少する。<sup>4)</sup>

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

健康成人にエチレフリン塩酸塩 0.75mg を静脈内投与した場合、血中濃度の半減期は約 2 時間である<sup>5)</sup>。

(参考：外国人のデータ)



ヒトに 0.75mg 静脈内投与後の遊離型エチレフリンの経時変化を示す<sup>5)</sup>

※ 本剤の承認された用法・用量は 1 回 0.2~1mL (エチレフリン塩酸塩として 2~10mg) を皮下注射, 筋肉内注射又は静脈内注射である。

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

静脈内投与時：投与直後

(3) 通常用量での血中濃度

該当資料なし

(4) 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし



## 2. 薬物速度論的パラメータ

### (1) 吸収速度定数

該当資料なし

### (2) バイオアベイラビリティ

AUC :  $965 \pm 74 \text{ ng}^{-1} \cdot \text{mL}/\text{min}$  (0.75mg 静脈内投与時, 健康成人, 外国人でのデータ<sup>5)</sup>)

### (3) 消失速度定数

$0.035 \pm 0.002 \text{ min}^{-1}$  (0.75mg 静脈内投与時, 健康成人, 外国人でのデータ<sup>5)</sup>)

### (4) クリアランス

#### 1) トータルクリアランス

$954.3 \pm 131.3 \text{ mL}/\text{min}$  (0.75mg 静脈内投与時, 健康成人, 外国人でのデータ<sup>5)</sup>)

#### 2) 腎排泄クリアランス

$150.6 \pm 9.8 \text{ mL}/\text{min}$  (0.75mg 静脈内投与時, 健康成人, 外国人でのデータ<sup>5)</sup>)

### (5) 分布容積

$158.2 \pm 14.6 \text{ L}$  (0.75mg 静脈内投与時, 健康成人, 外国人でのデータ<sup>5)</sup>)

### (6) 血漿蛋白結合率

$23 \pm 4\%$  (外国人でのデータ<sup>5)</sup>)

## 3. 吸 収

該当資料なし

#### 4. 分 布

[参 考]

静脈内投与した場合、2分で全身に分布し、心筋及び肝に大量に分布した。脳内への分布は認められなかった（ラット<sup>6)</sup>）。

(1) 血液－脳関門通過性

通過しない（ラット<sup>6)</sup>）。

(2) 胎児への移行性

該当資料なし

(3) 乳汁中への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

#### 5. 代 謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

代謝部位： 肝臓

代謝経路： 主代謝物はエチレフリンのグルクロン酸及び硫酸抱合体である（健康成人, 外国人でのデータ<sup>5)</sup>）。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当しない

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排 泄

### (1) 排泄部位

糞中及び尿中

### (2) 排 泄 率

健康成人にエチレフリン塩酸塩 0.75mg を静脈内投与した場合、24 時間で約 78% が尿中に排泄される。未変化体の尿中排泄率は約 28% である（健康成人外国人でのデータ<sup>5)</sup>）。

### (3) 排泄速度

健康成人にエチレフリン塩酸塩 0.75mg を静脈内投与した場合の尿中累積排泄率<sup>5)</sup>

2 時間後 約 41%

6 時間後 約 60%

12 時間後 約 72%

24 時間後 約 78%

## 7. 透析等による除去率

### (1) 腹膜透析

該当資料なし

### (2) 血液透析

該当資料なし

### (3) 直接血液灌流

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

**【禁忌（次の患者には投与しないこと）】**

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

理由：再度の投与により過敏症状が現れる可能性がある。

**【原則禁忌（次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること）】**

心室性頻拍のある患者

[刺激伝導系の促進により、症状を悪化させるおそれがある。]

理由：交感神経刺激による刺激伝導系の促進により症状が増強されるおそれがある。

### 3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

**慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）**

(1) 高血圧の患者

[血圧を上昇させるおそれがある。]

(2) 重篤な動脈硬化症の患者

[症状を悪化させるおそれがある。]

(3) 甲状腺機能亢進症の患者

[心悸亢進、頻脈等を悪化させるおそれがある。]

(4) 高齢者

[高齢者への投与] の項参照

(5) 心疾患のある患者

[心筋酸素消費量の増大により、症状を悪化させるおそれがある。]

(6) 徐脈のある患者

[反射性の拍動数の増加を抑制するおそれがある。]

- 理由：(1) 本剤は交感神経刺激剤であり，昇圧作用を有する。
- (2) 重篤な動脈硬化症の患者では冠動脈硬化をきたしている可能性が高く，交感神経刺激剤による心筋酸素消費量の増大は冠不全症状を増悪させるおそれがある。
- (3) 甲状腺機能亢進時ではアドレナリンなどの分泌も亢進している。このため交感神経刺激剤の投与により心悸亢進，頻脈等の交感神経興奮様症状が増強されるおそれがある。
- (4) 高齢者では脳，心臓に動脈硬化が進展しており，循環調節機能が低下している。そのため過度の血圧上昇をきたしやすい。また，腎機能なども低下しており副作用が発生しやすい。
- (5) 心疾患，特に冠動脈疾患では交感神経刺激剤による心筋酸素消費量の増大が症状を増悪させるおそれがある。
- (6) 過度の血圧上昇時では圧受容体を介した反射性の拍動数の増加を抑制するおそれがある。

## 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (1) ショックの緊急治療の原則は換気の確保，輸液及び心拍出量の増加と昇圧である。ショック時の循環動態はショックを起こした原因及び病期によって異なるので，昇圧剤の選択及び使用時期については十分注意すること。
- また，本剤は血圧下降等の応急処置剤として用いるべき薬剤であり，輸血又は輸液にかかわるものではない。
- (2) 過度の昇圧反応を起こすことがあり，急性肺水腫，不整脈，心停止等があらわれることがあるので，過量投与にならないよう注意すること。

## 7. 相互作用

- (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### (2) 併用注意とその理由

【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
ハロゲン化吸入麻酔剤 ハロタン	期外収縮，徐脈等があらわれることがある。	ハロタン等の麻酔剤は本剤に対する心筋の感受性を高めるため，不整脈がおこりやすくなる。
分娩促進剤 オキシトシン エルゴタミン	血圧の異常上昇をきたすことがあるので，その様な場合はクロルプロマジンの静注を行う。	本剤の昇圧作用と麦角アルカロイドの末梢血管収縮作用により血圧が上昇する。

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

調査症例 1,025 例（再評価結果）中副作用が報告されたのは 6 例（0.59%）であった。主な副作用は心悸亢進 4 件（0.39%），頭痛 3 件（0.29%）であった。また，臨床検査値においては特に一定の傾向を示す変動は認められていない。

#### 1) 重大な副作用と初期症状

該当しない

#### 2) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には，症状に応じて適切な処置を行うこと。

	0.1～5%未満	0.1%未満
循環器 <sup>注1)</sup>	心悸亢進，胸内苦悶，徐脈，血圧異常上昇，呼吸困難	
精神神経系	頭痛	不眠，振戦
過敏症 <sup>注2)</sup>		発疹

注 1) 徐脈は，アトロピンにより容易に回復する。

注 2) 発現した場合には，投与を中止すること。

(2) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

総 症 例 数		1,025 例	
副作用発現症例数		6 例 (0.59%)	
	副作用の種類	発現件数	発現率 (%)
循環器	心 悸 亢 進	4	0.4
	胸 内 苦 悶	※※	
	徐 脈	※※	
	血 圧 異 常 上 昇	※※	
	呼 吸 困 難	※※	
精神神経系	頭 痛	3	0.3
	不 眠	※	
	振 戦	※	
過敏症	発 疹	※※	

※ 外国報告例 (1979年2月 社内集計)

※※ 薬効群共通

(3) 基礎疾患，合併症，重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度  
該当資料なし

(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

本剤に対し過敏症の既往歴のある患者には，本剤を投与しないこと。  
(2. 禁忌内容とその理由 (14 ページ) 参照)

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与

該当しない

11. 小児等への投与

該当しない

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

特に一定の傾向を示す変動は認められていない。

13. 過量投与

症状：ときに脳内出血，肺水腫，頭痛等があらわれることがあるので，特に感受性の高い患者には注意すること。

14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

(1) 静脈内注射時

静脈内注射にあたっては，血圧の異常上昇を来さないよう慎重に投与すること。

点滴静注で大量の注射液が血管外に漏出した場合，局所の虚血性壊死があらわれることがあるので，注意すること。本剤により過度の血圧上昇を生じた場合には， $\alpha$ 遮断剤（フェントールアミン等）を使用すること。

(2) 皮下・筋肉内注射時

動物実験で充血，出血，変性等の局所障害が認められるので，皮下，筋肉内注射にあたっては，組織・神経等への影響を避けるため，下記の点に留意すること。

- 1) 神経走行部位を避けるよう注意して注射すること。
- 2) 繰り返し注射する場合には，例えば左右交互に注射するなど，注射部位を変えて行うこと。  
なお，乳幼小児には連用しないことが望ましい。
- 3) 注射針を刺入したとき，激痛を訴えたり，血液の逆流をみた場合には，直ちに針を抜き，部位を変えて注射すること。

(3) アンプルカット時

本剤は「ワンポイントカットアンプル」を使用しているので，カット部をエタノール綿等で清拭した後，ヤスリを用いず，アンプル枝部のマークの反対方向に折り取ること。

15. その他の注意

該当しない

16. その他

該当しない



## IX. 非臨床試験に関する項目

## 1. 一般薬理

呼吸数には作用しなかった（ヒト<sup>7)</sup>。

## 2. 毒 性

## (1) 単回投与毒性試験

LD<sub>50</sub> (mg/kg)<sup>8)</sup>

動物		投与経路		
		経 口	皮 下	静脈内
マウス	♂	2,250	860	20
	♀	1,240	1,180	22
ラット	♂	760	420	3
	♀	600	610	4

## (2) 反復投与毒性試験

ラットに 1, 4, 16mg/kg/日を 3~6 ヶ月間経口投与したが, 中毒症状は認められず, 病理組織学的所見でも異常は認められなかった<sup>9)</sup>。

## (3) 生殖発生毒性試験

胎児（マウス, ラット）に及ぼす影響を試験したが, 薬物に起因すると考えられる催奇形作用は認められなかった<sup>10)</sup>。

## (4) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 取扱い上の注意等に関する項目

### 1. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験の結果に基づく）

### 2. 貯法・保存条件

遮光保存

### 3. 薬剤取扱い上の注意点

処方箋医薬品

注意－医師等の処方箋により使用すること

### 4. 承認条件

該当しない

### 5. 包 装

エホチール注 10mg（1mL）：10管，50管

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：エホチール錠 5mg

同 効 薬：なし

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号

エホチール注 10mg

製造販売承認年月日：2008年9月5日

製造販売承認番号：22000AMX02008000

エホチール注射液

製造販売承認年月日：1998年12月14日

製造販売承認番号：21000AMZ00851000

製造販売承認年月日：1981年9月29日

製造販売承認番号：56AMY194

エホチール注射液（田辺製薬株式会社）

製造販売承認年月日：1960年12月3日

製造販売承認番号：阪薬第0950号

9. 薬価基準収載年月日

2008年12月19日

10. 効能・効果追加，用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

第15次再評価結果通知年月日：1979年2月2日

12. 再審査期間

該当しない

13. 長期投与の可否

厚生労働省告示第107号（平成18年3月6日付け）による投与期間の制限は設けられていない。

14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード

2119401A1057

15. 保険給付上の注意

該当しない

## XI. 文 献

### 1. 引用文献

- 1) 第十改正 日本薬局方解説書. C-382. [EFR0001]
- 2) Unna K., *et al.* : Arch Exp Pathol Pharmacol. 213 : 207-234, 1951 [EFR0002]
- 3) 橋本虎六 他 : 応用薬理 3(1) : 27-33, 1969 [EFR0003]
- 4) 斎藤十六 他 : 内科の領域 9(1) : 75-80, 1961 [EFR0004]
- 5) Hengstmann J.H., *et al.* : Eur. J. Clin. Pharmacol. 9 : 179-187, 1975 [EFR0005]
- 6) 社内資料 : 薬物動態 (ラット) [EFR-01]
- 7) 岩淵光夫 他 : 産科と婦人科 29 : 1366-1369, 1962 [EFR0006]
- 8) 社内資料 : 単回投与毒性試験 [EFR-02]
- 9) 社内資料 : 反復投与毒性試験 [EFR-03]
- 10) 社内資料 : 生殖発生毒性試験 [EFR-04]

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## XII. 参考資料

## 主な外国での発売状況

本邦における効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。

## 【効能又は効果】

起立性低血圧、各種疾患若しくは状態に伴う急性低血圧又はショック時の補助治療

## 【用法及び用量】

通常成人には1回0.2～1mL（エチレフリン塩酸塩として2～10mg）を皮下注射，筋肉内注射又は静脈内注射する。なお，年齢，症状により適宜増減する。

国名	イタリア
販売名	EFFORTIL 10 mg/ml solution for injection
剤形	注射剤
含量	エチレフリン塩酸塩 10mg
効能・効果	起立性低血圧の治療
用法・用量	1管を皮下注射，筋肉内注射又は重症な場合は静脈内注射する。必要な場合は2時間あけて1日に数回投与する。

エチレフリン塩酸塩の注射剤は，上記を含み世界10ヵ国で発売されている。（2014年9月現在）

XIII. 備 考

その他の関連資料

該当資料なし

