

※※印：2015年 2月改訂 (第5版)

※印：2014年11月改訂

日本標準商品分類番号

872219

貯 法：室温保存
 使用期限：アンプル及び外装に表示の使用期限内に使用すること。

取扱い上の注意：「**取扱い上の注意**」の項参照

※ 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)

※※	承認番号	22600AMX00055000
※※	薬価 収載	2015年6月
	販売開始	2008年7月

ベンゾジアゼピン受容体拮抗剤

※※フルマゼニル 静注液 0.5mg「TEVA」

Flumazenil I.V. Injection 0.5mg “TEVA”

フルマゼニル注射液

【禁忌 (次の患者には投与しないこと)】

- (1) 本剤及びベンゾジアゼピン系薬剤に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 長期間ベンゾジアゼピン系薬剤を投与されているてんかん患者 [痙攣が生ずることがある]

【組成・性状】

組 成	1管 (5mL) 中： フルマゼニル…………… 0.5mg (添加物) エデト酸ナトリウム水和物…………… 0.5mg 氷酢酸、等張化剤、pH調節剤
性 状	無色澄明の注射液
pH	3.0～5.0
浸透圧比	0.9～1.1 (日局生理食塩液に対する比)

【効能・効果】

ベンゾジアゼピン系薬剤による鎮静の解除及び呼吸抑制の改善

【用法・用量】

通常、初回0.2mgを緩徐に静脈内投与する。投与後4分以内に望まれる覚醒状態が得られない場合は更に0.1mgを追加投与する。

以後必要に応じて、1分間隔で0.1mgずつを総投与量1mgまで、ICU領域では2mgまで投与を繰り返す。ただし、ベンゾジアゼピン系薬剤の投与状況及び患者の状態により適宜増減する。

【用法・用量に関連する使用上の注意】

ベンゾジアゼピン系薬剤を長期間にわたり高用量投与している患者には急速に静脈内投与すると、ベンゾジアゼピン系薬剤の離脱症状が出現することがあるので、急激な投与を避け、緩徐に静脈内投与するよう注意すること。

なお、離脱症状があらわれた場合はベンゾジアゼピン系薬剤を緩徐に静脈内投与するなど適切な処置を行うこと。

【使用上の注意】

1. 慎重投与 (次の患者には慎重に投与すること)

- (1) 手術前あるいは鎮静される前の不安の程度が高い患者、特に冠動脈疾患を有する患者 [早期に覚醒させるよりもある程度鎮静状態を保つほうが良い場合が多いので、このような患者に本剤を投与する場合は、少量より投与を開始し、患者個々に必要量を投与するよう注意すること]
- (2) ICU領域における高血圧を有する患者 [覚醒時に血圧上昇がみられることがあるので、このような患者に本剤を投与する場合は、少量より投与を開始し、患者個々に必要量を投与するよう注意すること]
- (3) ベンゾジアゼピン系薬剤を投与されている重症頭部外傷患者又は不安定な頭蓋内圧を有する患者 [ベンゾジアゼピン系薬剤の解除に伴い、頭蓋内圧亢進が起こることがある]
- (4) ベンゾジアゼピン系薬剤と三(四)環系抗うつ剤を服用している患者 [ベンゾジアゼピン系薬剤の作用低下に伴い、抗うつ剤の中毒症状 (自律神経系症状等) が顕在化することがある]
- (5) 高齢者 (「**高齢者への投与**」の項参照)

- (6) 肝機能障害を有する患者 [ベンゾジアゼピン系薬剤の作用消失時間の延長が考えられるため、覚醒後も患者の状態を十分に観察し、慎重に投与すること]

2. 重要な基本的注意

- (1) ベンゾジアゼピン系薬剤によっては**消失半減期が本剤の半減期 (約50分) より長いもの**があり、これらの薬剤を特に高用量投与していた場合は本剤投与により患者が覚醒した後もベンゾジアゼピン系薬剤の作用が**再出現する可能性**があるので**患者を監視下におき十分注意**すること。
また、本剤投与後24時間は危険な機械の操作や自動車の運転等**完全な精神的緊張を必要とする仕事に従事させないように注意**すること。

(2) **本剤投与の対象**は、手術又は検査時にベンゾジアゼピン系薬剤で鎮静された患者で**覚醒遅延又は呼吸抑制が認められた場合**、ベンゾジアゼピン系薬剤を高用量あるいは長期にわたり投与された患者で**過度の鎮静状態**を生じたり必要以上に**鎮静状態が持続**した場合、又は大量にベンゾジアゼピン系薬剤を服薬した**中毒患者**とする。

なお、**侵襲の大きい手術を受けた患者、精神的不安の程度が高い患者**は早期に覚醒させるよりある程度鎮静状態を維持する方が望ましい場合があるので、患者の状態を考慮し、**覚醒させることが必要と判断される場合のみ本剤を投与**すること。

- (3) 麻酔科領域において手術終了時に本剤を使用する場合は、**筋弛緩剤の作用消失後に本剤を投与**すること。

- (4) 本剤を用法・用量の範囲内で繰り返し投与しても**意識及び呼吸機能に有意な改善がみられない場合はベンゾジアゼピン作用薬以外の原因**を考慮すること。

3. 相互作用

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
ベンゾジアゼピン系薬剤 三(四)環系抗うつ剤	自殺企図等故意にベンゾジアゼピン系薬剤を過量服薬した患者で、同時に三(四)環系抗うつ剤を服用している場合は、ベンゾジアゼピン系薬剤の作用低下に伴い三(四)環系抗うつ剤の中毒作用が増強するため、このような患者には特に注意して投与すること。	本剤はGABA受容体、ベンゾジアゼピン受容体及びグロルタミン受容体の複合体と結合し、ベンゾジアゼピン系薬剤の作用を低下させ、三(四)環系抗うつ剤の中毒作用が増強すると考えられている。

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

※(1) 重大な副作用 (頻度不明)

ショック、アナフィラキシー ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので観察を十分に行い、蕁麻疹、顔面蒼白、血圧低下、呼吸困難、嘔気等の症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

	頻度不明
精神神経系	頭痛、興奮、不穏、幻覚、不安感、体動、痙攣
血液	白血球減少
循環器	血圧上昇、頻脈、徐脈
呼吸器	咳、咽頭異和感
消化器	嘔気、嘔吐、胸部不快感
肝臓	AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、血清ビリルビン上昇、AL-P 上昇
腎臓	クレアチニン上昇
その他	羞明、過換気

5. 高齢者への投与

投与に際しては患者の状態を十分に観察し、慎重に投与すること。[高齢者はベンゾジアゼピン系薬剤の作用に対し感受性が高い]

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) **妊婦等**：妊婦又は妊娠している可能性のある婦人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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない]
- (2) **授乳婦**：投与中は授乳を避けさせること。[動物実験で乳汁中へ移行することが報告されている]

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

8. 適用上の注意

アンプルカット時：アンプルカット部分をエタノール綿等で清拭してから、ヤスリを用いないで、アンプル頭部のマークの反対方向に折ること。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：フルマゼニル (Flumazenil)

化学名：Ethyl 8-fluoro-5,6-dihydro-5-methyl-6-oxo-4H-imidazo[1,5-a][1,4]benzodiazepine-3-carboxylate

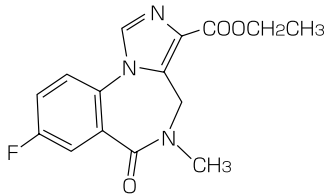
分子式：C₁₅H₁₄FN₃O₃

分子量：303.29

融点：198～202℃

性状：フルマゼニルは白色の結晶性の粉末で、においはないか又はわずかに特異なにおいがある。酢酸(100)、クロロホルム又はジクロロメタンに溶けやすく、1mol/L塩酸試液にやや溶けやすく、エタノール(95)又はメタノールにやや溶けにくく、エタノール(99.5)に溶けにくく、水又はジエチルエーテルに極めて溶けにくい。

構造式：



【取扱い上の注意】¹⁾

安定性試験結果の概要

加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、フルマゼニル静注液0.5mg「テバ」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

【包装】

フルマゼニル静注液0.5mg「テバ」(1管5mL中0.5mg) 5管

【主要文献】

1) テバ製薬(株)社内資料(安定性試験)

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。
テバ製薬株式会社 DIセンター
〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号
TEL 0120-923-093 FAX 052-459-2853
受付時間 9:00～17:00(土・日・祝日を除く)

製造販売元

テバ製薬株式会社

名古屋市中村区太閤一丁目24番11号

BT5B70