

承認番号	21800AMZ10121000
薬価収載	2006年7月
販売開始	2006年7月

貯 法：室温保存

使用期限：3年（ラベル等に表示の使用期限を参照すること。）

注 意：取扱い上の注意の項参照

ベンゾジアゼピン受容体拮抗剤

劇薬・処方箋医薬品^(注)

フルマゼニル注射液 0.5mg 「F」

フルマゼニル注射液

FLUMAZENIL Injection

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

【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 [けいれんが生ずることがある。]

【組成・性状】

販売名	フルマゼニル注射液0.5mg 「F」
有効成分	フルマゼニル
含量	0.5mg
容量	5mL
添加物	エデト酸ナトリウム水和物 0.5mg 氷酢酸 塩化ナトリウム（等張化剤） pH調整剤
pH	3.0～5.0
浸透圧比 （生理食塩液に対する比）	約1
色調・性状	無色澄明の水溶性注射液
剤形	注射剤（アンプル）

【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】（改訂箇所：____）

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（「5. 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も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**に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クロルチャンネルの複合体と結合し、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、けいれん
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、AI-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：本品はワンポイントカットアンプルであるが、アンプルのカット部分をエタノール綿等で清拭してからカットすることが望ましい。

【有効成分に関する理化学的知見】

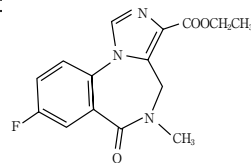
一般名：フルマゼニル（Flumazenil）

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

構造式：



性状：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、1 mol/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。

融点：198～202℃

**【取扱い上の注意】

安定性試験

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温、なりゆき湿度、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、フルマゼニル注射液0.5mg「F」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。¹⁾

【包装】

5mL×5アンプル

【主要文献】

1) 富士製薬工業株式会社 社内資料（安定性試験）

*【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。
丸石製薬株式会社 学術情報グループ
〒538-0042 大阪市鶴見区今津中2-4-2
TEL. 0120-014-561

発売元

丸石製薬株式会社

大阪市鶴見区今津中2-4-2

製造販売元

富士製薬工業株式会社

富山県富山市水橋辻ヶ堂1515番地