

# 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2013に準拠して作成

## 催眠鎮静剤

### 注射用アイオナル<sup>®</sup>・ナトリウム(0.2)

### IONAL<sup>®</sup> SODIUM FOR INJECTION

剤形	注射剤
製剤の規制区分	劇薬，向精神薬，習慣性医薬品（注意 - 習慣性あり）， 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	1バイアル中セコバルビタールナトリウム 200mg 含有
一般名	和名：セコバルビタールナトリウム 洋名：Secobarbital Sodium
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	承認年月日：1961年 9月 29日 薬価基準収載：2006年 7月 7日 発売年月日：2005年 6月 1日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>

本IFは2019年3月改訂（第7版）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、医薬品医療機器総合機構ホームページ  
<http://www.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

## 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

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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（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）の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、（独）医薬品医療機器総合機構のホームページ（<http://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公式サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

### 2. IFとは

IFは「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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの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。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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の様式]

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

#### [IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」（以下、「IF記載要領2013」と略す）により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

## **【IFの発行】**

- ①「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

### **3. IFの利用にあたって**

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	1	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	9
1. 開発の経緯 .....	1	1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群 .....	9
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1	2. 薬理作用 .....	9
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	2	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	10
1. 販売名 .....	2	1. 血中濃度の推移・測定法 .....	10
2. 一般名 .....	2	2. 薬物速度論的パラメータ .....	10
3. 構造式又は示性式 .....	2	3. 吸収 .....	11
4. 分子式及び分子量 .....	2	4. 分布 .....	11
5. 化学名（命名法） .....	2	5. 代謝 .....	11
6. 慣用名，別名，略号，記号番号 .....	2	6. 排泄 .....	12
7. CAS 登録番号 .....	2	7. トランスポーターに関する情報 .....	12
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	3	8. 透析等による除去率 .....	12
1. 物理化学的性質 .....	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	13
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	3	1. 警告内容とその理由 .....	13
3. 有効成分の確認試験法 .....	3	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） .....	13
4. 有効成分の定量法 .....	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 .....	13
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	4	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 .....	13
1. 剤形 .....	4	5. 慎重投与内容とその理由 .....	13
2. 製剤の組成 .....	4	6. 重要な基本的注意 .....	13
3. 注射剤の調製法 .....	4	7. 相互作用 .....	14
4. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 .....	4	8. 副作用 .....	14
5. 製剤の各種条件下における安定性 .....	5	9. 高齢者への投与 .....	16
6. 溶解後の安定性 .....	5	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 .....	16
7. 他剤との配合変化 .....	6	11. 小児等への投与 .....	16
8. 生物学的試験法 .....	6	12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	16
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	7	13. 過量投与 .....	16
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	7	14. 適用上の注意 .....	17
11. 力価 .....	7	15. その他の注意 .....	17
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	7	16. その他 .....	17
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 .....	7	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	18
14. その他 .....	7	1. 薬理試験 .....	18
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	8	2. 毒性試験 .....	18
1. 効能又は効果 .....	8	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	19
2. 用法及び用量 .....	8	1. 規制区分 .....	19
3. 臨床成績 .....	8		

2. 有効期間又は使用期限	19
3. 貯法・保存条件	19
4. 薬剤取扱い上の注意点	19
5. 承認条件等	19
6. 包装	19
7. 容器の材質	19
8. 同一成分・同効薬	19
9. 国際誕生年月日	19
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	19
11. 薬価基準収載年月日	19
12. 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	19
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	19
14. 再審査期間	20
15. 投与期間制限医薬品に関する情報	20
16. 各種コード	20
17. 保険給付上の注意	20
<b>X I. 文献</b>	<b>21</b>
1. 引用文献	21
2. その他の参考文献	21
<b>X II. 参考資料</b>	<b>21</b>
1. 主な外国での発売状況	21
2. 海外における臨床支援情報	21
<b>X III. 備考</b>	<b>21</b>

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

Secobarbital は 1938 年 Waters によってその経口投与が、また 1948 年 Stoelting によって静注が試みられた。

再評価（薬効の再評価）の結果、1995 年 9 月、薬事法第 14 条第 2 項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないとの再評価結果を得た。

日医工株式会社は、2004 年 10 月 5 日、セコバルビタールナトリウム製剤である注射用アイオナル・ナトリウム(0.2)を三菱ウェルファーマ株式会社（現：田辺三菱製薬株式会社）より承継し、2005 年 6 月 1 日から販売を開始した。

その後、粉末充填アンプルから凍結乾燥バイアルに剤型変更を行い、2006 年 7 月 7 日に薬価収載され、販売を開始した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、セコバルビタールナトリウムを含有する催眠鎮静剤である。
- (2) Secobarbital は短時間作用性のバルビツレートである。
- (3) 医療事故防止に配慮し、バイアルのラベルを二層ラベルにしている。
- (4) 総症例数 945 例中 73 件（7.72%）の副作用が報告されている。主な副作用は眠気 10 件（1.06%）、頭重感 8 件（0.85%）、脈拍異常 4 件（0.42%）等であった。（再評価結果）  
重大な副作用として、皮膚粘膜眼症候群（Stevens - Johnson 症候群）（頻度不明）、チアノーゼ、呼吸抑制（0.1～5%未満）、薬物依存（頻度不明）が報告されている。  
（「Ⅷ - 8.副作用」の項参照）

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

注射用アイオナール®・ナトリウム(0.2)

#### (2) 洋名

IONAL® SODIUM FOR INJECTION

#### (3) 名称の由来

特になし

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

セコバルビタールナトリウム (JAN)

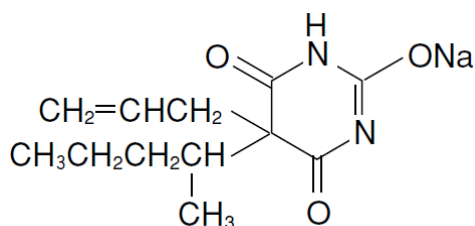
#### (2) 洋名 (命名法)

Secobarbital Sodium (JAN)

#### (3) ステム

バルビツール酸系催眠薬：(-)barb-

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>12</sub>H<sub>17</sub>N<sub>2</sub>NaO<sub>3</sub>

分子量：260.26

### 5. 化学名 (命名法)

Sodium 5-allyl-5-(1-methylbutyl)barbiturate (IUPAC)

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

別名：Quinalbarbitone Sodium (BP)

### 7. CAS 登録番号

309-43-3 (Secobarbital Sodium)

76-73-3 (Secobarbital)

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 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、においはない。

##### (2) 溶解性

水に極めて溶けやすく、エタノール (95) に溶けやすく、ジエチルエーテル又はクロロホルムにほとんど溶けない。

##### (3) 吸湿性

本品は吸湿性である。

##### (4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点

セコバルビタールの融点: 100°C

##### (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→10) の pH は 9.7~11.0 である。

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

- (1) 融点測定法: 本品に水を加えて溶かし、希酢酸を加えた後、更に水を加え、加熱して溶かす。この液を放冷し、濁り始めたとき、セコバルビタールの結晶粒を加えて一夜放置する。析出した結晶をろ取り乾燥するとき、その融点は 96~100°C である。
- (2) リトマス試験紙反応: 本品に水酸化ナトリウム試液を加えて煮沸するとき、発生するガスは潤した赤色リトマス紙を青変する。
- (3) 呈色反応: 本品にアンモニア・塩化アンモニウム緩衝液及び薄めたピリジンを加えて溶かし、クロロホルム及び硫酸銅 (II) 試液を加えるとき、水槽に青紫色の沈殿を生じ、振り混ぜるとき、クロロホルム層は紫色を呈する。
- (4) 融点測定法: 本品に無水炭酸ナトリウム及び水を加えて振り混ぜ、*p*-ニトロ塩化ベンジルをエタノールに溶かした液を加え還流冷却器を付け加熱した後、放置し析出した結晶をろ取り、水酸化ナトリウム試液及び水で洗い、エタノールから再結晶し乾燥するとき、その融点は 156~161°C である。
- (5) 呈色反応: 本品に水を加えて溶かし、過マンガン酸カリウム試液を加えるとき、試液の赤色は直ちに消える。
- (6) 定性反応: 本品の水溶液はナトリウム塩の定性反応(1)を呈する。

#### 4. 有効成分の定量法

滴定法: 本品を水で溶かし、エタノール、希塩酸を加えクロロホルムで抽出し、エタノールを加え、水酸化カリウム・エタノール液で滴定する。



#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別, 外観及び性状

剤形：用時溶解して用いる注射剤

性状：白色の粉末又は塊

###### (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	9.7～11.0 (5%水溶液)
浸透圧比(生理食塩液に対する比)	1.2～ 1.4 (5%水溶液)

###### (3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

窒素置換

##### 2. 製剤の組成

###### (1) 有効成分(活性成分)の含量

1 バイアル中セコバルビタールナトリウム 200mg を含有する。

###### (2) 添加物

添加物なし

###### (3) 電解質の濃度

1 バイアル中にナトリウム 17.67mg (0.768mEq) を含有する。

###### (4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

###### (5) その他

該当しない

##### 3. 注射剤の調製法

###### 【用法・用量】

通常、成人にはセコバルビタールナトリウムとして、1回 100～200mg (5%溶液<sup>\*</sup>2～4mL) を徐々に静脈内注射するか、または筋肉内注射する。

なお、年齢、症状により適宜増減するが、総量 500mg (5%溶液<sup>\*</sup>10mL) を超えないことが望ましい。

※5%溶液；本品 1 バイアルを注射用水等 4mL に溶解

##### 4. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

## 5. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

本品につき加速試験（40℃，75%RH，6 ヶ月）を行った結果，注射用イオナール・ナトリウム(0.2)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。

◇加速試験（40℃，75%RH）〔最終包装形態（バイアル包装）〕

測定項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <白色の粉末又は塊>	ED2400	適合	適合	適合	適合
確認試験 (赤外吸収スペクトル，定性反応)	ED2400	適合	適合	適合	適合
pH <9.7~11.0>	ED2400	10.4	10.5	10.8	10.3
浸透圧比 <1.2~1.4>	ED2400	1.2	—	—	1.3
純度試験（溶状） <液は無色澄明>	ED2400	適合	適合	適合	適合
純度試験（中性，塩基性物質） <0.30%以下>	ED2400	適合	適合	適合	適合
乾燥減量 <3.0%以下>	ED2400	0.5	0.9	0.6	0.9
含量（%）* <95~105%>	ED2400	103.0	102.1	100.6	101.8

※：表示量に対する含有率（%）

その他，不溶性異物，不溶性微粒子，質量偏差，エンドトキシン及び無菌試験を実施し，適合していることを確認した。

## 6. 溶解後の安定性<sup>2)</sup>

(1) 注射用イオナール・ナトリウム(0.2) 1 瓶を注射用水（4mL）に溶解後の安定性

ロット番号：CO2800

試験報告日：2006年7月31日

保存 条件	項目	溶解後の経過時間			
		溶解直後	6 時間後	24 時間後	
密 栓	冷蔵 庫	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	10.22	10.22	10.22
		定量値(%)	100.0	99.8	99.5
		浸透圧比	1.29	1.30	1.35
		T L C	1 スポット	—	1 スポット
	室内 散光 下	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	10.22	10.20	10.20
		定量値(%)	100.0	100.9	99.4
		浸透圧比	1.29	1.36	1.33
		T L C	1 スポット	—	1 スポット
開 放	冷蔵 庫	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	10.22	10.08	9.84
		定量値(%)	100.0	100.5	99.7
		浸透圧比	1.29	1.29	1.34
		T L C	1 スポット	—	1 スポット
	室内 散光 下	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	10.22	9.94	9.64
		定量値(%)	100.0	98.4	99.1
		浸透圧比	1.29	1.31	1.36
		T L C	1 スポット	—	1 スポット

(2) 注射用イオナール・ナトリウム(0.2) 1瓶を生理食塩液及び5%ブドウ糖に溶解後の安定性

ロット番号：CO2800

保存条件	溶解液	項目	溶解後の経過時間			
			溶解直後	3時間後	6時間後	24時間後
室内 密栓 散光下	生理食塩液 (4mL)	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	10.19	10.20	10.25	10.23
	5%ブドウ糖 (4mL)	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	9.96	9.99	9.98	9.96
室内 開放 散光下	生理食塩液 (4mL)	定量値(%)	100	99.8	99.4	100.1
		外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
	pH	10.17	10.02	9.90	9.56	
	定量値(%)	100	99.7	100.0	103.4	
	5%ブドウ糖 (4mL)	外観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	9.95	9.87	9.78	9.52
	定量値(%)	100	100.0	99.9	100.0	

※保存条件：26.5℃，46%RH

## 7. 他剤との配合変化<sup>3)</sup>

### 本資料の情報に関する注意

本資料には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、可否を示すものではない。

試験実施日：2006年7月3日

### pH変動試験

1瓶を注射用水 4mLに溶解し、試料とした。

試料 pH	0.1mol/L HCl(A)mL 0.1mol/L NaOH(B)mL	最終 pH 又は 変化点 pH	移動指数	変化所見
10.22	(A)0.60mL	9.11	1.11	白色の結晶析出
	(B)10.0mL	12.61	2.39	—

pH 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 11 12 13 14

白色の結晶析出	←①	②→
---------	----	----

9.11 10.22 12.61

①0.1 mol/L HCl 消費量 0.60mL      ②0.1 mol/L NaOH 消費量 10.0mL

## 8. 生物学的試験法

該当しない

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

### (1) 赤外吸収スペクトル測定法

本品につき臭化カリウム錠剤法により測定するとき、波数  $3217\text{cm}^{-1}$ ,  $1560\text{cm}^{-1}$ ,  $1439\text{cm}^{-1}$ ,  $1339\text{cm}^{-1}$  及び  $996\text{cm}^{-1}$  付近に吸収を認める。

### (2) 定性反応

本品の水溶液はナトリウム塩の定性反応(1)を呈する。

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：リン酸塩緩衝液，アセトニトリル混液

## 11. 力価

該当しない

## 12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

## 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

## 14. その他

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

不眠症，麻酔前投薬，全身麻酔の導入，不安緊張状態の鎮静

### 2. 用法及び用量

通常，成人にはセコバルビタールナトリウムとして，1回 100～200mg（5%溶液<sup>※</sup>2～4mL）を徐々に静脈内注射するか，または筋肉内注射する。

なお，年齢，症状により適宜増減するが，総量 500mg（5%溶液<sup>※</sup>10mL）を超えないことが望ましい。

※5%溶液；本品 1 バイアルを注射用水等 4mL に溶解

### 3. 臨床成績

#### （1）臨床データパッケージ

該当資料なし

#### （2）臨床効果

該当資料なし

#### （3）臨床薬理試験

該当資料なし

#### （4）探索的試験

該当資料なし

#### （5）検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

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

#### （6）治療的使用

##### 1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（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

該当しない

## VI. 薬効薬理に関する項目

### 1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

バルビツレート

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

血液に入ったバルビツレートは、脳において急速に麻酔作用をあらわす。

麻酔深度は脳内のバルビツレート濃度に比例する。すなわち、少量であっても急速に静注すると深麻酔に陥る。中枢の抑制は麻酔深度に比例するので、注射速度を緩徐にすることが望ましい。ただし、あまり緩徐にすぎると、適当な麻酔深度に達するのに大量を要し、覚醒が遷延する結果になる。<sup>4)</sup>

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

セコバルビタールナトリウムは鎮静催眠作用を示すバルビタール系薬剤であり、作用持続時間からみるとチアミラール等の超短時間作用性バルビツレートとアモバルビタール等の中時間作用性バルビツレートとの間に位する。

静脈内投与時の麻酔持続時間<sup>5)</sup>

薬剤 (投与量)	使用動物	ウサギ
セコバルビタールナトリウム(20mg/kg)		69 分
アモバルビタールナトリウム(40mg/kg)		90 分
チアミラールナトリウム(20mg/kg)		18 分 22 秒

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

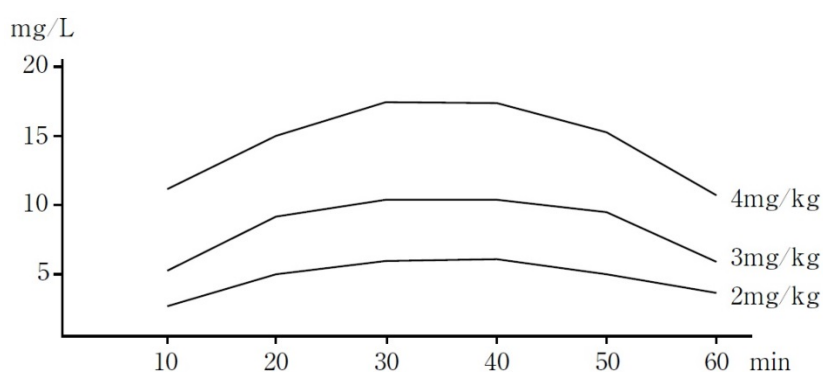
#### (2) 最高血中濃度到達時間

(「臨床試験で確認された血中濃度」の項参照)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

成人患者の麻酔前投薬としてセコバルビタールナトリウム 2, 3, 4mg/kg を上腕筋肉内に投与した結果, 各々 30~40 分後に最高血中濃度 5.8mg/L, 10.3mg/L, 17.6mg/L を示した。また 60 分後には各々 3.1mg/L, 5.4mg/L, 10.2mg/L と低下した (各群 15 例)。<sup>6)</sup>

図 セコバルビタールナトリウム筋注投与後の血中濃度の時間変動



#### (4) 中毒域

該当資料なし

#### (5) 食事・併用薬の影響

(「VIII - 7.相互作用」の項参照)

#### (6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

#### (4) 消失速度定数

該当資料なし

#### (5) クリアランス

該当資料なし

#### (6) 分布容積

該当資料なし

### (7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

## 3. 吸収

血液に入ったバルビツレートは、脳において急速に麻酔作用をあらわす。<sup>4)</sup>

## 4. 分布

### (1) 血液-脳関門通過性

通過する。

### (2) 血液-胎盤関門通過性

通過する。バルビツレートを出産中またはその前に服用していると、生まれた子供はうとうと状態で、離脱症状が発現することも認められている。<sup>7)</sup>

### (3) 乳汁への移行性

バルビツレートは母乳中にも排泄される。<sup>7)</sup>

### (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

<参考><sup>4)</sup>

血液中のバルビツレートは徐々に肝、腎などの臓器中に移行し、ついで脂肪組織などの濃度が上昇してくる。

## 5. 代謝

<参考><sup>8)</sup>

家兎にセコバルビタールを経口投与した場合の尿中排泄物から、次の4つが確認された。

- ・ Secobarbital carboxylic acid
- ・ Hydroxy Secobarbital
- ・ Secobarbital
- ・ ring-destroyed metabolite

### (1) 代謝部位及び代謝経路

代謝部位：肝臓

代謝経路：該当資料なし

### (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

該当資料なし

### (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) 排泄部位及び経路

腎からの排泄はごく微量である。<sup>4)</sup>

### (2) 排泄率

該当資料なし

### (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 8. 透析等による除去率

(「VIII - 13.過量投与」の項参照)

## 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

該当記載事項なし

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

#### 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (1) バルビツール酸系化合物に対し過敏症の患者
- (2) 急性間歇性ポルフィリン症の患者 [酵素誘導によりポルフィリン合成を促進し、症状を悪化させるおそれがある。]

#### 【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）】

- (1) 心障害を有する患者 [バルビツール酸系化合物を大量投与した場合、血管拡張作用、心拍出量の減少が知られており、血圧下降が増強されるおそれがある。]
- (2) 肝障害、腎障害を有する患者 [代謝・排泄の遅延により副作用発現のおそれがある。]
- (3) 呼吸機能の低下している患者 [呼吸中枢抑制作用により、症状を悪化させるおそれがある。]
- (4) 薬物過敏症の患者

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び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) 幼児，小児，虚弱者 [呼吸抑制を起こすことがある。]
- (2) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照） [呼吸抑制を起こすことがある。]
- (3) 頭部外傷後遺症又は進行した動脈硬化症等の脳の器質障害のある患者 [中枢作用が増強されるおそれがある。]

### 6. 重要な基本的注意

- (1) 本剤投与中の患者には、**自動車の運転等、危険を伴う機械の操作**に従事させないよう注意すること。
- (2) 連用により薬物依存を生じることがあるので、漫然とした継続投与による長期使用を避けること。本剤の投与を継続する場合には、治療上の必要性を十分に検討すること（「重大な副作用」の項参照）。

## 7. 相互作用

### (1) 併用禁忌とその理由

該当記載事項なし

### (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
アルコール 抗不安薬 抗精神病薬 催眠鎮静薬 抗うつ薬 抗ヒスタミン薬 抗パーキンソン薬 解熱鎮痛薬	相互に作用が増強されることがあるので、減量するなど慎重に投与すること。	相加的に中枢神経抑制作用が増強される。
チアジド系薬物	起立性低血圧が増強されることがあるので、減量するなど慎重に投与すること。	相互に作用が増強される。
クラレ様物質	相加的な筋弛緩作用が起こることがあるので、減量するなど慎重に投与すること。	相互に作用が増強される。
ジスルフィラム	中枢神経抑制作用が増強されることがあるので、減量するなど慎重に投与すること。	ジスルフィラムは肝ミクロゾームの薬物代謝酵素系を抑制するため、バルビツール酸系薬剤の代謝が阻害される。
クマリン系抗凝血薬	クマリン系抗凝血薬の作用に影響を与えるので、通常より頻回にプロトロンビン値の測定を行い、クマリン系抗凝血薬の用量を調節すること。	バルビツール酸系薬剤は肝の代謝酵素を誘導し、クマリン系抗凝血薬の代謝を促進させる。
ドキシサイクリン	ドキシサイクリンの血中濃度半減期が短縮することがある。	バルビツール酸系薬剤は肝の代謝酵素を誘導し、ドキシサイクリンの代謝を促進させる。

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

総症例数 945 例中 73 件（7.72%）の副作用が報告されている。主な副作用は眠気 10 件（1.06%）、頭重感 8 件（0.85%）、脈拍異常 4 件（0.42%）等であった。（再評価結果）

### (2) 重大な副作用と初期症状

#### 1) 皮膚粘膜眼症候群（Stevens - Johnson症候群）（頻度不明）

皮膚粘膜眼症候群(Stevens - Johnson症候群)（発熱、皮膚・粘膜の発疹又は紅斑、壊死性結膜炎等の症候群）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、投与を中止すること。

#### 2) チアノーゼ、呼吸抑制（0.1～5%未満）

チアノーゼ、呼吸抑制があらわれることがあるので、観察を十分に行い注意すること。

続き

3) **薬物依存** (頻度不明)

連用により薬物依存を生じることがあるので、観察を十分に行い、用量及び使用期間に注意し慎重に投与すること。特にアルコール中毒、薬物依存の傾向又は既往歴のある患者、重篤な神経症患者に対しては注意すること。また、連用中における投与量の急激な減少ないし投与の中止により、不安、不眠、痙攣、悪心、幻覚、妄想、興奮、錯乱又は抑うつ状態等の離脱症状があらわれることがあるので、投与を中止する場合には徐々に減量するなど、慎重に行うこと。なお、高齢者、虚弱者の場合は特に注意すること。

(3) **その他の副作用**

	0.1~5%未満	頻度不明
<b>過 敏 症</b> <sup>注1)</sup>	発疹等	
<b>精神神経系</b> <sup>注2)</sup>		知覚異常、構音障害、精神機能低下、せん妄、昏迷又は運動失調
<b>腎 臓</b> <sup>注3)</sup>		ヘマトポルフィリン尿、蛋白尿、低カルシウム血症
<b>血 液</b> <sup>注3)</sup>		巨赤芽球性貧血
<b>消 化 器</b>	悪心・嘔吐	
<b>そ の 他</b>	眠気、頭重感、めまい、脈拍異常、興奮、腱反射亢進、痙攣、口渇	

注1) このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

注2) 連用により、このような症状があらわれた場合には、減量するなど適切な処置を行うこと。

注3) 連用に際しては注意すること。

(4) **項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧**

調査症例数：945 例 (再評価結果)

副作用の種類		発現件数	%
過敏症	発疹	1	0.11
消化器	悪心・嘔吐	4	0.42
その他	呼吸抑制	3	0.32
	チアノーゼ	12	1.27
	眠気	10	1.06
	頭重感	8	0.85
	めまい	3	0.32
	脈拍異常	4	0.42
	興奮	1	0.11
	腱反射亢進	1	0.11
	痙攣	3	0.32
	口渇	1	0.11
	血圧下降	3	0.32
	見当識障害	1	0.11
	硬結	10	1.06
注射時痛	8	0.85	

(5) **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

## (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

- 1) **禁忌**：バルビツール酸系化合物に対し過敏症の患者には投与しないこと。
- 2) **原則禁忌**：薬物過敏症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。
- 3) **重大な副作用**：皮膚粘膜眼症候群(Stevens - Johnson症候群) (発熱，皮膚・粘膜の発疹又は紅斑，壊死性結膜炎等の症候群) 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，投与を中止すること。
- 4) **その他の副作用**：過敏症（発疹等）の症状があらわれた場合には投与を中止すること。

## 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

- (1) 妊婦に投与する場合には慎重に投与すること。[妊娠中に投与すると，新生児の出血傾向，呼吸抑制等を起こすことがある。]
- (2) 分娩前に連用した場合，出産後新生児に離脱症状（多動，振戦，反射亢進，過緊張など）があらわれることがある。

## 11. 小児等への投与

小児では，呼吸抑制が起こることがあるので，慎重に投与すること。（「慎重投与」の項参照）

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当記載事項なし

## 13. 過量投与

- (1) **症状**：バルビツレート急性中毒症状としては，中枢神経系及び呼吸器系の抑制があり，チェーン・ストークス呼吸，瞳孔縮小（重度な中毒時には麻痺性の拡張），乏尿，頻脈，低血圧，体温低下，昏睡等の症状があらわれるおそれがある。
- (2) **処置**：呼吸，循環，バイタルサインのチェック等の全身管理を実施する。  
血液透析，血液灌流が有効であったとの報告もある。

## 14. 適用上の注意

### (1) 投与時

#### 1) 皮下には決して投与しないこと。

2) 本剤は高アルカリ性であるため、皮下への漏出により壊死を起こすことがあるので皮下に漏出させないように注意すること。

3) 皮下に漏れた場合はプロカイン注射液等の局所麻酔剤による浸潤、温湿布等の適切な処置を行うこと。

4) 呼吸抑制、血圧降下があらわれることがあるので、注射方法については十分注意し、静脈内投与においては注射速度をできるだけ遅くすること。

### (2) 筋肉内注射時

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、下記の点に注意すること。

1) 筋肉内投与はやむを得ない場合にのみ必要最小限に行うこと。なお、特に同一部位への反復注射は行わないこと。また新生児、低出生体重児、乳児、小児には注意すること。

2) 神経走行部位を避けるよう注意すること。

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は、直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。

### (3) バイアル穿刺時

注射針はゴム栓の中心円内に垂直に穿刺すること。注射針をゴム栓の中心を外れて穿刺したり、斜めに穿刺するとゴム栓が削られゴム片がバイアル内に落下する原因になるので注意すること。

## 15. その他の注意

該当記載事項なし

## 16. その他

該当記載事項なし

## 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) 副次的薬理試験

該当資料なし

#### (3) 安全性薬理試験

該当資料なし

#### (4) その他の薬理試験

○循環系に対する作用：セコバルビタールはワルファリンの代謝を促進し、ワルファリンの抗凝血作用を減少させる(イヌ)。<sup>9)</sup>

○肝機能に及ぼす影響：Bromsulphalein (BSP) 試験で検討した結果、BSP の停滞を認めた(イヌ)。<sup>10)</sup>

### 2. 毒性試験

#### (1) 単回投与毒性試験

セコバルビタールナトリウムの急性毒性 (LD<sub>50</sub>) は 126.5mg/kg である (マウス, 腹腔内投与)<sup>11)</sup>。また, 最小致死量 (MLDmg/kg) は次表の通りである。<sup>5), 12)</sup>

<MLD mg/kg>

投与経路 使用動物	経口	皮下	静脈内	腹腔内
ラット	125	140	35	110
家兎	450	90	50	50

#### (2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

#### (3) 生殖発生毒性試験<sup>5)</sup>

胎児に及ぼす影響

子宮内胎児呼吸運動：妊娠家兎の子宮を露出させ、耳動脈よりセコバルビタール 20mg/kg を注射し、胎児の呼吸運動を観察したところ、1分後で呼吸抑制が起こり、その後わずかながら抑制されつつ回復へ向かった。しかし、子宮切開により取り出した胎児はすぐ正常にもどった。

組織呼吸：セコバルビタールを投与した妊娠家兎を屠殺後、各臓器を取り出して homogenate し、warburg 検圧計にて測定したところ、胎児の脳、心、肝、腎においては、セコバルビタール投与例は酸素消費量は高値をとり、静注では低値をとった。

#### (4) 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	注射用アイオナール・ナトリウム(0.2)	劇薬，向精神薬，習慣性医薬品（注意 - 習慣性あり），処方箋医薬品（注意 - 医師等の処方箋により使用すること）
有効成分	セコバルビタールナトリウム	劇薬，向精神薬，習慣性医薬品（注意 - 習慣性あり）

### 2. 有効期間又は使用期限

外箱等に表示の使用期限内に使用すること。（3年：安定性試験結果に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存，遮光保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

（「規制区分」，「貯法・保存条件」の項参照）

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

患者向医薬品ガイド：有，くすりのしおり：有

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」を参照）

#### (3) 調剤時の留意点について

（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」を参照）

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

200mg × 5 バイアル

### 7. 容器の材質

ガラスバイアル，ブチルゴム栓

### 8. 同一成分・同効薬

同効薬：注射用チオペンタールナトリウム

### 9. 国際誕生年月日

不明

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造承認年月日	承認番号
注射用アイオナール・ナトリウム(0.2)	1961年9月29日	13600AZZ03350000

### 11. 薬価基準収載年月日

2006年7月7日

### 12. 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

### 13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果公表年月日：1995年9月7日

内容：薬効の再評価

結果：薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しない



**14. 再審査期間**

該当しない

**15. 投与期間制限医薬品に関する情報**

本剤は、投薬期間制限の対象となる医薬品ではない。

**16. 各種コード**

販売名	薬価基準収載 医薬品コード	レセプト 電算コード	HOT(9桁) コード
注射用アイオナール・ナトリウム(0.2)	1125401D2028	620004156	117576901

**17. 保険給付上の注意**

特になし

## **X I. 文献**

### **1. 引用文献**

- 1) 日医工株式会社 社内資料 (製剤安定性試験)
- 2) 日医工株式会社 社内資料 (溶解後の安定性試験)
- 3) 日医工株式会社 社内資料 (pH 変動試験)
- 4) 兵頭正義：麻酔科学 金芳堂, 211 (1991)
- 5) 増岡陸浪：産婦人科の世界, 12, 1757 (1960)
- 6) 小川秀道 他：麻酔, 11, 705 (1962)
- 7) M.N.G.Dukes 編：メイラー・医薬品の副作用大辞典第 10 版, 87 (1990)
- 8) Tsukamoto,H.et al.:Chem Pharm Bull., 11, 9 (1963)
- 9) Hunninghake,D.B.et al.:Arch Intern Med., 121, 349 (1968)
- 10) Delas,R.et al.:Compt Rendu Soc Biol., 155, 670 (1961)
- 11) Archer,J.D.:Texas Report Biology Med., 14, 1 (1956)
- 12) Swanson,E.E.et al.:J.A.Pharm.Ass., 26, 1248 (1937)

### **2. その他の参考文献**

- The Merck Index 11th ed., 8374 (1989)  
日本薬局方外医薬品規格 930 (1993)

## **X II. 参考資料**

### **1. 主な外国での発売状況**

該当資料なし

### **2. 海外における臨床支援情報**

なし

## **X III. 備考**

### **その他の関連資料**