

貯 法	遮光、室温保存
使用期限	包装に表示の使用期限内に使用すること。

麻酔用神経遮断剤

劇薬、処方せん医薬品*

日本標準商品分類番号
8 7 1 1 1 9

承認番号	21800AMX10251
薬価収載	2006年6月
販売開始	1972年2月
再評価結果	1990年9月

ドロレプタン[®]注射液 25mg

DROLEPTAN[®] INJECTION

ドロペリドール注射液

※注意—医師等の処方せん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. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2. 痙攣発作の既往歴のある患者[痙攣を誘発することがある。]
3. 外来患者[麻酔前後の管理が行き届かない。]
4. 重篤な心疾患を有する患者[重篤な副作用が生じる可能性がある。]
5. QT延長症候群のある患者[QT延長が発現したとの報告がある。]
6. 2歳以下の乳児・小児[安全性が確立していない。]

【組 成 ・ 性 状】

1. 組 成

1 mL中に次の成分を含有

販 売 名	有効成分	添 加 物
ドロレプタン注射液25mg	ドロペリドール(日局) 2.5mg	酒石酸、パラオキシ安息香酸メチル0.5mg、パラオキシ安息香酸プロピル0.05mg、pH調節剤

2. 製剤の性状

販 売 名	pH	浸 透 圧 比 (生理食塩液対比)	外 観
ドロレプタン注射液25mg	2.5～4.5	約0.1	ほとんど無色の澄明な注射液

【効 能 ・ 効 果】

1. フェンタニルとの併用による、手術、検査、及び処置時の全身麻酔並びに局所麻酔の補助
2. ドロペリドールの単独投与による麻酔前投薬

【用 法 ・ 用 量】

1. フェンタニルクエン酸塩との併用による場合：
導入麻酔剤として投与する場合には通常成人ドロレプタン注射液0.1～0.2mL/kg(ドロペリドールとして0.25～0.5mg/kg)をフェンタニル注射液0.1～0.2mL/kg(フェンタニルとして5～10μg/kg)と共に緩徐に静注するか、又はブドウ糖液等に希釈して点滴静注する。
局所麻酔の補助として投与する場合には局所麻酔剤投与10～15分後に通常成人ドロレプタン注射液0.1mL/kg(ドロペリドールとして0.25mg/kg)をフェンタニル注射液0.1mL/kg(フェンタニルとして5μg/kg)と共に緩徐に静注する。
なお、患者の年齢・症状に応じて適宜増減する。
2. ドロペリドール単独で麻酔前投薬として投与する場合：
通常成人ドロレプタン注射液0.02～0.04mL/kg(ドロペリドールとして0.05～0.1mg/kg)を麻酔開始30～60分前に筋注する。
なお、患者の年齢・症状に応じて適宜増減する。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

本剤の用法・用量は、患者の感受性、全身状態、手術々式、麻酔方法等に応じてきめるが、一般にフェンタニルとの併用による導入麻酔・局所麻酔、また本剤単独投与による前投薬は通常次の如く行われている。

1. 導入麻酔剤として：
アトロピン硫酸塩水和物など通常の前投薬に引き続き、本剤及びフェンタニルの1回量を緩徐に静注(点滴静注が安全で確実)する。なお症例により、同時にGO、GOF等の吸入麻酔やチアミラール等の静注用全身麻酔剤の併用も行われる。
2. 局所麻酔の補助として：
メピバカイン等による持続硬膜外麻酔の補助として本剤を併用する(症例によっては、全身麻酔や気管内挿管を必要としないで手術可能な例もある)。
3. 前投薬として：
通常麻酔開始30分～1時間前に本剤1回量の筋注を行う。
投与後10～30分後にはほとんどの例に十分な鎮静効果が得られる。
なお症例により、アトロピン硫酸塩水和物が併用される場合もある。

【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) MAO阻害剤の投与を受けている患者(「相互作用」の項参照)
 - (2) 肝障害、腎障害のある患者[血中濃度が高くなるため、副作用発現の危険性が増加する。]
 - (3) パーキンソン病等錐体外路系疾患の患者[過量投与により錐体外路症状を呈することがある。]
 - (4) β-遮断剤を使用中の患者(「相互作用」の項参照)
 - (5) 心疾患のある患者[QT延長、心室頻拍(Torsades de pointesを含む)が発現したとの報告がある。]
 - (6) poor risk状態の患者(適宜減量すること。)[錐体外路系症状等の副作用が発現し易い。]
 - (7) 高齢者[錐体外路系症状等の副作用が発現し易い。](「高齢者への投与」の項参照)
 - (8) 褐色細胞腫の患者[異常な血圧上昇を起こすことがある。]
2. 重要な基本的注意
 - (1) 本剤の使用に際しては、一般の全身麻酔剤と同様、必ず気道確保、呼吸管理等の蘇生設備の完備された場所で、麻酔医の管理の下に使用すること。
 - (2) 麻酔を行う際にはあらかじめ絶食をさせておくこと。
 - (3) 麻酔を行う際には原則として麻酔前投薬を行うこと。
 - (4) 麻酔中は気道に注意して呼吸・循環に対する観察を怠らないこと。
 - (5) 麻酔の深度は手術、検査に必要な最低の深さにとどめること。
 - (6) 麻酔前に酸素吸入器、吸引器具、挿管器具等の人工呼吸のできる器具を手もとに準備しておくことが望ましい。

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
中枢神経系抑制剤 バルビツール酸系 薬剤、向精神薬、 麻薬性鎮痛剤等 MAO阻害剤	中枢神経抑制作用 が増強され覚醒が 遅延することがある。	相加的に中枢神経 抑制作用が増強さ れる。
β-遮断剤	血圧降下、頻脈等 の心毒性が増強さ れるおそれがある。	本剤の心血管系に対 する作用がβ-遮断剤 により増強される。

4. 副作用(本項には頻度が算出できない副作用報告を含む。)
総症例9,528例中副作用がみられたのは1,980例(20.78%)であ
った。その主なものは血圧降下(2.25%)、発汗(3.44%)、
悪心・嘔吐(2.97%)等であった。
〔新開発医薬品の副作用のまとめ(その67)〕

(1) 重大な副作用

- 1) 血圧降下(2.25%)：血圧降下がみられることがあるので
このような症状があらわれた場合には輸液を行い、更に
必要な場合は昇圧剤(アドレナリンを除く)の投与を行う
こと。なお、本剤を腰椎麻酔、硬膜外麻酔に併用する
と、更に血圧降下を招くおそれがあるので、このよ
うな場合には慎重に投与すること。
- 2) 不整脈(頻度不明)、期外収縮(頻度不明)、QT延長(頻度
不明)、心室頻拍(頻度不明)、心停止(頻度不明)：不整脈、
期外収縮、QT延長、心室頻拍(Torsades de pointesを
含む)、心停止があらわれることがある。
- 3) ショック(0.1%未満)：ショックを起こすことがあるので、
観察を十分に行い、異常が認められた場合には直ちに
投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4) 間代性痙攣(0.1%未満)：間代性痙攣があらわれること
がある。
- 5) 悪性症候群(頻度不明)：悪性症候群が発現したとの報告
があるので体温上昇、筋硬直、不安、混乱、昏睡、CK
(CPK)上昇等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。ダントロレン、プロモクリプ
チン、ECTが効果的であったとの報告がある。

(2) その他の副作用

	1%以上	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^{注1)}			紅斑、 蕁麻疹	そう痒
呼吸器				呼吸抑制
循環器		血圧上昇		起立性低血圧 ^{注2)} 、 頻脈、徐脈
精神神経系		頭痛、 錐体外路症状、 覚醒遅延	ふるえ、眩暈、 気分動揺、 興奮、不眠	譫妄、傾眠
肝 臓		AST(GOT)上昇、 ALT(GPT)上昇		
その他	悪心・嘔吐、 発汗、 体温降下	咽頭痛、 喀痰排出増加、 喀痰排出困難、 喘鳴、吃逆、 四肢冷感、発熱	嘔声、 口渇	

注1) 投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
注2) 術後患者を動かしたり、体位を変えるときには注意
すること。

5. 高齢者への投与

減量するなど注意すること。〔一般に高齢者では生理機能が
低下している。〕

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 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
が危険性を上まわ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) マウスに本剤を投与した試験(15・40mg/kg 妊娠7日目から
6日 腹腔内)において、40mg/kg投与群に骨格(胸椎骨、
肋骨)異常、生仔平均体重の減少が認められている。
(三共研究所)

7. 適用上の注意

- 筋肉内注射時：筋肉内注射にあたっては、組織・神経など
への影響を避けるため、下記の点に配慮すること。
- (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、同一注射部位を避けること。
なお、2歳以下の乳児・小児には投与しないこと。
 - (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。

【薬 物 動 態】

血漿中濃度¹⁾
健康男子3例に³H-ドロペリドール5mgを静注投与した場合、ドロ
ペリドールの血漿中濃度は投与後30分で約30ng/mLに低下し、以後
緩やかに漸減した。
投与後96時間以内に投与量の約75%相当の代謝物及び1%未満の
未変化体が尿中に排泄された。
また、健康男子9例に³H-ドロペリドール5mgを筋注投与した場合、
吸収は速く、その血漿中濃度の推移は静注と類似していた。
(外国人のデータ)

(参考：動物)

分 布
ラットに³H-ドロペリドール1.6mg/kgを皮下注し、臓器中の放射
活性を測定した結果、肝・腎では投与後30分、血液その他の臓器で
は15分後に最高値を示し、いずれの臓器においても急速に低下し、
蓄積傾向は認められなかった。
(三共研究所)

【臨 床 成 績】^{2～5)}

麻酔の前投薬として5施設、147症例について臨床試験が実施された
結果、通常麻酔開始30分～1時間前にドロペリドールとして25～5mg
ずつ筋注するとき、鎮静効果は97.2%(143/147)、催眠効果は69.7%
(87/125)に認められた。
フェンタニルとの併用では、7施設、1,413例について、導入麻酔、
維持麻酔及び局所麻酔の補助の目的で、臨床試験が実施された結果、
すぐれた鎮静効果と鎮痛効果が認められた。

【薬 効 薬 理】^{6,7)}

1. 鎮静作用
本剤は動物(マウス・ラット・イヌ)での行動への影響についての
実験から鎮静、攻撃性の抑制、条件回避反応の阻害等強い鎮静
作用を示すことが認められる。本剤はハロペリドールの約15倍、
クロルプロマジンの約200倍の強さ(条件回避反応抑制実験：イヌ)
を示すが、持続性は短い。またアンフェタミンによる痙攣性咬歯
誘発作用(ラット)に対し、本剤は前記神経遮断剤にまさる拮抗
作用を示す。
2. 効果の発現と持続
通常用量では、作用は静注後2～3分であられ、周囲に全く
無関心となるMineralizationの状態が約30分続くが、鎮静状態は
なお6～12時間持続する。
3. 制吐作用
イヌを用いた実験では本剤の制吐作用はクロルプロマジン、ハロ
ペリドールに比し、強力であることが認められている。
4. α-受容体遮断作用
本剤はラットを使用した実験によるとα-受容体遮断作用を有し
ており、カテコールアミンの作用を阻害し、末梢血管拡張作用
が認められる。またアドレナリン等に対する抗ショック作用
(ラット)、抗不整脈作用(イヌ)を有する。
5. 本剤はイヌの静脈内投与で、チオペンタールの麻酔時間を延長
させることが認められている。
6. 本剤は前記の如き作用から、麻酔用神経遮断剤として、運動反射
抑制、精神的無関心、自律神経系の安定化を伴った神経遮断状態
をもたらすので、前投薬としてのみでなく、鎮痛剤フェンタニル
注射液(フェンタニルクエン酸塩)との併用により、いわゆる
Neuroleptanalgesia^{注)}の状態を得ることができ、特に大手術及
び長時間にわたる手術時に使用されている。

(注)Neuroleptanalgesiaの特長は、意識の消失なしに鎮痛効果と鎮静効果の得られることで、無痛状態を得ると同時に、安静、周囲の環境に対する無関心、自律神経系の安定、さらに高度の非被刺激性が得られ、精神科領域でいうMineralizationの状態－無生物のように情動表出のなくなった状態－となり、この状態では、患者は手術に伴う苦痛もなく、患者と術者との間に意志の疎通のある状態で手術を行うことができる。

【有効成分に関する理化学的知見】

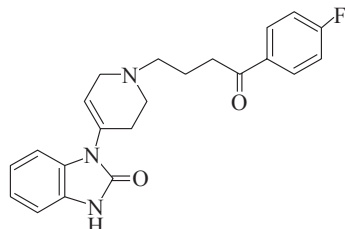
一般名：ドロペリドール (Droperidol)

* 化学名：1- [1-[4-(4-Fluorophenyl)-4-oxobutyl]-1, 2, 3, 6-tetrahydropyridin-4-yl]-1, 3-dihydro-2H-benzimidazol-2-one

分子式：C₂₂H₂₂FN₃O₂

分子量：379.43

構造式：



性 状：白色～淡黄色の粉末である。

酢酸(100)に溶けやすく、ジクロロメタンにやや溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

光によって徐々に着色する。

分配係数(log Pow)：2.9(pH7.0)

(Pow＝オクタノール相のドロペリドール濃度／水相のドロペリドール濃度)

【 包 装 】

ドロレプタン注射液25mg (10mL) 1バイアル

【主 要 文 献】

- 1) Cressman WA, et al. : Anesthesiology 1973;38(4) :363-369
- 2) 井上莊三郎ほか：ドロレプタン文献集 No.1 1973:22-26
- 3) 溝田 弘：ドロレプタン文献集 No.1 1973:31-34
- 4) 西山友博ほか：ドロレプタン文献集 No.1 1973:35-40
- 5) 山下九三夫ほか：診療と保険 1970;12(4) :553-556
- 6) Janssen AJ, et al. : Arzneimittelforschung 1963;13(3) :205-211
- 7) Yelnosky J, et al. : Toxicol Appl Pharmacol 1964;6:63-70

*【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

第一三共株式会社 製品情報部

〒103-8426 東京都中央区日本橋本町 3 - 5 - 1

TEL：0120-189-132

