

貯 法：遮光、室温保存  
使用期限：外箱、容器に表示

劇薬 習慣性医薬品<sup>注1)</sup> 処方箋医薬品<sup>注2)</sup>

全身麻酔剤

日本薬局方 注射用チアミラールナトリウム

**チトゾール注用0.3g**

**チトゾール注用0.5g**

**CITOSOL Injection 0.3g, 0.5g**

	0.3g	0.5g
承認番号	22000AMX02393000	22000AMX02394000
薬価収載	2008年12月	
販売開始	1957年12月	
再評価結果	1974年11月	

注1) 注意－習慣性あり

注2) 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. ショック又は大出血による循環不全、重症心不全の患者  
[血管運動中枢抑制作用により、過度の血圧降下を起こすおそれがある。]
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。]
3. アジソン病の患者  
[催眠作用が持続又は増強するおそれがある。また本疾患は高カリウム血症を伴うがカリウム値が上昇するおそれがある。]
4. 重症気管支喘息の患者  
[気管支痙攣を誘発するおそれがある。]
5. バルビツール酸系薬物に対する過敏症の患者

**【組成・性状】**

販売名	チトゾール注用0.3g	チトゾール注用0.5g
成分・含量 (1バイアル中)	日局 チアミラールナトリウム 0.3g	0.5g
添加物 (1バイアル中)	乾燥炭酸ナトリウム 0.021g	
	pH調整剤 適量	
溶解液組成 (1管中)	日局 注射用蒸留水 12mL	20mL
剤形	注射剤(用時溶解)	
内容物	淡黄色の結晶、粉末又は塊、不快な臭い	
pH	10.5～11.5(溶解後)	
浸透圧比	約0.8(溶解後)	
溶血性	(＋)	

(浸透圧比は生理食塩液に対する比)

**【効能・効果】**

全身麻酔、全身麻酔の導入、局所麻酔剤・吸入麻酔剤との併用、精神神経科における電撃療法の際の麻酔、局所麻酔剤中毒・破傷風・子癇等に伴う痙攣

**【用法・用量】**

静脈内投与

○溶液濃度：2.5%水溶液(5%溶液は静脈炎を起こすことがある。)

○投与量・投与方法：調整したチアミラール水溶液を静脈より注入する。本剤の用量や静注速度は年齢・体重とは関係が少なく個人差があるため一定ではないが、大体の基準は次の通り。

1. 全身麻酔の導入

最初に2～4mL(2.5%溶液で50～100mg)を注入して患者の全身状態、抑制状態などを観察し、その感受性より追加量を決定する。次に患者が応答しなくなるまで追加注入し、応答がなくなった時の注入量を就眠量とする。さらに就眠量の半量ないし同量を追加注入したのち、他の麻酔法に移行する。

なお、気管内に挿管する場合は筋弛緩剤を併用する。

2. 短時間麻酔

ア. 患者とコンタクトを保ちながら最初に2～3mL(2.5%溶液で50～75mg)を10～15秒位の速度で注入後30秒間、麻酔の程度、患者の全身状態を観察する。さらに必要ならば2～3mLを同速度で注入し、患者の応答のなくなった時の注入量を就眠量とする。なお、手術に先立ち、さらに2～3mLを同速度で分割注入すれば10～15分程度の麻酔が得られる。

イ. 短時間で手術が終了しない場合は注射針を静脈中に刺したまま呼吸、脈拍、血圧、角膜反射、瞳孔対光反射などに注意しながら手術の要求する麻酔深度を保つように1～4mL(2.5%溶液で25～100mg)を分割注入する(1回の最大使用量は1gまでとする)。

3. 精神神経科における電撃療法の際の麻酔

通常12mL(2.5%溶液で300mg)をおよそ25～35秒で注入し、必要な麻酔深度に達したことを確かめたのち、直ちに電撃療法を行う。

4. 併用使用

本剤は局所麻酔剤あるいは、吸入麻酔剤と併用することができる。通常2～4mL(2.5%溶液で50～100mg)を間歇的に静脈内注入する。点滴投与を行う場合は、静脈内点滴麻酔法に準ずる。

5. 痙攣時における使用

患者の全身状態を観察しながら、通常2～8mL(2.5%溶液で50～200mg)を痙攣が止まるまで徐々に注入する。

**【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) 重症肝障害及び重症腎障害のある患者  
[代謝・排泄の遅延及び蛋白結合の低下により、本剤の作用が増強するおそれがある。]
- (2) 重症糖尿病の患者  
[糖尿病を悪化させるおそれがある。]
- (3) 重症高血圧症、低血圧症、重症貧血、低蛋白血症の患者  
[血圧を変動させるおそれがある。また、重症貧血及び低蛋白血症では本剤の作用が増強されるおそれがある。]
- (4) 心筋障害、動脈硬化症の患者  
[血圧降下が発現するおそれがある。]
- (5) 脳圧上昇時  
[呼吸抑制や気道閉塞により血中のCO<sub>2</sub>分圧を上昇させ脳血流量を増加させ、脳圧を上昇させるおそれがある。]
- (6) 重症筋無力症、筋ジストロフィー、呼吸困難及び気道閉塞を呈する疾患の患者  
[呼吸抑制を誘発するおそれがある。]
- (7) 電解質アンバランス時(特にカリウム中毒)  
[血中カリウム値が上昇するおそれがある。]
- (8) 薬物過敏症の患者
- (9) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)

2. 重要な基本的注意

- (1) 麻酔を行う際には原則としてあらかじめ絶食をさせておくこと。
- (2) 麻酔を行う際には原則として麻酔前投薬を行うこと。
- (3) 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。
- (4) 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。

(5) 麻酔前に酸素吸入器、吸引器具、挿管器具など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
中枢神経抑制剤	呼吸抑制作用、降圧作用、中枢神経抑制作用(鎮静、催眠等)が増強することがある。併用する場合には、用量に注意する。	中枢神経抑制作用を増強させる。
血圧降下剤	降圧作用、中枢神経抑制作用(鎮静、催眠等)が増強することがある。併用する場合には、用量に注意する。	
モノアミン酸化酵素阻害剤	中枢神経抑制作用(鎮静、催眠等)が増強することがある。併用する場合には、用量に注意する。	
三環系抗うつ剤	降圧作用、中枢神経抑制作用(鎮静、催眠等)が増強することがある。また、三環系抗うつ剤の作用が減弱することがある。併用する場合には、用量に注意する。	
中枢性筋弛緩剤 クロルフェネシン カルバミン酸エステル等 スルホニル尿素系血糖降下剤 抗パーキンソン剤 レボドパ等	中枢神経抑制作用(鎮静、催眠等)が増強することがある。併用する場合には、用量に注意する。	
ジスルフィラム	中枢神経抑制作用(鎮静、催眠等)が増強することがある。また、併用により、重篤な低血圧があらわれたとの報告がある。異常が認められた場合には本剤を減量するなど適切な処置を行う。	ジスルフィラムは本剤の代謝を阻害する。
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。	本剤は肝の薬物代謝酵素を誘導し、ドキシサイクリンの代謝を促進する。
クマリン系抗凝血剤 ワルファリンカリウム等	抗凝血作用が減弱することがある。頻回にプロトロンビン値の測定を行い、クマリン系抗凝血剤の用量を調節する。	本剤は肝の薬物代謝酵素を誘導し、クマリン系抗凝血剤の代謝を促進する。

### 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

##### 1) ショック

ショックを起こすことがあるので、観察を十分に行い、呼吸困難、血圧低下等が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

##### 2) 呼吸停止、呼吸抑制

呼吸停止、呼吸抑制、舌根沈下、喉頭痙攣、気管支痙攣、咳、しゃっくりを起こすことがある。このような症状があらわれた場合には、直ちに気道の確保、酸素吸入等の処置とともに、筋弛緩剤の投与等、適切な処置を行うこと。

#### (2) その他の副作用

	頻度不明
循環器	血圧下降、不整脈
過敏症	皮疹等
覚醒時	悪心、嘔吐、頭痛、めまい、流涙、ふるえ、痙攣、興奮、顔面潮紅、複視、しびれ感、尿閉、倦怠感等

### 5. 高齢者への投与

高齢者では生理機能が低下しているため、呼吸抑制、血圧降下等が強くあらわれることがあるので慎重に投与すること。

### 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投与しないことが望ましい。

[動物実験(マウス)で催奇形作用が認められている。]

(2) 帝王切開などの分娩に使用する場合には、できるだけ最小有効量を慎重に投与すること。

[新生児への影響が考えられる。]

### 7. 適用上の注意

#### (1) 投与速度：

本剤の用法及び注射速度は患者の体質、健康状態などの個人差を考慮すること。特に幼・小児、高齢者、虚弱者の麻酔には注意すること。

#### (2) 投与経路：

動脈内に注入した場合には、動脈の閉塞、末梢の壊死などの重篤な症状を起こすことがあるので、絶対に避けること。

#### (3) 投与时：

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などの局所麻酔剤による浸潤、温湿布などの適切な処置を行うこと。

4) 静脈内投与により血栓性静脈炎を起こすことがある。

5) 長時間の手術に使用する場合には、単独投与を避け、他の麻酔剤を併用することが望ましい。

6) 喉頭筋及び副交感神経が過敏状態になることがあるので、前処置として、アトロピン・スコポラミンなどのペラドンナ系薬剤を投与することが望ましい。

7) 本剤は鎮痛作用を有しないので、必要ならば鎮痛剤を併用すること。

#### (4) アンブルカット時：

添付の溶解液はワンポイントカットアンブルを使用しているが、アンブルの首尾をエタノール綿等で清拭し、カットすること。

## 【薬効薬理】

1. チアミラールはチオペンタールより約1.5倍強力であり、麻酔効果も早く、興奮性も少なく、また、麻酔の回復が早い(イヌ)<sup>1)</sup>。
2. 精神科に於いて電気ショックの術前に使用し、血圧抑制、脈拍速度の減少、発作時間の減少等の好結果が得られた<sup>2)</sup>。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：チアミラールナトリウム (Thiamylal Sodium) [JAN]

化学名：Monosodium 5-allyl-5-[(1R)-1-methylbutyl]-4,6-dioxo-1,4,5,6-tetrahydropyrimidine-2-thiolate

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

分子量：276.33

性状：本品は淡黄色の結晶又は粉末である。  
本品は水に極めて溶けやすく、エタノール(95)に溶けやすい。

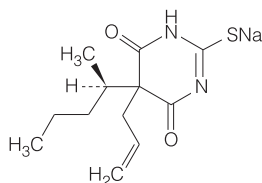
本品1.0gを水10mLに溶かした液のpHは10.0～11.0である。

本品は吸湿性である。

本品は光によって徐々に分解する。

本品のエタノール(95)溶液(1→10)は旋光性を示さない。

化学構造式：



及び鏡像異性体

## 【包装】

チトゾール注用0.3g

50バイアル(溶解液12mL、50管添付)

チトゾール注用0.5g

50バイアル(溶解液20mL、50管添付)

## 【主要文献】

1)Wyngaarden, J. B., et al., *J. Pharm. Exp. Ther.*, **95**, 322(1949).

2)Brown, E. O., A. M. A. *Archives of Neurology and Psychiatry*, **68**(1), 43(1952).

## 【文献請求先】「\*」「\*\*」

杏林製薬株式会社 くすり情報センター

〒101-8311 東京都千代田区神田駿河台4-6

電話 0120-409341

受付時間 9:00～17:30(土・日・祝日を除く)

---

**\*\* 杏林製薬株式会社**  
東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地