2020年4月改訂（第11版）

日本標準商品分類番号
871115

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2018に準拠して作成

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

剤形	粉末注射剤（用時溶解）
製剤の規制区分	劇薬 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バイアル中に日局チアミラールナトリウム0.3g又は0.5g含有
一般名	和名：チアミラールナトリウム（ＪＡＮ） 洋名：Thiamylal　Sodium（ＪＡＮ）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日　：2008年10月15日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日　：2008年12月19日（販売名変更による） 販売開始年月日　：1957年12月 1日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	杏林製薬株式会社　くすり情報センター TEL　0120-409341 受付時間：9:00～17:30（土・日・祝日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.kyorin-pharm.co.jp/prodinfo/

本ＩＦは2020年4月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。
最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、ＭＲと略す）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医薬品インタビューフォーム（以下、ＩＦと略す）が誕生した。

1988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ＩＦの位置付け、ＩＦ記載様式、ＩＦ記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第３小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がＩＦ記載要領の改訂を行ってきた。

ＩＦ記載要領2008以降、ＩＦは紙媒体の冊子としての提供方式からＰＤＦ等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加したＩＦが速やかに提供されることとなった。最新版のＩＦは、医薬品医療機器総合機構（以下、ＰＭＤＡと略す）の医療用医薬品情報検索のページ（http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されて入手可能となっている。日病薬では、2008年より新医薬品のＩＦの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

この度、2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、新たに日病薬医薬情報委員会が記載要領を改め、「ＩＦ記載要領 2018」として公表された。

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。

ＩＦ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。ただし、医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律（以下、薬機法と略す）に基づく承認事項を逸脱するもの、製薬企業の機密等に関わ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の提供は、電子媒体を基本とし、必要に応じて薬剤師が印刷して使用する。製薬企業での製本は必須ではない。

３．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦは、ＰＭＤＡの医療用医薬品情報検索の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ＩＦを作成・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、あるいは各種の医薬品情報提供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ＰＭＤＡの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

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があり、その取り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いただきたい。しかし、薬機法の広告規制や医療用医薬品プロモーションコード等により、製薬企業が提供できる情報の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。

（2018 年 10 月改訂）

目　　次

Ⅰ. 概要に関する項目 1

１．開発の経緯 1
２．製品の治療学的特性 1
３．製品の製剤学的特性 1
４．適正使用に関して周知すべき特性 1
５．承認条件及び流通・使用上の制限事項 1
(1)承認条件 1
(2)流通・使用上の制限事項 1
６．ＲＭＰの概要 1

Ⅱ. 名称に関する項目 2

１．販売名 2
(1)和名 2
(2)洋名 2
(3)名称の由来 2
２．一般名 2
(1)和名(命名法) 2
(2)洋名(命名法) 2
(3)ステム 2
３．構造式又は示性式 2
４．分子式及び分子量 2
５．化学名(命名法)又は本質 2
６．慣用名、別名、略号、記号番号 2

Ⅲ. 有効成分に関する項目 3

１．物理化学的性質 3
(1)外観・性状 3
(2)溶解性 3
(3)吸湿性 3
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点 3
(5)酸塩基解離定数 3
(6)分配係数 3
(7)その他の主な示性値 3
２．有効成分の各種条件下における安定性 3
３．有効成分の確認試験法、定量法 3

Ⅳ. 製剤に関する項目 4

１．剤形 4
(1)剤形の区別 4
(2)製剤の外観及び性状 4
(3)識別コード 4
(4)製剤の物性 4
(5)その他 4
２．製剤の組成 4
(1)有効成分(活性成分)の含量及び添加剤 4
(2)電解質等の濃度 4
(3)熱量 4
３．添付溶解液の組成及び容量 5
４．力価 5
５．混入する可能性のある夾雑物 5
６．製剤の各種条件下における安定性 5
７．調製法及び溶解後の安定性 5
(1)注射剤の調製法 5
(2)溶解後の安定性 5
８．他剤との配合変化(物理化学的変化) 6
９．溶出性 7
10．容器・包装 7
(1)注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報 7
(2)包装 7
(3)予備容量 7
(4)容器の材質 7
11．別途提供される資材類 7
12．その他 7

Ⅴ. 治療に関する項目 8

１．効能又は効果 8
２．効能又は効果に関連する注意 8
３．用法及び用量 8
(1)用法及び用量の解説 8
(2)用法及び用量の設定経緯・根拠 8
４．用法及び用量に関連する注意 8
５．臨床成績 9
(1)臨床データパッケージ 9
(2)臨床薬理試験 9
(3)用量反応探索試験 9
(4)検証的試験 9
(5)患者・病態別試験 9
(6)治療的使用 10
(7)その他 10

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目 11

１．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 11
２．薬理作用 11
(1)作用部位・作用機序 11
(2)薬効を裏付ける試験成績 11
(3)作用発現時間・持続時間 11

Ⅶ. 薬物動態に関する項目 12

１．血中濃度の推移 12
(1)治療上有効な血中濃度 12
(2)臨床試験で確認された血中濃度 12
(3)中毒域 12
(4)食事・併用薬の影響 12
２．薬物速度論的パラメータ 12
(1)解析方法 12
(2)吸収速度定数 12
(3)消失速度定数 12
(4)クリアランス 12
(5)分布容積 12
(6)その他 12
３．母集団(ポピュレーション)解析 12
(1)解析方法 12
(2)パラメータ変動要因 13
４．吸収 13
５．分布 13
(1)血液－脳関門通過性 13

(2)血液－胎盤関門通過性.....13
(3)乳汁への移行性.....13
(4)髄液への移行性.....13
(5)その他の組織への移行性.....14
(6)血漿蛋白結合率.....14
６．代謝.....14
(1)代謝部位及び代謝経路.....14
(2)代謝に関与する酵素(ＣＹＰ等)の分子種、寄与率.....14
(3)初回通過効果の有無及びその割合.....14
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率.....14
７．排泄.....14
８．トランスポーターに関する情報.....14
９．透析等による除去率.....14
10．特定の背景を有する患者.....14
11．その他.....14

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目.....15

１．警告内容とその理由.....15
２．禁忌内容とその理由.....15
３．効能又は効果に関連する注意とその理由.15
４．用法及び用量に関連する注意とその理由.15
５．重要な基本的注意とその理由.....15
６．特定の背景を有する患者に関する注意....16
(1)合併症・既往歴等のある患者.....16
(2)腎機能障害患者.....16
(3)肝機能障害患者.....16
(4)生殖能を有する者.....16
(5)妊婦.....16
(6)授乳婦.....16
(7)小児等.....17
(8)高齢者.....17
７．相互作用.....17
(1)併用禁忌とその理由.....17
(2)併用注意とその理由.....17
８．副作用.....18
(1)重大な副作用と初期症状.....18
(2)その他の副作用.....18
９．臨床検査結果に及ぼす影響.....18
10．過量投与.....18
11．適用上の注意.....19
12．その他の注意.....19
(1)臨床使用に基づく情報.....19
(2)非臨床試験に基づく情報.....19

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目.....20

１．薬理試験.....20
(1)薬効薬理試験.....20
(2)安全性薬理試験.....20
(3)その他の薬理試験.....20
２．毒性試験.....20
(1)単回投与毒性試験.....20
(2)反復投与毒性試験.....20
(3)遺伝毒性試験.....20
(4)がん原性試験.....20
(5)生殖発生毒性試験.....20
(6)局所刺激性試験.....20
(7)その他の特殊毒性.....20

Ⅹ. 管理的事項に関する項目.....21

１．規制区分.....21
２．有効期間.....21
３．包装状態での貯法.....21
４．取扱い上の注意.....21
５．患者向け資材.....21
６．同一成分・同効薬.....21
７．国際誕生年月日.....21
８．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日.....21
９．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.....22
10．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....22
11．再審査期間.....22
12．投薬期間制限に関する情報.....22
13．各種コード.....22
14．保険給付上の注意.....22

ⅩⅠ．文献.....23

１．引用文献.....23
２．その他の参考文献.....23

ⅩⅡ. 参考資料.....24

１．主な外国での発売状況.....24
２．海外における臨床支援情報.....24

ⅩⅢ. 備考.....25

略　語　集

なし

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

臨床に使用された最初の静注麻酔剤はメチルヘキサビタールである。
続いて含硫バルビタールであるチオペンタールが発見され、広く使用されるようになったが、この二製剤とも呼吸及び血圧に障害を来たす度合が少なくなかった。
そこでより副作用が少なく有効性で優る製剤が研究された結果、チアミラールが登場し、現在広く使用されるようになった。この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）といわれている [1)]。
なお、医薬品再評価結果その 3（1974 年 11 月結果公示）で本剤の有用性が認められている。
チトゾール 0.3g、チトゾール 0.5g は「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について（平成 16 年 6 月 2 日付 薬食発第 0602009 号）」に基づき、2008 年 12 月「チトゾール注用 0.3g」、「チトゾール注用 0.5g」と販売名を変更した。

２．製品の治療学的特性

(1)超短時間作用型バルビツレートに分類される静脈麻酔薬である。

(2)全身麻酔や全身麻酔の導入以外に、局所麻酔剤中毒・破傷風・子癇等に伴う痙攣の治療にも用いられる。
（「Ⅴ.1.効能又は効果」の項参照）

(3)重大な副作用は、ショック、呼吸停止、呼吸抑制である。
（「Ⅷ.8.(1)重大な副作用と初期症状」の項参照）

３．製品の製剤学的特性

用時溶解して使用する粉末の注射剤で、溶解溶液（日局 注射用水）が添付されている。
（「Ⅳ.製剤に関する項目」の項参照）

４．適正使用に関して周知すべき特性

該当しない

５．承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1)承認条件

該当しない

(2)流通・使用上の制限事項

該当しない

６．ＲＭＰの概要

該当しない

Ⅱ．名称に関する項目

１．販売名

(1) 和名

チトゾール注用 0.3g
チトゾール注用 0.5g

(2) 洋名

CITOSOL Injection 0.3g,0.5g

(3) 名称の由来

チアミラールナトリウムがチオバルビツール酸系に属しているため。

２．一般名

(1) 和名(命名法)

チアミラールナトリウム（ＪＡＮ）

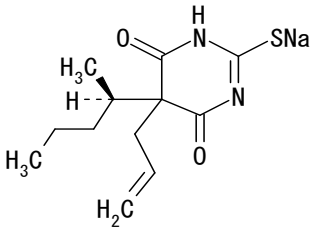
(2) 洋名(命名法)

Thiamylal Sodium（ＪＡＮ）

(3) ステム

不明

３．構造式又は示性式



及び鏡像異性体

４．分子式及び分子量

分子式：$C_{12}H_{17}N_2NaO_2S$
分子量：276.33

５．化学名(命名法)又は本質

Monosodium 5-allyl-5-[(1*RS*)-1-methylbutyl]-4,6-dioxo-1,4,5,6-tetrahydropyrimidine-2-thiolate

６．慣用名、別名、略号、記号番号

なし

Ⅲ．有効成分に関する項目

１．物理化学的性質

(1)外観・性状

本品は淡黄色の結晶又は粉末である。
本品は光によって徐々に分解する。

(2)溶解性

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。

(3)吸湿性

吸湿性が強く、約 60%RH(30℃)で 1 時間後には 7～7.5%吸湿する。

(4)融点(分解点)、沸点、凝固点

該当資料なし

(5)酸塩基解離定数

pK_{a1}＝7.38、pK_{a2}＝12.27(28±1℃)

(6)分配係数

該当資料なし

(7)その他の主な示性値

旋光度：本品のエタノール(95)溶液(1→10)は旋光性を示さない。
pH：本品 1.0 g を水 10mL に溶かした液の pH は 10.0～11.0 である。

２．有効成分の各種条件下における安定性

水溶液は放置するとき、徐々に分解する。空気中の二酸化炭素を吸収し、チアミラールを遊離して濁る。
また、長時間放置すると加水分解して開環する。この分解は温度依存性である。

３．有効成分の確認試験法、定量法

1)確認試験法

日本薬局方チアミラールナトリウムの確認試験による。
(1)本品のエタノール(95)溶液(7→1000000)につき、紫外可視吸光度測定法〈*2.24*〉により吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。
(2)本品を乾燥し、赤外吸収スペクトル測定法〈*2.25*〉の臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。
(3)本品の水溶液(1→10)はナトリウム塩の定性反応〈*1.09*〉を呈する。

2)定量法

日本薬局方チアミラールナトリウムの定量法による。
液体クロマトグラフィー〈*2.01*〉
検出器：紫外吸光光度計（測定波長：289 nm）
移動相：メタノール／pH 4.6 の 0.05 mol/L 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液混液（13：7）

Ⅳ. 製剤に関する項目

１. 剤形

(1) 剤形の区別

本剤は用時溶解して用いる粉末注射剤である。
凍結乾燥品である。

(2) 製剤の外観及び性状

販 売 名	チトゾール注用 0.3ｇ	チトゾール注用 0.5ｇ
色調・性状	淡黄色の結晶、粉末又は塊、吸湿性、光によって徐々に分解する	

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

pH	10.5～11.5（溶解後）
浸透圧比 （生理食塩液に対する比）	0.6～0.9（溶解後）

製剤均一性

日本薬局方 製剤均一性試験法 *〈6.02〉*：質量偏差試験を行うとき、適合する。

(5) その他

販 売 名	チトゾール注用 0.3ｇ	チトゾール注用 0.5ｇ
溶血性	（＋）	

バイアル内及びアンプル内は無菌である。

２. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販 売 名	チトゾール注用 0.3g	チトゾール注用 0.5g
有効成分 （1 バイアル中）	日局 チアミラールナトリウム	
	0.3g	0.5g
添加剤 （1 バイアル中）	乾燥炭酸ナトリウム	
	0.021ｇ	0.035ｇ
	ｐＨ調節剤	
	適量	適量

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当資料なし

３．添付溶解液の組成及び容量

販 売 名	チトゾール注用 0.3g	チトゾール注用 0.5g
添付溶解液 （1 アンプル中）	日局 注射用水	
	12mL	20mL

４．力価

該当しない

５．混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

６．製剤の各種条件下における安定性

相対比較試験

保　存　条　件		保存期間	結 果
保 存 方 法	保　存　形　態		
40℃、 75%	無色バイアル ＋ 紙箱	6 箇月	変化なし
	無色アンプル ＋ 紙箱	6 箇月	変化なし

［参考］

長期保存試験

保　存　条　件		保存期間	結 果
保 存 方 法	保　存　形　態		
室温	無色アンプル ＋ 紙箱	72 箇月	変化なし

７．調製法及び溶解後の安定性

(1) 注射剤の調製法

チアミラールナトリウム溶液の濃度は通常 2.5%のものが最も多く使用されるため、以下 2.5%溶液を例としてその調整法を示す。

①溶液の調製に当たっては無菌的に操作を行うよう留意すべきである。

②静注針を装着した注射器内に添付の注射用水 20mL を吸引し、その約半量を 0.5g チアミラールナトリウム粉末バイアル中に注入する。暫時軽く振盪し、次いで残液を加え、数回吸引排出を繰り返して完全に溶解し 2.5%溶液とする。

③溶解後は直ちに使用する。

④溶解後沈殿を生じたもの、完全に澄明でないものは使用しない。

(2) 溶解後の安定性

該当資料なし

［参考］

2.5%水溶液　アンプル（室内散光下）

項目	試験期間／保存条件	開始時	1時間	3時間	6時間	24時間	48時間	120時間
pH	冷所・密栓	10.93	10.85	10.94	10.86	10.92	10.92	10.89
	室温・密栓		10.78	10.77	10.73	10.87	10.84	10.81
	室温・開栓		10.80	10.79	10.70	10.81	10.64	10.38
含量(%)	冷所・密栓	99.3	99.4	99.6	99.4	99.2	98.1	97.8
	室温・密栓		99.6	99.0	99.4	96.7	94.8	90.4
	室温・開栓		99.0	99.1	99.2	97.3	94.1	92.7
残存率(%)	冷所・密栓	100.0	100.1	100.3	100.1	99.9	98.8	98.5
	室温・密栓		100.3	99.7	100.1	97.4	95.5	91.0
	室温・開栓		99.7	99.8	99.9	98.0	94.8	93.4

８．他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

［参考］

pH 変動試験値

販売名	一般名又は成分単位/容量	投与法	規格pH域	試料pH	0.1mol/L HCl(A) 0.1mol/L NaOH(B) mL	最終pH又は変化点pH	移動指数	変化所見	希釈試験 20mL 0	希釈試験 20mL 30'	希釈試験 20mL 1h	希釈試験 20mL 3h	希釈試験 500mL 0	希釈試験 500mL 30'	希釈試験 500mL 1h	希釈試験 500mL 3h	浸透圧比
ﾁﾄｿﾞｰﾙ 0.3g	ﾁｱﾐﾗｰﾙ ﾅﾄﾘｳﾑ 0.3g/12mL (添付溶解液に溶解)	静注	10.5～11.5	10.9	(A) 1.7	9.2	1.7	白濁	9.2 +	+	+	+	9.0 +	+	+	+ (5.7)	約10
					(B) 10.0	12.2	1.3										
ﾁﾄｿﾞｰﾙ 0.5g	ﾁｱﾐﾗｰﾙ ﾅﾄﾘｳﾑ 0.5g/20mL (添付溶解液に溶解)	静注	10.5～11.5	10.9	(A) 1.8	9.3	1.6	白濁	9.2 +	+	+	+	8.9 ±	+	+	+ (5.7)	約10
					(B) 10.0	12.1	1.2										

＊：規格pH域：製造承認書に記載された値を示す。

＊：試料pHは実験に供した注射薬のpHで、用時溶解して用いる注射薬では、一般名または成分単位／容量に記入された条件におけるpHを示す。

＊：pH変動：0.1mol/L HClを（A）、0.1mol/L NaOHを（B）とし、滴加mL数を記入してある。10mLをもって限度とし、次に最終または変化点pHを記入、移動指数は試料pHとこれらの差で示される。

＊：変化所見で全く変化のないものは空白とした。

＊：希釈試験における20mL、500mLの0時の数値は希釈直後のpH、500mLの3hの欄の（　）内の数値は使用した蒸留水のpHを示す。＋は外観変化の認められるもの、－は外観変化の認められないもの、すなわち、再び澄明となったことを意味する。＋－±といった形で変化の状態を表した。

＊：浸透圧比は氷点降下法により測定し、0.9%生理食塩液（286mOsm）を1として比で表した。

９．溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

(2) 包装

チトゾール注用 0.3g：

50 バイアル［溶解液 12mL、50 アンプル添付］

チトゾール注用 0.5g：

50 バイアル［溶解液 20mL、50 アンプル添付］

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

透明のガラス

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

Ⅴ．治療に関する項目

１．効能又は効果

4. 効能又は効果
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

２．効能又は効果に関連する注意

設定されていない

３．用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

〈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、大体の基準は次のとおり。

6.1 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、応答がなくなったときの注入量を就眠量とする。更に就眠量の半量ないし同量を追加注入した後、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。

6.2 短時間麻酔

6.2.1 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 秒ぐらいの速度で注入後 30 秒間、麻酔の程度、患者の全身状態を観察する。更に必要ならば 2～3mL を同速度で注入し、患者の応答のなくなったときの注入量を就眠量とする。なお、手術に先立ち、更に 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。

6.2.2 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）。

6.3 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後、直ちに電撃療法を行う。

6.4 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。

6.5 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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

４．用法及び用量に関連する注意

設定されていない

５．臨床成績

(1)臨床データパッケージ

該当しない

(2)臨床薬理試験

該当資料なし

(3)用量反応探索試験

該当資料なし

(4)検証的試験

1）有効性検証試験

該当資料なし

2）安全性試験

該当資料なし

(5)患者・病態別試験

臨床試験を集計した資料がないため、公表文献の中から参考文献の要約を紹介する。

1)全身麻酔の導入

① ASA（American Society of anesthesiologists）Ⅰ～Ⅱの患者10名に、チアミラール5mg/kgを約15秒の速さで静脈内投与した結果、30秒以内に全例睫毛反射、呼名反応の消失が認められた[2)]。

② ASAクラスⅠの手術患者20名を2群に分け、1群はリドカイン1.5mg/kg静注、チアミラール2mg/kg投与で就眠させた後、チアミラール4mg/kg追加投与、サクシニルコリン1mg/kgで気管内挿管する方法（2回投与法）を、もう1群はリドカイン 1.5mg/kg静注、チアミラール5mg/kg及びサクシニルコリン1mg/kg投与で気管内挿管する方法（1回投与法）を行い、循環変動を比較した。
その結果、気管内挿管により血圧及び心拍数はともに上昇したが、2回投与群における変化は1回投与群に比較して有意に少なかった[3)]。

2)短時間麻酔

子宮内容除去術（D&C）を行った55例中、サイアミラール法（サイアミラール＋ペンタゾシン）16例、NLA変法（ミダゾラム＋ペンタゾシン）21例、ケタミン法（ケタミン＋ジアゼパム）18例において、心拍数、収縮期血圧、拡張期血圧、呼吸数、呼気終末炭酸ガス濃度、動脈血酸素飽和度を術前・術中・術後に測定し、その安全性、有用性につき検討した。
その結果、術中・術後の呼吸抑制が最小であり、また、3群中では最も鎮静効果が強いケタミン法が最良と考えた。サイアミラール法は、術中・術後の呼吸抑制が強く、手術時間とともに鎮静度の低下と血圧上昇が起こった。NLA変法は術中鎮静が不良であり、しかも呼吸抑制、循環抑制が強かった[4)]。

3)併用療法

① 局所麻酔剤との併用

52名53眼の局所麻酔手術患者に、チアミラール（高齢者では2mg/kg、比較的若年者で体格の良い者では2～3mg/kg）を静注し、患者が呼名に反応しなくなった時点で局所麻酔を施行した。
局所麻酔としては、2%リドカインと0.5%ブピバカインの等量混合液を用い、Van Lint法またはO'Brien法による瞬目麻酔と球後麻酔を行った。その結果、局所的、全身的に大きな副作用もなく、患者のほとんどが、局所麻酔時の疼痛を自覚しなかった[5)]。

② 吸入麻酔剤との併用

術中脳虚血発生が予測された6例の脳血管外科手術において、チアミラール麻酔を併用した。
麻酔方法は、全例アトロピン0.1mg/kg、ハイドロキシジン1mg/kgを前投薬として使用した。麻酔導入はフ

ェンタニール前投与後、チアミラールで行い、筋弛緩薬を投与後気管内挿管した。維持は GOE（笑気エーテル麻酔）で行った。頸動脈血流遮断中は、Michenfelder らの方法を改変したチアミラール麻酔を次のように行った。

ア．連続脳波モニター下にまず burst-suppression をきたすに十分な量のチアミラール（3～5mg/kg）を静注する。

イ．維持量として持続静注量約 10mg/kg/h を投与する。

ウ．脳波上 15～30 秒間隔の burst-suppression が認められることを目標として必要に応じ間歇的にチアミラールを追加静注する（1～2mg/kg）。

エ．血圧低下に対してはドパミン、ドブタミンを使用し、チアミラール使用前の値を維持する。

その結果、チアミラール投与量は導入に 4.3～8.7mg/kg、維持には 5～26mg/kg/h を要した。術中の経過はチアミラール使用前後で血圧の著明な変動はみられず、術中昇圧薬としてドパミン 2～10μg/kg/h、ドブタミン 2μg/kg/h 程度で血圧を維持しえた。

チアミラール麻酔後の覚醒状況、合併症及び予後では、覚醒は各症例とも 6～9 時間程度を要し、術後は 1 例を除き著明な合併症はみられなかった。予後においては、いずれも術中 stroke の発生はなく良好であった [6)]。

4)痙攣時の使用

① 破傷風に伴う痙攣

開口障害から全身痙攣発作が起こるまでの onset time が 24 時間以内の重症破傷風患者（女、54 歳）で、ジアゼパム、フェノバルビタール投与にてコントロールしえなかった痙攣に対し、大量のチアミラール（2～4mg/kg/h、投与期間 19 日、総投与量 50,000mg）を用い良好な結果を得たとの報告がある [7)]。

② 子癇等に伴う痙攣

妊娠中毒症の明らかな既往のない患者（22 歳）で、妊娠 40 週目に、突然、発熱（38℃）、頭痛、続いて眼華閃発がおこり、数時間後に全身性の間代性・強直性痙攣が出現した。その後も、全身痙攣および興奮状態を繰り返し、治療薬としてジアゼパム、クロルプロマジン等が投与されたが、一時的な効果しか得られなかった。緊急帝王切開術が行われたが、その後も痙攣発作が続くため、大量バルビタール療法（チアミラール 4mg/kg/h）を 19 時間行った。以後痙攣発作は消失したが、意識障害、視力喪失は改善されないため、低酸素脳症が疑われた。そこで、高圧酸素療法をステロイド、グリセオール併用下に行い、意識および視力の改善が得られ、何らの障害も残さずに退院した症例報告がある [8)]。

(6)治療的使用

1)使用成績調査(一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

(7)その他

該当資料なし

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

１．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

バルビツール酸系化合物等

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

２．薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

作用部位：中枢神経[9)]

作用機序：バルビツール酸誘導体としての共通の作用機序により鎮静、催眠作用を現す。すなわち、$GABA_A$受容体のサブユニットに存在するバルビツール酸誘導体結合部位に結合することにより、抑制性伝達物質 GABA の受容体親和性を高め、Cl^-チャネル開口作用を増強して神経機能抑制作用を促進する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

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）[1)]。
2) 神経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（外国人データ）[10)]。

(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

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

チアミラールをおよそ 5mg/kg の見当で約 10～20 秒かけて静脈内投与した時の血中濃度推移は以下の通りであった[11)]。

	投与後時間								
	1 分	5 分	10 分	20 分	30 分	1 時間	2 時間	3 時間	6 時間
成人群 （平均 35 歳、n＝7）	26.1	13.1	11.1	8.9	7.1	5.2	3.2	2.1	1.8
高齢者群 （平均 68 歳、n＝7）	42.6	14.5	11.1	8.2	6.3	4.6	2.8	2.3	1.7

（単位：μg/mL）

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当しない

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

全身クリアランス：0.673 L/kg/h（4.68mg/kg、静注）
0.688 L/kg/h（5.0mg/kg、静注）

(5) 分布容積

1.823 L/kg（4.68mg/kg、静注）
1.081 L/kg（5.0mg/kg、静注）

(6) その他

該当しない

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

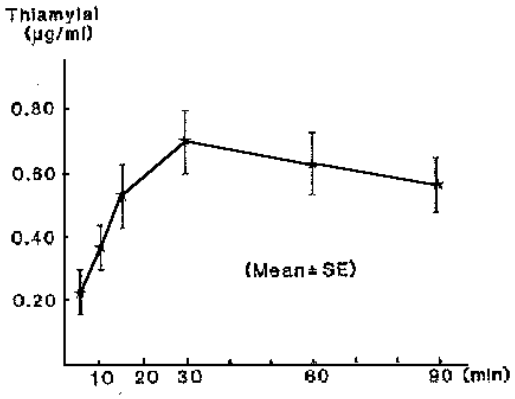
4. 吸収

1) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

2) 吸収部位、吸収率

破裂脳動脈瘤根治術の約1ヵ月後に、続発性水頭症に対し、V－Pシャント造設が実施された7名にチアミラール5mg/kg静注した時の脳室脳脊髄液中の推移は下図の通りであった[14]。



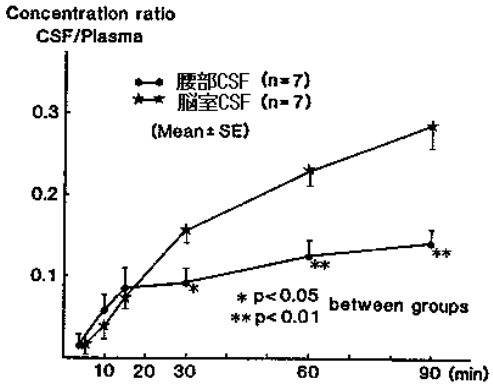
3) 腸肝循環

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

チアミラール5mg/kg静注後の腰部及び脳室脳脊髄液(CSF)濃度／血漿濃度比は下図の通りであった[14]。



(2) 血液－胎盤関門通過性

帝王切開手術の患者に2.5%チアミラールナトリウム4mg/kgを20秒間で静脈内投与した場合、母体の血中濃度は1分以内に最高に達し、胎児移行濃度の最も高い時期は投与開始後1～2分間であった。また、母親と胎児の血中チアミラールナトリウムの濃度平衡は2～3分、遅くとも4分以内に成立した[15),16)]。

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

「Ⅶ.薬物動態に関する項目 4.吸収」の項参照

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

［参考］

家兎にチアミラールナトリウム 20mg/kg を静脈内投与 5 分後の各組織の濃度は肝臓、副腎、腎臓、心筋及び筋肉組織の順に高かった[17]。

(6) 血漿蛋白結合率

血清蛋白結合率はチアミラール濃度 5 及び 25μg/mL のとき、それぞれ 90.9 及び 89.7%であった。

６．代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（ＣＹＰ等）の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

［参考］

家兎に静脈内投与した場合の尿中代謝物はチアミラール・カルボキシル酸、セコバルビタール、ヒドロキシチアミラールである[18]。

７．排泄

該当資料なし

［参考］

家兎に静脈内投与すると中枢神経、肝、腎などの各組織に分布した後、急激に減少する。麻酔から覚醒後も脂肪組織ではチアミラールの増加がみられるのは、各組織から脂肪組織への再配分が起こり、徐々に排泄されていくと思われる[17]。

８．トランスポーターに関する情報

該当資料なし

９．透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当しない

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

設定されていない

２．禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）
2.1 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。］［11.1.1 参照］
2.2 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。］
2.3 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。］
2.4 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。］
2.5 バルビツール酸系薬物に対する過敏症の患者［9.1.7 参照］

［解説］
2.1：（「Ⅷ.8.(1)重大な副作用と初期症状」の項参照）
2.5：バルビツール酸系薬物に対する過敏症を有する患者では、化学構造が類似した本剤でも過敏症を発現するおそれがある[19]ため、設定した。（「Ⅷ.6.(1)合併症・既往歴等のある患者」の項参照）

３．効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

４．用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

５．重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意
8.1 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。
8.2 麻酔を行う際には原則として麻酔前投薬を行うこと。［14.1.4 参照］
8.3 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。［11.1.1、11.1.2 参照］
8.4 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。
8.5 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。［11.1.1、11.1.2 参照］

［解説］
8.1：麻酔時には肺内への胃内容物の誤嚥（引）により嚥下性（誤引性）肺炎（aspiration pneumonia）を引き起こす危険性があるので、麻酔開始前、及び麻酔終了後一定期間経口摂取を制限するのが原則である[20]。
8.2：麻酔前の患者の不安を軽減するとともに、麻酔の導入・維持を安全かつ円滑に行うため[20]。（「Ⅷ.11.適用上の注意」の項参照）
8.3：麻酔薬は中枢神経系、心・循環系、呼吸系に対して抑制的に作用するため、麻酔管理のうえで経時的・連続的監視が必要である[20]。（「Ⅷ.8.(1)重大な副作用と初期症状」の項参照）
8.4：チオペンタールで用量相関的に呼吸抑制を発現することが認められており、麻酔の深度の増強によって本剤でも同様のおそれがある[21]。
8.5：静脈麻酔薬の多くは呼吸や心・血管系への影響が比較的大きく、その投与には、不慮の場合に備え十分な

準備と注意が必要である[20]。（「Ⅷ.8.(1)重大な副作用と初期症状」の項参照）

６．特定の背景を有する患者に関する注意

(1)合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 重症糖尿病の患者

糖尿病を悪化させるおそれがある。

9.1.2 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。

9.1.3 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。

9.1.4 脳圧上昇時

呼吸抑制や気道閉塞により血中のCO_2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。

9.1.5 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。

9.1.6 電解質アンバランス時（特にカリウム中毒の患者）

血中カリウム値が上昇するおそれがある。

9.1.7 薬物過敏症の患者（バルビツール酸系薬物に対する過敏症の患者を除く）

［2.5参照］

［解説］

9.1.7：薬物過敏症の患者（バルビツール酸系薬物に対する過敏症を有する患者を除く）では、一般に再投与により再び過敏症を発症する可能性が高いため、設定した。（Ⅷ.2.禁忌内容とその理由」の項参照）

(2)腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重症腎障害のある患者

排泄の遅延により、本剤の作用が増強するおそれがある。

(3)肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重症肝障害のある患者

代謝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。

(4)生殖能を有する者

設定されていない

(5)妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないことが望ましい。マウスで催奇形性が認められている。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。ヒトで胎児に移行することが報告されている[15)、16)]。

［解説］

（「Ⅶ.5.(2)血液－胎盤関門通過性」及び「Ⅸ.2.(5)生殖発生毒性試験」の項参照）

(6)授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。［14.1.1 参照］

［解説］

（「Ⅷ.11.適用上の注意」の項参照）

(8) 高齢者

9.8 高齢者

呼吸抑制、血圧降下等が強くあらわれることがある。一般に生理機能が低下している。［14.1.1 参照］

7．相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 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。	
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		
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。	
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。

８．副作用

11.副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1)重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 **ショック**（頻度不明）

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。[2.1、8.3、8.5 参照]

11.1.2 **呼吸停止、呼吸抑制**（頻度不明）

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。[8.3、8.5 参照]

[解説]

11.1.1：(「Ⅷ.2.禁忌内容とその理由」及び「Ⅷ.5.重要な基本的注意とその理由」の項参照)

11.1.2：(「Ⅷ.5.重要な基本的注意とその理由」の項参照)

(2)その他の副作用

11.2 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

９．臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

14.1.1 注射速度

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。[9.7、9.8 参照]

14.1.2 投与経路

以下の点に注意すること。

・静脈内投与により血栓性静脈炎を起こすことがある。

・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。

・皮下には決して投与しないこと。

・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注意すること。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。

14.1.3 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。

14.1.4 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ベラドンナ系薬剤を投与することが望ましい。[8.2 参照]

14.1.5 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。

[解説]

14.1.1：（**「Ⅷ.6.(7)小児等」及び「Ⅷ.6.(8)高齢者」の項参照**）

14.1.4：（**「Ⅷ.6.(2)腎機能障害患者」の項参照**）

12. その他の注意

(1)臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2)非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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」の項参照

(2) 安全性薬理試験

イヌに人工呼吸下でチアミラールナトリウムを投与した場合、自発呼吸下での投与量の 1.5～3.5 倍量まで忍容する。自発呼吸下で致死量を投与すればしばしば不整脈が発現する。最終的には呼吸が停止し、ついで突然血圧下降をきたし、心拍動が停止する。人工呼吸下で致死量を投与すれば血圧は長時間正常に保たれた後、ショックレベルまで徐々に下降し、まもなく死亡する[22]。

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

２．毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

動物種＼投与経路	LD_{50} (mg/kg)
	静 脈 内
ラ　ッ　ト	65
家　　兎	26.9
イ　　ヌ	36.3

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

妊娠 10 日目のマウスにチアミラールナトリウム 20、40、60、80、100、120、140mg/kg を 1 回腹腔内投与した実験で、20mg/kg 以上で胎児の発育抑制、40mg/kg 以上で死亡率の上昇、60mg/kg 以上で少数の奇形（軽度の内反足又は外反足等）がみられた[24]。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) 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：劇薬、習慣性医薬品[注1)]、処方箋医薬品[注2)]

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

有効成分：劇薬、習慣性医薬品

２．有効期間

5年

３．包装状態での貯法

室温保存

４．取扱い上の注意

設定されていない

５．患者向け資材

くすりのしおり：なし

患者向医薬品ガイド：なし

その他の患者向け資材：なし

６．同一成分・同効薬

同一成分薬：イソゾール注射用0.5g

同　効　薬：注射用チオペンタールナトリウム（ラボナール）等

７．国際誕生年月日

不明

８．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

チトゾール注用0.3g、チトゾール注用0.5g

履　歴	製造販売承認年月日	承　認　番　号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
（旧販売名） チトゾール0.3g チトゾール0.5g	1959年9月22日	（東薬）第6527号	1987年10月1日	1957年12月1日
（販売名変更） チトゾール注用0.3g チトゾール注用0.5g	2008年10月15日	22000AMX02393000 22000AMX02394000	2008年12月19日	1957年12月1日

※本剤は1960年6月1日薬価基準収載されたが、1987年3月第11改正日本薬局方の制定に伴い、日本薬局方収載品目となったため、1987年10月1日新たに日本薬局方医薬品として薬価基準へ収載された。

2007年7月6日にバイアル品として薬価基準へ収載されたのち、2008年12月に「医薬品関連医療事故防止

対策の強化・徹底について（平成 16 年 6 月 2 日付　薬食発第 0602009 号)」に基づき、販売名変更により薬価基準収載された。

９．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

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価：1974年11月20日（その3）
内　容：カテゴリー1（変化なし）

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	個別医薬品コード（YJ コード）	HOT（9 桁）番号	レセプト電算処理システム用コード
チトゾール注用 0.3g	1115403D4015（バイアル）	1115403D4031	118113501	620009266
チトゾール注用 0.5g	1115403D3019（バイアル）	1115403D3051	116999703	620009267

14. 保険給付上の注意

該当しない

ＸＩ．文献

１．引用文献

1) Wyngaarden, J.B., et al. :J. Pharmacol. Exp. Ther. 1949 ;95(3) :322-327 (PMID :18114531)
2) 樫本温, 他 :日本臨床麻酔学会誌. 1986 ;6(2) :179-182
3) 西川俊昭, 他 :臨床麻酔. 1988 ;12(4) :509-510
4) 上山博史, 他 :大阪府立母子医療センター雑誌. 1991 ;6(2) :31-36
5) 河野佐代子, 他 :眼科臨床医報. 1989 ;83(11) :2277-2280
6) 新野清人, 他 :臨床麻酔. 1990 ;14(4) :583-586
7) 武山直志, 他 :救急医学. 1983 ;7(4) :501-506
8) 今泉均, 他 :ICU と CCU. 1985 ;9(12) :1275-1280
9) 田中潔, 編 :現代の薬理学全訂第 15 版, 金原出版. 1988 :56-68
10) Brown, E.O.Jr. :A. M. A. Arch. Neurol. Psychiatry. 1952 ;68(1) :43-47 (PMID :14932545)
11) 江崎公明, 他 :麻酔. 1986 ;35(9S) :S366-S366
12) 中村昭三郎, 他 :函医誌. 1984 ;8(1) :16-22
13) 松下和裕, 他 :チアミラールのヒト血清タンパク結合率の測定(社内資料)
14) 半澤辰夫, 他 :札幌医誌. 1986 ;55(3) :201-214
15) 小坂義弘, 他 :広島医学. 1966 ;19(7) :626-636
16) 小坂義弘, 他 :広島医学. 1966 ;19(8) :739-745
17) 難波真木二 :札幌医誌. 1959 ;16(2) :137-151
18) Tsukamoto, H., et al. :Chem. Pharm. Bull. 1963 ;11(4) :427-430
19) 大久保滉 :臨床と研究. 1974 ;51(5) :1231-1236
20) 高橋長雄, 編 :NEW 麻酔科学, 南江堂. 1990 :25-29, 31-33, 75-83, 172-185
21) 藤原元始, 他 :グッドマン・ギルマン薬理書 第 8 版, 廣川書店. ;1992 :355-358
22) Woods, L.A., et al. :J. Pharmacol. Exp. Ther. 1949 ;95(3) :328-335 (PMID :18114532)
23) Swanson, E.E. :J. Pharm. Pharmacol. 1951 ;3(2) :112-116 (PMID :14825094)
24) 谷村孝 :解剖学雑誌. 1965 ;40(6) :323-328

２．その他の参考文献

なし

ＸⅡ．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

該当資料なし

ＸⅢ．備考

その他の関連資料

1）弊社インターネットサイト

・医療従事者向けサイト

（添付文書、インタビューフォーム、剤形写真、お知らせ、製品コード等）

https://www.kyorin-pharm.co.jp/prodinfo/

製造販売元
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