

## ▼プレセデックス静注液・○デクスメドミジン静注液シリンジ [注]

【重要度】★ 【一般製剤名】デクスメドミジン塩酸塩 Dexmedetomidine Hydrochloride 【分類】 $\alpha$ 2 作動性鎮静剤

【単位】▼200  $\mu$ g/V (2mL) [0.01%], ○200  $\mu$ g/50mL シリンジ

【常用量】

集中治療における人工呼吸中及び離脱後の鎮静、局所麻酔下における非挿管での手術及び処置時の鎮静に適用

■導入：初回負荷として 6  $\mu$ g/kg/hr で 10 分間静注

■維持量：0.2～0.7  $\mu$ g/kg/hr [維持開始速度は 0.4  $\mu$ g/kg/hr 目安]

初回負荷時の血圧上昇に注意 [末梢血管収縮作用による一過性の血圧上昇] (ICU での使用では場合により負荷しないことも選択)

※シリンジ製剤 (4  $\mu$ g/mL) を 50kg 患者に適用する場合

負荷量 12.5mL/hr に設定して 10 分間 (50  $\mu$ g), 維持量 2.5～8.7mL/hr (10～35  $\mu$ g/hr) で設定

【用法】持続静注

■バイアルは生食 48mL に 2mL (200  $\mu$ g) を混和し、静かに振盪し十分に混和

■人工呼吸中、離脱過程及び離脱後を通じて投与可能であるが、本剤の持続投与期間が 5 日 (成人) を超える使用経験は少ない

【透析患者への投与方法】代謝物が蓄積する可能性があるため長期投与时は慎重投与 (1)

PK は腎機能正常者と変わらない (Zhong W, et al: J Clin Pharm Ther 2018 PMID: 29247451)

術前適用でプロポフォール使用量が減る (Ergenoglu P, et al: Braz J Anesthesiol 2015 PMID: 26323728)

【PD】腰椎麻酔と併用で PD カテーテル留置術の麻酔に適用できる (Fukunaga T, et al: Clin Exp Nephrol 2022 PMID: 35275296, Nakayama T, et al: Int Urol Nephrol 2022 PMID: 34143371)

【保存期 CKD 患者への投与方法】代謝物が蓄積する可能性があるため慎重投与 (1)

【その他の報告】Vd やクリアランスには腎機能正常者と有意差を認めず消失半減期は腎障害患者でやや短縮したが、鎮静作用は腎障害患者で長くなった (De Wolf AM, et al: Anesth Analg 2001 PMID: 11682398)

【特徴】メドミジンの D 体の選択的中枢性  $\alpha$ 2 受容体作動薬で、脳橋の背外側部にある青斑核に存在する中枢性  $\alpha$ 2A 受容体を介して鎮静作用を発現する。呼吸抑制をほとんど認めない。鎮静作用の他に、脊髄や延髄に存在する  $\alpha$ 2A 受容体を刺激して、鎮痛、血圧低下、心拍数低下、末梢血管収縮などの作用をもたらす、ストレスや侵害刺激による交感神経系の亢進を緩和する方向に作用する。沈静中にも認知機能を維持できる。鎮痛作用は強くないが、他の鎮痛薬の使用量を低減できる。

【主な副作用・毒性】低血圧、高血圧、徐脈、嘔気、口腔乾燥、不整脈など。薬剤離脱症候群が発現することがあるので、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。

【安全性に関する情報】術後 AKI に関連せず [むしろ保護的] (Loomba RS, et al: J Clin Pharm Ther 2022 PMID: 34510502)

【吸収】筋注での吸収は線形 (Scheinin H, et al: Clin Pharmacol Ther 52: 537-46, 1992)

【F】筋注の F は 73±11% (Dyck JB, et al: Anesthesiology 78: 813-20, 1993) 経口投与で平均 16%, 口腔内投与 (バツカル) で平均 82%, 筋注で平均 104%であり、口腔粘膜からの吸収は比較的高い (Anttila M, et al: Br J Clin Pharmacol 56: 691-3, 2003)

経粘膜 11% (Dent BT, et al: Am J Vet Res 2019 PMID: 31556717) 経口 7% (Chamadia S, et al: Anesthesiology 2020 PMID: 32986820)

【代謝】2 種の N-グルクロニドに代謝され、その割合は血漿中の 41% を占める (1) 肝クリアランスは大きい (1) N-グルクロニドを含め、活性代謝物は認められていない (1) CYP も代謝に関与し、CYP2A6 が主で、その他に 2E1, 2D6, 3A4, 2C9 も関与している可能性がある (1)

【排泄】尿中に未変化体は検出されず、グルクロン酸抱合体として 85% が尿中に回収 [24hr まで] (1)

【CL】29.98～35.98L/hr (1) 0.7～0.9L/hr/kg [im] (Scheinin H, et al: Clin Pharmacol Ther 52:537-546, 1992) 48.3L/hr (Venn RM, et al: Br J Anaesth 88: 669-75, 2002) 34.7L/hr (Ber J, et al: J Clin Pharmacol 2020 PMID: 32500578)

【t1/2】 $\alpha$  相 6min,  $\beta$  相約 2hr (1) 2.39±0.71hr (1) 1.6～2.4hr [im] (Scheinin H, et al: Clin Pharmacol Ther 52: 537-46, 1992) 1.9±0.62hr (Dutta S, et al: J Pharm Sci 89:519-527,2000) t1/2  $\alpha$  : 8.6min, t1/2  $\beta$  : 3.14hr (Venn RM, et al: Br J Anaesth 88: 669-75, 2002) 【ke】0.238～0.330L/hr (1)

【蛋白結合率】94%以上 (1)

【Vd】Vss 85～100L/man [健康成人] (1) 1.54±0.983L/kg (1) 2.1～2.6L/kg (Scheinin H, et al: Clin Pharmacol Ther 52: 537-46, 1992) 72±19L/man (Dutta S, et al: J Pharm Sci 89: 519-27, 2000) Vss 173L (Venn RM, et al: Br J Anaesth 88: 669-75, 2002)

【MW】236.74

【透析性】資料なし (1) 蛋白結合率が高くほとんど透析されないとと思われるが、全身クリアランスが大きいので結局 HD の寄与率は小さい (5)

【薬物動態】2 相性に消失 (Dyck JB, et al: Anesthesiology 78:813-820, 1993)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない。適切な鎮静状態は血漿濃度 0.3~1.25ng/mL で得られる (1)

【O/W係数】 $\log P=2.89$  (1)

【主な臨床報告】尿毒症性中枢症状治療に有用であった症例 (Nomoto K, et al: J Clin Anesth 2011 PMID: 22137518)

【備考】1%ディプリバン注との配合変化は認めない (1) 併用時にはプロポフォールが必要量が減る結果になる可能性がある (Dutta S, et al: J Pharm Sci 90:172-181, 2001) 負荷量 2.5  $\mu\text{g}/\text{kg}/\text{hr}$  で 10 分投与し、以後 0.7  $\mu\text{g}/\text{kg}/\text{hr}$  の持続静注は ICU での鎮静に効果的であった (Venn RM, et al: Br J Anaesth 88:669-675, 2002)

【更新日】20231129

---

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。