

## ◎1%ディプリバン注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】プロポフォール (U) Propofol 【分類】全身麻酔・鎮静剤

【単位】◎200mg/A [20mL], ◎500mg/キット [50mL]

【常用量】■全身麻酔の導入・維持：0.05mL/kg/10秒の速度で静注し、効果があるまで投与する。維持量は0.4~1.0mL/kg/hr [4~10mg/kg/hr]

■集中治療における人工呼吸中の鎮静：0.03mL/kg/hr で開始し、0.3mL/kg/hr までで調節 [0.3~3.0mg/kg/hr]

【用法】静注または持続静注。鎮静には急速静注しない。最長7日まで。5%ブドウ糖に希釈してもよいが、5倍以下として6hr以内に使用。

【透析患者への投与方法】腎クリアランスは全身クリアランスにほとんど寄与していないため減量の必要はない (3, Postgraduate Med J 61(S3): 62-3,1985)

【保存期 CKD 患者への投与方法】減量の必要なし (3,12)

【その他の報告】PK は腎障害の影響を受けない (1)

【特徴】体内での分布及び代謝が速やかなため麻酔導入が速やかで、投与終了後の意識の回復も早い。蓄積作用が少なく、麻酔深度及び鎮静深度の調節性も良好なことから、麻酔導入のみならず麻酔維持及び集中治療における人工呼吸中の鎮静にも使用できる。吸入麻酔剤による麻酔維持の場合と同程度の循環動態を維持できる。

【主な副作用・毒性】低血圧、心拍数低下、一過性無呼吸、気管支痙攣、アナフィラキシー、てんかん様体動、重篤な徐脈、肺水腫、覚醒遅延、心室頻拍、発赤、血管痛、ST 低下、振戦、静脈炎、血栓症、頭痛、悪心、嘔吐、口腔内分泌物増加、変色尿 (白濁、緑尿)、しびれ感、術後発熱など。

【安全性に関する情報】長期投与時には添加物の EDTA による亜鉛欠乏の可能性 (1) 血清脂質、リンの上昇に注意 (1) 卵、大豆、ココナッツアレルギー患者に注意 (1)

【tmax】約2時間後で定常状態時血中濃度の85% (1)

【代謝】肝。主としてグルクロナール転移酵素によるグルクロナール酸抱合で代謝され、主代謝物には活性はない (1,U) 主な尿中代謝物は1,4-キノール体のグルクロナール酸抱合体、1,4-キノール体の硫酸抱合体 (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率0.3% (11) 0.3%未満 (12) ほとんどが代謝物として尿中に排泄され、尿中回収率68.3% [iv, 24hr まで] (1) 尿中回収率88%でほとんどが代謝物 [iv, 120hr まで] (11) 糞便中排泄率2%以下 (11)

【CL】1.62L/min と大きく、肝血流量流速 (1) 2.2L/min と肝血流よりも大きく、肝外での消失もある (11) CL は体温が高いと上昇、TG が高いと低下 (Knibbe CA, et al: Clin Pharmacol Ther 72: 670-84, 2002 PMID: 12496748) 心疾患患者では CL が 38%低下するので用量を減らす必要がある (Peeters MYM, et al: Clin Pharmacol Ther 83: 443-51, 2008)

【t1/2】α相 2.6min, β相 51.0min, γ相 365min (1) α相 2~4min, β相 30~64min, γ相 3~12hr (U) α相 2~4min (筋肉や脂肪に分布する時間)、β相 30~60min (代謝される時間)、γ相 184~502min (移行しにくい臓器からゆっくりと血漿内に戻ってきて消失する時間) (11) 1.5hr (12) 【腎不全患者の t1/2】16.8hr (12)

【蛋白結合率】約97~99% (1) 97~98% (11) 96~99% (12) 95~99% (U)

【Vd】Vc=26L/man, Vss=317L/man (1) 297~1100L/man (11) 8~19L/kg (12) 初期のみかみナ 13~76L/man, 定常状態 171~349L/man, 消失相 209~1008L/man (U)

【分布】速やかに脳内に移行し、2.9min で血漿濃度と脳内濃度が平衡状態になる。脳内濃度は血漿濃度の2倍 (11)

【MW】178.27

【透析性】ろ過されない (1) 透析されないと思われる (5)

【TDM のポイント】TDM の対象にならない

【薬物動態】2.5mg/kg の静注投与で Cmax は 8μg/mL になる。睡眠に必要な血漿濃度は 1μg/mL 以下。持続静注により 20 分で血漿濃度は定常状態に達する。投与が中止されると 10 分で血漿濃度は 1/2 に低下する。最終相半減期は長い静注に際して考慮する必要はない (11) 肥満患者では LBW が用量設定により適切 (Ingrande J, et al: Anesth Analg 113: 57-62, 2011) 2-compartment model で記述され、治療濃度には個人差が大きい (Knibbe CA, et al: Clin Pharmacol Ther 72: 670-84, 2002 PMID: 12496748)

【O/W 係数】5000 (11) 水にほとんど溶けず、ほぼ有機層に分配 [1-オクタノール水系] (1) 【pKa】11.05 (1)

【相互作用】鎮静作用の増強に注意 (1)

【備考】DEHP free の輸液セットを使用 (1) フィルターを通さない (1) 1%ディプリバン 1mL 中 精製卵黄レシチン 12mg 配合されておりレシチン中のリン含有量は 3.5~4.2% である。ディプリバン中のリン含有量に換算すると、およそ 0.05% となり、リンとして 0.5mg/mL (50mL 中投与で 25mg のリン負荷) (1) 12hr 以上連続して使用する場合は、本体およびレートを交換する [12hr 毎に交換] (1)

【更新日】20211202

※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、当院では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・配付を禁じます。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。