

麻薬拮抗剤

日本薬局方 レバロルフアン酒石酸塩注射液

ロルファン®注射液1mg**LORFAN® INJECTION**貯法：室温保存
有効期間：3年

日本標準商品分類番号	
872213	
承認番号	販売開始
21800AMX10450	1961年1月

処方箋医薬品^{注)}

注)注意 - 医師等の処方箋により使用すること

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- 2.1 呼吸抑制が緩徐な患者[無効である。]
- 2.2 バルビツール系薬剤等の非麻薬性中枢神経抑制剤又は病的
原因による呼吸抑制のある患者[無効である。]
- 2.3 麻薬依存患者[禁断症状を起こすことがある。]

3. 組成・性状**3.1 組成**

販売名	ロルファン注射液1mg
有効成分	1アンプル(1mL)中：レバロルフアン酒石酸塩 1mg
添加剤	1アンプル(1mL)中：塩化ナトリウム(9mg)、パラオキシ安息香酸プロピル(0.1mg)、パラオキシ安息香酸メチル(0.8mg)

3.2 製剤の性状

販売名	ロルファン注射液1mg
色・剤形	無色澄明の液
pH	3.0~4.5
浸透圧比	約1(生理食塩液に対する比)

4. 効能又は効果**麻薬による呼吸抑制に対する拮抗****6. 用法及び用量**

麻薬投与前後あるいは投与と同時に皮下、筋肉内、又は静脈内注射する。

投与される麻薬の種類、用法、用量等に応じて種々の投与方法を行うが、一般に次の投与方法が適当である。

投与量比率

レボルファノール/レバロルフアン酒石酸塩 10 : 1

〔皮下又は静脈内注射
例……レボルファノール3mg及び
レバロルフアン酒石酸塩0.3mg〕

モルヒネ/レバロルフアン酒石酸塩 50 : 1

〔皮下又は静脈内注射
例……モルヒネ15mg及び
レバロルフアン酒石酸塩0.3mg〕

アルファプロジン塩酸塩/レバロルフアン酒石酸塩 50 : 1

〔皮下又は静脈内注射
例……アルファプロジン塩酸塩60mg及び
レバロルフアン酒石酸塩1.2mg〕

ベチジン塩酸塩/レバロルフアン酒石酸塩 100 : 1

〔筋肉内又は静脈内注射
例……ベチジン塩酸塩100mg及び
レバロルフアン酒石酸塩1mg〕

(1)産科的応用

- 麻薬投与による母体及び胎児の呼吸抑制の予防
レバロルフアン酒石酸塩はそれぞれ適当な比率で麻薬と同時に皮下あるいは筋肉内注射し、以後は必要に応じて30分以上の間隔で各1/2量を投与する。

- 分娩時麻薬によって起こる新生児の呼吸抑制の予防(レバロルフアン酒石酸塩を麻薬と併用していない場合)
分娩前5~10分にレバロルフアン酒石酸塩1~2mgを静脈内注射する。
- 新生児の麻薬による呼吸抑制の治療
分娩後直ちに臍帯静脈にレバロルフアン酒石酸塩0.05~0.1mgを注射する。
- 産婦の麻薬による呼吸抑制の治療
(4)の用法・用量に準ずる。
- (2)補助薬として麻薬を用いた麻酔
- 麻薬による呼吸抑制の治療
レバロルフアン酒石酸塩0.5~1.5mgを静脈内注射する。
- 麻薬による呼吸抑制の予防
レバロルフアン酒石酸塩を適当な比率で麻薬と共与、あるいは麻薬投与の4~6分前に静脈内注射する。
投与後の呼吸機能が十分であれば更にレバロルフアン酒石酸塩を投与する必要はないが、長時間にわたる手術あるいは麻酔終了時患者の呼吸機能が不十分であれば、更にレバロルフアン酒石酸塩0.4~0.6mgを1~数回投与する。
- (3)術前・術後又は内科での麻薬投与時
術前・術後の疼痛緩解のため及び内科患者に麻薬を投与した時に起こる呼吸抑制の予防には、必要に応じ、適当な比率で麻薬と同時に皮下あるいは筋肉内注射する。
- (4)成人の麻薬過量投与による呼吸抑制の治療
- 過剰量が不明の場合
レバロルフアン酒石酸塩1mgを静脈内注射し、効果が現れれば更に必要に応じて3分間隔で0.5mgを1~2回投与する。
- 麻薬及びその過剰量がわかっている場合
適当な比率で静脈内注射し、必要があれば次いで3分間隔でその1/2量ずつ1~2回投与する。

8. 重要な基本的注意

麻薬による著明な呼吸抑制の患者に投与する場合には、人工呼吸を行うなど、適当な処置を併せて行うこと。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意**9.5 妊婦**

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

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。

9.7 小児等

新生児仮死状態に投与した場合、易刺激性及び啼泣増大傾向があらわれることがある。

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 呼吸抑制(頻度不明)

反復投与した場合、効力が減少し、呼吸抑制を起こすおそれがある。単独投与により、呼吸抑制を起こすことがある。

11.1.2 幻視、もうろう状態、見当識障害(頻度不明)

11.2 その他の副作用

	頻度不明
眼	縮瞳、眼瞼偽下垂症
精神神経系	めまい、傾眠、発汗
胃腸	悪心、嘔吐、胃部不快感
過敏症	過敏症状
その他	不快感、蒼白、四肢重圧感

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

14.1.1 筋肉内注射にあたっては、組織・神経等への影響を避けるため、下記の点に注意すること。

- ・筋肉内注射はやむを得ない場合のみ、必要最小限に行うこと。なお、特に同一部位への反復注射は行わないこと。また、小児等には特に注意すること。
- ・神経走行部位を避けるよう注意すること。
- ・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。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

レバロルファン酒石酸塩の作用は、モルヒネ系薬剤のレセプターにおける競合阻害によるものと考えられる。

その作用機転としては、モルヒネ系薬剤によって呼吸中枢の炭酸ガスに対する閾値の上昇したものがレバロルファン酒石酸塩によって正常近くに下げられることによるものと考えられている¹⁾。

本剤は麻薬によって引き起こされる呼吸抑制及び中毒症状を特異的に抑制するが、バルビツレート或いは麻酔剤による呼吸抑制には効果を示さない²⁾。

18.2 麻薬拮抗作用

本剤は適量を用いることにより、麻薬の鎮痛効果にほとんど影響せず、麻薬の呼吸抑制作用を速やかに消失させる(ウサギ³⁾、ネコ⁴⁾、ヒト²⁾)。

18.3 作用発現時間及び作用持続時間

効果は投与後1～2分で発現し(笑気-ベチジン塩酸塩による呼吸抑制患者)、その作用は2～5時間持続する^{1).5).6)}。

18.4 本剤によるモルヒネ様作用

本剤自体には鎮痛作用等、モルヒネ様作用はほとんど認められていない⁷⁾(マウス、ラット)。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：レバロルファン酒石酸塩(Levallorphan Tartrate)

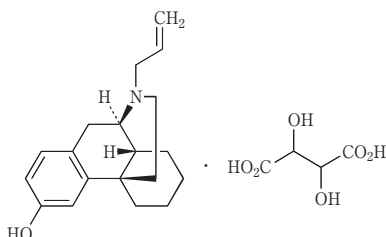
化学名：17-Allylmorphinan-3-ol monotartrate

分子式：C₁₉H₂₅NO・C₄H₆O₆

分子量：433.49

性状：白色～微黄色の結晶性の粉末で、においはない。水又は酢酸(100)にやや溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

構造式：



22. 包装

1mL×5アンプル

23. 主要文献

- 1) 山村秀夫：実験治療．1961；348：88
- 2) Sadove M.S. et al.：Postgrad Med. 1957；22：566
- 3) Yim G.K.W. et al.：J.Pharmacol.Exp.Ther. 1955；115：96
- 4) Remien J. et al.：Z Kreislaufforsch. 1967；56：1207
- 5) 稲本 晃 他：麻酔．1961；10：204
- 6) The Extra Pharmacopoeia 28th. 1982：1031
- 7) Blumberg H. et al.：Pharmacologist. 1967；9：231

24. 文献請求先及び問い合わせ先

武田テバ薬品株式会社 武田テバDIセンター

〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号

TEL 0120-923-093

受付時間 9：00～17：30(土日祝日・弊社休業日を除く)

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

武田テバ薬品株式会社

大阪市中央区道修町四丁目1番1号

26.2 販売

武田薬品工業株式会社

大阪市中央区道修町四丁目1番1号