

貯法	冷所保存 ([取扱上の注意]の項参照)
使用期限	包装に表示の使用期限内に使用すること。

処方箋医薬品※

重金属解毒剤

日本薬局方 ジメルカプロール注射液

バル®筋注100mg「AFP」

BAL® Intramuscular Injection 100mg「AFP」

日本標準商品分類番号	873923
承認番号	22000AMX01515
薬価収載	1960年6月
販売開始	2008年6月
再評価結果	1975年12月

※注意－医師等の処方箋により使用すること

【原則禁忌】(次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)
肝障害、腎障害のある患者[ジメルカプロール-金属複合体の胆汁中及び尿中への排泄が遅延することがある。]

【組成・性状】

1. 組成

1 アンプル中に次の成分を含有

販売名	有効成分	添加物
バル筋注100mg「AFP」	ジメルカプロール(日局) 100mg/1mL(10 ^W /V%)	安息香酸ベンジル 200mg、 ラッカセイ油 適量

2. 製剤の性状

油性の注射剤である。

販売名	におい	外観
バル筋注100mg「AFP」	不快なにおい	無色～淡黄色澄明の液

【効能・効果】

ヒ素・水銀・鉛・銅・金・ビスマス・クロム・アンチモンの中毒

【用法・用量】

- ジメルカプロールとして通常成人1回2.5mg/kgを第1日目は6時間間隔で4回筋肉内注射し、第2日目以降6日間は毎日1回2.5mg/kgを筋肉内注射する。
 - 重症緊急を要する中毒症状の場合は、1回2.5mg/kgを最初の2日間は4時間ごとに1日6回、3日目には1日4回、以降10日間あるいは回復するまで毎日2回筋肉内注射する。
- なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

- 重要な基本的注意
鉄、カドミウム又はセレンの中毒の際には投与しないこと。
[これらの金属とジメルカプロールとの結合により毒性の増強をみることがある。]
- 副作用(再審査対象外)
過敏症(頻度不明^{注)}): 過敏症状があらわれた場合には投与を中止すること。
注) 自発報告又は海外において認められている副作用のため頻度不明。
- 高齢者への投与
本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。
- 妊婦、産婦、授乳婦等への投与
妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上まわると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
- 小児等への投与
投与後一過性の発熱を伴うことがある。

6. 過量投与

悪心・嘔吐、頭痛、口唇・口腔・咽頭・眼の灼熱感、流涙・流涎、筋肉痛、胸部の圧迫感、振戦、血圧上昇等があらわれることがある。

また、ときに昏睡又は痙攣があらわれることがある。この場合、アドレナリン、エフェドリン、抗ヒスタミン薬等の投与が症状を緩解するとの報告がある。

7. 適用上の注意

- 投与経路：筋肉内のみ注射すること。
- 筋肉内注射時：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。
 - 1) 注射部位については、神経走行部位を避けて慎重に投与すること。
 - 2) くりかえし注射する場合には、左右交互に注射するなど、同一部位を避けること。なお、低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児には特に注意すること。
 - 3) 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。
- 開封時：アンプルカット時の異物混入を避けるため、エタノール消毒綿等で清拭しカットすること。

【薬物動態】

- 血中濃度¹⁾
ヒトに筋肉内注射した場合、0.5～2時間で最高血中濃度に達し、4時間後にはその約半分に減じ、6～24時間で完全に代謝されて排泄された。
- 分布²⁾
参考(動物実験)
ラットに³⁵S-ジメルカプロール32mgを筋肉内注射し、1時間後の組織内濃度を調べると、腎臓、肝臓、小腸で血液よりも高い濃度を示した。
- 代謝¹⁾
ジメルカプロールの注射により、尿中のグルクロン酸が増加するが、これは体内に入ったジメルカプロールの一部がグルクロン酸抱合体に代謝されて排泄されるためと考えられる。
- 排泄²⁾
参考(動物実験)
ラットに³⁵S-ジメルカプロール63mg/kgを皮下、筋肉内、腹腔内に注射し、経日的に尿中代謝物を分画した場合、投与方法による各分画への影響は少なく、大部分が尿中へ中性イオンとして排泄された。

【臨床成績】

重金属中毒患者61例を対象にした臨床試験において、82.0%(50例)[ヒ素中毒77.1%(37例)、水銀中毒100%(6例)等]に解毒効果が認められている。

【薬 効 薬 理】

諸種のチオール化合物は、金属と安定に結合するが、ジメルカプロールも金属イオンに対する親和性が強く、体内の諸酵素のSH基と金属イオンの結合を阻害する。また、既に結合が起こっている場合には、金属と結合して体外への排泄を促進し、阻害されていた酵素の活性を賦活する効果をあらわす。

酵素を再賦活化できる程度は時間経過に伴って低下するので、本剤による治療は中毒の初期に処置すれば効果的である。

本剤は、ヒ素、水銀、鉛、銅中毒に有効であることが確認されており、金、ビスマス、クロム、アンチモンによる中毒の毒性も低下させる。ウラニウムには無効である。

【有効成分に関する理化学的知見】

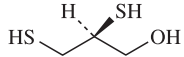
一般名：ジメルカプロール(Dimercaprol)

化学名：(2RS)-2,3-Disulfanylpropan-1-ol

分子式：C₃H₈OS₂

分子量：124.23

構造式：



及び鏡像異性体

性 状：無色～微黄色の液で、メルカプタンのような不快なにおいがある。メタノール又はエタノール(99.5)と混和する。ラッカセイ油にやや溶けやすく、水にやや溶けにくい。旋光性を示さない。

【取 扱 い 上 の 注 意】

1.貯 法

保存中に結晶が析出した場合は、室温で溶解して使用すること。

2.アンプルカット時の注意

本品は、「ワンポイントカットアンプル」を使用しているので、アンプル枝部のマークを上にして、反対方向に折りとること。

【 包 装 】

バル筋注100mg[AFP] (1 mL) 10アンプル
(日本薬局方ジメルカプロール注射液)

【主 要 文 献】

- 1)池田良雄：臨床薬理学大系(中山書店) 1967；15：194-197
- 2)Peters RA, et al.：Biochem J. 1947；41(3)：370-373

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

アルフレッサ ファーマ株式会社 製品情報部
〒540-8575 大阪市中央区石町二丁目2番9号
TEL 06-6941-0306 FAX 06-6943-8212

alfresa
製 造 アルフレッサファーマ株式会社
販 売 元 大阪市中央区石町二丁目2番9号