

貯法：室温保存
有効期間：5年

催眠鎮静剤

劇薬、向精神薬、習慣性医薬品^{注1)}、処方箋医薬品^{注2)}

日本薬局方 アモバルビタール

イソミタル[®] 原末Isomytal[®]

承認番号	21900AMX01459000
販売開始	1950年2月

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

Z25

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）
- 2.1 バルビツール酸系化合物に対し過敏症の患者
- 2.2 急性間歇性ポルフィリン症の患者〔痙攣や精神神経症状など本症の急性症状を誘発することがある。〕

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	イソミタル原末
有効成分	日本薬局方アモバルビタール
添加剤	なし

3.2 製剤の性状

販売名	イソミタル原末
色	白色
性状	結晶又は結晶性の粉末

4. 効能又は効果

不眠症、不安緊張状態の鎮静

6. 用法及び用量

不眠症には、アモバルビタールとして、通常成人1日0.1～0.3gを就寝前に経口投与する。

不安緊張状態の鎮静には、アモバルビタールとして、通常成人1日0.1～0.2gを2～3回に分割経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

7. 用法及び用量に関連する注意

不眠症には、就寝の直前に服用させること。また、服用して就寝した後、睡眠途中において一時的に起床して仕事等をする可能性があるときは服用させないこと。

8. 重要な基本的注意

8.1 本剤投与中の患者には、自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないよう注意すること。

8.2 連用により薬物依存を生じることがあるので、漫然とした継続投与による長期使用を避けること。本剤の投与を継続する場合には、治療上の必要性を十分に検討すること。〔9.1.4、11.1.2 参照〕

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 以下の患者には治療上やむを得ないと判断される場合を除き投与しないこと。

(1) 心障害のある患者

血圧が低下することがある。

(2) 呼吸機能の低下している患者

呼吸抑制を起こすことがある。

9.1.2 虚弱者

呼吸抑制を起こすことがある。また、離脱症状に特に注意すること。〔11.1.2 参照〕

9.1.3 頭部外傷後遺症又は進行した動脈硬化症等の脳の器質障害のある患者

脳血流量の低下により、脳障害が悪化するおそれがある。

9.1.4 アルコール中毒、薬物依存の傾向又は既往歴のある患者、重篤な神経症患者

連用により薬物依存を生じやすい。〔8.2、11.1.2 参照〕

9.2 腎機能障害患者

治療上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しないこと。代謝、排泄機能の低下により、効果や副作用が強くなる可能性がある。

9.3 肝機能障害患者

治療上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しないこと。代謝、排泄機能の低下により、効果や副作用が強くなる可能性がある。

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。妊娠中に投与すると、新生児に出血傾向、呼吸抑制等を起こすことがある。分娩前に連用した場合、出産後新生児に禁断症状（多動、振戦、反射亢進、過緊張等）があらわれることがある。

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

呼吸抑制を起こすことがある。

9.8 高齢者

9.8.1 少量から投与を開始するなど慎重に投与すること。呼吸抑制を起こすことがある。また、運動失調等の副作用が発現しやすい。

9.8.2 離脱症状に特に注意すること。〔11.1.2 参照〕

10. 相互作用

本剤は、主として肝代謝酵素CYP3Aを誘導することが示唆されているので、CYP3Aで代謝される薬剤は、本剤との併用により代謝が亢進され、血中濃度が低下する可能性がある。

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
抗不安薬 抗精神病薬 催眠鎮静薬 抗うつ薬 抗ヒスタミン薬 チアジド系薬物 ジスルフィラム 解熱鎮痛剤 アルコール	相互に作用が増強されることがあるので、このような場合は減量するなど慎重に投与すること。	本剤及びこれらの薬剤の中枢神経抑制作用による。
クラレー様物質		クラレー様物質の筋弛緩作用が増強される。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
クマリン系抗凝血薬	クマリン系抗凝血薬の作用に影響を与えるので、本剤をクマリン系抗凝血薬の治療下にある患者に投与する場合には、通常より頻回にプロトロンビン値の測定を行い、クマリン系抗凝血薬の量を調整すること。	本剤は薬物代謝酵素を誘導し、これらの代謝を促進させ、作用を減弱させる。
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。	
ゲフィチニブ	ゲフィチニブの作用を減弱させることがある。	本剤の肝代謝酵素(CYP3A)誘導作用により、ゲフィチニブの代謝が亢進し、血中濃度が低下する可能性がある。

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 皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）（頻度不明）

11.1.2 薬物依存（頻度不明）

連用により薬物依存を生じることがあるので、観察を十分に行い、用量及び使用期間に注意し慎重に投与すること。また、連用中における投与量の急激な減少ないし投与の中止により、ときに不安、不眠、痙攣、悪心、幻覚、妄想、興奮、錯乱又は抑うつ状態等の離脱症状があらわれることがあるので、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こと。[8.2、9.1.2、9.1.4、9.8.2 参照]

11.2 その他の副作用

	頻度不明
過敏症	過敏症状
精神神経系	知覚異常、構音障害、精神機能低下、せん妄、昏迷又は運動失調
腎臓・血液	ヘマトポルフィリン尿、蛋白尿、低カルシウム血症、巨赤芽球性貧血（葉酸代謝異常によると思われる。）
その他	頭痛、発熱、発疹、めまい

16. 薬物動態

16.2 吸収

経口投与した場合、全消化管から容易に吸収される¹⁾。

16.3 分布

体内の各組織及び体液に分布する。一般に脳、腎及び肝に高濃度に分布する¹⁾。

16.4 代謝

主に肝臓で代謝される¹⁾。

16.5 排泄

投与量の34～49%はヒドロキシアモバルビタールに代謝され尿中に排泄される。未変化体は4～5日間、ヒドロキシアモバルビタールは6～9日間にわたって尿中に検出される²⁾（外国人データ）。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

大脳皮質及び脳幹網様体の上行性賦活系に対して強く作用し、求心性刺激による皮質ニューロンの賦活を抑制する。

18.2 催眠・鎮静作用

アモバルビタールはバルビタールに比し強い催眠作用を示し、作用発現は早く、持続時間は短い（マウス³⁾、イヌ⁴⁾）。また低用量で鎮静作用を示す（マウス⁵⁾）。

18.3 その他の作用

抗痙攣作用（ウサギ⁶⁾）、血圧低下作用（ウサギ³⁾、⁵⁾）を示し、呼吸（マウス³⁾、ウサギ³⁾、⁵⁾）及び心機能（ネコ⁷⁾）を抑制する。

19. 有効成分に関する理化学的知見

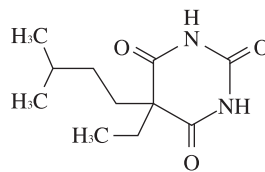
一般的名称：アモバルビタール（Amobarbital）（JAN）

化学名：5-Ethyl-5- (3-methylbutyl) pyrimidine-2, 4, 6 (1*H*, 3*H*, 5*H*) -trione

分子式：C₁₁H₁₈N₂O₃

分子量：226.27

化学構造式：



融点：157～160℃

性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味はわずかに苦い。

本品はエタノール（95）、アセトン又はジエチルエーテルに溶けやすく、クロロホルムにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

本品は水酸化ナトリウム試液又は炭酸ナトリウム試液に溶ける。

本品の飽和水溶液のpHは5.0～5.6である。

22. 包装

25g、100g

23. 主要文献

- 1) 島本暉朗ほか：薬理学、医学書院、p. 74-86（1964）
- 2) Grove J, *et al.* : J Pharm Pharmacol. 1971;23 (12) :936-40
- 3) 荻生規矩夫ほか：薬学研究. 1950;22 (4) :151-4
- 4) Shonle HA, *et al.* : J Am Chem Soc. 1923;45 (1) :243-9
- 5) 新津茂良：成医会雑誌. 1931;50 (9) :50-97
- 6) Swanson EE : J Lab Clin Med. 1932;17:325-32
- 7) Garry RC : J Pharmacol Exp Ther. 1930;34 (2) :129-36

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本新薬株式会社 製品情報担当
〒601-8550 京都市南区吉祥院西ノ庄門口町14
フリーダイヤル 0120-321-372
TEL 075-321-9064
FAX 075-321-9061

25. 保険給付上の注意

本剤は厚生労働省告示第97号（平成20年3月19日）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品（麻薬及び向精神薬取締法第二条第六号に規定する向精神薬）」に該当し、1回14日分を限度に投与の制限が定められている。

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

日本新薬株式会社
京都市南区吉祥院西ノ庄門口町14