

日本標準商品分類番号	
871149	
承認番号	14500AMZ00894
薬価収載	1976年9月
販売開始	2012年10月

貯 法：室温保存

使用期限：5年（ラベル等に表示の使用期限を参照すること）

劇薬、向精神薬、習慣性医薬品^{注1)}、処方箋医薬品^{注2)}

ソセゴン®注射液30mg

(ペンタゾシン注射液)

Sosegon® Injection 30mg

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

*【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

(改訂箇所：——)

- (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 頭部傷害がある患者又は頭蓋内圧が上昇している患者〔頭蓋内圧が上昇することがある。〕
- (3) 重篤な呼吸抑制状態にある患者及び全身状態が著しく悪化している患者〔呼吸抑制を増強することがある。〕
- (4) ナルメフェン塩酸塩水和物を投与中又は投与中止後1週間以内の患者〔オピオイド離脱症状(又はその悪化)があらわれるおそれがある。〕(「3. 相互作用 (1)」の項参照)

【組成・性状】

1. 組成

有効成分(1管1mL中)	添加物
ペンタゾシン30mg	乳酸、等張化剤

2. 製剤の性状

剤形	色・形状	pH	浸透圧比*
注射剤 (無色アンプル)	無色～ほとんど 無色澄明	3.5～5.5	約1

*生理食塩液に対する比

【効能・効果】

麻酔前投薬および麻酔補助

【用法・用量】

通常、ペンタゾシンとして30～60mgを筋肉内、皮下または静脈内に注射するが、症例により適宜増減する。

*【使用上の注意】(改訂箇所：——)

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1) 薬物依存の既往歴のある患者
- (2) 麻薬依存患者〔軽度の麻薬拮抗作用が認められているので、ときとして禁断症状を呈することがある。〕
- (3) 胆道疾患のある患者〔大量投与した場合Oddi氏筋を収縮する。〕
- (4) 心筋梗塞の患者〔特に静脈内投与の場合、急性心筋梗塞患者の動脈圧、血管抵抗を上昇させる。〕
- (5) 肝機能障害のある患者〔本剤の作用が増強するおそれがある。〕
- (6) 高齢者(「5. 高齢者への投与」の項参照)

2. 重要な基本的注意

- (1) 外来患者に投与した場合には、十分に安静にした後、安全を確認し帰宅させること。
- (2) 眠気、めまい、ふらつき等があらわれることがあるので、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は従事させないよう注意すること。
- (3) 連用により薬物依存を生ずることがあるので、観察を十分に行い、慎重に投与すること。特に薬物依存の既往歴のある患者には注意すること。(「4. 副作用」の項参照)

3. 相互作用

(1) 併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ナルメフェン塩酸塩水和物 セリシクロ	本剤の離脱症状を起こすおそれがある。また、本剤の鎮痛作用を減弱させるため、効果を得るために必要な用量が通常用量より多くなるおそれがある。緊急の手術等によりやむを得ず本剤を投与する場合、患者毎に用量を漸増し、呼吸抑制等の中枢神経抑制症状を注意深く観察すること。また、手術等において本剤を投与することが事前にわかる場合には、少なくとも1週間前にナルメフェン塩酸塩水和物の投与を中断すること。	μオピオイド受容体拮抗作用により、本剤の作用が競合的に阻害される。

(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
モルヒネ製剤	本剤の作用が増強されることがある。併用が必要な場合には、一方又は両方の投与量を必要に応じて減らすこと。また、本剤は高用量において、モルヒネの作用に拮抗することがあるので、通常、モルヒネとの併用は避けること。	ペンタゾシンの作用は、脳内オピオイドレセプターの飽和濃度に左右される。
中枢性鎮痛剤 ブプレノルフィン塩酸塩、エブタゾシン臭化水素酸塩等 ベンゾジアゼピン誘導体・その他の鎮静剤 ジアゼパム、ニトラゼパム、メダゼパム等 中枢性薬剤(睡眠剤等) バルビツール酸誘導体(フェノバルビタール等) アルコール	本剤の作用が増強されることがある。併用が必要な場合には、一方又は両方の投与量を必要に応じて減らすこと。	中枢神経系が抑制されることによると考えられる。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
セロトニン神経系賦活作用を有する抗うつ剤 アミトリプチリン塩酸塩等	抗うつ剤の作用が増強され不安感、悪心、発汗、潮紅等が起こるおそれがある。 併用が必要な場合には、一方又は両方の投与量を必要に応じて減らすこと。	中枢のセロトニン作動活性を増強すると考えられる。 外国において、セロトニン神経系賦活作用を作用機序とする抗うつ剤（フルオキセチン）投与患者でセロトニン神経系賦活作用の増強に由来すると考えられる症状（不安感、悪心、発汗、潮紅等）が認められたとの報告がある。
メサドン塩酸塩	メサドン塩酸塩の鎮痛作用を減弱させることがある。また、 <u>退薬症候を起こすおそれがある。</u>	本剤はメサドン塩酸塩の作用する μ 受容体の部分アゴニストである。

動物実験（ウサギ）においてサリチルアミドとの併用によりペンタゾシンのCmaxが約2倍程度高くなり、サリチルアミドのCmaxは過剰のペンタゾシンを併用することにより約2.5倍となるとの報告があるので、併用しないことが望ましい。また、やむをえず併用する場合には本剤を減量するなど注意すること。

4. 副作用

総症例8,722例中、副作用の発現をみたものは2,517例（28.86%）で、このうち1%以上の発現率をみたものは、悪心・嘔吐（6.10%）、傾眠（5.10%）等であった。（承認時及び承認後3年間の市販後調査結果）
また、昭和46年から53年の8年間に報告されたペンタゾシンによる依存症例（疑いも含む）は276例であった¹⁾。

なお、NLA変法麻酔において、本剤の静脈内大量1回投与（ペンタゾシンとして2.5～3.0mg/kg）にて動脈血血漿カリウム値の低下が認められた²⁾。

(1) 重大な副作用

- 1) ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）：ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので観察を十分に行い、顔面蒼白、呼吸困難、チアノーゼ、血圧下降、頻脈、全身発赤、血管浮腫、蕁麻疹等の症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) 呼吸抑制（0.42%）：呼吸抑制がみられることがある。このような場合には、酸素吸入（必要に応じて人工呼吸）か、又はドキサプラムの投与が有効であるが、麻薬拮抗剤（レバロルファン）は無効である。
- 3) 依存性（頻度不明）：連用により薬物依存を生ずることがあるので、観察を十分に行い、慎重に投与すること。特に薬物依存の既往歴のある患者には注意すること。また、連用後、投与を急に中止すると、振戦、不安、興奮、悪心、動悸、冷感、不眠等の禁断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こと。
- 4) 中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis: TEN)（頻度不明）：中毒性表皮壊死融解症があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 5) 無顆粒球症（頻度不明）：無顆粒球症があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- 6) 神経原性筋障害（頻度不明）：大量連用により、神経原性の四肢の筋萎縮が起こり、脱力、歩行困難があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような場合には投与を中止すること。
- 7) 痙攣（頻度不明）：強直性痙攣又は間代性痙攣があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

	5%以上	1～5%未満	1%未満	頻度不明
精神神経系	傾眠	めまい、ふらつき、発汗	幻覚 ^{注1)} 、しびれ感、多幸感、不安、興奮、頭痛、頭重、痙攣、複視	錯乱 ^{注1)} 、鎮静、意識障害、振戦、浮遊感
循環器		血圧上昇	皮膚潮紅、熱感	血圧低下
消化器	悪心・嘔吐	口渇	便秘	
過敏症 ^{注2)}				顔面浮腫、発赤、発疹、多形紅斑
血液				白血球減少、貧血
肝臓				肝機能異常
泌尿器				排尿障害、尿閉
その他			胸内苦悶、疲労感、不快感、悪寒	発熱、脱力感、倦怠感

注1) 特に静脈内注射する場合には注意すること。

注2) 投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

高齢者では、低用量から投与を開始するとともに、投与間隔を延長するなど慎重に投与すること。[高い血中濃度が持続する傾向等が認められている。〔薬物動態〕の項参照]

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 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回ると判断される場合にのみ投与すること。[胎児に対する安全性は確立されていない。]
- (2) 分娩時の投与により新生児に呼吸抑制があらわれることがある。
- (3) 分娩前に投与した場合、出産後新生児に禁断症状（神経過敏、振戦、嘔吐等）があらわれることがある。

7. 小児等への投与

乳児・小児への投与に関する安全性は確立されていないので、投与しないことが望ましい。

8. 過量投与

症状：傾眠、呼吸抑制、血圧低下等を起こすことがあり、重症の場合には、循環不全、昏睡、痙攣等を起こすことがある。

処置：十分な呼吸維持と循環器系の補助療法を行う。痙攣に対する治療は必須であり、中枢神経抑制作用に対してはナロキソン投与を行う。

9. 適用上の注意

(1) 皮下・筋肉内注射時：

皮下・筋肉内への連続注射により、まれに注射部位に潰瘍等の障害があらわれることがある。

(2) 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、下記の点に配慮すること。

- 1) 神経走行部位を避けるよう注意して注射すること。
- 2) 繰り返し注射する場合には、同一注射部位を避けること。なお、乳児・小児には投与しないことが望ましい。
- 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。

(3) 調製時:

本品は、ワンポイントカットアンプルであるが、アンプルカット部分をエタノール綿等で清拭してからカットすることが望ましい。

10. その他の注意

バルビタール系薬剤（注射液）と同じ注射筒で使用すると沈殿を生ずるので、同じ注射筒で混ぜないこと。

【薬物動態】

1. 血中濃度

16～63歳の整形外科もしくは婦人科の手術患者30名に、ペンタゾシン0.5mg/kg・1mg/kgを筋注（臀部内）もしくは0.5mg/kgを静注した場合の最高血中濃度及び半減期、AUCは以下のとおりである³⁾。

薬動力学的パラメータ

投与経路	用量 (mg/kg)	Cmax* (μ g/mL)	Tmax (min)	t _{1/2} * (h)	AUC* (μ g·h/mL)
筋肉内投与	0.5	0.15 ± 0.04	約10	1.28 ± 0.71	0.23 ± 0.13
	1.0	0.28 ± 0.09	30	2.02 ± 0.50	0.87 ± 0.47
静脈内投与	0.5	2.07 ± 1.20	投与直後	0.73 ± 0.60	0.28 ± 0.16

※平均±標準偏差

2. 代謝・排泄

海外における検討によれば、ペンタゾシンを人に投与後の尿中には未変化体と代謝産物として*cis*-アルコール体及び*trans*-カルボン酸体とその抱合体が認められる⁴⁾。健康成人男子にペンタゾシンを静注して、その生体内代謝を検討した成績によれば、投与後32時間尿中に投与量の8.4～24.0%が未変化体で排泄されることが認められている⁵⁾。

3. 血漿蛋白結合率

健康成人(20例)及び脳神経外科手術後の患者(22例)でのペンタゾシンの血漿蛋白結合率を検討した結果、それぞれ61.1%及び65.8%であった⁶⁾。

4. 高齢者の血中濃度

若年(22～48歳)の健康成人(8例)、術後患者(1例)及び高齢(60～90歳)の術後患者(5例)、疼痛患者(3例)にペンタゾシンをそれぞれ30mg、80mg、45～60mg、30mgを静脈内投与した時、高齢者では健康成人と比較して総クリアランスが約1/2に低下し、消失半減期は約1.6倍に延長した⁷⁾。

高齢者に本剤を投与する場合には、投与量、投与間隔の適切な調節が必要である。

【臨床成績】

1. 麻酔前投薬⁸⁾

本剤の麻酔前投薬としての臨床効果は、手術予定の成人患者61例を対象に検討されており、アトロピン、鎮静剤もしくは笑気麻酔等との併用により77.0%(47/61)の有効率が得られた。

2. 麻酔補助⁹⁾

ジアゼパム、ペンタゾシン併用による変法 Neuroleptanalgesia (以下 NLA 変法麻酔と略す)は、従来の NLA 変法麻酔に比し、術後鎮痛効果が長く、呼吸抑制も少ないことが認められた。

【薬効薬理】

1. 鎮痛効果

術後患者を対象に、ペンタゾシンの鎮痛効果をモルヒネ、ペチジンと比較した成績によれば、ペンタゾシン30mgの非経口投与は、モルヒネ10mg¹⁰⁾ 11)、ペチジン75～100mg¹²⁾にほぼ匹敵する鎮痛効果を有する。

2. 作用機序

ペンタゾシンは中枢神経における刺激伝導系を抑制することにより、鎮痛効果を発現する(イヌ)¹³⁾。

3. 作用発現・持続

皮下注、筋注では15～20分で鎮痛効果が発現し、約3～4時間持続する¹¹⁾ 12)。

【有効成分に関する理化学的知見】

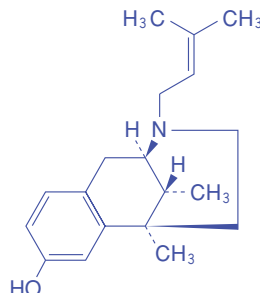
一般名:ペンタゾシン (Pentazocine)

化学名:(2*RS*,6*RS*,11*RS*)-6,11-Dimethyl-3-(3-methylbut-2-en-1-yl)-1,2,3,4,5,6-hexahydro-2,6-methano-3-benzoazocin-8-ol

分子式:C₁₉H₂₇NO

分子量:285.42

構造式:



性状:白色～微黄白色の結晶性の粉末で、においはない。

酢酸(100)又はクロロホルムに溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けやすく、ジエチルエーテルにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

【包装】

注射液 30mg/1mL : 10 管

【主要文献】

- 1) 厚生省医薬品情報 No.8(1979)
日本医師会雑誌 81(1979)
- 2) 高木雅矩 他: 臨床麻酔 5(7): 865(1981)
- 3) 荒川佳子 他: 麻酔 30(4): 356(1981)
- 4) Berkowitz, B.: Ann.N.Y.Acad.Sci. 179: 269(1971)
- 5) Beckett, A.H.et al.: J. Pharm.Pharmacol. 22: 123(1970)
- 6) Ehrnebo, M.et al.: Clin.Pharmacol.Ther. 16(3): 424(1974)
- 7) Ritchel, W.A.et al.: Methods Find.Exp.Clin.Pharmacol. 8(8): 497(1986)
- 8) 岩月賢一 他: 麻酔 18(4): 292(1969)
- 9) 久世照五 他: 麻酔 26(3): 315(1977)
- 10) Stoelting, V.K.: Anesth.Analg. 44(6): 769(1965)
- 11) 美馬昂 他: 医学のあゆみ 73(6): 307(1970)
- 12) Sadove,M.S.et al.: JAMA. 193(11): 887(1965)
- 13) Lim,R.K.S.et al.: Bull Drug Addiction and Narcotics.: 3983(1964)

【文献請求先】

丸石製薬株式会社 学術情報部

〒538-0042 大阪市鶴見区今津中2-4-2

TEL. 0120-014-561

製造販売元

丸石製薬株式会社

大阪市鶴見区今津中2-4-2

提携

SANOFI

®登録商標

(SOSEGON、ソセゴンはサノフィーアベンティス・ユー・エス・リミテッド・ライアビリティ・カンパニーの登録商標です。)

