

貯法：室温保存  
使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること  
\*\*規制区分：劇薬，習慣性医薬品（注意－習慣性あり），  
処方せん医薬品（注意－医師等の処方せん  
により使用すること）

承認番号	(62AM)37
薬価収載	1987年3月
販売開始	1987年4月
再審査結果	1994年9月

### 拮抗性鎮痛剤

# セダペイン® 注15

## Sedapain Inj. 15

エプタゾシン臭化水素酸塩注射液

#### 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 重篤な呼吸抑制状態にある患者 [呼吸機能を悪化させるおそれがある。]
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 [頭蓋内圧を上昇させるおそれがある。]

#### 【組成・性状】

##### 1. 組成

セダペイン注15は1アンプル（1mL）中エプタゾシンとして15mg（エプタゾシン臭化水素酸塩20.25mg）を含有する。添加物としてグリシン5mg，等張化剤，pH調節剤を含有する。

##### 2. 製剤の性状

色調	pH	浸透圧比
無色澄明	3.0~5.0	0.9~1.1 (生理食塩液に対する比)

#### 【効能・効果】

下記疾患ならびに状態における鎮痛  
各種癌，術後

#### 【用法・用量】

エプタゾシンとして，通常成人1回15mg（本剤1アンプル）を皮下又は筋肉内注射する。  
なお，症状により適宜増減する。

#### 【使用上の注意】

##### 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 [薬物依存を生じるおそれがある。]
- (2) 麻薬依存患者 [動物実験で軽度のモルヒネ拮抗作用が認められているので，禁断症状を呈することがある。]
- (3) 胆道疾患のある患者 [動物実験で大量投与した場合，Oddi括約筋の収縮が認められる。]
- (4) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

##### 2. 重要な基本的注意

- (1) 本剤を投与後，悪心，嘔吐，めまい，ふらつき等の症状があらわれることがあるので，**外来患者に投与した場合には十分に安静にした後，安全を確認して帰宅させること。**
- (2) 眠気，めまい，ふらつき等の症状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. 相互作用

#### 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
中枢性鎮痛剤 ペンタゾシン， ブプレノルフィン 塩酸塩， 酒石酸ブトルファ ノール等	本剤の作用が増強するおそれがあるので，併用が必要な場合は一方又は両方の投与量を減らすなど慎重に投与すること。	本剤は中枢性鎮痛剤と同じオピオイドレセプターに作用するため。
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 中枢抑制剤（催眠剤等） バルビツール酸誘導体（フェノバルビタール等） アルコール等	本剤の作用が増強するおそれがあるので，併用が必要な場合は一方又は両方の投与量を減らすなど慎重に投与すること。	ともに中枢神経抑制作用を有するため。
モルヒネ製剤	本剤の作用が増強するおそれがあるので，併用が必要な場合は一方又は両方の投与量を減らすなど慎重に投与すること。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考えられる。	本剤はモルヒネと同じオピオイドレセプターに作用するため，本剤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。

### 4. 副作用

調査症例4035例中228例（5.65%）に副作用が認められ，主な副作用は悪心・嘔気92件（2.28%），発汗・多汗71件（1.76%），口渴26件（0.64%），熱感19件（0.47%），嘔吐19件（0.47%），めまい17件（0.42%）等であった。（再審査終了時）  
以下の副作用には，別途市販後に報告された頻度の算出できない副作用を含む。

#### (1) 重大な副作用

- 1) ショック（0.1%未満）  
まれにショック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，胸部圧迫感（0.1~5%未満）  
ときに呼吸抑制，胸部圧迫感があらわれることがある。このような場合には人工呼吸（必要に応じて酸素吸入）か，ジモルホラミンの投与が有効であるが，レバロルファン，ロベリンの投与は無効である。
- 3) 依存性（頻度不明）  
大量連用により薬物依存を生じるおそれがあるので，観察を十分に行い，慎重に投与すること。また，大量連用後，投与を急に中止すると手指振せん，不安，興奮，悪

心、動悸、冷感、不眠等の禁断症状があらわれるおそれがあるので、投与を中止する場合には徐々に減量すること。

(2) その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満
精神神経系	発汗、冷汗、めまい、もうろう感、ふらつき、頭痛	頭重感、不安感・異和感、興奮、不眠、耳鳴、手足のしびれ、多弁等
循環器	熱感、動悸	頻脈、顔面潮紅、血圧上昇、冷感等
消化器	悪心、嘔吐、口渇	胃部不快感、吃逆等
注射部位	注射部位の疼痛	発赤・腫脹、硬結
その他	気分不良	発熱、頸部リンパ節腫脹

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているため、慎重に投与すること。

6. 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していない。]
- 授乳中の婦人に投与する場合には授乳を中止させることが望ましい。[動物実験(ラット)で母乳中への移行が報告されている。]
- 類似化合物で分娩時の投与により新生児に呼吸抑制があらわれたとの報告がある。
- 類似化合物で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、振せん、嘔吐等)があらわれたとの報告がある。

7. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。(使用経験が少ない。)

8. 適用上の注意

(1) 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。

- 同一部位への反復注射は行わないこと。また、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。
- 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には直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。

(2) 調製時

バルビタール系薬剤(注射剤)と同じ注射筒を使用すると沈殿を生じるので、同じ注射筒で混ぜないこと。

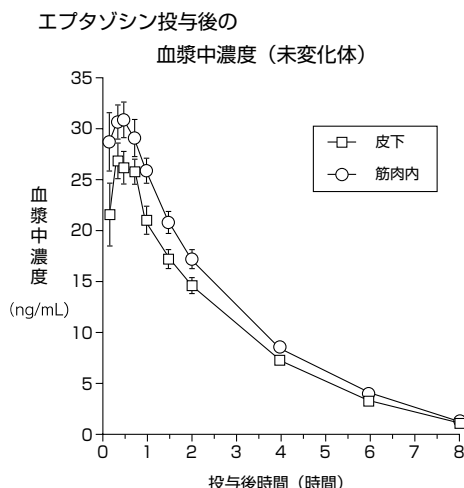
(3) アンプルカット時

本剤はワンポイントカットアンプルを使用しているため、アンプル枝部のマークを上にして反対方向に折ること。なお、アンプルカット時の異物の混入を避けるため、カット部をエタノール綿等で清拭し、カットすること。

【薬物動態】

1. 血中濃度

健康成人にエプタゾシン15mg(本品1mL)を皮下又は筋肉内投与したとき、投与後20～30分で最高血漿中濃度に達した。<sup>1)</sup>



2. 代謝・排泄

主代謝物はエプタゾシンのグルクロン酸抱合体であり、更にN-脱メチル体、9位水酸化体とそれらの抱合体が認められた。主な排泄経路は腎で、投与後24時間で82.5%が尿中に排泄された。<sup>2)</sup>

【臨床成績】

二重盲検比較試験4試験を含む臨床試験で総投与回数1495回について本剤の効果が検討された。<sup>3)~8)</sup>

対象疾患	有効率
術後疼痛	82.2% (366回/445回)
癌性疼痛	81.4% (855回/1050回)

なお、二重盲検比較試験において本剤の有用性が認められている。

【薬効薬理】

1. 鎮痛作用

マウスを用いた圧刺激法、熱板法、酢酸writhing法、電気刺激法並びにラットでの圧刺激法、ブラジキニン動注法等によりエプタゾシンはペンタゾシンの1～2倍の鎮痛効力を示した。<sup>9)</sup>

2. 作用機序

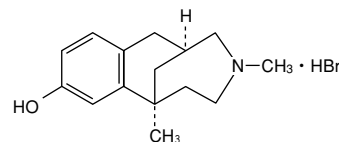
オピオイド受容体に対してカップアゴニストとして作用し、大縫線核から脊髄後角シナプスへの下行性抑制経路を介して、鎮痛作用を示すと考えられている。<sup>10),11)</sup>

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：エプタゾシン臭化水素塩(Eptazocine Hydrobromide)

別名：臭化水素酸エプタゾシン

化学名：(-)-(1S,6S)-2,3,4,5,6,7-Hexahydro-1,4-dimethyl-1,6-methano-1H-4-benzazonin-10-ol hydrobromide



分子式：C<sub>15</sub>H<sub>21</sub>NO · HBr

分子量：312.25

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。

水又はメタノールに溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けやすく、酢酸(100)又はアセトンに溶けにくく、クロロホルムに極めて溶けにくく、ベンゼンにほとんど溶けない。

本品の水溶液(1→100)のpHは5.0～6.0である。

融点：257～263℃(分解)

【包装】

セダペイン注15

1mL×10アンプル

【主要文献】

- 日医工株式会社 社内資料：ヒト安全性試験
- 小川貫山ほか：薬学雑誌 100, 967 (1980)
- 草間 悟ほか：薬理と治療 8, 1921 (1980)
- 渡辺 決ほか：ibid. 10, 3513 (1982)
- 森岡恭彦ほか：臨床評価 13, 791 (1985)
- 森岡恭彦ほか：薬理と治療 10, 6853 (1982)
- 岡部達士郎ほか：ibid. 10, 6039 (1982)
- 遠藤正臣ほか：ibid. 10, 6485 (1982)
- 野沢 勉ほか：応用薬理 19, 973 (1980)
- 亀山 勉ほか：日本薬理学雑誌 78, 599 (1981)
- 亀山 勉ほか：ibid. 78, 613 (1981)

\*【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター  
〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

☎ (0120)517-215

Fax (076)442-8948