

劇薬  
向精神薬  
習慣性医薬品<sup>注1)</sup>  
処方箋医薬品<sup>注2)</sup>

鎮痛剤  
**ペルタゾン錠25**  
PELTAZON<sup>®</sup> TABLETS

承認番号	20900AMZ00512
薬価収載	1997年9月
販売開始	1997年10月
再審査結果	2006年12月
国際誕生	1966年9月

塩酸ペンタゾシン錠

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

貯 法: 室温保存  
使用期限: 外箱等に表示

**【警告】**

本剤を注射しないこと。  
[本剤にはナロキソンが添加されているため、水に溶解して注射投与しても効果なく、麻薬依存患者では禁断症状を誘発し、また肺塞栓、血管閉塞、潰瘍、膿瘍を引き起こすなど、重度で致死的な事態を生じることがある.]

**【禁忌】** (次の患者には投与しないこと)

1. ペンタゾシン又はナロキソン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.]

- (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 (「薬物動態」の項参照).]
- (6) 高齢者 (「高齢者への投与」の項参照)

2. 重要な基本的注意

- (1) 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に注意すること。
- (2) 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 (「副作用」の項参照)。

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
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 酒石酸ブトルファンノール等 ベンゾジアゼピン誘導体・その他の鎮痛剤 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。
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。

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、やむを得ず併用する場合には本剤を減量するなど注意すること。

【組成・性状】

販売名	ペルタゾン錠25		
成分・含量	1錠中 塩酸ペンタゾシン28.2mg (ペンタゾシンとして25.0mg)		
添加物	ナロキソン塩酸塩0.278mg (ナロキソンとして0.25mg)、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、タルク、トウモロコシデンプン、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール6000		
剤形	白色フィルムコーティング錠		
外形	表	側面	裏
	直径約6.7mm 厚さ約3.1mm 質量約105mg		
識別コード	G154		

【効能・効果】

各種癌における鎮痛

【用法・用量】

通常、成人には1回ペンタゾシンとして25~50mgを経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。必要に応じ追加投与する場合には、3~5時間の間隔をおく。

【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
  - (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) 心筋梗塞患者  
[肺動脈圧及び血管抵抗を上昇させる.]

#### 4. 副作用

承認時までの臨床試験では、3,302例中659例（19.96％）に、市販後の使用成績調査では、2,223例中385例（17.32％）に副作用が認められた。その主なものは、悪心、嘔吐等であった（再審査終了時）。

##### (1) 重大な副作用（頻度不明）

- 1) ショック、アナフィラキシー様症状：ショック、アナフィラキシー様症状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：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：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) 無顆粒球症：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。

##### (2) その他の副作用

副作用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。

	5%以上又は頻度不明	1～5%未満	1%未満
精神神経系		めまい、ふらつき、発汗、傾眠	幻覚、興奮、頭痛、頭重、不安、もうろう状態、酩酊感、冷汗、浮遊感、不眠、振戦、意識障害
循環器			熱感、顔面潮紅、動悸、血圧上昇、血圧低下、顔面蒼白
消化器	悪心	嘔吐	口渇、食欲不振、腹部膨満感、胃部不快感、腹痛、便秘
過敏症 <sup>注3)</sup>	多形紅斑 <sup>※)</sup>		発疹
血液			貧血、赤血球減少、白血球減少
肝臓			肝機能異常
泌尿器			排尿障害、尿閉
その他	疲労感 <sup>※)</sup>		倦怠感、不快感、発熱、悪寒、脱力感

※) 頻度不明

注3) 投与を中止すること。

#### 5. 高齢者への投与

高齢者では高い血中濃度が持続する傾向等が認められているので、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（「薬物動態」の項参照）。

#### 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。

[本剤の胎児に対する安全性は確立されていない。]

#### 7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない（使用経験がない）。

#### 8. 過量投与

外国において薬物嗜癖の病歴を有する患者が、術後疼痛のため処方された本剤を過量服用（ペンタゾシンとして1g）し、死亡（肝不全）したとの報告がある。

#### 9. 適用上の注意

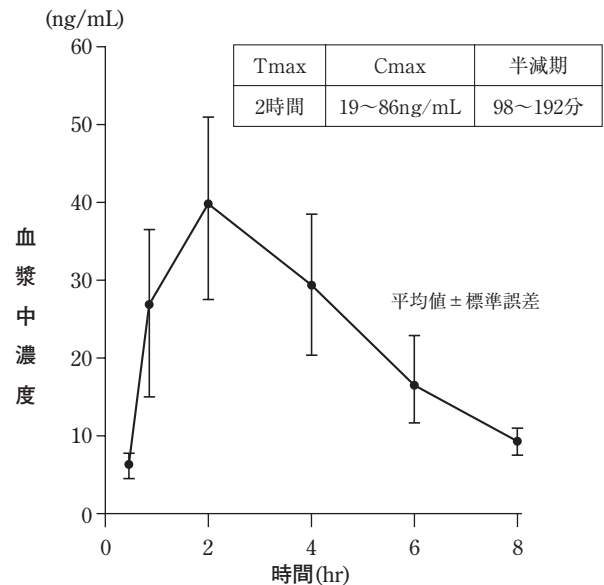
##### 薬剤交付時

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること（PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている）。

#### 【薬物動態】

##### 1. 血漿中濃度<sup>1)</sup>

<健康成人（6例）に塩酸ペンタゾシン錠（ペンタゾシンとして50mg含有）を経口投与>



##### 2. 代謝、排泄<sup>1)</sup>

経口投与後の吸収は良く、尿中には主としてペンタゾシンと代謝物の抱合型として排泄され、投与後24時間までに総排泄率は投与量の70.4%であった。

##### 3. 血漿蛋白結合率<sup>2)</sup>

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。

##### 4. 肝障害患者・高齢者の血中濃度

ペンタゾシン0.4mg/kgを経口投与した結果、肝硬変患者（8例）においては健康成人（4例）と比較してペンタゾシンの血中クリアランスは約1/2に低下して半減期は約1.7倍に延長し、生物学的利用率は約3.8倍に増加した<sup>3)</sup>。

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を静脈内投与した結果、高齢層では若年層と比較して総クリアランスは約1/2に低下し、半減期は約1.6倍に延長した<sup>4)</sup>。

肝障害患者及び高齢者に本剤を投与するときは、投与量、投与間隔の適切な調節が必要である。

## 【臨床成績】<sup>5)~7)</sup>

各種癌における鎮痛を目的とした二重盲検比較試験における本剤の有効率は「有効」以上で71.43% (85/119) であり、有用性が認められている。

## 【薬効薬理】

### 1. 鎮痛効果

化学刺激（マウス酢酸writhing法<sup>8)</sup>、ラットアセチルコリン動注法<sup>9)</sup>）及び電気刺激（ラット尾部電気刺激<sup>8)</sup>、ネコ屈曲反射<sup>9)</sup>、ウサギ歯髄刺激<sup>9)</sup>）による疼痛反応に対する鎮痛効果試験において、ペンタゾシン（20～200mg/kg P.O.）の効力は、コデインリン酸塩の約1/3～1倍、アスピリンの約3.5倍であった。経口投与した場合15分以内に鎮痛効果が発現し、その後約60分持続する（ラットアセチルコリン動注法<sup>9)</sup>）。本剤中に添加されているナロキソン量（1錠あたり0.25mg）では、経口投与により全量が肝初回通過効果による速やかな代謝を受け<sup>10),11)</sup>、作用を発現せず、ペンタゾシンの薬理作用を阻害することはない。しかし、本剤を注射投与した場合、ナロキソンはペンタゾシンの薬理作用に拮抗する。

### 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）<sup>12)</sup>。

## 【有効成分及び添加物に関する理化学的知見】

### 1. 塩酸ペンタゾシンの理化学的知見

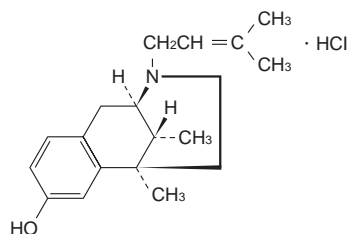
一般名：塩酸ペンタゾシン

Pentazocine Hydrochloride [JAN]

化学名：(2*R*\*,6*R*\*,11*R*\*)-1,2,3,4,5,6-hexahydro-6,11-dimethyl-3-(3-methyl-2-butenyl)-2,6-methano-3-benzazocin-8-ol monohydrochloride

分子式：C<sub>19</sub>H<sub>27</sub>NO·HCl

化学構造式：



分子量：321.89

融点：約248℃（分解）

性状：白色～微黄白色の結晶性の粉末である。

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

### 2. ナロキソン塩酸塩の理化学的知見

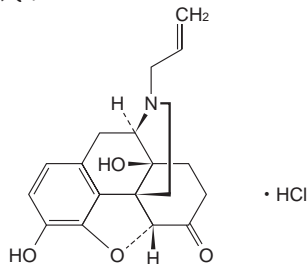
一般名：ナロキソン塩酸塩

Naloxone Hydrochloride [JAN]

化学名：(5*R*,14*S*)-17-Allyl-4,5-epoxy-3,14-dihydroxymorphinan-6-one monohydrochloride

分子式：C<sub>19</sub>H<sub>21</sub>NO<sub>4</sub>·HCl

化学構造式：



分子量：363.84

性状：白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

水に溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール（99.5）又は酢酸（100）に溶けにくく、無水酢酸に極めて溶けにくい。

吸湿性である。

光によって着色する。

## 【包装】

ペルタゾン錠25：100錠（10錠×10）

## \*\*\*【主要文献及び文献請求先】

### <主要文献>

- 1) 社内資料（健康人VolunteerにPentazocine Hydrochloride 経口投与後の血中濃度ならびに尿中排泄）
- 2) Ehrnebo, M. et al.: Clin. Pharmacol. Ther., **16** : 424,1974
- 3) Neal, E. A. et al.: Gastroenterology, **77** : 96, 1979
- 4) Ritschel, W. A. et al.: Meth and Find Exptl. Clin. Pharmacol., **8** : 497, 1986
- 5) 榎本尚美他：治療, **58** : 1835, 1976
- 6) 坪井慶孝他：治療, **59** : 178, 1977
- 7) 古江尚他：医学のあゆみ, **93** : 292, 1975
- 8) 社内資料〔Pentazocine・HClの経口投与による鎮痛効果の検討（第1報）〕
- 9) 社内資料〔Pentazocine・HClの経口投与による鎮痛効果の検討（第2報）〕
- 10) Berkowitz, B. A.: Clinical Pharmacokinetics, **1** : 219, 1976
- 11) Weinstein, S. H. et al.: J. Pharm. Sci., **62** : 1416, 1973
- 12) Lim, R. K. S. et al.: Bull. Drug Addiction and Narcotics, p3983, 1964

### <文献請求先>

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

日本化薬株式会社 医薬事業本部

営業本部 医薬品情報センター

（住所）〒100-0005 東京都千代田区丸の内二丁目1番1号

（TEL）0120-505-282（フリーダイヤル）

製造販売元

**あすか製薬株式会社**

東京都港区芝浦二丁目5番1号

\*\*\* 発売元

**日本化薬株式会社**

東京都千代田区丸の内二丁目1番1号

\* 提携先

**SANOFI**