

医薬品インタビューフォーム
日本病院薬剤師会のIF記載要領 2018（2019年更新版）に準拠して作成

鎮痛剤
ペンタゾシン注射液
ソセゴン®注射液15mg
Sosegon® Injection 15mg

ペンタゾシン注射液
ソセゴン®注射液30mg
Sosegon® Injection 30mg

®登録商標
(SOSEGON、ソセゴンはサノフィアベンティス・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ある。)

剤形	注射剤（アンプル：溶液）		
製剤の規制区分	劇薬、向精神薬（第二種向精神薬）、習慣性医薬品（注意－習慣性あり）、処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）		
規格・含量	15mg：1アンプル（1mL）中 日局ペンタゾシン 15mg 30mg：1アンプル（1mL）中 日局ペンタゾシン 30mg		
一般名	和名：ペンタゾシン（JAN） 洋名：Pentazocine（JAN、INN）		
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日		15mg	30mg
	製造販売承認年月日	1970年 3月24日	1970年 3月24日
	薬価基準収載年月日	1970年 8月 1日	1976年 9月 1日
	販売開始年月日	1970年 8月 1日	1970年 6月 4日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元 丸石製薬株式会社 提携：SANOFI		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	丸石製薬株式会社 学術情報部 TEL 0120-014-561 FAX 06-6965-0900 受付時間：9：00～17：00（土日祝日、当社休日を除く） 医薬関係者向けホームページ https://www.maruishi-pharm.co.jp/medicalstaffs		

本IFは2024年3月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。
最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。
専用アプリ「添文ナビ」でGS1バーコードを読み取ることで、最新の電子添文等を閲覧できます。

15mg

30mg



(01)14987211135338



(01)14987211135376

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってI Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、I Fの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I Fが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I Fの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I Fを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。I Fは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的特性	1
3. 製品の製剤学的特性	1
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1
6. RMPの概要	2
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名（命名法）又は本質	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3
IV. 製剤に関する項目	4
1. 剤形	4
2. 製剤の組成	4
3. 添付溶解液の組成及び容量	4
4. 力価	4
5. 混入する可能性のある夾雑物	4
6. 製剤の各種条件下における安定性	5
7. 調製法及び溶解後の安定性	5
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5
9. 溶出性	5
10. 容器・包装	5
11. 別途提供される資材類	6
12. その他	6
V. 治療に関する項目	6
1. 効能又は効果	6
2. 効能又は効果に関連する注意	6
3. 用法及び用量	6
4. 用法及び用量に関連する注意	6
5. 臨床成績	6
VI. 薬効薬理に関する項目	8
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	8
2. 薬理作用	8
VII. 薬物動態に関する項目	8
1. 血中濃度の推移	8
2. 薬物速度論的パラメータ	9
3. 母集団（ポピュレーション）解析	9
4. 吸収	9
5. 分布	9
6. 代謝	10
7. 排泄	11
8. トランスポーターに関する情報	11
9. 透析等による除去率	11
10. 特定の背景を有する患者	11
11. その他	12

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	12
1. 警告内容とその理由	12
2. 禁忌内容とその理由	12
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	12
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	12
5. 重要な基本的注意とその理由	12
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	13
7. 相互作用	14
8. 副作用	16
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	18
10. 過量投与	18
11. 適用上の注意	18
12. その他の注意	19
IX. 非臨床試験に関する項目	19
1. 薬理試験	19
2. 毒性試験	19
X. 管理的事項に関する項目	21
1. 規制区分	21
2. 有効期間	21
3. 包装状態での貯法	21
4. 取扱い上の注意	21
5. 患者向け資材	21
6. 同一成分・同効薬	21
7. 国際誕生年月日	21
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	21
9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	21
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	22
11. 再審査期間	22
12. 投薬期間制限に関する情報	22
13. 各種コード	22
14. 保険給付上の注意	22
X I. 文献	22
1. 引用文献	22
2. その他の参考文献	23
X II. 参考資料	23
1. 主な外国での発売状況	23
2. 海外における臨床支援情報	23
X III. 備考	24
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	24
2. その他の関連資料	24

略語表

なし（個別に各項目において解説する。）

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

1959年スターリング・ウインスロップ研究所(現 SANOFI)で、ベンゾモルファン核化合物を研究中 N-dimethyl allyl 誘導体であるペンタゾシンを発見した。

本剤は弱い麻薬拮抗性を有し、鎮痛作用は、動物実験では弱いが生体では強力であり、臨床的には、ソセゴン(ペンタゾシン) 30mg の非経口投与は、モルヒネ 10mg にはほぼ匹敵する鎮痛効果が認められた。

一方、米国 NIH のサルの実験および Lexington の Addiction Research Center におけるヒトの実験によりソセゴンにはモルヒネ様の依存性のないことが証明された。ついで 1,200 例以上の臨床試験の結果、90%以上の有効率が得られ、1966年、WHO 依存性薬物専門委員会は、麻薬として規制する必要が無いとの結論を下した。

ソセゴン注射液 15mg 及びソセゴン注射液 30mg は、1970年3月24日に山之内製薬(現 アステラス製薬)が製造販売承認を取得し、2012年10月1日付で丸石製薬が製造販売承認を承継し、販売を開始した。

2. 製品の治療学的特性

1. ソセゴン注射液 15mg・30mg は以下の効能又は効果^{*注}を有している。

ソセゴン注射液 15mg

○下記疾患並びに状態における鎮痛

各種癌、術後、心筋梗塞、胃・十二指腸潰瘍、腎・尿路結石、閉塞性動脈炎、胃・尿管・膀胱検査器具使用時

○麻酔前投薬および麻酔補助

ソセゴン注射液 30mg

麻酔前投薬および麻酔補助

^{*注}：効能又は効果により承認用法(投与経路)が異なる。各種鎮痛(15mgのみ)の目的においては「筋肉内または皮下に注射」、麻酔前投薬および麻酔補助(15mg・30mg)の目的においては「筋肉内、皮下または静脈内に注射」である。

(「V. 1. 効能又は効果」、3. 「用法及び用量」の項参照)

2. 本剤の有効成分ペンタゾシン 30mg の非経口投与は、モルヒネ 10mg^{1,2)}、ペチジン 75~100mg³⁾ にはほぼ匹敵する鎮痛効果を有する。

(「VI. 2. (2) 薬効を裏付ける試験成績」の項参照)

3. 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^{2,3)}。

(「VI. 2. (2) 薬効を裏付ける試験成績」の項参照)

4. 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)、呼吸抑制(0.42%)、依存性(頻度不明)、中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis: TEN)(頻度不明)、無顆粒球症(頻度不明)、神経原性筋障害(頻度不明)、痙攣(頻度不明)が報告されている。主な副作用として、傾眠、めまい、ふらつき、発汗、悪心(いずれも 1~5%)が報告されている。

副作用の詳細については、電子添文の副作用を参照のこと。(「VIII. 8. 副作用」の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

本剤は非麻薬性鎮痛薬で、規制区分は劇薬、向精神薬(第二種向精神薬)、習慣性医薬品、処方箋医薬品である。

(「X. 1. 規制区分」の項参照)

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

(2024年12月2日時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない（RMP策定対象外の事例）

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和 名 ソセゴン注射液 15mg

ソセゴン注射液 30mg

(2) 洋 名 Sosegon Injection 15mg

Sosegon Injection 30mg

(3) 名称の由来 不明

(SOSEGON、ソセゴンはサノフイーアベンティス・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ある。)

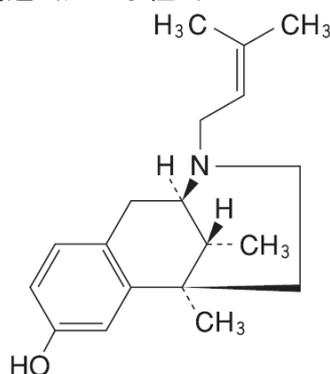
2. 一般名

(1) 和名（命名法） ペンタゾシン（JAN）

(2) 洋名（命名法） Pentazocine（JAN、INN）

(3) ステム 6,7-ベンゾモルファン系麻薬拮抗薬／作動薬：-azocine

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₉H₂₇NO

分子量：285.42

5. 化学名（命名法）又は本質

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-benzazocin-8-ol

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

一般名：ペンタゾシン 記号番号：Win20228

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～微黄白色の結晶性の粉末で、においはない。

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

吸湿性はない^{4,5)}。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：150～158℃

(5) 酸塩基解離定数

pKa₁：8.0^{4,5)}

pKa₂：9.7^{4,5)}

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

吸光度： $E_{1\text{cm}}^{1\%}$ （278nm）67.5～71.5（乾燥後、0.1g、0.01mol/L 塩酸試液、1000mL）

2. 有効成分の各種条件下における安定性

試験の種類		保存条件	保存形態	保存期間	結果*1
長期保存試験		室温・遮光	気密	24週間	変化なし
苛酷試験	加温・加湿	40℃、80%RH、遮光	曝気	12週間	変化なし
	光	室温 フェードメーター*2	気密	5時間	変化なし

*1：測定項目は、外観、融点、含量、薄層クロマトグラフィー、紫外外部吸収スペクトル

*2：本試験における照射量は、19,236MW/min/cm²であり、当照射1時間は、自然条件における48時間の日光照射量に相当する。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

日本薬局方 医薬品各条「ペンタゾシン」の確認試験法による

- (1) 本品 1 mg にホルムアルデヒド液・硫酸試液 0.5 mL を加えるとき、濃赤色を呈し、直ちに灰褐色に変わる。
- (2) 本品 5 mg を硫酸 5 mL に溶かし、塩化鉄（Ⅲ）試液 1 滴を加え、水浴中で 2 分間加熱するとき、液の色は淡黄色から濃黄色に変わる。さらに硝酸 1 滴を加え、振り混ぜるとき、液は黄色を保つ。
- (3) 本品の 0.01 mol/L 塩酸試液溶液（1→10000）につき、紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

定量法

日本薬局方 医薬品各条「ペンタゾシン」の定量法による

本品を乾燥し、その約 0.5g を精密に量り、酢酸（100）50 mL を加えて溶かし、0.1mol/L 過塩素酸で滴定する（指示薬：クリスタルバイオレット試液 2 滴）。同様の方法で空試験を行い、補正する。

0.1 mol/L 過塩素酸 1 mL = 28.54 mg C₁₉H₂₇NO

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

注射剤（アンプル：溶液）

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	ソセゴン注射液 15mg	ソセゴン注射液 30mg
外観	注射剤（無色アンプル） 	注射剤（無色アンプル） 
性状	無色～ほとんど無色澄明の液	

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

販売名	ソセゴン注射液 15mg	ソセゴン注射液 30mg
pH	3.5～5.5	
浸透圧比	約 1（生理食塩液に対する比）	

(5) その他

注射剤の容器中の特殊な気体（窒素置換等）の有無：あり

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	ソセゴン注射液 15mg	ソセゴン注射液 30mg
有効成分	1 アンプル（1mL）中 日局ペンタゾシン 15mg	1 アンプル（1mL）中 日局ペンタゾシン 30mg
添加剤	乳酸、等張化剤	

(2) 電解質等の濃度

販売名	ソセゴン注射液 15mg	ソセゴン注射液 30mg
Na ⁺ (mEq)	0.09	0.05
Cl ⁻ (mEq)	0.09	0.05

(3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験 (ソセゴン注射液 15mg 及びソセゴン注射液 30mg)

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
加速試験	40°C±2°C、 75%RH±5%RH	最終包装形態 (ガラスアンプル・ 個装箱)	6 ヶ月	全ての試験項目において 規格の範囲内であった。

試験項目：性状（外観、pH）、確認試験、採取容量試験、不溶性異物検査、不溶性微粒子試験、エンドトキシン試験、無菌試験、定量法

(2) 苛酷試験 (ソセゴン注射液 15mg 及びソセゴン注射液 30mg)

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果*1
苛酷試験	温度	無色アンプル	12週間	変化なし
苛酷試験	室温 フェードメーター*2	無色アンプル	5時間	変化なし

*1：測定項目は、性状、pH、定量、紫外吸収スペクトル、薄層クロマトグラフィー

*2：本試験における照射量は、19,236MW/min/cm であり、当照射 1 時間は、自然条件における 48 時間の日光照射量に相当する。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

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。（「Ⅷ. 11. 適用上の注意（14.1）」の項参照）

pH 変動試験

販売名 (有効成分 単位/容量)	試料 pH	0.1mol/mLHCl 添加量 (A)	変化点 pH 又は 最終 pH	移動指数	変化所見
		0.1mol/mLNaOH 添加量 (B)			
ソセゴン注射液 15mg (ペンタゾシン 15mg/1mL)	4.40	(A) 10.0mL	1.12	3.28	変化なし
		(B) 0.13mL	6.20	1.80	白色結晶析出
ソセゴン注射液 30mg (ペンタゾシン 30mg/1mL)	4.40	(A) 10.0mL	1.12	3.28	変化なし
		(B) 0.28mL	6.50	2.10	白色結晶析出

配合変化

他剤との配合変化については、「丸石製薬株式会社医療関係者向けウェブサイト <https://www.maruishi-pharm.co.jp/medicalstaffs>」をご参照いただくか、表紙の問い合わせ窓口までご連絡ください。

※配合変化表の内容については製造販売承認承継時に入手したものであり、配合薬品の販売名・会社名は試験当時の名称を記載しています（販売名変更や販売中止になっていることがあります）。

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

(2) 包装

ソセゴン注射液 15mg

1mL×10 アンプル、1mL×50 アンプル

ソセゴン注射液 30mg

1mL×10 アンプル

(3) 予備容量

該当しない

- (4) 容器の材質
無色透明ガラス（ワンポイントカットアンプル）

11. 別途提供される資材類
該当資料なし

12. その他
該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

ソセゴン注射液 15mg

○下記疾患並びに状態における鎮痛

各種癌、術後、心筋梗塞、胃・十二指腸潰瘍、腎・尿路結石、閉塞性動脈炎、胃・尿管・膀胱検査器具使用時

○麻酔前投薬および麻酔補助

ソセゴン注射液 30mg

麻酔前投薬および麻酔補助

2. 効能又は効果に関連する注意
設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

ソセゴン注射液 15mg

〈鎮痛〉

通常、成人にはペンタゾシンとして 1 回 15mg を筋肉内または皮下に注射し、その後必要に応じて、3～4 時間毎に反復注射する。なお、症状により適宜増減する。

〈麻酔前投薬および麻酔補助〉

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。

ソセゴン注射液 30mg

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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意
設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

〈鎮痛〉

① 一般臨床試験成績

本剤の臨床試験は、各科領域における各種疼痛の緩解を目的として、総症例数 2,493 例について実施された。その結果、癌性疼痛 96.9% (1,275/1,316 例)、術後疼痛 88.2% (484/549 例)、胸腹部臓器疾患に伴う疼痛 94.4% (321/340 例)、検査器具使用時の疼痛 79.5% (159/200 例) 等の有効率が得られた^{4～12)}*。(*:ここに示した文献は、現在公開されているもののみ記載した。)

② 二重盲検比較試験成績

癌性疼痛、術後疼痛を対象としたプラセボ（生理食塩液）との二重盲検比較試験により、本剤の鎮痛効果は投与後 20 分から 2～3 時間において、対照群に比し有意差をもって認められた^{13～17)}。

〈麻酔前投薬及び麻酔補助〉

麻酔前投薬及び麻酔補助本剤の麻酔前投薬及び麻酔補助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、30～60mg 投与により 77.0% (47/61 例) の有効率が得られた^{18,19)} *。 (*：ここに示した文献は、現在公開されているもののみ記載した。)

2) 安全性試験

該当資料なし

〈参考〉

長期投与試験（使用経験データより）^{4,6,7,9)}。

慢性疼痛に対してペンタゾシンを 15～30mg/回を標準量として、症例により適宜増減し、最長 130 日間にわたって反復投与した結果、鎮痛効果持続時間には一定の傾向が認められず、依存性の形成、投与中止による禁断症状は報告されていない。また、少数例に一過性の悪心、嘔吐、発汗がみられた以外には長期連用によると思われる副作用の発現は認められなかった。

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

実施していない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

1) 探索的試験

下記に示した結果は、国内での多施設臨床試験であり、二重盲検比較試験を含むペンタゾシン使用経験を示したものである^{4～13)} *。 (*：ここに示した文献は、現在公開されているもののみ記載した。)

〈参考〉

癌性疼痛、術後疼痛、胸腹部臓器疾患に伴う疼痛、検査器具使用時の疼痛、麻酔前投与及び麻酔補助、分娩に伴う疼痛に対して、標準量として 15～30mg/回（症例により適宜増減可）を単回もしくは反復投与し、本剤の有効性、安全性を検討した結果、効能又は効果、用法及び用量「各種疼痛では、1 回 15mg を筋肉内又は皮下に注射し、その後必要に応じて 3～4 時間毎に反復注射する。症状により適宜増減可。麻酔前投薬及び麻酔補助では 30～60mg を筋肉内、皮下又は静脈内に注射する。症例により適宜増減可」、および安全性が確認された。

2) 無作為化並行用量反応試験

下記に示した結果は、国内での多施設臨床試験であり、クロスオーバー試験を含む二重盲検試験を示したものである^{13～17)} *。 (*：ここに示した文献は、現在公開されているもののみ記載した。)

〈参考〉

癌性疼痛、術後疼痛、炎症性疼痛の患者を対象として、ペンタゾシン 15mg または 30mg およびプラセボを 1 回筋注し、その効果を二重盲検比較試験（1 部施設にて重複投与あり）にて本剤の有効性および安全性を検討した結果、ペンタゾシン 15mg・30mg 群はプラセボ群に比し有意差を持って有効性が認められ、安全性においても問題ないことが確認された。

3) 比較試験

① 〈外国人データ〉

術後疼痛の患者を対象として、ペンタゾシン 30mg、塩酸メペリジン（対象薬）50mg および 100mg を 1 回筋注し、その効果を二重盲検比較試験法により調べた結果、ペンタゾシン 30mg の鎮痛効果は、塩酸メペリジン（ペチジン）50～100mg にほぼ匹敵するものと考えられた³⁾。

② 〈外国人データ〉

術後疼痛の患者を対象として、ペンタゾシン 30mg、モルヒネ 10mg を 1 回筋注し、その効果を二重盲検比較試験法により調べた結果、ペンタゾシン 30 mg の鎮痛効果は、モルヒ

- ネ 10mg にほぼ匹敵するものと考えられた¹⁾。
 ③術後疼痛の患者を対象として、ペンタゾシン 15mg および 30mg、モルヒネ 5mg および 10mg、プラセボを 1 回筋注し、その効果を二重盲検比較試験にて調べた結果、ペンタゾシン 30mg は、モルヒネ 10mg にほぼ匹敵する鎮痛効果を示すが、持続性においては、やや劣るものと考えられた²⁾。

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

オピオイド受容体作動薬

一般名：モルヒネ塩酸塩水和物等

オピオイド受容体作動薬・拮抗薬

一般名：ブプレノルフィン塩酸塩等

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

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²⁰⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

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 10mg^{1,2)}、ペチジン 75～100mg³⁾ にほぼ匹敵する鎮痛効果を有する。

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^{2,3)}。

(3) 作用発現時間・持続時間

「VI. 2. (2) 薬効を裏付ける試験成績」の項参照

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

0.03～0.1 μ g/mL²¹⁾

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

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（臀筋内）^{注)}もしくは 0.5mg/kg を静注^{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²²⁾。

薬動学的パラメータ

投与経路	用量 (mg/kg)	C _{max} [*] (μ g/mL)	T _{max} (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

注) ソセゴン注射液 15mg の承認された用量は、「〈鎮痛〉通常、成人にはペンタゾシンとして 1 回 15mg を筋肉内または皮下に注射し、その後必要に応じて、3～4 時間毎に反復注射する。なお、症状により適宜増減する。〈麻酔前投薬および麻酔補助〉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。」である。

ソセゴン注射液 30mg の承認された用量は、「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。」である。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

「VIII. 7. 相互作用」の項参照

2. 薬物速度論的パラメータ

- (1) 解析方法
該当資料なし
- (2) 吸収速度定数
該当資料なし
- (3) 消失速度定数
 0.0278min^{-1} ²¹⁾
- (4) クリアランス
該当資料なし
- (5) 分布容積
 $3.5\sim 7.5\text{L/kg}$ ²¹⁾
- (6) その他
該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

- (1) 解析方法
該当資料なし
- (2) パラメータ変動要因
該当資料なし

4. 吸収

術後疼痛患者 8 名に、ペンタゾシン 45mg を筋注し、1 時間間隔で採血し、spectrophotofluorometric 法（蛍光法）で血漿中のペンタゾシン濃度を測定すると共に、鎮痛効果を 5 段階に評価したところ、血漿中濃度と鎮痛効果は平行しており、15～60 分で最高濃度 $0.14\ \mu\text{g/mL}$ を示し、半減期は約 2 時間であった ^{23,24)}。（外国人データ）

<参考>

AUC ($\mu\text{g}\cdot\text{h/mL}$) : 0.23 ± 0.13 (ヒト、 0.5mg/kg 筋注)、 0.87 ± 0.47 (ヒト、 1.0mg/kg 筋注)、 0.28 ± 0.16 (ヒト、 0.5mg/kg 静注) ²²⁾。

5. 分布

- (1) 血液－脳関門通過性
通過する ²⁵⁾
- (2) 血液－胎盤関門通過性
通過する
(外国人データ)
 24mg 投与で母体血中濃度 $0.03\sim 0.11\ \mu\text{g/mL}$ に比し、新生児 $0.02\sim 0.08\ \mu\text{g/mL}$ と比較的低かった ²⁶⁾。
- (3) 乳汁への移行性
該当資料なし
- (4) 髄液への移行性
移行する

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

<参考>

サル：H³-ペンタゾシン静注投与後の組織分布は以下のようになった。

H³-ペンタゾシン静注投与後の組織分布（サル）^{24,27)}

($\mu\text{g/g}$ 組織)

サル	A	B	C
投与量mg/kg	5.5	2.4	4.0
組 織	4.5	5.0	6.2
副 腎	2.86	1.29	1.46
脳*	1.19	0.60	0.39
脂 肪	1.02	0.48	0.59
心 臓	1.78	0.72	0.92
腎 臓	8.40	3.18	2.82
肝 臓	10.25	4.43	5.64
肺 臓	3.89	1.74	2.55
筋 肉	1.28	0.49	0.50
脾 臓	4.61	2.28	2.40

* 白質、灰白質の平均値

組織内濃度では肝が最高であり、腎、脾がこれにつき、中枢神経系からも検出された²⁷⁾。

(6) 血漿蛋白結合率

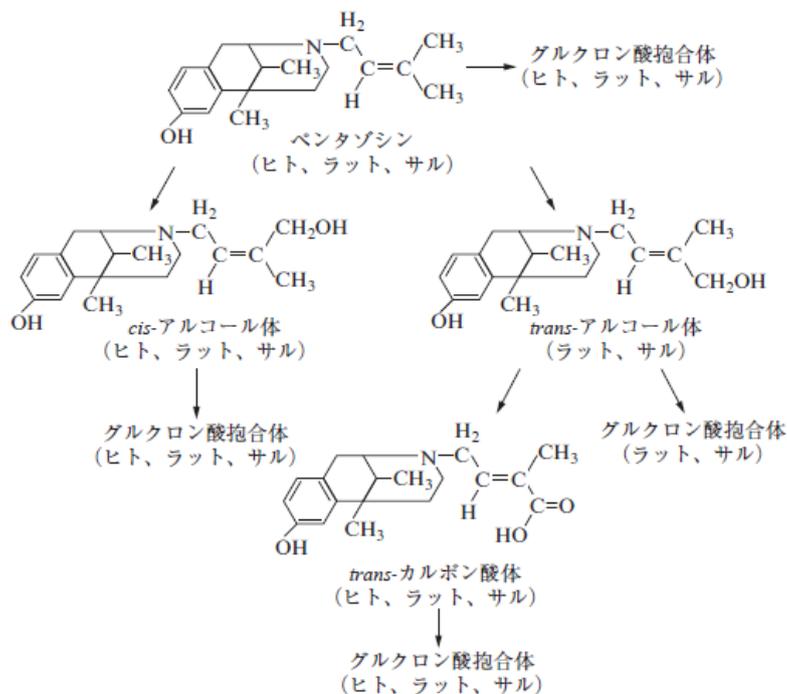
健康成人（20例）及び脳神経外科手術後の患者（22例）でのペンタゾシンの血漿蛋白結合率を検討した結果、それぞれ61.1%及び65.8%であった²⁸⁾。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

肝で代謝される^{21,29)}

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²³⁾。



(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

CYP2D6³¹⁾

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当しない

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

ペンタゾシン代謝物である *trans*-カルボン酸体及び *trans*-アルコール体は、鎮痛作用をほとんど示さなかった。

また、*cis*-アルコール体も *trans*-カルボン酸体と同様に鎮痛作用はないとされることから、代謝物による鎮痛作用への寄与はほとんどないと考えられる²³⁾。

7. 排泄

腎臓より尿中に排泄される³²⁾。

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³²⁾。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

1) 高齢者〈外国人データ〉

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^{注)}、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³³⁾。

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。

(「VIII. 6. (8) 高齢者」の項参照)

	症例数	投与量	総クリアランス (mL/min/kg)	半減期 (h)
若年層	健康成人 (8例) 術後患者 (1例)	30mg 80mg	22.1±4.1	2.5±0.7
高齢層	術後患者 (5例) 疼痛患者 (3例)	45~60mg 30mg	11.7±3.6	4.1±1.2

Mean±S.D.

注) ソセゴン注射液 15mg の承認された用量は、「〈鎮痛〉通常、成人にはペンタゾシンとして 1 回 15mg を筋肉内または皮下に注射し、その後必要に応じて、3~4 時間毎に反復注射する。なお、症状により適宜増減する。〈麻酔前投薬および麻酔補助〉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。」である。

ソセゴン注射液 30mg の承認された用量は、「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。」である。

2) 肝障害患者 (外国人データ)

健常人 (4 例) と肝硬変患者 (8 例) にペンタゾシン 0.4mg/kg を静脈内投与した結果、肝硬変患者では健常人と比較して血中クリアランスが約 1/2 に低下し、半減期は約 1.7 倍に延長、生物学的利用率は約 3.8 倍に増加した³⁴⁾。

健康成人と肝硬変の被験者に関する薬物動態学データ

	ペンタゾシン	
	健康成人 (n=4)	肝硬変患者 (n=8)
血中クリアランス (mL/min)	1.246±236	675±296
腎クリアランス (mL/min)	45±107	75±29
見かけの分布容積 (L)	415±107	356±94
定常状態での分布容積 (L)	342±188	306±77
後期相半減期 (min)	230±28	396±115
生物学的利用率	0.18±0.05	0.68±0.21

Mean±S.D.

11. その他
該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由
設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2.2 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。]
2.3 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。]
2.4 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。] [10.1 参照]

(解説)

- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往が判明した場合は、より重篤な症状が発現する可能性があるため、本剤の投与を避けること。
2.2 本剤を投与することにより、呼吸抑制を生じることがある。その結果、血中の二酸化炭素分圧が高まり、これが脳内血管を拡張し、頭蓋内圧が上昇することが考えられるので、頭部傷害がある患者又は頭蓋内圧が上昇している患者には本剤の投与を避けること。
2.3 本剤は呼吸中枢を抑制し、血中の二酸化炭素分圧に対する感受性を低下させることによる、中枢性鎮痛剤に特有の呼吸抑制メカニズムを有している。そのため、既に呼吸抑制状態にある患者及び全身状態が悪化している患者には本剤の投与を避けること。
2.4 μ オピオイド受容体拮抗剤であるナルメフェン塩酸塩水和物（販売名：セリクロ錠）が本剤に対して競合的に阻害することで、本剤の離脱症状を起こすおそれや、本剤の効果を減弱させるおそれがある。そのため、ナルメフェン塩酸塩水和物を投与中又は投与中止後 1 週間以内の患者には本剤の投与を避けること。（「VIII. 7. 相互作用 (1) 併用禁忌とその理由」の項参照）

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由
設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由
設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

- 8.1 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。
8.2 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。
8.3 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、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。[11.1.3 参照]

(解説)

- 8.2 本剤は鎮痛作用とともに鎮静作用を有しており、本剤投与中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が必要である。
8.3 本剤は μ オピオイド受容体の部分作動薬であるため、連用すると依存性を生じることがあるので、観察を十分に行うことが大切である。特に薬物依存の既往歴がある患者には注意して投与すること。（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状 (11.1.3)」の項参照）

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 薬物依存の既往歴のある患者

[11.1.3 参照]

9.1.2 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。

9.1.3 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。

9.1.4 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。

(解説)

9.1.1 本剤を投与することにより、依存性が発現する可能性がある。問診の結果、薬物依存の既往歴のある患者に投与する場合は、患者の状態を十分に観察するよう注意すること。(「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状 (11.1.3)」の項参照)

9.1.2 本剤は、麻薬 (モルヒネ等) と拮抗する作用 (μ 受容体拮抗作用) が認められているので、本剤を投与することにより、禁断症状を呈することがある。本剤を投与する場合は、患者の状態を十分に観察するよう注意すること。

9.1.3 本剤を大量投与することにより、Oddi 氏筋 (Oddi 括約筋) が収縮することがある。胆道疾患のある患者はさらに胆汁が流れにくくなる可能性があるので、患者の状態を十分に観察するよう注意すること。

9.1.4 本剤を投与することにより肺動脈圧及び血管抵抗を上昇させることがあるので、心筋梗塞の患者に投与する場合は、患者の状態を十分に観察するよう注意すること。

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

本剤の作用が増強するおそれがある。

(解説)

9.3 ペンタゾシン 0.4mg/kg をクロスオーバー法で静脈内投与及び経口投与を行い、健康成人と肝硬変患者における本剤の薬物動態を検討した試験では、血中クリアランスは健康成人の約 1/2 に低下、半減期は約 1.7 倍に延長、生物学的利用率は約 3.8 倍に増加した 51)。

この結果より、肝機能障害のある患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となる。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

9.5.1 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。

9.5.2 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。

9.5.3 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。

(6) 授乳婦

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。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等には投与しないことが望ましい。小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

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。[16.6.1 参照]

(解説)

9.8 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。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が必要である。(「VII. 10. 特定の背景を有する患者」の項参照)

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

10.1 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 セリンクロ [2.4 参照]	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。

(解説)

μ オピオイド受容体拮抗剤であるナルメフェン塩酸塩水和物(販売名:セリンクロ錠)が本剤に対して競合的に阻害することで、本剤の離脱症状を起こすおそれや、本剤の効果を減弱させるおそれがある。そのため、本剤とナルメフェン塩酸塩水和物は併用しないこと。(VIII. 2. 禁忌内容とその理由(2.4)の項参照)

(2) 併用注意とその理由

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
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。
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、退薬症候を起こすおそれがある。	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 C_{max} が約2倍程度高くなり、サリチルアミドの C_{max} 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。

8. 副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

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。

11.1.2 呼吸抑制（0.42%）

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（レバロルフアン）は無効である。

11.1.3 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。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。[8.3 参照]、[9.1.1 参照]

11.1.4 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）（頻度不明）

11.1.5 無顆粒球症（頻度不明）

11.1.6 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。

11.1.7 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。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

種類\頻度	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)} 、しびれ感、多幸感、不安、頭痛、頭重、複視、振戦	錯乱 ^{注)} 、鎮静、意識障害、浮遊感、興奮、痙攣
循環器		血圧上昇、血圧低下、皮膚潮紅、熱感	
消化器	悪心	嘔吐、口渇	便秘
過敏症			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) 特に静脈内注射する場合には注意すること。

◆副作用頻度一覧表等

時期 対象	承認時迄の調査	使用成績調査の累計 (1970年3月24日～ 1973年11月21日)	合計
調査施設数①	221	-	-
調査症例数②	2,554	6,168	8,722
副作用等の発現症例数③	363	2,154	2,517
副作用等の発現件数④	-	-	-
副作用等の発現症例率 (③/② × 100) (%)	14.21	34.92	28.86

副作用等の種類	副作用等の種類別発現症例数及び件数 (発現率 (%))		
皮膚・皮膚付属器障害	0	1 (0.02)	1 (0.01)
掻痒感	0	1 (0.02)	1 (0.01)
中枢・末梢神経系障害	63 (2.47)	344 (5.58)	407 (4.67)
めまい・ふらつき	50 (1.96)	293 (4.75)	343 (3.93)
頭痛・頭重	7 (0.27)	31 (0.50)	38 (0.44)
しびれ感	3 (0.12)	8 (0.13)	11 (0.13)
拘縮・振せん	3 (0.12)	5 (0.08)	8 (0.09)
舌のもつれ	0	1 (0.02)	1 (0.01)
冷感	0	1 (0.02)	1 (0.01)
不随意運動	0	1 (0.02)	1 (0.01)
全身痙攣発作	0	2 (0.03)	2 (0.02)
意識レベルの低下	0	2 (0.03)	2 (0.02)
自律神経系障害	74 (2.90)	349 (5.66)	423 (4.85)
発汗	74 (2.90)	348 (5.64)	422 (4.84)
冷汗	0	1 (0.02)	1 (0.01)
視覚障害	1 (0.04)	6 (0.10)	7 (0.08)
複視	1 (0.04)	3 (0.05)	4 (0.05)
視野不明瞭	0	1 (0.02)	1 (0.01)
結膜充血	0	1 (0.02)	1 (0.01)
目があけられない	0	1 (0.02)	1 (0.01)
聴覚・前庭障害	1 (0.04)	0	1 (0.01)
耳鳴	1 (0.04)	0	1 (0.01)
精神障害	51 (2.00)	574 (9.31)	563 (6.45)
ねむけ	37 (1.45)	480 (6.61)	455 (5.10)
幻覚	6 (0.23)	21 (0.34)	27 (0.31)
不安感	4 (0.16)	3 (0.05)	7 (0.08)
爽快感・多幸福感	3 (0.12)	13 (0.21)	16 (0.18)
多弁	1 (0.04)	0	1 (0.01)
興奮	0	10 (0.16)	10 (0.11)
耐薬性	0	1 (0.02)	1 (0.01)
ぼんやり感	0	1 (0.02)	1 (0.01)
神経過敏	0	2 (0.03)	2 (0.02)
習慣性	0	4 (0.06)	4 (0.05)
夢	0	37 (0.60)	37 (0.42)
覚醒遅延	0	2 (0.03)	2 (0.02)
消化管障害	115 (4.50)	517 (8.38)	632 (7.25)
悪心	76 (2.98)	0	76 (0.87)
嘔吐	25 (0.98)	0	25 (0.29)
悪心・嘔吐	0	431 (6.99)	431 (4.94)
腹部膨満感	1 (0.04)	0	1 (0.01)
腹痛	0	1 (0.02)	1 (0.01)
便秘	0	5 (0.08)	5 (0.06)
食欲不振	0	1 (0.02)	1 (0.01)

副作用等の種類	副作用等の種類別発現症例数及び件数（発現率（%））		
唾液分泌増加	0	1 (0.02)	1 (0.01)
口渇	13 (0.51)	78 (1.26)	91 (1.04)
心・血管障害	6 (0.23)	187 (3.03)	193 (2.21)
血压上昇	3 (0.12)	104 (1.69)	107 (1.23)
血压低下	2 (0.08)	43 (0.70)	45 (0.52)
顔面蒼白	1 (0.04)	39 (0.63)	40 (0.46)
チアノーゼ	0	1 (0.02)	1 (0.01)
心拍数・心リズム障害	7 (0.27)	66 (1.07)	73 (0.84)
動悸	6 (0.23)	31 (0.50)	37 (0.42)
頻脈	1 (0.04)	31 (0.50)	32 (0.37)
徐脈（脈拍減少を含む）	0	2 (0.03)	2 (0.02)
不整脈	0	1 (0.02)	1 (0.01)
結滞	0	1 (0.02)	1 (0.01)
呼吸器障害	6 (0.23)	36 (0.58)	42 (0.48)
呼吸抑制	5 (0.20)	32 (0.52)	37 (0.42)
呼吸促進（迫）	1 (0.04)	1 (0.02)	2 (0.02)
気道分泌過多	0	3 (0.05)	3 (0.03)
女性生殖（器）障害	5 (0.20)	24 (0.39)	29 (0.33)
陣痛減弱	5 (0.20)	24 (0.39)	29 (0.33)
一般的全身障害	31 (1.21)	108 (1.75)	139 (1.59)
疲労感	18 (0.70)	37 (0.60)	55 (0.63)
皮膚紅潮	4 (0.16)	12 (0.19)	16 (0.18)
胸内苦悶	4 (0.16)	16 (0.26)	20 (0.23)
不快感	2 (0.08)	9 (0.15)	11 (0.13)
悪寒	2 (0.08)	4 (0.06)	6 (0.07)
全身熱感	1 (0.04)	14 (0.23)	15 (0.17)
死亡	0	9 (0.15)	9 (0.10)
体温下降	0	7 (0.11)	7 (0.08)
適用部位障害	3 (0.12)	9 (0.15)	12 (0.14)
注射部痛	3 (0.12)	9 (0.15)	12 (0.14)
不明	0	5 (0.08)	5 (0.06)
不明	0	5 (0.08)	5 (0.06)

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

傾眠、呼吸抑制、血压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。

13.2 処置

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。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

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。

14.2 薬剤投与時の注意

14.2.1 皮下・筋肉内注射時

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。

14.2.2 筋肉内注射時

組織・神経等への影響を避けるため、以下の点に配慮すること。

- ・ 神経走行部位を避けるよう注意して注射すること。
- ・ 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、小児等には投与しないことが望ましい。
- ・ 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。

12. その他の注意

- (1) 臨床使用に基づく情報
設定されていない
- (2) 非臨床試験に基づく情報
設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

平成15年7月1日以前に実施された試験であるため、医薬審発第902号(平成13年6月21日)に定める安全性薬理試験としては実施しておらず、一般薬理試験として実施した。ペンタゾシンは、モルヒネ、フェナゾシンの鎮痛効果に対し、弱い拮抗作用を示し、その作用はナロルフィン約1/50である。(ラット、tail-flick法)³⁵⁾ また、モルヒネ、ペチジンによる呼吸器・循環器系への抑制や行動抑制に対してもごく軽度の拮抗作用を示す(イヌ)³⁶⁾。

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

マウス及びラットでのLD₅₀値は以下の通りである³⁷⁾。

動物種	性別	投与経路	LD ₅₀ [mg/kg]
マウス	雄	経口	464 (411-524)
		皮下	167 (140-199)
		静脈内	28.5 (24.8-32.8)
	雌	経口	446 (391-509)
		皮下	167 (144-197)
		静脈内	25.0 (18.2-34.3)
ラット	雄	経口	1,110 (1,000-1,230)
		皮下	340 (293-394)
		静脈内	25.8 (22.63-29.4)
	雌	経口	1,160 (1,020-1,320)
		皮下	315 (258-384)
		静脈内	36.4 (30.6-43.3)

(2) 反復投与毒性試験

ラットによる実験(1、4、26、32mg/kg/day、6ヵ月皮下注射)で、32mg投与群において、肝・腎重量増加、副腎肥大、胸腺萎縮、赤血球、Hb値、アルブミン値の減少を認めたが、他の投与群では異常は認められなかった³⁷⁾。

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

ラットに、ペンタゾシンの有効量 (2.0mg/kg)、最大安全量 (30mg/kg) 及びその中間量 (15mg/kg) を妊娠 9 日目より 6 日間連続腹腔内に投与し、20 日目に開腹して観察したところ、着床率、死胎仔率、生存平均体重、外形並びに骨格異常に関して、薬剤投与群と対照群との間に有意差は認められなかった³⁸⁾。

(6) 局所刺激性試験

- ①ウサギにおける Trypan Blue 試験では、ペンタゾシンの局所組織刺激作用はメペリジンの約 2 倍であった³⁹⁾。
- ②イヌにおける皮膚攣縮試験では、ペンタゾシンの局所組織刺激作用はメペリジンの約 50 倍であった³⁹⁾。
- ③ウサギの背最長筋に対する局所障害作用を検討⁴⁰⁾

経過時間	肉眼所見	組織学的検索
1時間	注射部位に強い出血	白血球の遊走
3時間	注射部位に強い出血	白血球の遊走
6時間	限局的な出血痕	筋線維の淡染性、断裂、浮腫、横紋の消失、白血球の遊走
24時間	軽度の硬結	限局的に6時間後の症状が認められる
72時間	症状のほとんどが消失	症状のほとんど消失、僅かの出血痕

ウサギの背部の毛を 20cm 刈り取り、30mg/mL ペンタゾシンを 0.1mL ずつ 2 個所に注射上記結果より、ペンタゾシンを筋肉内に注射すると、限局性の炎症が起こるが、比較的短時間に消失するものと考えられる。

(7) その他の特殊毒性

依存性試験

- ①直接法による身体的依存性試験 (ラット) では、ペンタゾシン 5~10mg/kg の 6 日間反復投与で禁断症状による体重減少が認められなかったことから、この用量では身体的依存性は生じないものとする⁴¹⁾。また、ペンタゾシンの一定量又は週毎に増量し、40~49 日間反復投与した際のラット体重、体温及び自発的運動量に現れる変動を指標として考察した結果、ペンタゾシンを長期間にわたり反復投与すれば、耐性が形成されるが、その程度はモルヒネより明かに弱い。加えて、ペンタゾシンの長期反復投与により身体的依存が形成される可能性は少なく、この際の身体的依存は、その性質においてモルヒネ類のそれとは異なり、その程度はモルヒネ類よりも遥かに弱い⁴²⁾。
- ②脳室内投与による試験 (ラット) では、ペンタゾシンは対照の生理食塩液と同様禁断症状を起こす作用は全くないか極めて弱く、また、レバロルフアンで起こした禁断症状に拮抗する作用も殆んどないことを認めた⁴³⁾。
- ③下垂体-副腎皮質系に及ぼす影響 (ラット) では、モルヒネが示すようなヒスタミンの ACTH 分泌亢進作用に対する抑制作用は認められなかった⁴⁴⁾。
- ④リーサス猿におけるモルヒネ様身体依存性に関する評価⁴⁵⁾
モルヒネ (3mg/kg) 依存性サルを 12~14 時間放置し中等度の禁断症状を発現させた後、ペンタゾシンを皮下注射して禁断症状の抑制度を観察した結果、ペンタゾシン 2~30mg/kg ではモルヒネの禁断症状を特異的に抑制することができず、30mg/kg の高用量では本剤自身による痙攣が認められ、これ以上の用量での実験が不可能であった。従って本剤をモルヒネ様身体依存性のない薬剤と報告している。
- ⑤アカゲザルにおける薬物依存性試験⁴⁶⁾
ペンタゾシンは、アカゲザルにおいて身体依存を形成したが、その程度はコデインに比してかなり弱かった。ペンタゾシンはサルの薬物探索行動を強化したが、その強さはコデインと同等もしくはそれ以下であった。また、ペンタゾシン身体依存下でのサル薬物探索行動強化効果は強められることはなかった。従って、ペンタゾシンの薬物依存性の強さは、コデインよりも弱いものと考えられる。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製剤：劇薬、向精神薬（第二種向精神薬）、習慣性医薬品（注意－習慣性あり）、処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：劇薬、向精神薬（第二種向精神薬）、習慣性医薬品（注意－習慣性あり）

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ソセゴン錠 25mg（塩酸ペンタゾシン製剤として）

同効薬：モルヒネ塩酸塩注射液、ペチジン塩酸塩注射液

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

ソセゴン注射液 15mg

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
ソセゴン注射液15mg	1970年3月24日	14500AMZ00893	1970年8月1日	1970年8月1日
製造販売承認承継	2012年10月1日			2012年10月1日

ソセゴン注射液 30mg

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
ソセゴン注射液30mg	1970年3月24日	14500AMZ00894	1976年9月1日	1970年6月4日
製造販売承認承継	2012年10月1日			2012年10月1日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

◎承認時：1970年3月24日：ソセゴン注射液 15mg、ソセゴン注射液 30mg

〔用法及び用量〕

1. 通常、成人にはペンタゾシンとして1回 15～30mg を筋肉内・皮下又は静脈内に注射し、その後必要に応じて、3～4時間毎に反復注射する。

なお、症状により適宜増減する。

2. 麻酔前投薬及び麻酔補助に用いる場合には通常ペンタゾシンとして 30～60mg を筋肉内、皮下又は静脈内に注射するが、症例により適宜増減する。

〔効能又は効果〕

1. 下記疾患並びに状態における鎮痛

各種癌、術後、心筋梗塞、胃・十二指腸潰瘍、腎・尿路結石、閉塞性動脈炎、胃・尿管・膀胱検査器具使用時

2. 麻酔前投薬および麻酔補助

◎一変承認時：1973年5月19日：ソセゴン注射液 15mg、ソセゴン注射液 30mg

〔用法及び用量〕

1. 通常、成人にはペンタゾシンとして1回 15mg を筋肉内または皮下に注射し、その後必要に応じて、3～4時間毎に反復注射する。

なお、症状により適宜増減する。

2.麻酔前投薬及び麻酔補助に用いる場合には、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。

◎一変承認時：1976年5月19日：ソセゴン注射液 30mg

〔用法及び用量〕

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。

〔効能又は効果〕

麻酔前投薬および麻酔補助

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

「療担規則及び薬担規則並びに療担基準に基づき厚生労働大臣が定める揭示事項等」（厚生労働省告示第 107 号：平成 18 年 3 月 6 日付）とその一部改正（厚生労働省告示第 97 号：平成 20 年 3 月 19 日付）により「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価 基準収載医薬品 コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
ソセゴン注射液15mg	1149401A1027	1149401A1027	101086202	641140051
ソセゴン注射液30mg	1149401A2023	1149401A2023	101091602	641140052

14. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) Stoelting, V.K. : Anesth. Analg., 1965 ; 44 (6) : 769-772 [SO0650003] (PMID : 5321191)
- 2) 美馬昂 他 : 医学のあゆみ, 1970 ; 73 (6) : 307-312 [SO0700023]
- 3) Sadove, M.S.et al. : JAMA., 1965 ; 193 (11) : 887-892 [SO0650006] (PMID : 14341131)
- 4) 武藤輝一 他 : 診療と新薬, 1969 ; 6 : 275-279 [SO0690005]
- 5) 上野 正 他 : 日本口腔外科学会雑誌, 1969 ; 8 : 509-515 [SO0690014]
- 6) 加藤和行 他 : 診療と保険, 1969 ; 378-381
- 7) 伊藤勝基 他 : 基礎と臨床, 1969 ; 3 (1) : 29-36
- 8) 永野信之 他 : 薬物療法, 1969 ; 2 (5) : 774-777, 1969
- 9) 横山 正 他 : 診療と保険, 1969 ; (6) : 830-834
- 10) 竹内弘幸 他 : 泌尿紀要, 1969 ; 5 : 539-543 [SO0690023]
- 11) 村中 篤 他 : 産婦人科の世界, 1969 ; 2 : 638-640 [SO0690027]
- 12) 一条元彦 他 : 産婦人科の世界, 1969 ; 2 : 859-861 [SO0690020]
- 13) 葛西洋一 他 : 診断と治療, 1969 ; 57 : 2288 -2292 [SO0690037]
- 14) 村瀬正雄 他 : 新歯潮, 1969 ; 3 : 187-196
- 15) 古江尚 他 : 診療と保険, 1969 ; 11 : 830-834
- 16) 竹内弘幸 : 泌尿紀要, 1969 ; 15 : 658-662 [SO0690012]
- 17) 美馬昂 他 : 麻酔, 1969 ; 18 : 299-304 [SO0690002]
- 18) 岩月賢一 他 : 麻酔, 1969 ; 18 (4) : 292-298 [SO0690041]
- 19) 久世照五 他 : 麻酔, 1977 ; 26 (3) : 315-326 [SO0770007]
- 20) Lim, R.K.S.et al. : Bull. Drug Addiction and Narcotics., 1964 ; 3983
- 21) 日本薬剤師研修センター編集 : JPDI 日本薬局方 医薬品情報 (じほう) , 2011 ; 1814-1819
- 22) 荒川佳子 他 : 麻酔, 1981 ; 30 (4) : 356-361 [SO0810033]

- 23) Berkowitz, B. : Ann.N.Y.Acad.Sci., 1971 ; 179 : 269-281 [SO0710031] (PMID : 5285378)
- 24) 岡田和夫 : 基礎と臨床, 1975 ; 9 (7) : 1660-1666
- 25) 押見真和 他 : 薬物動態, 1997 ; 2 (S) : 282 [SO0970016]
- 26) Beckett, A. H. et al. : J. Pharm. Pharmac., 1967 ; 19 : 50S-52S [SO0670009] (PMID : 4383857)
- 27) 社内報告書 : D199800738-01.00, 1964
- 28) Ehrnebo, M. et al : Clin. Pharmacol. Ther., 1974 ; 16 (3) : 424-429 [SO0740005] (PMID : 4415010)
- 29) 横山 和子 : 臨床透析, 1995 ; 11 (5) : 862-867 [SO0950002]
- 30) Conway, W. D et al. : Biochem. Pharmacol., 1969 ; 18 : 1673-1678 [SO0690007] (PMID : 4979842)
- 31) Dafang WU, et al : J. Pharmacol. Exp. Ther., 1993 ; 266 (2) : 715-719 [SO0930068] (PMID : 8355202)
- 32) Beckett, A.H. et al. : J.Pharm.Pharmacol., 1970 ; 22 : 123-128 [SO0700028] (PMID : 4392246)
- 33) Ritchel, W.A. et al. : Methods Find. Exp. Clin. Pharmacol., 1986 ; 8 (8) : 497-503 [SO0860003] (PMID : 3747643)
- 34) Neal, E.A. et al. : Gastroenterology, 1979 ; 77 : 96-102 [SO0790001] (PMID : 447033)
- 35) Harris, L. S. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., 1964 ; 43 : 141-148 [SO0640006] (PMID : 14163985)
- 36) Harris, L. S. : Naunyn-Schmiedeberg's Pharmac., 1964 ; 248 : 426-436 [SO0640007] (PMID : 14258615)
- 37) 野崎順久 他 : 基礎と臨床, 1970 ; 4 (10) : 2145-2175
- 38) 社内報告書 : D199800739-01.00, 1968
- 39) 社内報告書 : D199701858-01.00, 1964
- 40) 社内報告書 : D199701860-01.00, 1968
- 41) 社内報告書 : D199902073-01.00, 1968
- 42) 社内報告書 : D199902074-01.00, 1968
- 43) 社内報告書 : D199902075-01.00, 1968
- 44) 社内報告書 : D199902076-01.00, 1967
- 45) 社内報告書 : D199902077-01.00, 1962
- 46) 高橋 三郎 他 : 実中研・前臨床研究報, 1975 ; 1 (1) : 51-57 [SO0750052]

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報

日本の電子添文の「9.5 妊婦」、「9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリア分類とは異なる。

本邦における使用上の注意

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

9.5.1 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。

9.5.2 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。

9.5.3 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。

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。

オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)

pentazocine : Category C

Drugs which, owing to their pharmacological effects, have caused or may be suspected of causing, harmful effects on the human fetus or neonate without causing malformations. These effects may be reversible. Accompanying texts should be consulted for further details. (2024年12月時点)

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

配合変化表

他剤との配合変化については、「丸石製薬株式会社医療関係者向けウェブサイト <https://www.maruishi-pharm.co.jp/medicalstaffs>」をご参照いただくか、表紙の問い合わせ窓口までご連絡ください。

※配合変化表の内容については製造販売承認承継時に入手したものであり、配合薬品の販売名・会社名は試験当時の名称を記載しています（販売名変更や販売中止になっていることがあります）。

