

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

催眠・鎮静剤

日本薬局方 ペントバルビタールカルシウム錠

ラボナ[®]錠50mg

RAVONA[®]Tablets

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	劇薬 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	1錠中 ペントバルビタールカルシウム 50mg 含有
一般名	和名：ペントバルビタールカルシウム 洋名：Pentobarbital Calcium
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2007年3月1日 薬価基準収載年月日：2007年6月15日 販売開始年月日：1952年8月8日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：田辺ファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	田辺ファーマ株式会社 くすり相談センター TEL：0120-753-280 受付時間：9時～17時30分（土、日、祝日、会社休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://medical.tanabe-pharma.com/

本 IF は 2025 年 12 月改訂の電子化された添付文書（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。



「添文ナビ（アプリ）」を使って GS1 バーコードを読み取ることにより、最新の電子化された添付文書を閲覧いただけます。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 ―日本病院薬剤師会―

(2020年4月改訂)

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（<https://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、「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. IFの利用にあたって

電子媒体のIF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IFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF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	7	VI. 薬効薬理に関する項目	15
1. 開発の経緯	7	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15
2. 製品の治療学的特性	7	2. 薬理作用	15
3. 製品の製剤学的特性	7		
4. 適正使用に関して周知すべき特性	7	VII. 薬物動態に関する項目	16
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	7	1. 血中濃度の推移	16
6. RMPの概要	7	2. 薬物速度論的パラメータ	16
		3. 母集団（ポピュレーション）解析	17
II. 名称に関する項目	8	4. 吸収	17
1. 販売名	8	5. 分布	17
2. 一般名	8	6. 代謝	17
3. 構造式又は示性式	8	7. 排泄	18
4. 分子式及び分子量	8	8. トランスポーターに関する情報	18
5. 化学名（命名法）又は本質	8	9. 透析等による除去率	18
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	8	10. 特定の背景を有する患者	18
		11. その他	18
III. 有効成分に関する項目	9		
1. 物理化学的性質	9	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	19
2. 有効成分の各種条件下における安定性	9	1. 警告内容とその理由	19
3. 有効成分の確認試験法、定量法	9	2. 禁忌内容とその理由	19
		3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	19
IV. 製剤に関する項目	10	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	19
1. 剤形	10	5. 重要な基本的注意とその理由	19
2. 製剤の組成	10	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	20
3. 添付溶解液の組成及び容量	10	7. 相互作用	21
4. 力価	10	8. 副作用	22
5. 混入する可能性のある夾雑物	11	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	24
6. 製剤の各種条件下における安定性	11	10. 過量投与	24
7. 調製法及び溶解後の安定性	11	11. 適用上の注意	25
8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	11	12. その他の注意	25
9. 溶出性	11		
10. 容器・包装	11	IX. 非臨床試験に関する項目	26
11. 別途提供される資材類	12	1. 薬理試験	26
12. その他	12	2. 毒性試験	26
V. 治療に関する項目	13	X. 管理的事項に関する項目	27
1. 効能又は効果	13	1. 規制区分	27
2. 効能又は効果に関連する注意	13	2. 有効期間	27
3. 用法及び用量	13		
4. 用法及び用量に関連する注意	13		
5. 臨床成績	13		

3. 包装状態での貯法	27
4. 取扱い上の注意	27
5. 患者向け資材	27
6. 同一成分・同効薬	27
7. 国際誕生年月日	27
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	27
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	27
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	28
11. 再審査期間	28
12. 投薬期間制限に関する情報	28
13. 各種コード	28
14. 保険給付上の注意	28
X I. 文献	29
1. 引用文献	29
2. その他の参考文献	29
X II. 参考資料	30
1. 主な外国での発売状況	30
2. 海外における臨床支援情報	30
X III. 備考	31
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	31
2. その他の関連資料	32

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

ペントバルビタールカルシウムは、1916年 Bayer 社の特許にすでに記載されているが、1930年 Volwiler らによりその効果が再認識され広く用いられるようになった。

アメリカの Abbott 社により催眠薬としての効力が認められ、その Na 塩が催眠、麻酔などの注射薬として開発された。一方、Ca 塩は催眠、鎮静に内服用として用いられる¹⁾。

2. 製品の治療学的特性

- (1) バルビツール酸誘導体としての共通の作用機序により鎮静、催眠作用を現す。すなわち、GABA_A 受容体のサブユニットに存在するバルビツール酸誘導体結合部位に結合することにより、抑制性伝達物質 GABA の受容体親和性をたかめ、Cl⁻チャンネル開口作用を増強して神経機能抑制作用を促進する。バルビツール酸誘導体はその作用時間によって分類されるが、本薬は短時間作用型に属する¹⁾。「VI. 2. (1) 作用部位・作用機序」の項参照
- (2) 重大な副作用として、皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson Syndrome)、依存性があらわれることがある。

3. 製品の製剤学的特性

該当資料なし

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	タイトル・参照先
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	—

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

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名 :

ラボナ錠 50mg

(2) 洋名 :

RAVONA Tablets 50mg

(3) 名称の由来 :

不明

2. 一般名

(1) 和名 (命名法) :

ペントバルビタールカルシウム (JAN)

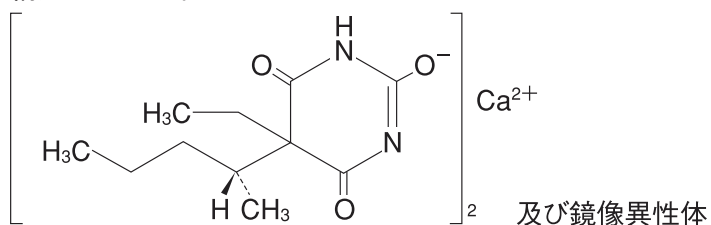
(2) 洋名 (命名法) :

Pentobarbital Calcium (JAN)

(3) ステム (s t e m) :

催眠剤、バルビツール酸誘導体 : -barb-

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : C₂₂H₃₄CaN₄O₆

分子量 : 490.61

5. 化学名 (命名法) 又は本質

Monocalcium bis{5-ethyl-5-[(1*R*)-1-methylbutyl]-4,6-dioxo-1,4,5,6-tetrahydropyrimidin-2-olate}

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状：

白色の粉末である。

(2) 溶解性：

水にやや溶けにくく、エタノール（95）に溶けにくく、アセトニトリルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性：

吸湿性でない。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点：

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数：

8.11

(6) 分配係数：

該当資料なし

(7) その他の主な示性値：

水溶液（1→100）は旋光性を示さない。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

室温、気密容器、遮光保存下での試験成績では 36 カ月間安定

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

日局「ペントバルビタールカルシウム」の確認試験による。

(1) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

(2) カルシウム塩の定性反応の (1)、(2) 及び (3)

定量法

日局「ペントバルビタールカルシウム」の定量法による。

液体クロマトグラフィー

内標準溶液：パラオキシ安息香酸イソプロピル 0.2g を液体クロマトグラフィー用アセトニトリル 20mL に溶かし、水を加えて 100mL とする。

検出器：紫外吸光光度計（測定波長：210nm）

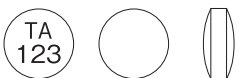
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別：

フィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観及び性状：

性状・剤形	白色・フィルムコーティング錠		
外形		直径 (mm) : 7.0 厚さ (mm) : 3.3 重量 (g) : 0.13	
識別コード	TA123		

(3) 識別コード：

表示部位：錠剤、PTPシート／表示内容：TA123

(4) 製剤の物性：

硬度：4kg以上

崩壊性：5分以内

(5) その他：

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤：

有効成分 (1錠中)	日局 ペントバルビタールカルシウム 50mg
添加剤	エチルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、セルロース、二酸化ケイ素、ヒドロキシプロピルセルロース、マクロゴール 6000

(2) 電解質等の濃度：

該当しない

(3) 熱量：

該当しない

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

(以下は製造販売した製品の試験成績を記載)

① 最終製品の室温保存で 36 ヶ月間性状、含量とも規格内。

② 各種条件下での安定性

保存条件		保存期間	性状	含量 (%)	硬度 (kg)	崩壊試験 (分)	備考
温度	40℃	イニシャル	白色錠	98	4.6-5.4	1	
		3 ヶ月	変化なし	100	4.6-5.6	1	気密容器
温度・湿度	30℃ 75%RH	イニシャル	白色錠	99.98	4.6-5.4	1	
		1 ヶ月	変化なし	99.4	4.6-5.5	1	開放
		2 ヶ月	変化あり ^{注)}	100.44	5.2-6.7	1	開放
光	1000 Lux 室温	イニシャル	白色錠	98	4.6-5.4	1	
		120 万 lx・hr	変化なし	101	4.7-5.9	1	気密容器 (ガラス瓶)

注) 錠と錠、錠と瓶がくっつく現象が認められる。

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)

該当資料なし

9. 溶出性

日局「ペントバルビタールカルシウム錠」の溶出法による。

すなわち、試験液に溶出試験第 2 液 900mL を用い、パドル法により、毎分 50 回転で試験を行うとき、本品の 15 分間の溶出率は 80%以上である。

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：

該当しない

(2) 包装：

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]

(3) 予備容量：

該当しない

IV. 製剤に関する項目

(4) 容器の材質：

PTP 包装：PTP（ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔）

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

- 不眠症
- 麻酔前投薬
- 不安緊張状態の鎮静
- 持続睡眠療法における睡眠調節

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：

〈不眠症〉

通常、成人にはペントバルビタールカルシウムとして1回 50～100mg を就寝前に経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈麻酔前投薬〉

通常、成人にはペントバルビタールカルシウムとして手術前夜 100～200mg、手術前 1～2 時間に 100mg を経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

〈不安緊張状態の鎮静〉

通常、成人にはペントバルビタールカルシウムとして1回 25～50mg を1日 2～3 回経口投与する。

なお、年齢、症状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

7. 用法及び用量に関連する注意

〈不眠症〉

- 7.1 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。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ：

該当資料なし

V. 治療に関する項目

(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：

該当資料なし

2) 安全性試験：

該当資料なし

(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：

該当資料なし

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：

該当資料なし

(7) その他：

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

バルビツール酸誘導体

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書又は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：

短時間作用型バルビツール酸誘導体で、中枢神経系に対し全般的な抑制作用を示すが、催眠・鎮静作用の一部は GABA 様作用ないしは GABA の作用増強に基づくものと考えられている²⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績：

<鎮静・催眠作用>

- ・バルビツレートの少量（催眠量の 1/4～1/5）では鎮静効果があり、用量を増すと催眠作用を発現し、更に増量すると麻酔状態に移行する³⁾。
- ・ペントバルビタールは腸管から迅速に吸収され、100～200mg 内服後 20～30 分で就眠又は迷朦状態に入り、その作用持続時間は比較的短く 3～5 時間で消失し、短時間作用型バルビツレートに属する⁴⁾。
- ・イヌでは 20mg/kg 経口投与で睡眠、40mg/kg では麻酔状態に陥り、50mg/kg では投与後 5～8 分で運動失調があらわれ、麻酔時間は 42 分、睡眠時間は 11 時間 40 分であった⁵⁾。
- ・ネコでは 15～20mg/kg 経口投与で鎮静効果が、25～30mg/kg で 120～200 分の外科的麻酔期が得られる⁶⁾。

(3) 作用発現時間・持続時間：

該当資料なし

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：

0.5～3 $\mu\text{g}/\text{mL}$ ⁸⁾

(2) 臨床試験で確認された血中濃度：

外国人のデータでは、健康成人男子 10 例にペントバルビタールナトリウム 100mg を経口投与したとき、投与量の大部分は速やかに吸収され、投与 1 時間後に最高血中濃度 (1.37 \pm 0.06 $\mu\text{g}/\text{mL}$ serum) に達する⁹⁾。

血中濃度の半減期は 15～48 時間である²⁾。

(3) 中毒域：

10 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 以上⁸⁾

(4) 食事・併用薬の影響：

該当資料なし

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：

摂食時：0.71 hr^{-1} (58min)

空腹時：2.00 hr^{-1} (21min)

() 内は消化管からの消失半減期⁷⁾

(3) 消失速度定数：

該当資料なし

<参考>

血中濃度の半減期は 15～48 時間である²⁾。

(4) クリアランス：

該当資料なし

(5) 分布容積：

該当資料なし

(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

主として腸管より吸収される。

胃内に食物が存在すると、吸収速度は減少するが、bioavailabilityの低下はなく、投与されたペントバルビタールはほとんど吸収される⁷⁾。

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性：

通過する。

(2) 血液－胎盤関門通過性：

容易に通過する。胎児の血中濃度は母体の血漿中濃度に近似する。

(3) 乳汁への移行性：

移行する。

(4) 髄液への移行性：

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性：

ほとんど全ての体組織及び体液中に移行するが、平衡状態に達した時点では脂肪組織、次いで肝臓、腎臓中濃度が高い。

(6) 血漿蛋白結合率：

60～70%⁸⁾

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路：

肝臓で代謝される。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率：

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合：

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率：

該当資料なし

7. 排泄

- ・ 主として肝臓で分解され、腎から排泄されるが、排泄は遅い。
- ・ 未変化体の尿中排泄率：0～3%³⁾
- ・ ¹⁵N 標識ペントバルビタールナトリウム 500mg 経口投与では3～4日にわたって投与量の約80%が排泄される¹⁰⁾。

※ 本剤の承認をうけた用法・用量は「V. 3. 用法及び用量」の項を参照。

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

該当資料なし

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 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 [酵素誘導によりポルフィリン合成を促進し、症状を悪化させるおそれがある。]

2.3 ミトタンを投与中の患者 [10.1 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

「V. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

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 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]

8.2 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に注意すること。

<解説>

8.1 慢性中毒

- ・長期連用によって習慣性を形成し、精神的依存と身体的依存を生じる。はじめは不眠、疼痛、イライラなどを訴えて、睡眠剤を使用していたものが次第にそれらの症状の為だけでなく、「薬を飲むと気が大きくなる」「うきうきする」等といった倒錯的な快感追求の動機で服薬するようになっている者があらわれている。また、身体的依存として意識障害、痙攣、幻聴を起こしている者があらわれている。このような状態となると知能の水準も低下してくる。

また、これらの人は次第に人格の障害も起こって、なげやりでうちとけない態度で対人場面を避けたり、責任を回避して周囲に頼り切ったり、あるいは周囲に攻撃的となったり、自虐的になったり、倫理観が障害されてくる人も現れている。決して睡眠剤を使用したすべての人がそのようになるわけではないが、医師の指示をはなれて薬を飲みはじめたり、医師が盲目的に睡眠剤を処方するようになったら危険である。身体的依存が生じた時、急激に薬を中断すると禁断症状が起こってくることがある¹³⁾。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

- ・ 通常の経過は、薬を止めて 12 時間から 16 時間は良好であるが、その期間の後に不安が増し、不眠、脱力感、振戦、嘔吐、痙攣などの症状が起こる。腱反射は過敏となり、わずかの刺激でも筋反応が起こるようになる¹¹⁾。
- ・ また、これらの禁断症状は処置をほどこさなくとも 2～3 週間で消失する。しかし、ときには激しい禁断症状により死亡することもある³⁾。

「慢性中毒症状の処置」¹³⁾

重篤な症状を起こさないように benzodiazepin 系の薬剤、Phenobarbital などで痙攣閾値を上げるとともに、抗精神薬を少量使用することで、不眠や不安のこないようにして、次第にそれらの薬を減量することが必要である。

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 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) 心障害を有する患者

バルビツール酸系化合物を大量投与した場合、血管拡張作用、心拍出量の減少が知られており、血圧下降が増強されるおそれがある。[13.1 参照]

(2) 呼吸機能が低下している患者

呼吸中枢抑制作用により、症状を悪化させるおそれがある。

9.1.2 虚弱者

呼吸抑制を起こすことがある。

9.1.3 脳に器質障害のある患者

中枢作用が増強されるおそれがある。

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が生じやすい。[8.1、11.1.2 参照]

(2) 腎機能障害患者：

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。排泄の遅延により副作用発現のおそれがある。

(3) 肝機能障害患者：

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。代謝の遅延により副作用発現のおそれがある。

(4) 生殖能を有する者：

設定されていない

(5) 妊婦：

9.5 妊婦

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。類薬（フェノバルビタール）で催奇形作用が報告されている。新生児の出血傾向、呼吸抑制等を起こすことがある。また、分娩前に連用しないことが望ましい。出産後新生児に退薬症候（多動、振戦、反射亢進、過緊張等）があらわれることがある。

(6) 授乳婦：

9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。母乳中への移行が報告されている。

(7) 小児等：

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。小児等では、呼吸抑制が起こることがある。

(8) 高齢者：

9.8 高齢者

少量から投与を開始すること。一般に高齢者では、めまい、運動失調、呼吸抑制等の副作用があらわれやすい。

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
ミトタン オペプリム [2.3 参照]	本剤の睡眠作用が減弱するおそれがある。	機序は明確でないが、本剤の睡眠作用が減弱するとの海外報告がある。

(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
アルコール	中枢神経抑制作用（催眠、鎮静、昏睡等）が増強することがある。定期的に臨床症状を観察し、異常があれば本剤を減量するなど適切な処置を行う。	相加的に作用（中枢神経抑制作用）を増強させる。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
抗ヒスタミン剤 ジフェンヒドラミン プロメタジン塩酸塩等	中枢神経抑制作用（催眠、鎮静、昏睡等）が増強することがある。 併用する場合には定期的に臨床症状を観察し、用量に注意する。	相加的に作用（中枢神経抑制作用）を増強させる。
フェノチアジン系薬剤 クロルプロマジン ハロペリドール等		
催眠・鎮静剤 アモバルビタール トリクロホスナトリウム等		
三環系抗うつ剤 イミプラミン塩酸塩 アミトリプチリン塩酸塩 ノルトリプチリン塩酸塩		
抗不安剤 ジアゼパム ニトラゼパム		
解熱・鎮痛剤 イブプロフェン ジクロフェナクナトリウム アセトアミノフェン		
チアジド系薬物 シクロペンチアジド トリクロルメチアジド等	起立性低血圧があらわれることがある。 異常が認められた場合には、本剤を減量するなど適切な処置を行う。	機序は不明である。
ジスルフィラム		ジスルフィラムは本剤の代謝を阻害する。
クラーレ様物質 ツボクラリン パンクロニウム	筋弛緩作用、呼吸抑制作用が増強することがある。 異常が認められた場合には、適切な処置を行う。	相加的に作用（筋弛緩作用、呼吸抑制作用）を増強させる。
ワルファリンカリウム	抗凝血作用が減弱することがある。 頻回にプロトロンビン値の測定を行い、ワルファリンカリウムの用量を調節する。	ワルファリンカリウムの代謝を促進し、半減期を短縮し、クリアランスを増加させる。
ドキシサイクリン	ドキシサイクリンの抗菌作用が減弱することがある。 併用する場合には、用量に注意する。	ドキシサイクリンの代謝を促進し、半減期を短縮させる。

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 皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson Syndrome）（頻度不明）

11.1.2 依存性（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、あくび、くしゃみ、流涙、発汗、悪心、嘔吐、下痢、腹痛、散瞳、頭痛、不眠、不安、せん妄、痙攣、振戦、全身の筋肉・関節痛、呼吸促迫、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、患者の状態を観察しながら行うこと。[8.1、9.1.4 参照]

(2) その他の副作用：

11.2 その他の副作用		
	0.1～5%未満	頻度不明
過敏症		発疹
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		ヘマトポルフィリン尿、蛋白尿
血液		低カルシウム血症又は葉酸代謝異常によると思われる巨赤芽球性貧血
その他	頭痛、頭重、めまい、悪心、嘔吐、術中不安、覚醒後の残遺・不快感、眠気、尿閉	興奮、倦怠感

注) 発現頻度は再評価の結果を含む。

項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

- ・ 総症例数：379 例
- ・ 副作用発生数：92 例（24.3%）
- ・ 内訳：下表の通り

副作用名	例数	%	副作用名	例数	%
悪心	13	3.43	呼吸数低下	1	0.26
嘔吐	6	1.58	血圧低下	1	0.26
嘔気	1	0.26	眠気	4	1.05
頭痛	11	2.90	虚脱感	1	0.26
頭重	8	2.11	朦朧感	2	0.52
めまい	17	4.48	覚醒時興奮	1	0.26
尿閉	3	0.79	覚醒後不快感	8	2.11
嘔声	1	0.26	覚醒後残遺感	2	0.52
術中興奮	2	0.52	児の仮死	2	0.52
術中不安	6	1.58	歩行躓さん	2	0.52

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

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

バルビツレートの急性中毒症状としては、中枢神経系及び呼吸器系の抑制があり、チェーン・ストークス呼吸、瞳孔縮小（重度な中毒時には麻痺性の拡張）、乏尿、頻脈、低血圧、体温低下、昏睡等の症状があらわれるおそれがある。[9.1.1 参照]

13.2 処置

呼吸管理には必要により気管内挿管や人工呼吸器の使用を考慮する。

循環管理には乳酸リンゲル等の輸液、改善されない低血圧には塩酸ドパミン等の使用を考慮する。

血液透析、血液灌流が有効であったとの報告もある。

<解説>

13. 急性中毒

- ・ 誤って過量投与した時及び自殺の目的で過量を服用すると、急性中毒症状がみられる。中毒量は通常催眠の5～10倍である³⁾。
- ・ 催眠量の10倍以上を一度に服用すると、死を招く危険性が極めて大きい（ペントバルビタールカルシウムの推定致死量は1.5～7.5g、ラボナ錠50mg 30～150錠といわれている¹⁾）。
- ・ 昏睡、呼吸抑制、血圧下降及び体温下降が主症状で、主として呼吸麻痺が死因となる³⁾。

「急性中毒症状の処置」¹²⁾

- ① 胃内容物の吸引：内服後4時間以内が望ましい。
咽頭反射が消失している時は、気管に異物入ることに注意する。胃洗浄も行う。
- ② 体温の保持につとめ、気道の通気と室内の換気をよくする。
- ③ 5%ブドウ糖と生理食塩水を1日2～3L注射して、薬物の体内濃度低下と排泄を促進する。
- ④ 中枢神経系の抑制薬であるから、これと拮抗する興奮薬を与えるべきであるが、この薬物だけに頼ることは却って危険であるとの報告もあって、アノレキシアと全身痙攣の発生を助長するという。しかし、上記①～③の処置を十分行って、補助的に中枢系興奮薬を使うことが望ましい。呼吸促進にジモルホラミン、ロベリンや強心性を兼ねたピタカンファー等を用いる。
- ⑤ バルビツール酸系化合物の中毒に対し、脳アノキシアを除く目的で、25%人血清アルブミンを用いて、中枢興奮剤で無効の患者を救うことができる。呼吸の減弱による肺浮腫、肺うっ血には、気管内挿管で50%O₂をもって間歇的陽圧呼吸を行う。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

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

Ⅹ. 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：

該当資料なし

(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：

急性毒性：LD₅₀ (mg/kg)

動物	経口
マウス	280±19.8
ウサギ	275
ネコ	約100
イヌ	85 (MLD：最小致死量)

(2) 反復投与毒性試験：

該当資料なし

(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：

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験：

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性：

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

(1) 製剤：劇薬、第二種向精神薬、習慣性医薬品^{注1)}、処方箋医薬品^{注2)}

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

(2) 有効成分：劇薬、第二種向精神薬、習慣性医薬品

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

20. 取扱い上の注意

開封後は湿気を避けて保存すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり

くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

先発医薬品、一物多名称の製品はない。

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

販売名	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
ラボナ錠 50mg	2007年3月1日	21900AMX00186000	2007年6月15日	1952年8月8日
ラボナ錠 (旧販売名)	1982年3月29日	15700AMZ00323000	1953年8月	

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

該当しない

X. 管理的事項に関する項目

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

- ・再評価結果公表年月日：1995年9月7日（平成7年度その1）
内容：製造（輸入）承認事項の一部を変更すれば薬事法第14条第2項各号のいずれにも該当しない。（効能・効果より「無痛分娩」を削除）
- ・品質再評価結果公表年月日：2002年7月10日（平成14年度その1）
内容：薬事法第14条第2項各号のいずれにも該当しない。

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

平成14年3月8日付厚生労働省令第23号及び平成20年3月19日付厚生労働省告示第97号に基づき、1回14日分を限度に投薬量の上限が設けられている。

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
ラボナ錠 50mg	1125006F1030	1125006F1030	100570701	620005131

14. 保険給付上の注意

該当しない

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 第十七改正日本薬局方解説書. 2016 ; C-5124-5128
- 2) Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics 7th ed. 1985 ; 351-360
- 3) 島本暉朗, 他 : 薬理学 (医学書院) . 1964 ; 74-86
- 4) 原 三郎, 他 : 臨床薬理学大系 (中山書店) . 1965 ; 1 : 84-103
- 5) Swanson EE, et al. : J Lab Clin Med. 1931 ; 16 : 1056-1063
- 6) 中川志郎, 他 : 動物園水族館雑誌. 1960 ; 2 : 37-39
- 7) Smith RB, et al. : J Pharmacokinet Biopharm. 1973 ; 1 (1) : 5-16
- 8) USP DI. 1984 ; 202-207
- 9) Doluisio JT, et al. : J Pharm Sci. 1978 ; 67 (11) : 1586-1588 (PMID : 712597)
- 10) 宇野豊三, 他 : 薬物の生体内移行 (南江堂) . 1968 ; 271-285
- 11) 福田英臣 : 薬局. 1978 ; 29 (2) : 175-178
- 12) 羽野 寿 : 新応用薬理学. 1969 ; 18-19
- 13) 奥村幸夫, 他 : 臨床と研究. 1976 ; 53 (1) : 73-76

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

米国、英国では、ペントバルビタールおよびその塩類の経口剤は発売されていない。

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

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

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉碎：

粉碎後の安定性

ラボナ錠 50mg の粉碎後の安定性は、以下のとおりであった。

【保存条件】

- 1) 温度：40℃±2℃、褐色ガラス瓶/密栓（暗所）
- 2) 湿度：30℃±2℃/75%RH±5%RH、褐色ガラス瓶/開放（暗所）
- 3) 光：D65 ランプ（2500lx）、25℃±2℃/湿度なりゆき、シャーレ（蓋あり）

【測定項目】

性状、重量変化、定量法（含量）

【結果】

- 1) 温度：40℃±2℃

測定項目	保存期間				
	試験開始時	7日	14日	21日	30日
性状	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
重量変化 (%)	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0
定量法 (含量) (%)	101.5	103.1	103.7	103.1	103.3

(1ロット)

- 2) 湿度：30℃±2℃/75%RH±5%RH

測定項目	保存期間				
	試験開始時	7日	14日	21日	30日
性状	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
重量変化 (%)	100.0	100.0	100.0	100.0	100.0
定量法 (含量) (%)	101.5	101.2	101.4	100.4	100.3

(1ロット)

- 3) 光：D65 ランプ（2500lx）

測定項目	保存期間		
	試験開始時	60万 lx・hr	120万 lx・hr
性状	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
重量変化 (%)	100.0	100.0	100.0
定量法 (含量) (%)	101.5	103.4	103.8

(1ロット)

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性：

1) 崩壊性及び懸濁液の経管通過性

【試験方法】

・崩壊懸濁試験

シリンジのピストン部を抜き取り、シリンジ内に錠剤をそのまま 1 個入れてピストンを戻し、シリンジに 55℃のお湯 20mL を吸い取り、筒先に蓋をして 5 分間自然放置した。5 分後にシリンジを手で 180 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察した。5 分後に崩壊・懸濁が不十分な場合は、更に 5 分間放置後に同様の操作を行った。計 10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合は、錠剤 1 個に亀裂を入れて（シートの上から錠剤を乳棒で 15 回叩く）から同様の操作を行い、崩壊・懸濁状況を観察した。

・通過性試験

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液をチューブの注入端より約 2～3mL/秒の速度で注入した。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端から 3 分の 2 を水平にし、他端（注入端）を 30cm の高さにセットして注入操作を行い、通過性を観察した。懸濁液注入後、懸濁液の注入に使用したシリンジを用いて 20mL の水でフラッシングするとき、シリンジ及びチューブ内に残存物がみられなければ、通過性に問題なしとした。

【試験結果】

		簡易懸濁法				備考
適否*	通過サイズ	水(約 55℃)		亀裂→水(約 55℃)		
		5 分	10 分	5 分	10 分	
条 3	8Fr.	○				通過性試験において、シリンジ内にごくわずかな残存物が認められた。また、8Fr. チューブ内にごくわずかな残存物が認められた。

条 3：条件付通過（備考欄参照）。

* 藤島一郎監修「内服薬 経管投与ハンドブック第 4 版」（2020 年）表 9 経管投与可否判定基準に基づく判定結果。

2) 懸濁液の安定性

該当資料なし

2. その他の関連資料

該当資料なし