

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 2013 に準拠して作成

鎮痛剤
ソセゴン®注射液15mg
Sosegon® Injection 15mg
ソセゴン®注射液30mg
Sosegon® Injection 30mg

剤 形	注射剤（アンプル）
製 剤 の 規 制 区 分	劇薬、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
規 格 ・ 含 量	ソセゴン注射液 15mg：1 管 1mL 中 ペンタゾシン 15mg ソセゴン注射液 30mg：1 管 1mL 中 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・ 発売年月日	ソセゴン注射液15mg 製造販売承認年月日：1970年 3月24日 薬価基準収載年月日：1970年 8月 1日 発 売 年 月 日：2012年10月 1日（製造販売承認承継による） ソセゴン注射液30mg 製造販売承認年月日：1970年 3月24日 薬価基準収載年月日：1976年 9月 1日 発 売 年 月 日：2012年10月 1日（製造販売承認承継による）
開発・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 医薬関係者向けホームページ https://www.maruishi-pharm.co.jp/medicalstaffs

本 IF は 2022 年 9 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。
最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ
<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認ください。
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。

ソセゴン注射液 15mg



(01)14987211135338

ソセゴン注射液 30mg



(01)14987211135376

IF 利用の手引きの概要—日本病院薬剤師会—

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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、(独) 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ (<http://www.info.pmda.go.jp/>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式】

- ①規格は A4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

【IF の作成】

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

【IF の発行】

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等自らが内容を充実させ、IF 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、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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

IF を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

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・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	1
1. 販売名	1
2. 一般名	1
3. 構造式又は示性式	1
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名（命名法）	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2
7. CAS 登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	2
1. 物理化学的性質	2
2. 有効成分の各種条件下における安定性	2
3. 有効成分の確認試験法	3
4. 有効成分の定量法	3
IV. 製剤に関する項目	3
1. 剤形	3
2. 製剤の組成	3
3. 注射剤の調製法	3
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	3
5. 製剤の各種条件下における安定性	4
6. 溶解後の安定性	4
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	4
8. 生物学的試験法	4
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	4
10. 製剤中の有効成分の定量法	4
11. 力価	4
12. 混入する可能性のある夾雑物	4
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	4
14. その他	4
V. 治療に関する項目	5
1. 効能又は効果	5
2. 用法及び用量	5
3. 臨床成績	5
VI. 薬効薬理に関する項目	6
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	6
2. 薬理作用	6
VII. 薬物動態に関する項目	7
1. 血中濃度の推移・測定法	7
2. 薬物速度論的パラメータ	8
3. 吸収	8
4. 分布	8
5. 代謝	9
6. 排泄	10
7. トランスポーターに関する情報	10
8. 透析等による除去率	10
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	10
1. 警告内容とその理由	10
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	10
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	11
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	11
5. 慎重投与内容とその理由	11
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	11

7. 相互作用	12
8. 副作用	13
9. 高齢者への投与	16
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	16
11. 小児等への投与	16
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
13. 過量投与	16
14. 適用上の注意	16
15. その他の注意	16
16. その他	16
IX. 非臨床試験に関する項目	17
1. 薬理試験	17
2. 毒性試験	17
X. 管理的事項に関する項目	19
1. 規制区分	19
2. 有効期間又は使用期限	19
3. 貯法・保存条件	19
4. 薬剤取扱い上の注意点	19
5. 承認条件等	19
6. 包装	19
7. 容器の材質	19
8. 同一成分・同効薬	19
9. 国際誕生年月日	19
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	19
11. 薬価基準収載年月日	19
12. 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	19
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	20
14. 再審査期間	20
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	20
16. 各種コード	20
17. 保険給付上の注意	20
XI. 文献	21
1. 引用文献	21
2. その他の参考文献	21
XII. 参考資料	22
1. 主な外国での発売状況	22
2. 海外における臨床支援情報	22
XIII. 備考	22
その他の関連資料	22

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（ソセゴン）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人体では極めて強力で、臨床的にはソセゴン 30mg＝モルヒネ 10mg の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・製剤学的特性

- ・ソセゴン 30mg はモルヒネ 10mg、ペチジン 75～100mg に匹敵する鎮痛効果を有する。
- ・皮下・筋注で 15～20 分、静注で 2～3 分というモルヒネ様の速効性と 3～4 時間の持続を有する。
- ・癌性疼痛や術後疼痛を始め広い領域の疼痛に奏効。
- ・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³⁶⁾。

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³⁷⁾。

II. 名称に関する項目

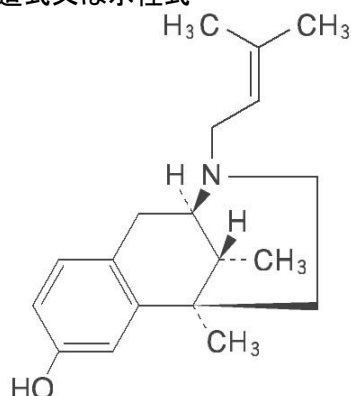
1. 販売名

- | | | |
|-----------|----|---|
| (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剤／アゴニスト：-azocine |

3. 構造式又は示性式



及び鏡像異性体

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）

(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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号なし

記号番号：Win20228

7. CAS 登録番号

359-83-1

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。

溶 媒	溶解度 (W/V%) ¹⁾	日局表現 ³⁾
クロロホルム	30以上	溶けやすい
エタノール（95）	7.24	やや溶けやすい
アセトン	3.05	やや溶けにくい
酢酸エチル	2.36	やや溶けにくい
ジエチルエーテル	3.06	やや溶けにくい
ベンゼン	0.95	溶けにくい
水	0.80	溶けにくい

（温度 20℃）

(3) 吸湿性

吸湿性はない^{1,4)}。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 150～158℃^{2,3)}

(5) 酸塩基解離定数

pK_{a1}：8.0^{1,4)}

pK_{a2}：9.7^{1,4)}

(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_{1cm}^{1%}（278nm）67.5～71.5（乾燥後、0.1g、0.01mol/L 塩酸試液、1000mL）^{2,3)}

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

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。

4. 有効成分の定量法

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 0.5 g 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、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
剤 形	注射剤（無色アンプル）	
性 状	無色澄明の液	

(2) 溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

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

(3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

本剤は容器中を N₂ ガスで置換している。

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

ソセゴン注射液 15mg : 1 管 1mL 中 ペンタゾシン 15mg 含有
ソセゴン注射液 30mg : 1 管 1mL 中 ペンタゾシン 30mg 含有

(2) 添加物

乳酸、等張化剤

(3) 電解質の濃度

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

(4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

(5) その他

該当しない

3. 注射剤の調製法

該当しない

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 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℃±2℃、 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	40℃	無色アンプル	12週間	変化なし
		56℃			
	光	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。

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

「XⅢ. 備考 その他の関連資料」参照

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) 呈色反応
- (2) 紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

紫外可視吸光度測定法

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

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。（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 14. 適用上の注意」の項参照）

14. その他

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

[ソセゴン注射液 15mg]

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

[ソセゴン注射液 30mg]

麻酔前投薬および麻酔補助

2. 用法及び用量

[ソセゴン注射液 15mg]

1. 鎮痛の目的に用いる場合

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. 麻酔前投薬および麻酔補助に用いる場合

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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

1. 鎮痛の目的に用いる場合

(1) 一般臨床試験成績^{1-9)*} (*：ここに示した文献は、現在公開されているものののみ記載した。)

本剤の臨床試験は、各科領域における中等～重症の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)、術後疼痛 88.2% (484/549)、胸腹部臓器疾患に伴う疼痛 94.4% (321/340)、検査器具使用時の疼痛 79.5% (159/200) 等の有効率が得られた。

(2) 二重盲検比較試験成績¹⁰⁾

癌性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。

2. 麻酔前投薬および麻酔補助に用いる場合

(1) 麻酔前投薬^{11)*} (*：ここに示した文献は、現在公開されているものののみ記載した。)

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¹²⁾

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。

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 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^{1-9,13)*}。(*：ここに示した文献は、現在公開されているものののみ記載した。)

〈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、効能効果、用法・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。

(5) 検証的試験

1) 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^{10,13-16)*}。(*: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。

2) 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¹⁷⁾。

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¹⁸⁾。

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¹⁹⁾。

3) 安全性試験

下記の長期投与試験は、使用経験データであり、参考として記載する^{1-3,6)}。

〈参考〉

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全く報告されていない。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。

4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）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試験の概要 該当しない

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

モルヒネ塩酸塩水和物、ブプレノルフィン塩酸塩、エブタゾシン臭化水素酸塩、酒石酸ブトルファノール等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

ペンタゾシンの作用部位は大脳皮質と考えられ、麻薬と同様に中枢神経系におけるオピオイド受容体に結合することにより神経伝達系を抑制し、鎮痛効果を発現する²⁰⁾。

本剤はκ受容体作動薬であり、μ受容体遮断薬としての作用も併せ持っていることから、それ自身鎮痛作用を有し、モルヒネ様の諸作用に拮抗する性質を有する麻薬拮抗型鎮痛剤である²¹⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

① 鎮痛作用

イヌの脾臓を使用した実験結果から、ペンタゾシンの鎮痛作用は、アスピリン、フェニールブタゾンとは異なった作用動態を示し、モルヒネ等麻薬性鎮痛剤と同様に中枢神経を介してシナ

プス伝導をブロックすることが明らかにされている²⁰⁾。

②麻薬拮抗作用

麻薬患者 7 例にモルヒネ 1.0～2.0mg/kg を静注し、モルヒネの呼吸抑制に対するペンタゾシンの拮抗作用を検討したところ、ペンタゾシンの拮抗作用は非常に弱く、ナロルフィンの約 1/50 であった²²⁾。

③呼吸器・循環器系に対する作用

ペンタゾシンの呼吸器系に対する影響をペチジンと比較したところ、呼吸数は低下したが、1 回呼吸量は代償的に増大したため、分時呼吸量には著しい変化は認められなかった。ペンタゾシン 30mg の呼吸抑制はペチジン 50mg～100mg と同程度であった。また、血圧に対しては殆ど変化が認められなかった¹⁷⁾。

なお、ペンタゾシンによって呼吸抑制が起こった時は、レバロルファンは無効で、ドキサプラム（ドプラム）が有効である。

(3) 作用発現時間・持続時間

ペンタゾシンの作用発現は迅速で、通常、静注では 2～3 分、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^{17,19)}。

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

0.03～0.1 μ g/mL²⁵⁾

(2) 最高血中濃度到達時間

筋注後約 10 分～30 分²³⁾

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

①単回投与

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）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²³⁾。

<薬動力学的パラメータ>

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 (n=各10)	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 (n=10)	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高齢者

<参考：外国人データ>

若年（22～48 歳）の健康人（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、高齢者では健康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²⁴⁾。

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。

	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.

③肝障害患者

<参考：外国人データ>

健康人（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、肝硬変患者では健康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⁵¹⁾。

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.

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 7. 相互作用」の項参照

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

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

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

<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)²³⁾。

(4) 消失速度定数

0.0278min⁻¹²⁵⁾

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

3.5～7.5L/kg²⁵⁾

(7) 血漿蛋白結合率

(外国人データ)

患者: 48～75%

健常人: 56～66%

健常人 (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%±3.0 (標準偏差) 及び 65.8%±6.0 (標準偏差) であった²⁶⁾。

3. 吸収

(外国人データ)

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^{27,28)}。

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

通過する²⁹⁾

(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 0.03～0.11 $\mu\text{g/mL}$ に比し、新生児 0.02～0.08 $\mu\text{g/mL}$ と比較的低かった³⁰⁾。

(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）^{28,31)}

(μ g/g組織)

サル	A	B	C
投与量mg/kg	5.5	2.4	4.0
組 織 時間	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

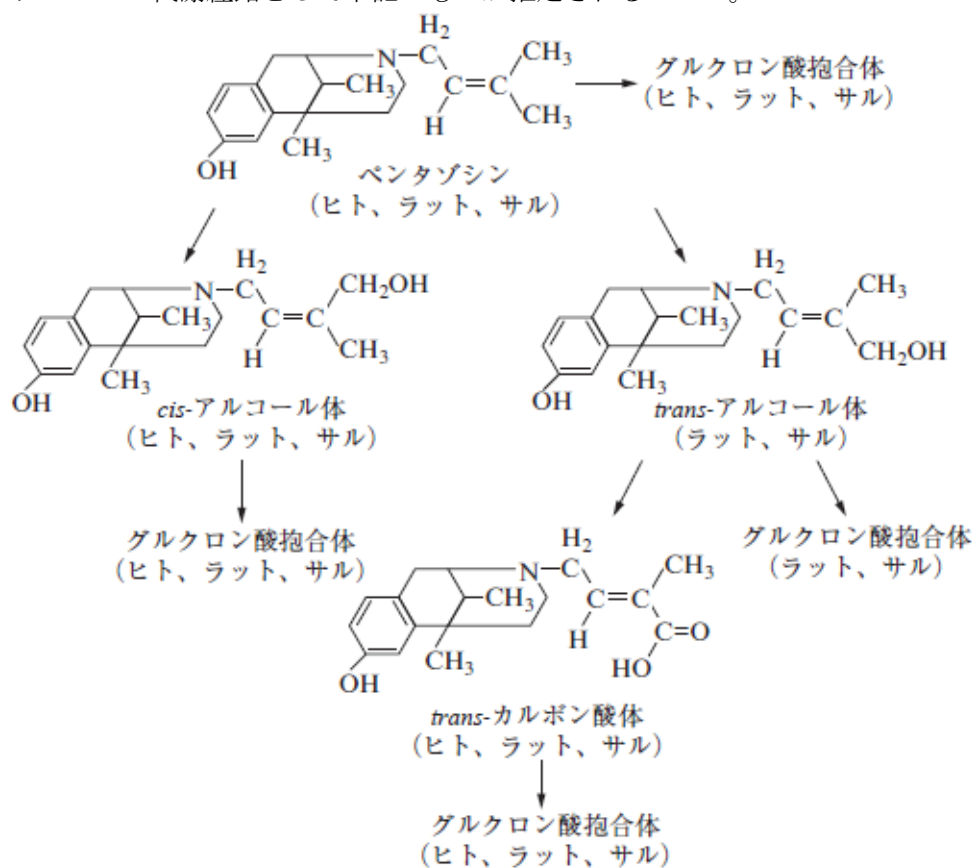
組織内濃度では肝が最高であり、腎、脾がこれにつき、中枢神経系からも検出された³¹⁾。

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

肝で代謝される^{25,32)}

ペンタゾシンの代謝経路として下記のものが推定される^{27,28,33)}。



- (2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種
CYP2D6³⁴⁾
- (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²⁷⁾。
- (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ
該当しない

6. 排泄

- (1) 排泄部位及び経路
腎臓より尿中に排泄される³⁵⁾。
- (2) 排泄率
〈外国人データ〉
健康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³⁵⁾。
健康男子にペンタゾシン 20mg 投与後 48 時間の尿中排泄を見ると、投与量の 11～13%が未代謝で排泄された³⁰⁾。
- (3) 排泄速度
〈外国人データ〉
ペンタゾシンの未変化体、グルクロナイド及び代謝物の総尿中排泄量は 24 時間で投与量の 60～70%であった²⁷⁾。

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

- (1) 腹膜透析
該当資料なし
- (2) 血液透析
該当資料なし
- (3) 直接血液灌流
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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (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。〕（「7. 相互作用（1）」の項参照）

（解説）

- (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) 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。
- (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。

- (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、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使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

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（「Ⅷ. 9. 高齢者への投与」の項参照）

（解説）

- (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. (2) 重大な副作用と初期症状」参照）。
- (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。
- (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。
- (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。
- (5) 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。
- (6) 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（「Ⅷ. 9. 高齢者への投与」「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 1. 血中濃度の推移・測定法 (3) 臨床試験で確認された血中濃度」参照）。

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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。（「Ⅷ. 8. 副作用」の項参照）

（解説）

- (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。
- (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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

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	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．禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）」（4）参照）

(2) 併用注意とその理由

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、 エプ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

(1) 副作用の概要

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³⁶⁾。

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³⁷⁾。

(2) 重大な副作用と初期症状

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。

(3) 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。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

対象	時期 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・多幸感	3 (0.12)	13 (0.21)	16 (0.18)

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（％））		
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)
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)
血圧上昇	3 (0.12)	104 (1.69)	107 (1.23)
血圧低下	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)
呼吸器系障害	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)

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「Ⅷ. 2. 禁忌の内容とその理由（原則禁忌を含む）」、

「Ⅷ. 8. 副作用 (2) 重大な副作用と初期症状、(3) その他の副作用」の項参照

9. 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)

(解説)

海外に高齢者の報告がある³⁶⁾。 (「Ⅷ. 5. 慎重投与内容とその理由」 「Ⅶ. 1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」、 「Ⅶ. 2. (5) クリアランス」 参照)。

10. 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。

11. 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。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

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ている³⁷⁾。

13. 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。

14. 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。

15. 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。

16. その他

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」参照）

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 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)³⁸⁾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)³⁹⁾。

(4) 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⁴⁰⁾。

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⁴⁰⁾。

(3) 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⁴¹⁾。

(4) その他の特殊毒性

1) 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考え⁴²⁾。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⁴³⁾。

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、レバロルファ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⁴⁴⁾。

③下垂体-副腎皮質系に及ぼす影響(ラット)では、モルヒネの示すときヒスタミンの ACTH 分泌亢進作用に対する抑制作用は認められなかった⁴⁵⁾。

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⁴⁶⁾

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⁴⁷⁾

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。

⑥ヒトにおける耽溺性試験の結果では、ペンタゾシンは、モルヒネ類似の依存性を有していないことを報告している⁴⁸⁾。

2) 抗原性試験

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) 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⁴⁹⁾。

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⁴⁹⁾。

③ウサギの背最長筋に対する局所障害作用を検討⁵⁰⁾

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。

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、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、習慣性医薬品（注意－習慣性あり）

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3 年（ラベル等に表示の使用期限を参照すること）〔安定性試験（加速試験）結果に基づく〕

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

本剤の依存性に基づく医療外使用の事例が報告されているので、保存管理に十分注意すること。

劇薬、向精神薬（第 2 種向精神薬）、習慣性医薬品、処方箋医薬品である。

注意－習慣性あり（習慣性医薬品）

注意－医師等の処方箋により使用すること（処方箋医薬品）

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

該当しない

(3) 調剤時の留意点について

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 14. 適用上の注意」の項参照

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

ソセゴン注射液 15mg/1mL：10 管、50 管

ソセゴン注射液 30mg/1mL：10 管

7. 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）

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ペンタゾシン注 15mg・30mg（塩酸ペンタゾシン製剤として：ソセゴン錠 25mg）

同 効 薬：モルヒネ塩酸塩注射液、ペチジン塩酸塩注射液

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

ソセゴン注射液 15mg

製造販売承認年月日：1970 年 3 月 24 日

承 認 番 号：14500AMZ00893

ソセゴン注射液 30mg

製造販売承認年月日：1970 年 3 月 24 日

承 認 番 号：14500AMZ00894

11. 薬価基準収載年月日

ソセゴン注射液 15mg：1970 年 8 月 1 日

ソセゴン注射液 30mg：1976 年 9 月 1 日

12. 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

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

「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掲示事項等」（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。

16. 各種コード

販売名	HOT（9桁）番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
ソセゴン注射液 15mg	101086202	1149401A1027	641140051
ソセゴン注射液 30mg	101091602	1149401A2023	641140052

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI . 文献

1. 引用文献

- 1) 武藤輝一 他：診療と新薬，1969；6：275-279 [SO0690005]
- 2) 加藤和行 他：診療と保険，1969；378-381
- 3) 伊藤勝基 他：基礎と臨床，1969；3（1）：29-36
- 4) 上野 正 他：日本口腔外科学会雑誌，1969；8：509-515 [SO0690014]
- 5) 永野信之 他：薬物療法，1969；2（5）：774-777, 1969
- 6) 横山 正 他：診療と保険，1969；（6）：830-834
- 7) 竹内弘幸 他：泌尿紀要，1969；5：539-543 [SO0690023]
- 8) 村中 篤 他：産婦人科の世界，1969；2：638-640 [SO0690027]
- 9) 一条元彦 他：産婦人科の世界，1969；2：859-861 [SO0690020]
- 10) 古江尚 他：診療と保険，1969；11：830-834
- 11) 岩月賢一 他：麻酔，1969；18（4）：292-298 [SO0690041]
- 12) 久世照五 他：麻酔，1977；26（3）：315-326
- 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) 竹内弘幸：泌尿紀要，1969；15：658-662 [SO0690012]
- 16) 美馬昂 他：麻酔，1969；18：299-304 [SO0690002]
- 17) Sadove,M.S.et al.：JAMA., 1965；193（11）：887-892 [SO0650006]
- 18) Stoelting,V.K.：Anesth.Analg., 1965；44（6）：769-772 [SO0650003]
- 19) 美馬昂 他：医学のあゆみ，1970；73（6）：307-312 [SO0700023]
- 20) Lim,R.K.S.et al.：Bull.Drug Addiction and Narcotics., 1964；3983
- 21) 融 直男 監修：臨床ハンドブック 神経伝達物質受容体（最新医学社），64-69, 1995.
- 22) Keats, A. S. et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther., 1964；143：157-164 [SO0640005]
- 23) 荒川佳子 他：麻酔，1981；30（4）：356-361 [SO0810033]
- 24) Ritchel, W.A.et al.：Methods Find.Exp.Clin.Pharmacol., 1986；8（8）：497-503
- 25) 厚生省薬務局研究開発振興課監修：JPDI 日本薬局方医薬品情報（薬業時報社），1277-1280, 1969.
- 26) Ehrnebo, M.et al.：Clin.Pharmacol.Ther., 1974；16（3）：424-429 [SO0740005]
- 27) Berkowitz, B.：Ann.N.Y.Acad.Sci., 1971；179：269-281 [SO0710031]
- 28) 岡田和夫：基礎と臨床，1975；9（7）：1660-1666
- 29) 押見真和 他：薬物動態，1997；2（S）：282 [SO0970016]
- 30) Beckett, A. H. et al.：J. Pharm. Pharmac., 1967；19：50S-52S [SO0670009]
- 31) 社内報告書：D199800738-01.00, 1964
- 32) 横山 和子：臨床透析，1995；11（5）：862-867 [SO0950002]
- 33) Conway, W. D et al.：Biochem. Pharmacol., 1969；18：1673-1678 [SO0690007]
- 34) Dafang WU, et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther., 1993；266（2）：715-719 [SO0930068]
- 35) Beckett, A.H.et al.：J.Pharm.Pharmacol., 1970；22：123-128 [SO0700028]
- 36) 厚生省医薬品情報 No.8：日本医師会雑誌，1979；81：巻末
- 37) 高木 雅矩 他：臨床麻酔，1981；5（7）：865-868 [SO0810002]
- 38) Harris, L. S. et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther., 1964；43：141-148 [SO0640006]
- 39) Harris, L. S.：Naunyn-Schmiedeberg's Pharmac., 1964；248：426-436 [SO0640007]
- 40) 野崎順久 他：基礎と臨床，1970；4（10）：2145-2175
- 41) 社内報告書：D199800739-01.00, 1968.
- 42) 社内報告書：D199902073-01.00, 1968.
- 43) 社内報告書：D199902074-01.00, 1968.
- 44) 社内報告書：D199902075-01.00, 1968.
- 45) 社内報告書：D199902076-01.00, 1967.
- 46) 社内報告書：D199902077-01.00, 1962.
- 47) 高橋 三郎 他：実中研・前臨床研究報，1975；1（1）：51-57 [SO0750052]
- 48) Fraster, H. F. et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther., 1964；43：149-156 [SO0640001]
- 49) 社内報告書：D199701858-01.00, 1964.
- 50) 社内報告書：D199701860-01.00, 1968.
- 51) Neal,E.A.et al.：Gastroenterology, 1979；77：96-102 [SO0790001]

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

1967 年 3 月：イギリス (PENTAOCINE)、同 7 月：アメリカ (TALWIN) での発売に加えて、カナダ (TALWIN)、ベルギー (FORTRAL)、オランダ (FORTRAL)、ポーランド (FORTRAL)、ドイツ (FORTRAL、BET-M) を含め、39 カ国以上で発売されている。

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報 (オーストラリア分類)

	分類
オーストラリアの分類	C
An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy	(2022 年 12 月)

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

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.

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりである。

【使用上の注意】「Ⅷ. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目 10. 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。 |
|---|

XIII. 備考

その他の関連資料

配合変化表：ソセゴン注射液 15mg (2 ページ)

配合変化表：ソセゴン注射液 30mg (6 ページ)

注射薬の pH 変動試験値及び浸透圧比：

ソセゴン注射液 15mg・ソセゴン注射液 30mg (2 ページ)

規制区分

劇薬、向精神薬、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

鎮痛剤

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15mgとソセゴン注射液30mgは濃度が異なります。
配合変化データをご利用の際にはご注意ください。

本剤の色、pH <添付文書記載値>
色：無色～ほとんど無色透明
pH：3.5～5.5
pH変動試験：pH6.20で白色結晶析出

ソセゴン注射液15mg 配合変化表 <本剤の性状：無色～ほとんど無色透明 pH：3.5～5.5、pH変動試験ではpH6.20で白色結晶析出>

製品名	メーカー名	成分名	配合剤の 使用量	本剤の 使用量	外観／pH／残存率					備考	
					配合剤	配合後					
						配合直後	3時間	6時間	24時間		
アタラックスーP注射液 (25mg/mL)	マルコ - ファ イザー	ヒドロキシジン塩酸塩	25mg/1mL +Sal. 100mL	15mg/1mL	無色透明	無色透明	無色透明	無色透明	無色透明		
					4.1	4.4	4.4	4.4	4.4		
						100.0	99.5	99.6	99.8		
					無色透明	無色透明 注)	無色透明	無色透明	無色透明		
強カネオミノファアゲン シー	ミノファアゲン	グリチルリチン・グリシ ン・システイン配合剤	100mL (5管)	15mg/1mL	6.5	6.4	6.4	6.4	6.4		
						100.0	99.7	99.7	99.7		
					無色透明	無色透明 注)	微濁	白濁	白濁		
					5.5	4.8	4.7	4.7	4.5		
スルベラゾン静注用1g	ファイザー	スルバクタムナトリウム (0.5g)・セフォペラゾン ナトリウム(0.5g)	1g /Sal. 100mL	15mg/1mL							
セスデン注射液	田辺	チメビジウム臭化物水和 物	7.5mg/1mL	15mg/1mL	無色透明	無色透明	無色透明	無色透明	無色透明		
					4.3	4.3	4.3	4.3	4.3		
					100.0		99.9		100.2		

(注) 製品名およびメーカー名は試験当時の名称を記載 配合量の / (溶解)、+ (希釈)の右側に記載の略号：D.W.は注射用水、Sal.は生理食塩液、Gul.はブドウ糖注射液、Sol.は添付溶解液を示す。

ソセゴン注射液15mg 配合変化表 (多剤)

<本剤の性状：無色～ほとんど無色透明 pH：3.5～5.5、pH変動試験ではpH6.20で白色結晶析出>

製品名	メーカー名	成分名	配合剤の 使用量	本剤の 使用量	配合剤	外観／pH／残存率				備考	
						配合後	配合直後				
							3時間	6時間	24時間		
ソセゴン注射液15mg	山之内	ペンタゾシン		15mg/1mL	無色透明	無色透明	無色透明	無色透明			
					4.2	4.2	4.2	4.2			
								100.0	100.4	100.4	
アタラックスーP注射液 (25mg/mL)	マルコ－ファ イザー	ヒドロキシジン塩酸塩	25mg/1mL		無色透明						
					4.1						
硫酸アトロピン注射液タ サベナ	田辺	アトロピン硫酸塩水和物	0.5mg/1mL		無色透明						
					5.4						

(注) 製品名およびメーカー名は試験当時の名称を記載 配合量の / (溶解)、+ (希釈)の右側に記載の略号：D.W.は注射用水、Sal.は生理食塩液、Gul.はブドウ糖注射液、Sol.は添付溶解液を示す。

ソセゴン注射液15mg

試験方法

〔1〕 配合方法

本剤と配合剤の配合方法は、表に示す「本剤の使用量」「配合剤の使用量」に示す比率にて配合した。

〔2〕 保存条件および試験項目

1) 保存条件

本剤と配合剤を配合した後、室温散光にて保存した。

2) 試験項目

外観： 配合直後、3 時間、6 時間、2 4 時間後に 目視にて外観の変化を観察した。

p H： 配合直後、3 時間、6 時間、2 4 時間後に 日局一般試験法 p H試験法 に準じて p Hを測定した。

含量および残存率： 配合直後、3 時間、6 時間、2 4 時間後に 配合溶液中のペンタゾシン（本剤の薬効成分）含量を液体クロマトグラフ法により測定した。

更に測定含量に基づき、配合直後の含量を100%とした残存率を算定した。

ただし、配合後に外観変化が認められた場合、以後の定量を実施せず。

規制区分

劇薬、向精神薬、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

ソセゴン®注射液30mg

Sosegon® Injection 30mg
ペンタゾシン注射液

ソセゴン注射液30mg 配合変化表

＜本剤の性状：無色～ほとんど無色澄明　pH：3.5～5.5、pH変動試験ではpH6.50で白色結晶析出＞

注）遮光下に配合変化試験を実施したものには製品名の後に★を付した

製品名	メーカー名	成分名	配合剤の使用量	本剤の使用量	外観／pH／残存率				備考	
					配合剤	配合後				
						配合直後	3時間	6時間		24時間
アクチャット注	日研	酢酸維持液(1)ノ血液代用剤	500mL	30mg/1mL	無色澄明 5.4	無色澄明 5.4	無色澄明 5.4	無色澄明 5.4	無色澄明 99.7	
アタラククスーP注射液 (25mg/mL)	ファイザー	ヒドロキシジン塩酸塩	25mg/1mL	30mg/1mL	無色澄明 4.5	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 99.6	
アドナ(AO-17)注射液(静脈用)	田辺製薬	カルバゾクロムスルホン酸ナトリウム水和物	25mg/5mL	30mg/1mL	橙黄色澄明 5.9	橙黄色澄明 4.5	橙黄色澄明 4.6	橙黄色澄明 4.5	橙黄色澄明 100.4	
アナフラニール注射液	チバガイギー ノバルティス	クロミプラミン塩酸塩	25mg/2mL +Sal. 250mL	30mg/1mL	無色澄明 5.6	無色澄明 4.4	無色澄明 4.4	無色澄明 4.4	無色澄明 98.5	
アネキセート注射液 0.5mg	山之内	フルマゼニル	0.5mg/5mL	30mg/1mL	無色澄明 4.1	無色澄明 4.2	無色澄明 4.2	無色澄明 4.2	無色澄明 100.2	
注射用アブレゾリン	チバガイギー	ヒドララジン塩酸塩	20mg /D. W. 1mL	30mg/1mL	無色澄明 4.1	無色澄明 4.2	無色澄明 4.2	無色澄明 4.2	微黄色澄明 99.2	
アミカリック	テルモ = 田辺製薬	アミノ酸・糖・電解質(1)	200mL	30mg/1mL	無色澄明 5.1	無色澄明 5.0	無色澄明 5.0	無色澄明 5.0	無色澄明 100.7	
アミノトリバ1号	大塚工場	アミノ酸・糖・電解質(2-1)	上室(250mL)・ 下室(600mL)	30mg/1mL	無色澄明 5.6	無色澄明 5.6	無色澄明 5.6	無色澄明 5.6	無色澄明 98.9	
アミノトリバ2号	大塚工場	アミノ酸・糖・電解質(2-2)	上室(300mL)・ 下室(600mL)	30mg/1mL	無色澄明 5.6	無色澄明 5.6	無色澄明 5.6	無色澄明 5.6	無色澄明 99.4	
アミパレン	大塚工場	高カロリー輸液用総合アミノ酸製剤(4)	200mL	30mg/1mL	無色澄明 7.0	無色澄明 7.0	無色澄明 7.0	無色澄明 7.0	無色澄明 100.6	
アリナミンF25注★	武田	フルスルチアミン塩酸塩	25mg*/10mL	30mg/1mL	無色澄明 3.5	無色澄明 4.1	無色澄明 4.1	無色澄明 4.1	無色澄明 99.6	遮光保存 *：フルスルチアミンとして25mg／フルスルチアミン塩酸塩として27.29mg
ヴィーニンD注	日研	酢酸リンゲル液(ブドウ糖加)	500mL	30mg/1mL	無色澄明 5.3	無色澄明 5.3	無色澄明 5.3	無色澄明 5.3	無色澄明 97.8	
エホチール注射液★	日本ベ－リンガー	エチレフリン塩酸塩	10mg/1mL	30mg/1mL	無色澄明 6.4	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 100.5	遮光保存
注射用エンドキサン	塩野義	シクロホスファミド水和物	100mg /D. W. 5mL	30mg/1mL	無色澄明 4.6	無色澄明 4.2	無色澄明 4.2	無色澄明 4.2	無色澄明 99.3	
大塚糖液5%	大塚工場	ブドウ糖	5% 20mL	30mg/1mL	無色澄明 4.8	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 100.3	
大塚糖液20%	大塚工場	ブドウ糖	20% 20mL	30mg/1mL	無色澄明 4.0	無色澄明 4.3	無色澄明 4.5	無色澄明 4.3	無色澄明 100.6	

（注）製品名およびメーカー名は試験当時の名称を記載　配合量の /（溶解）、+（希釈）の右側に記載の略号：D.W.は注射用水、Sal.は生理食塩液、GuI.はブドウ糖注射液、Sol.は添付溶解液を示す。

ソセゴン注射液15mgとソセゴン注射液30mgは濃度が異なります。
配合変化データをご利用の際にはご注意ください。

本剤の色、pH　＜添付文書記載値＞
色：無色～ほとんど無色澄明
pH：3.5～5.5
pH変動試験：pH6.50で白色結晶析出

ソセゴン注射液30mg 配合変化表 <本剤の性状：無色～ほとんど無色透明 pH：3.5～5.5、pH変動試験ではpH6.50で白色結晶析出>

注) 遮光下に配合変化試験を実施したものは製品名の後に★を付した

製品名	メーカー名	成分名	配合剤の 使用量	本剤の 使用量	外観／pH／残存率				備考
					配合剤	配合後			
						配合直後	3時間	6時間	
ガスター注射液20mg	アステラス	ファモチジン	20mg/2mL +Sal. 18mL	30mg/1mL	無色透明 6.1	無色透明 5.0	無色透明 5.1	無色透明 5.0	
クリニット注10%	小林薬工	キシリトール	10% 20mL	30mg/1mL	無色透明 6.7	無色透明 100.0	無色透明 99.0	無色透明 99.4	
K _N 補液3 B	大塚工場	維持液(6)／乳酸ナトリウム・無機塩類・糖類剤	500mL	30mg/1mL	無色透明 5.5	無色透明 5.4	無色透明 5.4	無色透明 5.4	
10mgコントミン注★	吉富	クロルプロマジン塩酸塩	10mg/2mL	30mg/1mL	無色透明 5.9	無色透明 4.6	無色透明 4.5	無色透明 4.3	遮光保存
セレネース注5mg	大日本	ハロペリドール	5mg/1mL	30mg/1mL	無色透明 3.9	無色透明 4.1	無色透明 4.1	無色透明 4.1	
ソリター-T 3号	清水 - 味の素 ファルマ	維持液(3)／乳酸ナトリウム・無機塩類・糖類剤	500mL	30mg/1mL	無色透明 5.1	無色透明 5.1	無色透明 5.1	無色透明 5.1	
ソリタックス-H	清水 - 武田	維持液(ブドウ糖加)(1) ／血液代用剤	200mL	30mg/1mL	無色透明 6.0	無色透明 6.0	無色透明 5.9	無色透明 5.9	
ソルデム1輸液	テルモ	開始液(1)／塩化ナトリウム・ブドウ糖剤	1mL	30mg/1mL	無色透明 5.9	無色透明 4.2	無色透明 4.2	無色透明 4.2	
ソルデム1輸液	テルモ	開始液(1)／塩化ナトリウム・ブドウ糖剤	4mL	30mg/1mL	無色透明 5.9	無色透明 4.4	無色透明 4.4	無色透明 4.4	
ソルデム1輸液	テルモ	開始液(1)／塩化ナトリウム・ブドウ糖剤	10mL	30mg/1mL	無色透明 5.9	無色透明 4.6	無色透明 4.6	無色透明 4.6	
ソルデム1輸液	テルモ	開始液(1)／塩化ナトリウム・ブドウ糖剤	200mL	30mg/1mL	無色透明 5.9	無色透明 5.5	無色透明 5.5	無色透明 5.5	
ソルデム3 A輸液	テルモ	維持液(3)／乳酸ナトリウム・無機塩類・糖類剤	200mL	30mg/1mL	無色透明 6.1	無色透明 5.6	無色透明 5.6	無色透明 5.6	
タチオン注射液	山之内	グルタチオン	200mg /D. W. 3mL	30mg/1mL	無色透明 5.9	無色透明 4.9	無色透明 4.8	無色透明 4.8	
デカドロン注射液3.3mg	万有	デキサメタゾンリン酸エステルナトリウム	3.3mg*/1mL	30mg/1mL	無色透明 7.8	白色沈殿 5.7	白色沈殿 5.7	白色沈殿 5.7	*：デキサメタゾンリン酸エステルとして4mg／デキサメタゾンとして3.3mg
トランサミン注	第一製薬	トラネキサム酸	250mg/5mL	30mg/1mL	無色透明 7.6	無色透明 6.0	無色透明 6.1	無色透明 6.0	
トリフリード	大塚工場	維持液(複合糖加)／血液代用液	500mL	30mg/1mL	無色透明 4.9	無色透明 4.9	無色透明 4.9	無色透明 4.9	
ドルミカム注	ロシュ - 山之内	ミダゾラム	10mg/2mL	30mg/1mL	無色透明 3.5	無色透明 4.4	無色透明 4.6	無色透明 4.3	
ネオアミュー	HMR	腎不全用アミノ酸製剤(1-2)	200mL	30mg/1mL	無色透明 7.2	無色透明 7.1	無色透明 7.1	無色透明 7.1	
ネオフィリン注	エーザイ	アミノフィリン水和物	250mg/10mL	30mg/1mL	無色透明 9.1	白濁 9.0	白濁 9.0	白色沈殿 9.0	

(注) 製品名およびメーカー名は試験当時の名称を記載

配合量の / (溶解), +(希釈)の右側に記載の略号：D. W.は生理食塩液, Sal.は生理食塩液, Gul.はブドウ糖注射液, Sol.は添付溶解液を示す。

ソセゴン注射液30mg 配合変化表 <本剤の性状：無色～ほとんど無色透明 p H：3.5～5.5、p H変動試験ではp H6.50で白色結晶析出>

注) 遮光下に配合変化試験を実施したものには製品名の後に★を付した

製品名	メーカー名	成分名	配合剤の 使用量	本剤の 使用量	外観／pH／残存率					備考
					配合剤	配合後				
						配合直後	3時間	6時間	24時間	
ノルアドリナリン★	三共	ノルアドレナリン	1mg/1mL	30mg/1mL	無色透明 2.5	無色透明 4.1	無色透明 4.1	無色透明 99.9	無色透明 99.5	遮光保存
ハイカリック液－1号	テルモ	高カリローリ輸液用基本液 (5-1)	700mL	30mg/1mL	無色透明 4.5	無色透明 4.5	無色透明 4.5	無色透明 100.4	無色透明 101.0	
ハイカリック液－2号	テルモ	高カリローリ輸液用基本液 (5-2)	700mL	30mg/1mL	無色透明 4.5	無色透明 4.5	無色透明 4.5	無色透明 99.9	無色透明 100.5	
ハイカリック液－3号	テルモ	高カリローリ輸液用基本液 (5-3)	700mL	30mg/1mL	無色透明 4.0	無色透明 4.1	無色透明 4.1	無色透明 99.6	無色透明 101.0	
ハイスコ★	杏林	スコボラミン臭化水素酸 塩水和物	0.5mg/1mL	30mg/1mL	無色透明 6.3	無色透明 4.3	無色透明 4.2	無色透明 4.3	無色透明 4.2	遮光保存
パドリン注射液	藤沢	ブリアフィニウム臭化物	7.5mg/1mL	30mg/1mL	無色透明 6.2	無色透明 4.2	無色透明 4.2	無色透明 100.6	無色透明 100.0	
パントール注射液100mg	トーアエイ ヨー－山之内	パンテノール	100mg/1mL	30mg/1mL	無色透明 5.5	無色透明 4.3	無色透明 4.4	無色透明 99.2	無色透明 99.4	
ピーエヌツイン－1号	森下ルセル	アミノ酸・糖・電解質(3- 1)	I層(800mL)・ II層(200mL)	30mg/1mL	無色透明 5.0	無色透明 5.0	無色透明 5.0	無色透明 98.6	無色透明 99.1	
ピーエヌツイン－2号	森下ルセル	アミノ酸・糖・電解質(3- 2)	I層(800mL)・ II層(300mL)	30mg/1mL	無色透明 5.1	無色透明 5.1	無色透明 5.1	無色透明 98.9	無色透明 98.2	
ピーエヌツイン－3号	森下ルセル	アミノ酸・糖・電解質(3- 3)	I層(800mL)・ II層(400mL)	30mg/1mL	無色透明 5.2	無色透明 5.2	無色透明 5.2	無色透明 100.2	無色透明 99.8	
ピクシリン注射用2g	明治製菓	アンピシリンナトリウム	2g /SaI. 100mL	30mg/1mL	無色透明 9.2	結晶析出 9.1	結晶析出 8.8	結晶析出 8.8	結晶析出 8.4	
ピタシミン注射液100mg	武田	アスコルビン酸	100mg/1mL	30mg/1mL	無色透明 7.0	無色透明 5.5	無色透明 5.5	無色透明 100.5	無色透明 101.5	
ピタメジン静注用	三共	リン酸チアアミンジスル フィド・B ₆ ・B ₁₂ 配合 剤	1瓶 /D.W. 20mL	30mg/1mL	淡紅色透明 4.6	淡紅色透明 4.6	淡紅色透明 4.5	淡紅色透明 100.0	淡紅色透明 100.9	
フィシザルツ	扶桑	塩化ナトリウム(生理食 塩液)	0.9% 100mL	30mg/1mL	無色透明 5.6	無色透明 4.3	無色透明 4.3	無色透明 99.9	無色透明 100.9	
10%フェノバール★	藤永－三共	フェノバルビタール	100mg/1mL	30mg/1mL	無色透明 8.8	白濁 8.0	白色沈殿 8.0	白色沈殿 7.9	白色沈殿 8.2	遮光保存
ブスコパン注射液	日本ベ－リン ガー－田辺製 薬	ブチルスコバラミン臭化 物	20mg/1mL	30mg/1mL	無色透明 4.5	無色透明 4.2	無色透明 4.2	無色透明 99.6	無色透明 100.3	
フラピタン注射液10mg★	トーアエイ ヨー－山之内	フラビンアデニンジヌク レオナド	10mg/1mL	30mg/1mL	橙黄色透明 5.7	橙黄色透明 4.4	橙黄色透明 4.5	橙黄色透明 99.2	橙黄色透明 100.2	遮光保存
ブリンペン注射液	藤沢	塩酸メトクロプロミド	10mg/2mL	30mg/1mL	無色透明 3.4	無色透明 4.2	無色透明 4.2	無色透明 100.7	無色透明 101.0	

(注) 製品名およびメーカー名は試験当時の名称を記載

配合量の / (溶解), + (希釈)の右側に記載の略号：D.W.は生理食塩液, Gul.は添付溶解液を示す。

ソセゴン注射液30mg 配合変化表 <本剤の性状：無色～ほとんど無色澄明 pH：3.5～5.5、pH変動試験ではpH6.50で白色結晶析出>

注) 遮光下に配合変化試験を実施したものには製品名の後に★を付した

製品名	メーカー名	成分名	配合剤の 使用量	本剤の 使用量	外観／pH／残存率					備考
					配合剤	配合後				
						配合直後	3時間	6時間	24時間	
フルクトラクT注	大塚工場	維持液(7)／乳酸ナトリウム・無機塩類・糖類剤	500mL	30mg/1mL	無色澄明 4.8	無色澄明 4.8	無色澄明 4.8	無色澄明 4.8	無色澄明 4.8	
5%フルクトン注 (販売中止)	大塚工場	果糖	5% 500mL	30mg/1mL	無色澄明 4.0	無色澄明 4.1	無色澄明 4.2	無色澄明 4.1	無色澄明 4.1	
プレオ	日本化薬	プレオマイシン塩酸塩	15mg /Sol. 10mL	30mg/1mL	無色澄明 4.8	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	
水溶性プレドニン50mg	塩野義	プレドニゾンコハク酸 エステルナトリウム	50mg* /Sal. 5mL	30mg/1mL	無色澄明 6.6	白色沈殿 6.3	白色沈殿 6.3	白色沈殿 6.3	白色沈殿 6.3	*：プレドニゾンコハク酸エステルとして63.9mg／プレドニゾンとして50mg
ヘスパンダー	杏林	ヒドロキシエチルデンプン 配合剤／血液代用剤	500mL	30mg/1mL	無色澄明 6.0	無色澄明 5.9	無色澄明 5.9	無色澄明 5.9	無色澄明 5.9	
ベルジピン注射液10mg★	山之内	ニカルジピン塩酸塩	10mg/10mL	30mg/1mL	微黄色澄明 3.6	微黄色澄明 4.3	微黄色澄明 4.4	微黄色澄明 4.3	微黄色澄明 4.3	遮光保存
ボスミン注★	第一製薬	アドレナリン	1mg/1mL	30mg/1mL	無色澄明 2.9	無色澄明 4.2	無色澄明 4.2	無色澄明 4.2	無色澄明 4.2	遮光保存
ボララミン注5mg★	ジェリングブ ラウ	αクロルフェニラミンマ レイン酸塩	5mg/1mL	30mg/1mL	無色澄明 4.9	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	遮光保存
マイトマイシン協和S	協和発酵	マイトマイシンC	2mg /Sol. 5mL	30mg/1mL	淡青紫色澄明 6.4	淡青紫色澄明 4.2	紫色澄明 4.3	赤紫色澄明 1) 4.3	赤紫色澄明 1) 4.3	1) 経時的に赤味が増した
マックアミン	日本製薬 - 武 田	総合アミノ酸・グリセリ ン配合剤	500mL	30mg/1mL	無色澄明 6.8	無色澄明 6.8	無色澄明 6.8	無色澄明 6.8	無色澄明 6.8	
ミルリーラ注射液10mg	山之内	ミルリノン	10mg/10mL	30mg/1mL	無色澄明 3.6	無色澄明 3.9	無色澄明 3.9	無色澄明 3.9	無色澄明 4.0	
メチロン注25%★	第一製薬	スルピリン水和物	250mg/1mL	30mg/1mL	微黄色澄明 7.1	微黄色澄明 4.9	微黄色澄明 5.0	微黄色澄明 5.1	微黄色澄明 5.3	遮光保存
モリヘバミン	森下ルセル	肝不全用アミノ酸製剤(2)	500mL	30mg/1mL	無色澄明 7.2	無色澄明 7.2	無色澄明 7.2	無色澄明 7.2	無色澄明 7.3	
ユニカリックL	テルモ = 田辺	アミノ酸・糖・電解質(4- 1)	1,000mL	30mg/1mL	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	無色澄明 4.3	
ユニカリックN	テルモ = 田辺	アミノ酸・糖・電解質(4- 2)	1,000mL	30mg/1mL	無色澄明 4.4	無色澄明 4.4	無色澄明 4.4	無色澄明 4.4	無色澄明 4.4	
ライボミンS注射液★	トーアエイ ヨー - 山之内	フラビンアデニンジスクレオ チド(5mg)・ピリドキサル リン酸エステル水和物(10mg)	1mL	30mg/1mL	橙黄色澄明 6.4	橙黄色澄明 5.1	橙黄色澄明 5.1	橙黄色澄明 5.1	橙黄色澄明 5.1	遮光保存
ラクテックG注	大塚工場	乳酸リンゲル液(ソルビ トール加)	100mL	30mg/1mL	無色澄明 6.6	無色澄明 5.6	無色澄明 5.6	無色澄明 5.6	無色澄明 5.7	
ラシックス注100mg	アベンティス	フロセミド	100mg/10mL	30mg/1mL	無色澄明 9.1	白濁 6.2	白濁 6.1	白濁 6.0	白色沈殿 6.1	

(注) 製品名およびメーカー名は試験当時の名称を記載 配合量の / (溶解), + (希釈)の右側に記載の略号：D.W.は注射用水、Sal.は生理食塩液、Gul.はブドウ糖注射液、Sol.は添付溶解液を示す。

ソセゴン注射液30mg 配合変化表 <本剤の性状：無色～ほとんど無色澄明 pH：3.5～5.5、pH変動試験ではpH6.50で白色結晶析出>

注）遮光下に配合変化試験を実施したものは製品名の後に★を付した

製品名	メーカー名	成分名	配合剤の 使用量	本剤の 使用量	配合剤	外観／pH／残存率				備考
						配合後				
						配合直後	3時間	6時間	24時間	
硫酸アトロピン注射液★	扶桑	アトロピン硫酸塩水和物	0.5mg/1mL	30mg/1mL	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	遮光保存	
					6.2	4.2	4.3	4.3		
					100.0	99.1	98.8	99.2		
リンゲル液	扶桑	リンゲル液	500mL	30mg/1mL	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明		
					5.9	4.7	4.7	4.6		
					100.0	99.4	99.7	99.0		
リンデロン注100mg (2%)	塩野義	ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム	100mg*/5mL	30mg/1mL	無色澄明	結晶析出	結晶析出	結晶析出	*：ベタメタゾンリン酸エステルナトリウムとして131.6mg/ベタメタゾンとして100mg	
					8.0	6.9	6.9	6.9		
レンチナン<山之内> 1mg (販売中止)	山之内	レンチナン	1mg /D.W. 2mL	30mg/1mL	無色澄明	—	—	—		
					6.5	4.2	4.1	4.2		
					100.0	99.7	99.8	99.9		
ワゴスチグミン注0.5mg ★	塩野義	メチル硫酸ネオスチグミン	0.5mg/1mL	30mg/1mL	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明	遮光保存	
					6.1	4.2	4.3	4.3		
					100.0	98.5	98.3	99.2		

ソセゴン注射液30mg 配合変化表（多剤）

<本剤の性状：無色～ほとんど無色澄明 pH：3.5～5.5、pH変動試験ではpH6.50で白色結晶析出>

製品名	メーカー名	成分名	配合剤の使用量	本剤の使用量	配合剤	外観／pH／残存率				備考
						配合後				
						配合直後	3時間	6時間	24時間	
ソセゴン注射液30mg	アステラス	ベンタゾシン		30mg/1mL	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明		
					4.2	4.2	4.2	4.2		
					100.0	100.3	100.3	100.1		
アタラックスーP注射液 (25mg/mL)	ファイザー	ヒドロキシジン塩酸塩	25mg/1mL		無色澄明					
					4.1					
アトロピン硫酸塩注 0.5mg「タナベ」	田辺三菱	アトロピン硫酸塩水和物	0.5mg/1mL		無色澄明					
					5.6					

（注）製品名およびメーカー名は試験当時の名称を記載

配合量の / (溶解), + (希釈)の右側に記載の略号：D.W.は注射用水, Sal.は生理食塩液, Gul.はブドウ糖注射液, Sol.は添付溶解液を示す。

ソセゴン注射液30mg

試験方法

〔1〕 配合方法

本剤と配合剤の配合方法は、表に示す「本剤の使用量」「配合剤の使用量」に示す比率にて配合した。

〔2〕 保存条件および試験項目

1) 保存条件

本剤と配合剤を配合した後、室温散光にて保存した。

2) 試験項目

外観： 配合直後、3時間、6時間、24時間後に 目視にて外観の変化を観察した。

pH： 配合直後、3時間、6時間、24時間後に 日局一般試験法 pH試験法 に準じてpHを測定した。

含量および残存率： 配合直後、3時間、6時間、24時間後に 配合溶液中のペンタゾシン（本剤の薬効成分）含量を液体クロマトグラフ法により測定した。

更に測定含量に基づき、配合直後の含量を100%とした残存率を算定した。

ただし、配合後に外観変化が認められた場合、以後の定量を実施せず。

ンセゴン注射液15mg ンセゴン注射液30mg

ペンタゾシン注射液

一般名又は成分 単位/容量	投与方法	用時 溶解	規格 pH域	試料 pH	(A) N/10HCl (B) N/10NaOH	変化点pH 又は最終pH	移動 指数	変化所見	希釈試験								浸透圧比 (約)
									20mL				500mL				
									0	30min	1hr	3hr	0	30min	1hr	3hr	
ペンタゾシン 15mg/1mL	静・筋 ・皮		3.5～5.5	4.40	(A) 10.0	1.12	3.28	変化なし								1	
					(B) 0.13	6.20	1.80	白色結晶析出	6.01 +	+	+	+	5.40 +	-	-		- (5.5)
ペンタゾシン 30mg/1mL	静・筋 ・皮		3.5～5.5	4.40	(A) 10.0	1.12	3.28	変化なし								1	
					(B) 0.28	6.50	2.10	白色結晶析出	6.25 +	+	+	+	5.45 +	-	-		- (5.5)

参考文献) 幸保文治：注射薬便覧(南山堂)：1976

〔凡 例〕

注射薬のpH変動試験法及び希釈試験法

1. 投与方法

静は静脈内注射、点は点滴静注、筋は筋肉内注射、皮は皮下注射、動は動脈内注射を意味する。

2. 用時溶解

●印は用時溶解して用いる注射薬を示し、※は用時懸濁して用いる注射薬を示す。空欄は溶解済の注射薬を示す。

3. 規格pH域

添付文書記載のpH域を記入した。

4. 試料pH

実験に供した注射薬のpHである。

5. (A)N/10 HCl、(B)N/10 NaOH

0.1N HCl、0.1N NaOHにより上限を10mLとして滴定を行ない、外観変化が認められた場合は、この時の滴下mL数とし、外観変化が認められなかった場合は10mLとした。

変化点pHまたは最終pH：上記滴定により、外観変化が認められたpHを変化点pHとし、外観変化が認められなかった場合は、10mL滴下時のpHを最終pHとした。

移動指数：上記pHと試料pHとの差を示す。

6. 変化所見

0.1N HCl、0.1N NaOHの滴定における外観変化を記入した。

7. 希釈試験における20mL、500mLの0の欄の数値は希釈直後のpH、500mLの3hrの欄()内の数値は使用した蒸留水のpHを示す。

+ は外観変化の認められるもの。

－ は外観変化の認められないもの。すなわち再び澄明となったことを意味する。

() は外観変化のうち、変色をあらわす。判定はいずれも肉眼的に行う。

8. 浸透圧比

浸透圧比は氷点降下法により測定し、生理食塩液を1として比であらわした(添付文書記載の値を記載した)。

9. その他

用時溶解以外の空欄は、データなしを意味する。

(幸保文治著「注射薬便覧」南山堂1976の凡例に基づく)

1. 試料

1アンブル、1バイアル中の容量が10mL以上の場合は10mL、10mL未満の場合は1アンブル、1バイアルの容量をもって試料とする。用時溶解して用いる注射薬は添付の溶解液、又は添付文書中に指定の注射液の指定量で溶解する。

2. pH変動試験法

0.1N HCl、0.1N NaOHにより、上限を10mLとして滴定を行ない、外観変化が認められた場合は、この時のpH(変化点pH)及び滴定量を測定する。また、外観変化が認められなかった場合は、10mL滴下時のpH(最終pH)を測定する。

3. 希釈試験

外観変化の認められるものについては変化点pHにおいて、さらに20mLおよび500mLの蒸留水を加えて良く攪拌し、外観変化の状態を希釈直後、30分、1時間、3時間、室温にて観察する。

(幸保文治著「注射薬便覧」南山堂1976 P.32に基づく)

