

◎ペルタゾン錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】 ペンタゾシン塩酸塩+ナロキソン塩酸塩 pentazocine hydrochloride/naloxone hydrochloride 【分類】 鎮痛剤

【単位】 ◎25mg/錠

【常用量】 1回 25～50mg [適宜増減]

【用法】 追加投与する場合は3～5時間の間隔をあける ■癌性疼痛管理には定時投与が望ましい (5)

【透析患者への投与方法】 透析患者の投与方法に言及した文献はないが減量の必要なし (4)

【その他の報告】 半量に減量 (6)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 減量の必要なし (4)

【その他の報告】 ペンタゾシン : Ccr10～50mL/min : 75%に減量, Ccr<10mL/min : 50%に減量 (3,12) ナロキソン : 減量の必要なし (3,12)

【特徴】ペンタゾシンの経口用製剤。乱用を防ぐため麻薬拮抗剤であるナロキソンを添加してある。ナロキソンは非経口投与で極めて強いオピオイド拮抗作用を示すが、経口投与では肝の初回通過効果により速やかに代謝されるため拮抗作用を示さない。従って錠剤を溶解させて静注する乱用を防いでいる。

【主な副作用・毒性】 軽度の呼吸抑制、大量連用により薬物依存・神経原性筋障害、軽度の鎮静、めまい、ショック、血圧上昇、顆粒球減少など

【F】 初回通過効果の個人差が大きく、11～32% (11)

【F】 50% (14)

【tmax】 2hr [坐] (1) 2～5min [im] (U) 内服1～3hr、筋注15～60min (11)

【代謝】 肝代謝 (11)

【排泄】 尿中未変化体排泄率 5～23% (U) 12% (4) 10%以下 (11) 5% (14) 尿中回収率 70.4% (未変化体・代謝物として) (1) 胆汁中にも排泄 (U)

【CL】 1317mL/min (1) 【非腎CL/総CL】 80% (10)

【t1/2】 98～192min (1) 2～3hr (U) 2hr (11) 2.5hr (14) 透析患者で2～3hr (U)

【蛋白結合率】 48～75% (11) 60～70% (6) 65% (10) 61.1～65.8% (1)

【Vd】 5.6L/kg (10) 250～550L/man (11) 4L/kg (14) 【分布】 赤血球内にも血漿濃度の50%分布する (11)

【MW】 363.84

【透析性】 透析で除去されるとする報告 (JPDI, 1996) もあるが、Vdが大きいため透析性は著しく低い可能性が高い (5)

【TDMのポイント】 TDMの対象にならない。有効治療域 100～600ng/mL (14) 【O/W係数】 22.8 [1-オクタノール/水系, pH7] (1) 【pKa】 8.0 (1)

【相互作用】 モルヒネ製剤、中枢性鎮痛薬、ベンゾジアゼピン誘導体、バルビツール酸誘導体、アルコールにより作用が増強され、アミトリプチリン等の中枢性のセロトニン作動活性を増強する (1)

【更新日】 20151202

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、

直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。