



日本標準商品分類番号
878211

貯 法：室温保存、遮光して保存する、密封容器
規 制 区 分：麻薬、処方箋医薬品(注意-医師等の処方箋によ
り使用すること)

	注射液35mg	注射液50mg
承認番号	16100AMZ02916	16100AMZ02917
薬価収載	1956年9月	
販売開始	1961年12月	

鎮痛・鎮痙剤

日本薬局方

ペチジン塩酸塩注射液

オピスタン[®]注射液35mg

オピスタン[®]注射液50mg

OPYSTAN[®] Injection 35mg・50mg

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1) 重篤な呼吸抑制のある患者〔呼吸抑制を増強する。〕
- 2) 重篤な肝障害のある患者〔昏睡に陥ることがある。〕
- 3) 慢性肺疾患に続発する心不全のある患者〔呼吸抑制や循環不全を増強する。〕
- 4) 痙攣状態(てんかん重症症、破傷風、ストリキニーネ中毒)にある患者〔脊髄の刺激効果があらわれる。〕
- 5) 急性アルコール中毒の患者〔呼吸抑制を増強する。〕
- 6) 既往に本剤に対する過敏症のある患者
- 7) MAO阻害剤を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕

【組成・性状】

販 売 名	オピスタン注射液35mg	オピスタン注射液50mg
成分・含量 1管(1mL)中	日局 ペチジン塩酸塩	
	35mg	50mg
添 加 物	pH調整剤(塩酸、水酸化ナトリウム)を含有する	
製 剤 の 外 観	無色澄明の液、光によって変化する	
pH	4.0~6.0	
浸透圧比 (生理食塩液 に対する比)	約 0.8	約 1.1

【効能・効果】

- 激しい疼痛時における鎮痛・鎮静・鎮痙
- 麻酔前投薬
- 麻酔の補助
- 無痛分娩

【用法・用量】

- 激しい疼痛時における鎮痛・鎮静・鎮痙には、通常、成人にはペチジン塩酸塩として、1回35~50mgを皮下又は筋肉内に注射する。なお、必要に応じて3~4時間ごとに追加する。特に急を要する場合には緩徐に静脈内に注射する。
- 麻酔前投薬には、通常、麻酔前30~90分にペチジン塩酸塩として、50~100mgを皮下又は筋肉内に注射する。
- 全身麻酔の補助には、通常、5%ブドウ糖注射液又は生理食塩液で、1mL当りペチジン塩酸塩として、10mgを含有するように希釈し、ペチジン塩酸塩として、10~15mgずつ間歇的に静脈内に注射する。なお、投与量は場合によりペチジン塩酸塩として50mgまで増量することもある。
- 無痛分娩には、通常、子宮口二横指開大ないし全開時に、ペチジン塩酸塩として、70~100mgを皮下又は筋肉内に注射する。なお、必要に応じて3~4時間ごとに35~70mgずつ1~2回追加する。この場合、母体及び胎児の呼吸抑制を防ぐために、ペチジン塩酸塩100mgに対してレパロルファン酒石酸塩1mgの投与比率で混合注射するとよい。なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 1) 心筋梗塞、心房粗動、上室性頻脈のある患者〔病態が増悪するおそれがある。〕
- 2) 手術後の患者及び血圧保持の困難な患者〔著しい血圧降下が生じることがある。〕
- 3) 呼吸機能障害のある患者〔呼吸抑制を増強するおそれがある。〕
- 4) 気管支喘息発作中の患者〔気管支平滑筋を収縮させる。〕
- 5) 肝・腎障害のある患者〔代謝・排泄が遅延し副作用があらわれるおそれがある。〕
- 6) 頭部外傷、脳に器質的障害のある患者及び頭蓋内圧亢進のある患者〔呼吸抑制や頭蓋内圧の上昇を増強するおそれがある。〕
- 7) ショック状態にある患者〔循環不全や呼吸抑制を増強するおそれがある。〕
- 8) 代謝性アシドーシスのある患者〔呼吸抑制を起こすおそれがある。〕
- 9) 甲状腺機能低下症(粘液水腫等)の患者〔呼吸抑制や昏睡を起こすおそれがある。〕
- 10) 副腎皮質機能低下症(アジソン病等)の患者〔呼吸抑制作用に対し、感受性が高くなっている。〕
- 11) 薬物依存の既往歴のある患者〔依存性を生じやすい。〕
- 12) 高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕
- 13) 新生児、乳児〔「小児等への投与」の項参照〕
- 14) 衰弱者〔呼吸抑制作用に対し、感受性が高くなっている。〕
- 15) 前立腺肥大による排尿障害、尿道狭窄、尿管手術後の患者〔排尿障害を増悪することがある。〕
- 16) 急性腹症のある患者〔急性腹症の経過及び診断を混乱させるおそれがある。〕
- 17) 器質的幽門狭窄、痙攣性イレウス又は最近消化管手術を行った患者〔消化管運動を抑制する。〕
- 18) 痙攣の既往歴のある患者〔痙攣を誘発するおそれがある。〕
- 19) 胆嚢障害及び胆石のある患者〔胆道痙攣を起こすことがある。〕
- 20) 重篤な炎症性腸疾患のある患者〔連用した場合、巨大結腸症を起こすおそれがある。〕

2. 重要な基本的注意

- 1) 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。〔「副作用」の項参照〕
- 2) 眠気、眩暈が起こることがあるので、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従事させないよう**注意すること。

3. 相互作用

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
MAO阻害剤	興奮、錯乱、呼吸循環不全等を起こすことがあるので併用しないこと。MAO阻害剤の投与を受けた患者に本剤を投与する場合には、少なくとも2週間の間隔をおくことが望ましい。	本剤は神経系のセロトニンの取り込みを阻害する。MAO阻害剤併用により中枢神経のセロトニンが蓄積する。

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
中枢神経抑制剤(フェノチアジン系薬剤、バルビツール酸系薬剤等)	呼吸抑制、低血圧及び顕著な鎮静又は昏睡が起こることがある。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。
三環系抗うつ剤		
吸入麻酔剤		
β遮断剤(プロプラノロール塩酸塩)		
アルコール		
クマリン系抗凝血剤(ワルファリンカリウム)	抗凝血作用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。	機序不明
抗コリン作用を有する薬剤(アトロピン硫酸塩水和物)	麻痺性イレウスに至る重篤な便秘又は尿貯留が起こるおそれがある。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(抗コリン作用)を増強させる。
イソニアジド	イソニアジドのMAO阻害作用により呼吸抑制、低血圧、昏睡、痙攣等が起こることがある。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。	本剤は神経系のセロトニンの取り込みを阻害する。イソニアジド併用により中枢神経のセロトニンが蓄積する。
アンフェタミン	アンフェタミンのMAO阻害作用により呼吸抑制、低血圧、昏睡、痙攣等が起こることがある。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。	本剤は神経系のセロトニンの取り込みを阻害する。アンフェタミン併用により中枢神経のセロトニンが蓄積する。
尿アルカリ化剤(炭酸水素ナトリウム)	本剤の作用が増強することがある。	本剤の尿中排泄が減少し、作用を増強させる。

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用

- 連用により**薬物依存**(頻度不明)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。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、振戦、全身の筋肉・関節痛、呼吸促進等の**退薬症候**があらわれることがあるので、投与を中止する場合には、1日用量を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。

*2) **ショック、アナフィラキシー様症状**(いずれも頻度不明)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、呼吸困難、意識低下等があらわれた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- 呼吸抑制**(頻度不明)があらわれることがあるので、息切れ、呼吸緩慢、不規則な呼吸、呼吸異常等があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。なお、本剤による呼吸抑制には、麻薬拮抗剤(ナロキソン塩酸塩、レバロルフアン等)が拮抗する。
- 錯乱、せん妄**(いずれも頻度不明)があらわれることがあるので、このような場合には、減量又は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 痙攣**(頻度不明)があらわれるとの報告がある。
- 無気肺、気管支痙攣、喉頭浮腫**(いずれも頻度不明)があらわれるとの報告がある。
- 炎症性腸疾患の患者に投与した場合、**麻痺性イレウス、中毒性巨大結腸**(いずれも頻度不明)があらわれるとの報告がある。

(2) その他の副作用

副作用が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

種類	頻度	頻度不明
循環器		不整脈、動悸、血圧変動、顔面潮紅
精神神経系		眠気、眩暈、不安、不穏、多幸感、振戦、幻覚、興奮、発汗
眼		視調節障害
消化器		悪心、嘔吐、便秘、口渇
過敏症		発疹、そう痒感
投与部位		静脈内投与による静脈炎・発赤
その他		排尿障害、頭蓋内圧の亢進

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しており、特に呼吸抑制の感受性が高いため、低用量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら、慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上まわると判断される場合にのみ投与すること。〔類似化合物(モルヒネ)の動物実験(マウス、ラット)で催奇形作用(骨格異常)が報告されている。〕
- 分娩前に投与した場合、出産後新生児に**退薬症候**(多動、神経過敏、不眠、振戦等)があらわれることがある。
- 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。
- 授乳中の婦人には、本剤投与中は授乳を避けさせること。〔ヒト母乳中へ移行することがある。〕

7. 小児等への投与

新生児、乳児では呼吸抑制の感受性が高いため、低用量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら、慎重に投与すること。

8. 過量投与

徴候・症状：

呼吸抑制、意識不明、痙攣、錯乱、血圧低下、重篤な脱力感、重篤なめまい、嗜眠、心拍数の減少、神経過敏、不安、縮瞳、皮膚冷感等を起こすことがある。

処置：

過量投与時には以下の治療を行うことが望ましい。

- 投与を中止し、気道確保、補助呼吸及び呼吸調節により適切な呼吸管理を行う。
- 麻薬拮抗剤投与を行い、患者に退薬症候又は麻薬拮抗剤の副作用が発現しないよう慎重に投与する。

- 3) 必要に応じて補液、昇圧剤等の投与又は他の補助療法を行う。

9. 適用上の注意

1) 静脈内投与時：

静脈内注射をする場合は、患者をねかせて極めて緩徐に投与するか、又は希釈(5%ブドウ糖液又は生理食塩液)して投与するのが望ましい(急速に注射した場合、呼吸抑制、血圧降下、循環障害、心停止等があらわれることがある)。麻薬拮抗剤(ナロキソン塩酸塩、レバロルフアン等)や呼吸の調節・補助設備のないところでは静脈内注射を行わないこと。また、静脈炎・発赤を起すことがあるので、なるべく太い静脈を選び、注射速度をできるだけ遅くすること。

2) 筋肉内注射時：

筋肉内注射に当たっては、組織・神経等への影響を避けるため、下記の点に注意すること。

- ① 筋肉内投与はやむを得ない場合にのみ必要最小限に行うこと。なお、特に同一部位への反復注射は行わないこと。また、新生児、未熟児、乳児、小児には特に注意すること。
- ② 神経走行部位を避けるよう注意すること。
- ③ 注射針を刺入れたとき、激痛を訴えたり、血液の逆流を見た場合は直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。

3) 皮下・筋肉内注射時：

皮下・筋肉内注射により、注射部位に疼痛、局所刺激及び硬結を見ることがある。

4) アンブルカット時：

本品はワンポイントカットアンブルであるが、カット部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。

【薬物動態】

(参考)外国人による成績である。

健康成人6例にペチジン塩酸塩約50mg($26\text{mg}/\text{m}^2$ ・体表面積)を静脈内投与した場合、投与1分後の血清中濃度は $0.52\ \mu\text{g}/\text{mL}$ を示し、 α 相及び β 相の半減期は、それぞれ4.2分、3.9時間である。また、筋肉内投与では投与1時間後に最高血中濃度(約 $0.20\ \mu\text{g}/\text{mL}$ serum)に達し、以後3.3時間の半減期で減少する。¹⁾

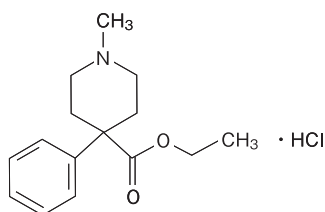
体内で加水分解及びN-脱メチル化を受け、尿中への未変化体の排泄は極めて少ない。²⁾

【薬効薬理】

1. 鎮痛作用：モルヒネ様の中樞性鎮痛作用を示し、その鎮痛効果はモルヒネの1/6～1/10である。^{3,4)}
2. 鎮痙作用：アトロピン様の向神経性鎮痙作用及びパパバリン様の向筋肉性鎮痙作用を示す。⁵⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

- 一般名：ペチジン塩酸塩(Pethidine Hydrochloride)
- 化学名：Ethyl 1-methyl-4-phenylpiperidine-4-carboxylate monohydrochloride



$\text{C}_{15}\text{H}_{21}\text{NO}_2 \cdot \text{HCl}$: 283.79

○性状：

- ・白色の結晶性の粉末である。
- ・水又は酢酸(100)に極めて溶けやすく、エタノール(95)に溶けやすく、無水酢酸にやや溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。
- ・1.0gを水20mLに溶かした液のpHは3.8～5.8である。
- ・融点：187～189℃

【取扱い上の注意】

本品は「ワンポイントカットアンブル」を使用しているため、ヤスリを用いず、アンブル枝部のマークの反対方向に折り取ること。

【包装】

オピスタン注射液35mg：1mL×10管

オピスタン注射液50mg：1mL×10管

【主要文献】

- 1) Stambaugh, J. E. et al. : J. Clin. Pharmacol. 1976 ; 16 : 245-256
- 2) Goodman and Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics 6th ed. 1980 ; 513-518
- 3) Zsilla, G. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther. 1976 ; 199(3) : 662-668
- 4) 島本暉朗：薬理学, 医学書院 1964 ; 145-147
- 5) 細谷英吉：臨床薬理学大系第4巻, 中山書店 1965 ; 160-161

**【文献請求先】

田辺三菱製薬株式会社 くすり相談センター
〒541-8505 大阪市中央区道修町3-2-10
電話 0120-753-280

**



販売

田辺三菱製薬株式会社

大阪市中央区道修町3-2-10

**製造販売元

田辺三菱製薬工場株式会社

大阪市淀川区加島3-16-89