2022 年 2 月改訂（第 8 版）　　日本標準商品分類番号：871125

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 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：田辺三菱製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	田辺三菱製薬株式会社　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.mt-pharma.co.jp/

本 IF は 2021 年 9 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。

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－

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り，製薬企業の医薬情報担当者（以下，ＭＲと略す）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，日病薬と略す）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は紙媒体の冊子としての提供方式から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と略す）の医療用医薬品情報検索のページ（https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されて入手可能となっている．日病薬では，2008 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．

この度，2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ，新たに日病薬医薬情報委員会が記載要領を改め，「ＩＦ記載要領 2018」として公表された．

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．

ＩＦ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．ただし，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（以下，薬機法と略す）に基づく承認事項を逸脱するもの，製薬企業の機密等に関わ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の提供は，電子媒体を基本とし，必要に応じて薬剤師が印刷して使用する．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，ＩＦ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「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

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いただきたい．しかし，薬機法の広告規制や医療用医薬品プロモーションコード等により，製薬企業が提供できる情報の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．

（2018 年 10 月改訂）

目　次

Ⅰ．概要に関する項目……6
1．開発の経緯……6
2．製品の治療学的特性……6
3．製品の製剤学的特性……6
4．適正使用に関して周知すべき特性……6
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項……6
6．ＲＭＰの概要……6

Ⅱ．名称に関する項目……7
1．販売名……7
2．一般名……7
3．構造式又は示性式……7
4．分子式及び分子量……7
5．化学名（命名法）又は本質……7
6．慣用名、別名、略号、記号番号……7

Ⅲ．有効成分に関する項目……8
1．物理化学的性質……8
2．有効成分の各種条件下における安定性……8
3．有効成分の確認試験法、定量法……8

Ⅳ．製剤に関する項目……9
1．剤形……9
2．製剤の組成……9
3．添付溶解液の組成及び容量……9
4．力価……9
5．混入する可能性のある夾雑物……10
6．製剤の各種条件下における安定性……10
7．調製法及び溶解後の安定性……10
8．他剤との配合変化（物理化学的変化）……10
9．溶出性……10
10．容器・包装……10
11．別途提供される資材類……11
12．その他……11

Ⅴ．治療に関する項目……12
1．効能又は効果……12
2．効能又は効果に関連する注意……12
3．用法及び用量……12
4．用法及び用量に関連する注意……12
5．臨床成績……12

Ⅵ．薬効薬理に関する項目……14
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群……14
2．薬理作用……14

Ⅶ．薬物動態に関する項目……15
1．血中濃度の推移……15
2．薬物速度論的パラメータ……15
3．母集団（ポピュレーション）解析……16
4．吸収……16
5．分布……16
6．代謝……16
7．排泄……17
8．トランスポーターに関する情報……17
9．透析等による除去率……17
10．特定の背景を有する患者……17
11．その他……17

Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目……18
1．警告内容とその理由……18
2．禁忌内容とその理由……18
3．効能又は効果に関連する注意とその理由……18
4．用法及び用量に関連する注意とその理由……18
5．重要な基本的注意とその理由……18
6．特定の背景を有する患者に関する注意……19
7．相互作用……20
8．副作用……21
9．臨床検査結果に及ぼす影響……23
10．過量投与……23
11．適用上の注意……24
12．その他の注意……24

Ⅸ．非臨床試験に関する項目……25
1．薬理試験……25
2．毒性試験……25

Ⅹ．管理的事項に関する項目……26
1．規制区分……26
2．有効期間……26

3. 包装状態での貯法…… 26
4. 取扱い上の注意……26
5. 患者向け資材……26
6. 同一成分・同効薬…… 26
7. 国際誕生年月日……26
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… 26
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……27
11. 再審査期間…… 27
12. 投薬期間制限に関する情報……27
13. 各種コード…… 27
14. 保険給付上の注意…… 27

ＸＩ．文献…… 28
1. 引用文献……28
2. その他の参考文献…… 28

ＸⅡ．参考資料…… 29
1. 主な外国での発売状況……29
2. 海外における臨床支援情報……29

ＸⅢ．備考…… 30

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）

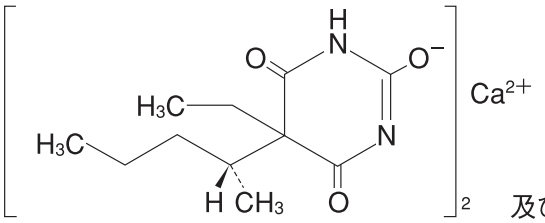
(2) 洋名（命名法）：

Pentobarbital　Calcium（JAN）

(3) ステム（ｓｔｅｍ）：

催眠剤、バルビツール酸誘導体：-barb-

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：$C_{22}H_{34}CaN_4O_6$

分子量：490.61

5. 化学名（命名法）又は本質

Monocalcium bis{5-ethyl-5-[(1*RS*)-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 ヵ月間安定

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）

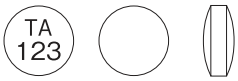
Ⅳ．製剤に関する項目

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

①最終製品の室温保存で 36 ヵ月間性状、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 ヵ月	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 ヵ月	変化なし	99.4	4.6-5.5	1	開放
		2 ヵ月	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（物理化学的変化）

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

(4) 容器の材質：

PTP 包装：ポリ塩化ビニル、アルミ箔

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

(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. 薬理学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：

0.5～3μg/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±0.06μg/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：

10μg/mL 以上 [8)]

(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：

摂食時：0.71hr^{-1}（58min）

空腹時：2.00hr^{-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

(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)]
・^{15}N 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)]。

・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。

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
嗄声	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	歩行蹣さん	2	0.52

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[11)]。

・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、気管に異物の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。

③5%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、この薬物のみ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ビ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%0_2 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

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：

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：LD_{50}（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

同一成分薬：

なし

同効薬：

アモバルビタール、セコバルビタール

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	21900AMX00186	2007 年 6 月 15 日	2007 年 6 月
ラボナ錠 (旧販売名)	1982 年 3 月 29 日	15700AMZ00323 〔(57AM) 第 323 号〕	1982 年 10 月 1 日	1982 年 10 月
ペントバルビタール カルシウム錠 (旧販売名)	1972 年 5 月 25 日[注1] 1952 年 5 月 6 日[注2]	無し[注3]	1953 年 8 月 1 日	1952 年 8 月 8 日

注 1：最終許可
注 2：初回許可
注 3：許可のため無し

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

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

ＸＩ．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

ＸⅡ．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

その他の関連資料

該当資料なし