

** 2022年4月改訂(第10版)

* 2020年2月改訂

貯法：気密容器

冷凍を避け、室温(1～30℃)で保存
使用期限：外箱等に記載劇薬
麻薬
処方箋医薬品^{注)}

癌疼痛治療剤

アンペック[®]坐剤10mg
アンペック[®]坐剤20mg
アンペック[®]坐剤30mg

<モルヒネ塩酸塩坐剤>

ANPEC[®]日本標準商品分類番号
878114

	坐剤10mg	坐剤20mg	坐剤30mg
承認番号	3AM-742	3AM-743	21100AMZ00431
薬価収載	1991年11月	1991年11月	1999年5月
販売開始	1991年12月	1991年12月	1999年6月
再審査結果	1999年3月		-



注) 注意 - 医師等の処方箋に
より使用すること


® 登録商標

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) 気管支喘息発作中の患者〔気道分泌を妨げる。〕
- (3) 重篤な肝障害のある患者〔昏睡に陥ることがある。〕
- (4) 慢性肺疾患に続発する心不全の患者〔呼吸抑制や循環不全を増強する。〕
- (5) 痙れん状態(てんかん重積症、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。〕
- (6) 急性アルコール中毒の患者〔呼吸抑制を増強する。〕
- (7) 本剤の成分及びアヘンアルカロイドに対し過敏症の患者
- * (8) 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〔「相互作用」の項参照〕

■組成・性状

販売名	アンペック坐剤10mg				アンペック坐剤20mg			
成分・含量	1個中モルヒネ塩酸塩水和物10mg				1個中モルヒネ塩酸塩水和物20mg			
添加物	ハードファット(基剤)				ハードファット(基剤)			
剤形	白色～微黄色の紡錘形の坐剤				白色～微黄色の紡錘形の坐剤			
外形								
大きさ	全長(mm)	尾部胴径(mm)	頭部胴径(mm)	重さ(g)	全長(mm)	尾部胴径(mm)	頭部胴径(mm)	重さ(g)
	26.5	7.5	9.0	1.20	30.5	8.0	9.4	1.60
識別コード	P187(コンテナーに印刷)				P188(コンテナーに印刷)			

販売名	アンペック坐剤30mg			
成分・含量	1個中モルヒネ塩酸塩水和物30mg			
添加物	ハードファット(基剤)			
剤形	白色～微黄色の紡錘形の坐剤			
外形				
大きさ	全長(mm)	尾部胴径(mm)	頭部胴径(mm)	重さ(g)
	30.5	8.0	9.4	1.60

販売名	アンペック坐剤30mg
識別コード	P189(コンテナーに印刷)

■効能・効果

激しい疼痛を伴う各種癌における鎮痛

■用法・用量

通常、成人にはモルヒネ塩酸塩水和物として1日20～120mgを2～4回に分割し直腸内に投与する。

なお、初めてモルヒネ製剤として本剤を投与する場合は、1回10mgより開始することが望ましい。

症状により投与量、投与回数を適宜増減する。

■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) 心機能障害のある患者〔循環不全を増強するおそれがある。〕
- (2) 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。〕
- (3) 肝・腎機能障害のある患者〔代謝・排泄が遅延し、副作用があらわれるおそれがある。〕
- (4) 脳に器質的障害のある患者〔呼吸抑制や頭蓋内圧の上昇を起こすおそれがある。〕
- (5) 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。〕
- (6) 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。〕
- (7) 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。〕
- (8) 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。〕
- (9) 薬物依存の既往歴のある患者〔依存性を生じやすい。〕
- (10) 高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕
- (11) 新生児、乳児〔「小児等への投与」の項参照〕
- (12) 衰弱者〔呼吸抑制作用に対し、感受性が高くなっている。〕
- (13) 前立腺肥大による排尿障害、尿道狭窄、尿路手術後の患者〔排尿障害を増悪することがある。〕
- (14) 器質的幽門狭窄、麻痺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。〕
- (15) 痙れんの既往歴のある患者〔痙れんを誘発するおそれがある。〕
- (16) 胆のう障害及び胆石のある患者〔胆道痙れんを起こすことがある。〕
- (17) 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。〕
- (18) ジドブジン(アジドチミジン)を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕

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〕(1)-1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など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)本剤を増量する場合には、予想される副作用(便秘、嘔気、眠気等)に対する対策をあらかじめ考慮するなど副作用に十分注意すること。

3. 相互作用

* (1)併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名	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(又はその悪化)が起こるおそれがある。また、本剤の効果が減弱するおそれがある。緊急の手術等によりやむを得ず本剤を投与する場合、患者毎に本剤の用量を漸増し、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。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週間前にはナルメフェン塩酸塩水和物の投与を中断すること。〔禁忌〕の項参照	μ -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。

(2)併用注意(併用に注意すること)

薬剤名	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 吸入麻酔剤 モノアミン酸化酵素阻害剤 三環系抗うつ剤 β -遮断剤 アルコール	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。	相加的に中枢神経抑制作用が増強する。
クマリン系抗凝血剤 ワルファリン	クマリン系抗凝血剤の作用を増強させることがある。	機序は不明である。
抗コリン作用を有する薬剤	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。	相加的に抗コリン作用が増強する。
ジドブジン(アジドチミジン)	ジドブジンの副作用(骨髄抑制等)を増強させるおそれがある。	本剤はジドブジンのグルクロン酸抱合を競合的に阻害し、クリアランスを低下させる。
ブプレノルフィン	ブプレノルフィンの高用量(8mg 連続皮下投与)において、本剤の作用に拮抗するとの報告がある。	ブプレノルフィンは解離の遅い部分的 μ -受容体作動薬で、モルヒネの投与前にブプレノルフィンを投与すると、その治療効果を減弱させる。
水溶性基剤を用いた非ステロイド性消炎鎮痛剤の坐剤 インドメタシン等	インドメタシン坐剤(水溶性基剤)との併用で、基剤の影響により本剤の吸収が低下するとの報告がある。	直腸内の水分が水溶性基剤の溶解に消費されるため、モルヒネの溶解が不十分になると考えられている。

薬剤名	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
脂溶性基剤を用いた非ステロイド性消炎鎮痛剤の坐剤 ジクロフェナク等	ジクロフェナク坐剤との併用で、主薬の影響により本剤の吸収が上昇するとの報告がある。	非ステロイド性消炎鎮痛剤が直腸粘膜の透過性を亢進することによると考えられている。

4. 副作用

承認までの臨床試験268例及び使用成績調査・特別調査1,254例の合計1,522例中447例(29.4%)に副作用がみられ、主なものは悪心・嘔吐(16.8%)、便秘(12.7%)、眠気(8.7%)等であった。(剤型追加承認時)

(1)重大な副作用

1)依存性(0.2%)

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。

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)呼吸抑制(0.8%)

呼吸抑制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、レバロルフアン等)が拮抗する。

3)錯乱(0.2%)、せん妄(0.1%未満)

錯乱、せん妄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。

4)無気肺、気管支痙攣、喉頭浮腫(いずれも0.1%未満)

無気肺、気管支痙攣、喉頭浮腫があらわれるとの報告がある。

5)麻痺性イレウス、中毒性巨大結腸(いずれも0.1%未満)

炎症性腸疾患の患者に投与した場合、麻痺性イレウス、中毒性巨大結腸があらわれるとの報告がある。

(2)その他の副作用

分類	5%以上	5%未満	頻度不明
循環器		血圧変動	不整脈、顔面潮紅
精神神経系	眠気	眩暈、不安、不穏、意識障害、幻覚、発汗、不眠	興奮、視調節障害
消化器	悪心・嘔吐、便秘	食欲不振、腹部膨満、直腸粘膜の刺激(肛門痛、粘膜びらん等)、口渇	
過敏症(注)		掻痒感	発疹
血液		白血球減少、血小板増多、血小板減少	
肝臓		AST(GOT)、ALT(GPT)、ALPの上昇	
腎臓		尿蛋白	
その他		排尿障害、全身倦怠感	頭蓋内圧の亢進

注:このような症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

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。〔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。〕

6. 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。〔動物実験(マウス、ラット)で胎児奇形(脳脱、軸骨格癒合)が報告されている。〕

(2)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。

(3)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。

(4)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、乳児には、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。〔呼吸抑制の感受性が高い。〕

8. 過量投与

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。

(1)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。

(2)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。なお、麻薬拮抗剤の作用持続時間はモルヒネのそれより短いので、患者のモニタリングを行うか又は患者の反応に応じて、初回投与後は注入速度を調節しながら持続静注する。

(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)投与経路 直腸内投与による外用にのみ使用すること。

(2)投与時期 できるだけ排便後に投与すること。

(3)患者等に対する指導

1)本剤の投与にあたっては、具体的な使用方法、使用時の注意点、保管方法等を十分に説明し、本剤の目的以外への使用あるいは他人への譲渡をしないよう指導するとともに、本剤を子供の手の届かないところに保管するよう指導すること。

2)本剤が不要となった場合には、病院又は薬局へ返却するなどの処置について適切に指導すること。

■薬物動態

1. 血漿中濃度¹²⁾

(癌疼痛患者、1回1個、8時間間隔で1日3回、3日間以上投与)

製剤	投与例数	Tmax(h)	Cmax(ng/mL)	t _{1/2} (h)
10mg	12	1.5±0.3	25.8±2.1	4.18±0.56
20mg	8	1.3±0.4	35.4±5.7	4.47±0.78
30mg	5	1.5±0.6	40.7±7.2	6.0±1.6

平均値±標準誤差

2. 主な代謝産物及び代謝経路

モルヒネは肝臓で3位又は6位の水酸基がグルクロン酸抱合を受け、モルヒネ-3-グルクロニド(活性なし)又はモルヒネ-6-グルクロニド(活性あり)になる。

■臨床成績

単盲検交叉比較試験(対照薬：モルヒネ硫酸塩徐放錠)を含む総計241例についての臨床成績は次のとおりである^{2,4)}。

試験	改善率	
単盲検交叉比較試験	88%(36/41)	
一般試験	10mg/20mg製剤開発時	88%(90/102)
	30mg製剤開発時	85%(83/98)

〔本剤を28日間以上(最長102日間)直腸内投与された36例についての疼痛のコントロール状態³⁾〕

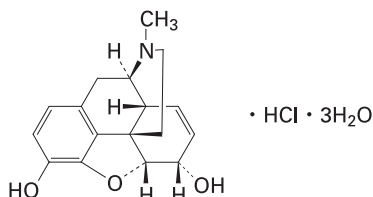
試験	疼痛のコントロール状態	
	良好	ほぼ良好以上
長期投与試験	50%(18/36)	97%(35/36)

■薬効薬理

鎮痛作用について、ラットの tail pressure 法及び酢酸 writhing 法を用いて直腸内投与と経口投与で検討した結果、モルヒネ塩酸塩水和物の直腸内投与は経口投与と比べ同等ないしそれ以上の効力を示した⁹⁾。

試験法	ED ₅₀ (mg/kg)	
	直腸内投与	経口投与
tail pressure 法	約17	34.3
酢酸 writhing 法	0.69	1.23

■有効成分に関する理化学的知見



一般名：モルヒネ塩酸塩水和物 Morphine Hydrochloride Hydrate
化学名：(5*R*, 6*S*)-4, 5-Epoxy-17-methyl-7, 8-didehydromorphinan-3, 6-diol monohydrochloride trihydrate

分子式：C₁₇H₁₉NO₃・HCl・3H₂O

分子量：375.84

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。ギ酸に溶けやすく、水にやや溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、エタノール(95)に溶けにくい。光によって徐々に黄褐色を帯びる。

■包装

アンベック坐剤10mg：50個

アンベック坐剤20mg：50個

アンベック坐剤30mg：30個

■主要文献

- 1)水口公信, ほか：臨床医薬, 6：2639, 1990
- 2)水口公信, ほか：基礎と臨床, 30：2645, 1996
- 3)水口公信, ほか：臨床医薬, 6：2357, 1990
- 4)水口公信, ほか：臨床医薬, 6：2339, 1990
- 5)水口公信, ほか：臨床医薬, 6：2621, 1990
- 6)喜多敦子, ほか：薬学雑誌, 110：349, 1990

**文献請求先、製品に関するお問い合わせ先

住友ファーマ株式会社

〒541-0045 大阪市中央区道修町2-6-8

くすり情報センター

TEL 0120-034-389

■投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は厚生労働省告示第75号(平成24年3月5日付)に基づき、投薬は1回30日分を限度とされています。

**製造販売元
住友ファーマ株式会社
大阪市中央区道修町2-6-8