

オピオイド製剤の適応の違い

オピオイドと言われると、一般的には「麻薬」を思い浮かべますが、トラマドール(当院採用薬:トラマール OD 錠、トラムセット⇐アセトアミノフェンとの合剤)、リン酸コデイン散 1%(劇薬)、ペンタゾシン(当院:ソセゴン注)、ブプレノルフィン(当院:レペタン坐薬)などがあります。今回は、その違いと、適応の違いを特集します。慢性疼痛、癌性疼痛、下痢など適応の違い有り。

各オピオイドのオピオイド受容体タイプに対する結合親和性(結合しやすさ)

オピオイド	μ受容体	δ受容体	κ受容体
モルヒネ	+++		+
フェンタニル	+++		
オキシコドン	+++		
コデイン	+		
トラマドール (トラマール、トラムセット)	+※		
ペンタゾシン (ソセゴン)	++ (P)	+	++
ブプレノルフィン (ノルスバンテープ、レペタン坐)	+++ (P)	++ (P)	+++ (P)

(P) 部分作動薬であることを示す

※トラマドール自体に結合親和性はなく、代謝物が部分作動薬として作用する

(トラマドール)

薬剤:トラムセット配合錠(トラマドール塩酸塩 37.5mg、アセトアミノフェン 325mg) 薬価:69.8円/錠

【効能・効果・用法・用量】非オピオイド鎮痛剤で治療困難な下記疾患における鎮痛

○非がん性慢性疼痛 ○抜歯後の疼痛

1回1錠、1日4回経口(最大、1回2錠)、トラマドールとして、150~300mg/日、アセトアミノフェン 1300mg~2600mg/日。

トラマール OD 錠(25mg)(トラマドール塩酸塩 25mg) 薬価:36.5円/25mg 錠

【効能・効果・用法・用量】非オピオイド鎮痛剤で治療困難な下記疾患における鎮痛 疼痛を伴う各種癌、慢性疼痛

1日100~300mgを4回に分割経口投与

上記薬剤の大きな違いは、トラムセットは、「非がん性」の疼痛であり、トラマール OD 錠は、「がん性」「慢性」の疼痛。トラムセットは、アセトアミノフェン(カロナールと同一)が配合されているのが特徴であり、使いやすい面と、使いにくい面がある。ただし、アセトアミノフェンだけで325mgあるため、錠剤が大きい。トラマドールはモルヒネの1/5~1/10程度の強さと言われている。(用量換算比)



(リン酸コデイン)

投与されたコデインの 10～20%が、モルヒネに代謝され、主な効果を発揮する。

一般的に、モルヒネの 1/6 程度の効果とされている。天井効果あり。【効能・効果・用法・用量】
各種呼吸器疾患における鎮咳・鎮静、疼痛時における鎮痛、激しい下痢症状の改善 1 回
20mg, 1 日 60mg を経口投与(適宜増減)



(ソセゴン)

成分:ペンタゾシン 強さはモルヒネに匹敵するが、麻薬拮抗作用があり、また、天井効果あり(一定以上に投与量を増やしてもそれ以上効かない)【効能・効果・用法・用量】下記疾患並びに状態における鎮痛:各種癌、術後、胃・十二指腸潰瘍、腎・尿路結石(以下略) 1 回 15mg を筋肉内又は皮下に注射(麻酔補助の場合は 1 回 30mg)。当院では、アタラックス P と一緒に、点滴静注で使われる事が多い。(注:急性腹症の第一選択薬は、アセトアミノフェンに変更。アセリオ注)

(ノルspanテープ) 週に 1 回貼り替え、腰痛症などに

成分は以前のレパタン注射薬と同じ、ブプレノルフィン。

【効能・効果・用法・用量】非オピオイド鎮痛剤で治療困難な下記疾患に伴う慢性疼痛における鎮痛:変形性関節症、腰痛症 成人に対し、前胸部、上背部、上腕外部又は側胸部に貼付し、7 日毎に貼り替えて使用する。初回貼付用量はブプレノルフィンとして 5mg とし、その後の貼付用量は患者の症状に応じて適宜増減するが、20mg を超えないこと。



モルヒネ経口 80mg/日以上からの変更は、効果が認められない事がある。現在のところ、モルヒネ等への換算比は、無い。 慢性疼痛に使うには、医師がe-ラーニングを受講する必要がある。

(モルヒネ) ほとんど全ての適応を持つ

内服も注射も、ほとんど全ての効能・効果を持つ。徐放性で無いため、4～6 時間で効果が切れる。がんで無い場合にも使えるので、がん以外の疼痛、鎮咳などが適応になる。

がんは、オキシコンチンやフェントステープが使われることが多い。(モルヒネの活性代謝物による鎮静作用が問題になったためと言われているが、個体差が多い。)



オプソはがんのみ適応。【効能・効果・用法・用量】激しい疼痛時における鎮痛・鎮静、激しい咳嗽発作における鎮咳、激しい下痢症状の改善及び手術後等の腸管蠕動運動の抑制、麻酔前投薬、麻酔の補助、中等度から高度の疼痛を伴う各種癌における鎮痛、通常内服 1 日 10～30mg 程度から開始し、必要な場合には増量する。(天井効果は無いため、上限は無い)

(フェンタニル)フェントステープ 1 日 1 回貼り替え、各種がん、慢性疼痛に

フェンタニル 1mg ≡ モルヒネ(経口)30mg。慢性疼痛に使うには、医師がe-ラーニングを受講する必要がある。【効能・効果・用法・用量】中等度から高度の疼痛を伴う各種癌、中等度から高度の慢性疼痛。成人に対し胸部、腹部、上腕部、大腿部等に貼付し、1 日(約 24 時間)毎に貼り替えて使用する。



(オキシコンチン TR 錠、オキノーム散) 各種がんの疼痛に

成分:オキシコドン。20mg ≡ モルヒネ(経口)30mg相当。

【効能・効果・用法・用量】成人にはオキシコドン塩酸塩(無水物)として 1 日 10～80mg を 4 回に分割経口投与する。(TR 錠は、徐放性製剤なので、1 日 2 回に分割)オキノーム散は、レスキュー投与として使われることが多い。天井効果が無く、モルヒネに代わる薬剤になっている。 **より安全な医療をみんなで行っていきましょう!**

