

貯法：気密容器で室温保存  
 使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること  
 \*規制区分：劇薬

|      |                  |
|------|------------------|
| 承認番号 | 21600AMZ00590000 |
| 薬価収載 | 2005年6月          |
| 販売開始 | 2005年7月          |

非ステロイド性鎮痛・消炎剤

日本薬局方 ザルトプロフェン錠  
 ザルトプロフェン錠80mg「日医工」  
 Zaltoprofen

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- 消化性潰瘍のある患者（ただし、「慎重投与」の項参照）  
[消化性潰瘍を悪化させることがある。]
- 重篤な血液の異常のある患者 [血液の異常をさらに悪化させるおそれがある。]
- 重篤な肝障害のある患者 [肝障害をさらに悪化させるおそれがある。]
- 重篤な腎障害のある患者 [腎障害をさらに悪化させるおそれがある。]
- 重篤な心機能不全のある患者 [心機能不全をさらに悪化させるおそれがある。]
- 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- アスピリン喘息（非ステロイド性消炎鎮痛剤等により誘発される喘息発作）又はその既往歴のある患者 [喘息発作を誘発させるおそれがある。]

- 又は再発させるおそれがある。]
- 肝障害又はその既往歴のある患者 [肝障害を悪化又は再発させるおそれがある。]
  - 腎障害又はその既往歴のある患者 [腎障害を悪化又は再発させるおそれがある。]
  - 心機能障害のある患者 [心機能障害を悪化させるおそれがある。]
  - 過敏症の既往歴のある患者
  - 気管支喘息のある患者 [喘息発作を誘発させるおそれがある。]
  - 潰瘍性大腸炎の患者 [症状を悪化させるおそれがある。]
  - クローン病の患者 [症状を悪化させるおそれがある。]
  - 高齢者（「重要な基本的注意」、「高齢者への投与」の項参照）

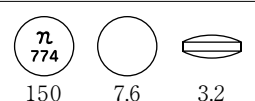
【組成・性状】

1. 組成

ザルトプロフェン錠80mg「日医工」は日本薬局方ザルトプロフェン錠で、1錠中ザルトプロフェン80mgを含有する。添加物として乳糖、トウモロコシデンプン、無水ケイ酸、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク、カルナウバロウを含有する。

2. 製剤の性状

本品は白色のフィルムコーティング錠である。

| 販売名                    | 形状<br>重量(mg) 直径(mm) 厚さ(mm)   | 本体<br>コード | 包装<br>コード |
|------------------------|--|-----------|-----------|
| ザルトプロフェン錠<br>80mg「日医工」 | <br>150 7.6 3.2 | 774       | 774       |

【効能・効果】

\*\* 下記疾患並びに症状の消炎・鎮痛

関節リウマチ、変形性関節症、腰痛症、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群

手術後、外傷後並びに抜歯後の消炎・鎮痛

【用法・用量】

通常、成人にザルトプロフェン1回80mg、1日3回経口投与する。

頓用の場合は、1回80～160mgを経口投与する。

【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）

- 消化性潰瘍の既往歴のある患者 [消化性潰瘍を再発させることがある。]
- 非ステロイド性消炎鎮痛剤の長期投与による消化性潰瘍のある患者で、本剤の長期投与が必要であり、かつミソプロストールによる治療が行われている患者 [ミソプロストールは非ステロイド性消炎鎮痛剤により生じた消化性潰瘍を効能・効果としているが、ミソプロストールによる治療に抵抗性を示す消化性潰瘍もあるので、本剤を継続投与する場合には十分経過を観察し、慎重に投与すること。]
- 血液の異常又はその既往歴のある患者 [血液の異常を悪化

2. 重要な基本的注意

- 消炎鎮痛剤による治療は原因療法ではなく対症療法であることに留意すること。
- 慢性疾患（関節リウマチ、変形性関節症等）に対し本剤を用いる場合には、次の事項を考慮すること。
  - 長期投与する場合には定期的に臨床検査（尿検査、血液検査及び肝機能検査等）を行うこと。また、異常が認められた場合には減量、休薬等の適切な措置を講ずること。
  - 薬物療法以外の療法も考慮すること。
- 急性疾患に対し本剤を用いる場合には、次の事項を考慮すること。
  - 急性炎症、疼痛及び発熱の程度を考慮し、投与すること。
  - 原則として同一の薬剤の長期投与を避けること。
  - 原因療法があればこれを行うこと。
- 患者の状態を十分観察し、副作用の発現に留意すること。
- 感染症を不顕性化するおそれがあるので、感染による炎症に対して用いる場合には適切な抗菌剤を併用し、観察を十分行い慎重に投与すること。
- 他の消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい。
- 高齢者及び小児には副作用の発現に特に注意し、必要最小限の使用にとどめるなど慎重に投与すること。（「高齢者への投与」、「小児等への投与」の項参照）

3. 相互作用

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  |
|------------------------|---------------------------------|--|
| ニューキノロン系抗菌剤<br>エノキサシン等 | 痙攣を誘発することがあるので、用量を調節するなど注意すること。 | ニューキノロン系抗菌剤は中枢神経系の抑制性伝達物質であるγ-アミノ酪酸（GABA）の受容体への結合を阻害することにより痙攣を誘発する。本剤はその阻害作用を増強すると考えられている。 |

| 薬剤名等                     | 臨床症状・措置方法   | 機序・危険因子  |
|--------------------------|---|--|
| クマリン系抗凝固剤<br>ワルファリン等     | 抗凝固作用を増強するおそれがあるので、用量を調節するなど注意すること。                 | 本剤のヒトにおける血漿蛋白結合率 (in vitro) は98%と高く、血漿蛋白結合率の高い薬剤と併用すると、血中の遊離型薬剤の濃度が上昇するためと考えられている。 |
| スルホニル尿素系血糖降下剤<br>トルブタミド等 | 血糖降下作用を増強するおそれがあるので、用量を調節するなど注意すること。                | 本剤のプロスタグランジン生成抑制作用により、水・塩類の排泄を低下させる可能性が考えられている。                                    |
| チアジド系利尿剤<br>ヒドロクロチアジド等   | チアジド系利尿剤の作用を減弱するとの報告がある。                            | 本剤のプロスタグランジン生成抑制作用により、水・塩類の排泄を低下させる可能性が考えられている。                                    |
| リチウム製剤<br>炭酸リチウム         | リチウム製剤の作用を増強するとの報告があるので、リチウム製剤の用量を調節するなど注意すること。     | 本剤の腎におけるプロスタグランジン生成抑制作用により、これらの薬剤の腎排泄が減少し、血中濃度が高くなる可能性が考えられている。                    |
| メトトレキサート                 | メトトレキサートの作用を増強するとの報告があるので、メトトレキサートの用量を調節するなど注意すること。 |  |

#### 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 (頻度不明)

###### 1) ショック、アナフィラキシー様症状

ショック、アナフィラキシー様症状を起こすことがあるので、観察を十分に行い、呼吸困難、血圧低下、冷汗、悪寒、発疹、かゆみ、紅潮、顔面浮腫、蕁麻疹等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

###### 2) 急性腎不全、ネフローゼ症候群

急性腎不全、ネフローゼ症候群等の腎障害があらわれることがあるので、観察を十分に行い、BUN・血中クレアチニンの上昇、乏尿、浮腫、蛋白尿、低蛋白血症等の異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

###### 3) 肝機能障害

黄疸、AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇、 $\gamma$ -GTP上昇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。

###### 4) 消化性潰瘍、小腸・大腸潰瘍、出血性大腸炎

消化性潰瘍及び小腸・大腸潰瘍(出血や穿孔を伴うことがある)、出血性大腸炎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し、適切な処置を行うこと。

###### 5) 無顆粒球症、白血球減少、血小板減少

無顆粒球症、白血球減少、血小板減少があらわれることがあるので、定期的に血液検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

##### (2) 重大な副作用 (類薬の場合)

###### 1) 皮膚粘膜眼症候群、中毒性表皮壊死症

他の非ステロイド性消炎鎮痛剤で、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、中毒性表皮壊死症(Lyell症候群)があらわれることが報告されているので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

###### 2) 溶血性貧血、再生不良性貧血

他の非ステロイド性消炎鎮痛剤で、溶血性貧血、再生不良性貧血があらわれることが報告されているので、血液検査を行うなど観察を十分に行い、異常がみら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。

##### (3) その他の副作用

|                   | 頻度不明  |
|-------------------|---|
| 消化器               | 胃不快感、胃痛、嘔気、心窩部痛、下痢、胃重感、胸やけ、口内炎、悪心、食欲不振、腹痛、嘔吐、便秘、腹部膨満感、舌炎、口渇 |
| 精神神経系             | 眠気、めまい、頭痛、しびれ(感)  |
| 過敏症 <sup>注)</sup> | 光線過敏症、発疹、皮疹、湿疹、掻痒   |
| 血液                | ヘモグロビン減少、ヘマトクリット値低下、赤血球減少、好酸球増加、血小板増加、白血球増加                 |
| 肝臓                | ALT(GPT)上昇、AST(GOT)上昇、Al-P上昇、 $\gamma$ -GTP上昇               |
| 腎臓                | BUN上昇、血中クレアチニン上昇、血尿   |
| その他               | ほてり、頻尿、浮腫、倦怠感、排尿痛、排尿障害、発熱                                   |

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

本剤は血漿蛋白結合率が高く、また、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では、血漿アルブミンが減少していることが多く、腎機能も低下していることがあり、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、消化器症状等患者の状態を観察しながら、投与回数を減らす(例えば1回1錠1日2回)か又は休薬するなど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回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
- 妊娠末期のラットに投与した実験で、胎児の動脈管収縮が報告されている。
- 授乳婦への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けさせること。[動物実験(ラット)で乳汁中に移行することが報告されている。]

##### 7. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。

##### 8. 適用上の注意

**薬剤交付時:** 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報告されている。)

##### 9. その他の注意

非ステロイド性消炎鎮痛剤を長期間投与されている女性において、一時的な不妊が認められたとの報告がある。

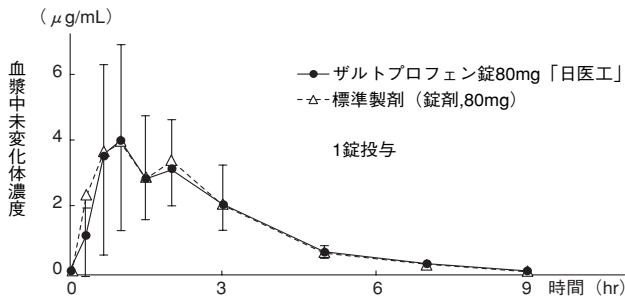
#### 【薬物動態】

##### 1. 生物学的同等性試験

ザルトプロフェン錠80mg「日医工」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(ザルトプロフェンとして80mg)を健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、 $C_{max}$ )について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

|                    | 判定パラメータ   |  | 参考パラメータ           |                   |
|--------------------|---|--|-------------------|-------------------|
|                    | AUC <sub>0-9</sub><br>( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ ) | $C_{max}$<br>( $\mu\text{g}/\text{mL}$ ) | $T_{max}$<br>(hr) | $t_{1/2}$<br>(hr) |
| ザルトプロフェン錠80mg「日医工」 | 12.03±<br>2.67  | 5.75±<br>1.80                            | 1.40±0.80         | 1.90±0.48         |
| 標準製剤<br>(錠剤, 80mg) | 12.56±<br>2.54  | 5.83±<br>2.10                            | 1.53±0.77         | 1.63±0.35         |

(1錠投与, Mean±S.D., n=10)



血漿中濃度並びにAUC, Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

## 2. 溶出挙動

ザルトプロフェン錠80mg「日医工」は、日本薬局方医薬品各条に定められたザルトプロフェン錠の溶出規格に適合することが確認されている。<sup>2)</sup>

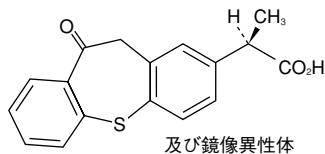
### 【薬効薬理】

ザルトプロフェンはプロピオン酸系の非ステロイド系抗炎症薬(NSAID)であり、シクロオキシゲナーゼ(COX)のうち炎症部位で誘導されるCOX-2を比較的選択的に阻害する。抗炎症作用に加えて鎮痛作用が強く、関節リウマチ、変形性関節症、外傷、手術後、抜歯などの対症療法に用いられる。解熱の適応はない。<sup>3)</sup>

### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ザルトプロフェン (Zaltoprofen)

化学名：(2*RS*)-2-(10-Oxo-10,11-dihydrodibenzo[*b,f*]thiepin-2-yl)propanoic acid



分子式：C<sub>17</sub>H<sub>14</sub>O<sub>3</sub>S

分子量：298.36

性状：白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

アセトンに溶けやすく、メタノール又はエタノール(99.5)にやや溶けやすく、水にほとんど溶けない。

本品は光によって徐々に分解する。

本品のアセトン溶液(1→10)は旋光性を示さない。

融点：135～139℃

### 【取扱い上の注意】

#### 安定性試験

本品につき加速試験(40℃, 相対湿度75%, 6ヵ月)を行った結果、ザルトプロフェン錠80mg「日医工」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。<sup>4)</sup>

### 【包装】

ザルトプロフェン錠80mg「日医工」

100錠(10錠×10; PTP)

500錠(10錠×50; PTP)

500錠(バラ)

1050錠(21錠×50; PTP)

### 【主要文献】

- 1) 日医工株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 日医工株式会社 社内資料：溶出試験
- 3) 第十五改正日本薬局方解説書 C-1515, 廣川書店, 東京(2006)
- 4) 日医工株式会社 社内資料：安定性試験

### 【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

☎ (0120)517-215

Fax (076)442-8948

製造販売元  

**日医工株式会社**  
 富山市総曲輪1丁目6番21