

# 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（2019年更新版）に準拠して作成

非ステロイド性消炎・鎮痛・解熱剤

フルフェナム酸アルミニウム製剤

劇薬 **オピリン錠125mg**劇薬 **オピリン錠250mg****OPYRIN® tablets 125mg / tablets 250mg**

剤形	白色フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	劇薬
規格・含量	オピリン錠125mg：1錠中フルフェナム酸アルミニウム125mg オピリン錠250mg：1錠中フルフェナム酸アルミニウム250mg
一般名	和名：フルフェナム酸アルミニウム（JAN） 洋名：flufenamate aluminum（JAN）
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： オピリン錠125mg：2006年1月30日（販売名変更による） オピリン錠250mg：2006年1月30日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日： オピリン錠125mg：2006年6月9日（販売名変更による） オピリン錠250mg：2006年6月9日（販売名変更による） 販売開始年月日： オピリン錠125mg：1967年8月1日 オピリン錠250mg：1984年6月4日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売：大正製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	大正製薬株式会社 メディカルインフォメーションセンター TEL：0120-591-818 9:00～17:30（土・日・祝日、当社休日除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://medical.taisho.co.jp/">https://medical.taisho.co.jp/</a>

本IFは2022年8月改訂の電子化された添付文書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—

(2020年4月改訂)

### 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）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）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目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）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）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009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。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、「IF記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

### 2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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に記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、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「V. 5. 臨床成績」や「X II. 参考資料」、「X III. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、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。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、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の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

# 目次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	7. 調製法及び溶解後の安定性	6
1. 開発の経緯	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	6
2. 製品の治療学的特性	1	9. 溶出性	6
3. 製品の製剤学的特性	1	10. 容器・包装	6
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	(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	6
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(2) 包装	6
(1) 承認条件	1	(3) 予備容量	6
(2) 流通・使用上の制限事項	1	(4) 容器の材質	7
6. RMPの概要	1	11. 別途提供される資材類	7
		12. その他	7
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>8</b>
1. 販売名	2	1. 効能又は効果	8
(1) 和名	2	2. 効能又は効果に関連する注意	8
(2) 洋名	2	3. 用法及び用量	8
(3) 名称の由来	2	(1) 用法及び用量の解説	8
2. 一般名	2	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠	8
(1) 和名（命名法）	2	4. 用法及び用量に関連する注意	8
(2) 洋名（命名法）	2	5. 臨床成績	9
(3) ステム（stem）	2	(1) 臨床データパッケージ	9
3. 構造式又は示性式	2	(2) 臨床薬理試験	9
4. 分子式及び分子量	2	(3) 用量反応探索試験	9
5. 化学名（命名法）又は本質	2	(4) 検証的試験	9
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	(5) 患者・病態別試験	12
		(6) 治療的使用	12
		(7) その他	13
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>3</b>	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>14</b>
1. 物理化学的性質	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	14
(1) 外観・性状	3	2. 薬理作用	14
(2) 溶解性	3	(1) 作用部位・作用機序	14
(3) 吸湿性	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	14
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点	3	(3) 作用発現時間・持続時間	14
(5) 酸塩基解離定数	3		
(6) 分配係数	3	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>15</b>
(7) その他の主な示性値	3	1. 血中濃度の推移	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(1) 治療上有効な血中濃度	15
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	(2) 臨床試験で確認された血中濃度	15
		(3) 中毒域	15
		(4) 食事・併用薬の影響	15
		2. 薬物速度論的パラメータ	15
		(1) 解析方法	15
		(2) 吸収速度定数	15
		(3) 消失速度定数	15
		(4) クリアランス	16
		(5) 分布容積	16
		(6) その他	16
		3. 母集団（ポピュレーション）解析	16
		(1) 解析方法	16
		(2) パラメータ変動要因	16
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>4</b>		
1. 剤形	4		
(1) 剤形の区別	4		
(2) 製剤の外観及び性状	4		
(3) 識別コード	4		
(4) 製剤の物性	4		
(5) その他	4		
2. 製剤の組成	4		
(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤	4		
(2) 電解質等の濃度	5		
(3) 熱量	5		
3. 添付溶解液の組成及び容量	5		
4. 力価	5		
5. 混入する可能性のある夾雑物	5		
6. 製剤の各種条件下における安定性	5		

# 目次

4. 吸収 .....	16	11. 適用上の注意 .....	25
5. 分布 .....	16	12. その他の注意 .....	25
(1) 血液－脳関門通過性 .....	16	(1) 臨床使用に基づく情報 .....	25
(2) 血液－胎盤関門通過性 .....	16	(2) 非臨床試験に基づく情報 .....	25
(3) 乳汁への移行性 .....	16		
(4) 髄液への移行性 .....	17		
(5) その他の組織への移行性 .....	17		
(6) 血漿蛋白結合率 .....	17		
6. 代謝 .....	17	<b>Ⅷ. 非臨床試験に関する項目 .....</b>	<b>26</b>
(1) 代謝部位及び代謝経路 .....	17	1. 薬理試験 .....	26
(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、		(1) 薬効薬理試験 .....	26
寄与率 .....	17	(2) 安全性薬理試験 .....	26
(3) 初回通過効果の有無及びその割合 .....	17	(3) その他の薬理試験 .....	26
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、		2. 毒性試験 .....	26
存在比率 .....	18	(1) 単回投与毒性試験 .....	26
7. 排泄 .....	18	(2) 反復投与毒性試験 .....	26
8. トランスポーターに関する情報 .....	18	(3) 遺伝毒性試験 .....	26
9. 透析等による除去率 .....	18	(4) がん原性試験 .....	27
10. 特定の背景を有する患者 .....	18	(5) 生殖発生毒性試験 .....	27
11. その他 .....	18	(6) 局所刺激性試験 .....	27
		(7) その他の特殊毒性 .....	27
		<b>Ⅸ. 管理的事項に関する項目 .....</b>	<b>28</b>
		1. 規制区分 .....	28
		2. 有効期間 .....	28
		3. 包装状態での貯法 .....	28
		4. 取扱い上の注意 .....	28
		5. 患者向け資材 .....	28
		6. 同一成分・同効薬 .....	28
		7. 国際誕生日 .....	28
		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 .....	28
		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 .....	29
		10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及び	
		その内容 .....	29
		11. 再審査期間 .....	30
		12. 投薬期間制限に関する情報 .....	30
		13. 各種コード .....	30
		14. 保険給付上の注意 .....	30
		<b>ⅩⅠ. 文献 .....</b>	<b>31</b>
		1. 引用文献 .....	31
		2. その他の参考文献 .....	31
		<b>ⅩⅡ. 参考資料 .....</b>	<b>32</b>
		1. 主な外国での発売状況 .....	32
		2. 海外における臨床支援情報 .....	32
<b>Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	<b>19</b>		
1. 警告内容とその理由 .....	19		
2. 禁忌内容とその理由 .....	19		
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 .....	19		
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 .....	19		
5. 重要な基本的注意とその理由 .....	19		
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 .....	20		
(1) 合併症・既往歴等のある患者 .....	20		
(2) 腎機能障害患者 .....	20		
(3) 肝機能障害患者 .....	21		
(4) 生殖能を有する者 .....	21		
(5) 妊婦 .....	21		
(6) 授乳婦 .....	22		
(7) 小児等 .....	22		
(8) 高齢者 .....	22		
7. 相互作用 .....	22		
(1) 併用禁忌とその理由 .....	22		
(2) 併用注意とその理由 .....	22		
8. 副作用 .....	23		
(1) 重大な副作用と初期症状 .....	23		
(2) その他の副作用 .....	23		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	25		
10. 過量投与 .....	25		

# 目 次

---

<b>XIII. 備考</b> .....	<b>33</b>
1. 調剤・服薬支援に際して 臨床判断を行うにあたっての参考情報 .....	33
(1) 粉碎 .....	33
(2) 崩壊・懸濁性及び 経管投与チューブの通過性 .....	34
2. その他の関連資料 .....	34

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

ステロイド性抗炎症剤の常用による副作用が注目されるようになり、これに替わる非ステロイド性抗炎症剤の研究開発が進められ実際に臨床に供されるようになった。

大正製薬株式会社における各種非ステロイド性抗炎症剤のスクリーニング結果において、*N*-フェニルアントラニル酸誘導体に強い抗炎症活性を有する化合物が存在することに着目し、この中からフルフェナム酸をとりあげた。さらに、オパイリンは従来の非ステロイド性抗炎症剤に一般的にみられる消化管に対する副作用を考慮し、これを可及的に軽減する目的でフルフェナム酸のアルミニウム塩として開発した。オパイリン錠は1967年7月、オパイリン250は1983年10月に承認を得た。1994年に再審査結果が公表された（「X-10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容」の項参照）。2006年1月に、厚生省医薬安全局長通知第935号「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成12年9月19日付）に基づき、販売名をオパイリン錠125mg、オパイリン錠250mgと名称変更した。

## 2. 製品の治療学的特性

- 1) オパイリンの効能又は効果は17に及び、その適応領域は整形外科、皮膚科、泌尿器科、内科及び歯科領域にわたる。（「V-1. 効能又は効果」の項参照）
- 2) オパイリンは消化管内でフルフェナム酸とアルミニウムに分解後、フルフェナム酸として吸収され、炎症組織に高濃度に移行する。（「VII-4. 吸収」、「VII-5. (5) その他の組織への移行性」の項参照）
- 3) 胃障害作用はフルフェナム酸に比べ弱かった（ラット）。（「IX-2. (7) その他の特殊毒性」の項参照）

## 3. 製品の製剤学的特性

- 1) PTPシートは、製品名・含量の識別性を高める目的で、ピッチコントロール（1錠ごとの定位置表示）を行っている。
- 2) PTPシートの印字には、見やすく誤認しにくい「ユニバーサルデザインフォント」を採用している。

## 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
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

オピリン錠125mg

オピリン錠250mg

#### (2) 洋名

OPYRIN tablets 125mg

OPYRIN tablets 250mg

#### (3) 名称の由来

ピリン系ではないというところから、OPYRIN（ゼロピリン）をオピリンとした。

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

フルフェナム酸アルミニウム（JAN）

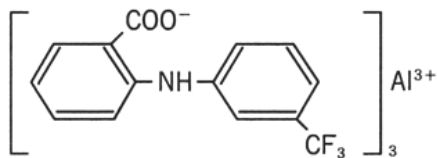
#### (2) 洋名（命名法）

flufenamate aluminum（JAN）

#### (3) ステム（stem）

抗炎症剤、アントラニル酸誘導体：-fenamic acid（-fenamate）

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>42</sub>H<sub>27</sub>AlF<sub>9</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量：867.65

### 5. 化学名（命名法）又は本質

aluminium 2-[[3-(trifluoromethyl)phenyl]-amino] benzoate

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

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

わずかに緑色を帯びた淡黄色の粉末で、においはなく、味はわずかに苦い。

##### (2) 溶解性

アセトンに極めて溶けやすく、エタノール（99.5）又はクロロホルムに溶けやすく、エタノール（95）に極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。

##### (3) 吸湿性

通常の保存状態では吸湿性は認められない。

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：120°C付近より褐変しはじめ250°Cまで昇温しても融解しない。

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

溶媒系	ベンゼン-水		クロロホルム-水	
	3	9	3	9
水のpH				
分配係数	175	0.242	∞	1.277

##### (7) その他の主な示性値

紫外線吸収スペクトル

$\lambda_{\text{EtOH}}=287\sim 291\text{ nm}$

$\lambda_{\text{EtOH}}=343\sim 350\text{ nm}$

それぞれの極大波長における吸光度を $A_1$ 及び $A_2$ とすると $A_2/A_1$ は0.45～0.55

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

保存条件	保存形態	保存期間	結果
室温		3年	規格内
40°C		6ヵ月	規格内
50°C		3ヵ月	規格内
40°C・80%RH		3ヵ月	規格内
室内散乱光	マイクロシャーレ	3ヵ月	規格内
直射日光		8時間	規格内
キセノン光		8時間	外観上やや色調の変化を認めたが、定量値の低下は認められない。

測定項目：外観、赤外線吸収スペクトル、紫外線吸収スペクトル、ペーパークロマトグラフィー

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

日本薬局方外医薬品規格「フルフェナム酸アルミニウム」の確認試験による。

定量法

日本薬局方外医薬品規格「フルフェナム酸アルミニウム」の定量試験による。

## 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

販売名	剤形	外形・サイズ等		
		上面	下面	側面
オパイリン錠 125mg	白色 フィルム コーティング錠			
		直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
		約9	約4.3	約250
オパイリン錠 250mg	白色 フィルム コーティング錠			
		直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
		約10	約5.0	約375

#### (3) 識別コード

販売名	表示部位	識別コード
オパイリン錠125mg	本体及びPTP包装	T135
オパイリン錠250mg	本体及びPTP包装	T137

#### (4) 製剤の物性

日本薬局方一般試験法、製剤試験法、製剤均一性試験法・含量均一性試験法により試験を行うとき、これに適合する。

#### (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

販売名	オパイリン錠125mg	オパイリン錠250mg
有効成分	1錠中 フルフェナム酸アルミニウム 125mg	1錠中 フルフェナム酸アルミニウム 250mg
添加剤	結晶セルロース、ヒドロキシプロピルスターチ、ポリソルベート80、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、硬化油、ヒプロメロース、酸化チタン、カルナウバロウ、パラフィン、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、ショ糖脂肪酸エステル、軽質無水ケイ酸	低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、結晶セルロース、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、カルメロースカルシウム、ポリソルベート80、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、硬化油、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、ヒプロメロース、酸化チタン、カルナウバロウ、パラフィン、ショ糖脂肪酸エステル、軽質無水ケイ酸

## IV. 製剤に関する項目

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当資料なし

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

オパイリン錠125mg

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	室温	PTP	1ヵ月	崩壊時間の短縮
			6ヵ月	規格内
		PTP+ピロー包装+紙器	5年	規格内
加温保存試験	40°C、50°C	PTP	6ヵ月	規格内
加温・加湿保存試験	40°C・75%RH	PTP	1ヵ月	崩壊時間の短縮
			6ヵ月	規格内
		缶包装	3ヵ月	規格内
光照射保存試験	室内散乱光	PTP	1年	規格内
	直射日光		4週間	
	キセノン光		8時間	

測定項目：外観、確認試験、崩壊試験、定量試験

オパイリン錠250mg

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	室温	PTP	6ヵ月	規格内
		缶包装		
		PTP+ピロー包装+紙器	5年	
加温・加湿保存試験	40°C・75%RH	PTP	6ヵ月	規格内
		缶包装		

測定項目：外観、確認試験、崩壊試験、定量試験

## IV. 製剤に関する項目

### PTPシートから外した状態での安定性試験結果 オピリン錠125mg

試験項目 保存条件	性状	含量	硬度	崩壊性
温度 (40°C、3ヵ月)	規格内	規格内	規格内	規格内
湿度 (25°C、75%RH、3ヵ月)	規格内	規格内	規格内	規格内
光 (蛍光灯1000Lux、50日)	規格内	規格内	規格内	規格内

測定項目：性状、含量、崩壊性、硬度

### オピリン錠250mg

試験項目 保存条件	性状	含量	硬度	崩壊性
温度 (40°C、3ヵ月)	規格内	規格内	規格内	規格内
湿度 (25°C、75%RH、3ヵ月)	規格内	規格内	規格内	規格内
光 (蛍光灯1000Lux、50日)	規格内	規格内	規格内	規格内

測定項目：性状、含量、崩壊性、硬度

### 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（物理化学的变化）

該当資料なし

### 9. 溶出性

日本薬局方一般試験法、製剤試験法、溶出試験法により試験を行うとき、これに適合する。

### 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

〈オピリン錠 125mg〉

PTP 100錠 [10錠×10]

〈オピリン錠 250mg〉

PTP 100錠 [10錠×10]

#### (3) 予備容量

該当しない

## IV. 製剤に関する項目

---

(4) 容器の材質

PTP：アルミニウム、ポリプロピレン (PP)

透明ピロー：オパイリン錠125mg ポリエチレン (PE)、ポリプロピレン (PP)

オパイリン錠250mg ポリプロピレン (PP)

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### 4. 効能又は効果

○下記疾患の消炎、鎮痛、解熱

関節リウマチ、変形性関節症、変形性脊椎症、腰痛症、肩胛関節周囲炎、関節炎、症候性神経痛

○下記疾患の消炎、鎮痛

抜歯後、歯髄炎、歯根膜炎

○下記炎症性疾患の消炎

膀胱炎、前立腺炎、帯状疱疹、湿疹・皮膚炎、紅斑症、各科領域の手術後ならびに外傷後の炎症性反応

○下記疾患の解熱・鎮痛

急性上気道炎（急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む）

### 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

#### 6. 用法及び用量

効能・効果	用法・用量
関節リウマチ、変形性関節症、変形性脊椎症、腰痛症、肩胛関節周囲炎、関節炎、症候性神経痛の消炎、鎮痛、解熱	通常、成人にはフルフェナム酸アルミニウムとして1回125～250mgを1日3回経口投与する。また、頓用する場合には、1回フルフェナム酸アルミニウムとして、250mgとする。なお、年齢、症状により適宜増減する。
抜歯後、歯髄炎、歯根膜炎の消炎、鎮痛	
膀胱炎、前立腺炎、帯状疱疹、湿疹・皮膚炎、紅斑症、各科領域の手術後ならびに外傷後の炎症性反応の消炎	
急性上気道炎（急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む）の解熱・鎮痛	通常、成人にはフルフェナム酸アルミニウムとして、1回250mgを頓用する。なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、原則として1日2回までとし、1日最大750mgを限度とすること。また、空腹時の投与は避けさせることが望ましい。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

##### 急性上気道炎

「急性上気道炎」は自然治癒傾向の強い疾患であり、安全対策上の見地から、非ステロイド性消炎鎮痛剤の投与は必要最小限とすることとされたため、用法が頓用とされ、「急性上気道炎」に対しては、1日2回で十分と考えられるので、1日2回とされた。

### 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

他の消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい。

## V. 治療に関する項目

### 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

###### ① 本剤750mgとイブプロフェン600mgとの比較<sup>1)</sup> (二重盲検試験)

対 象：股、膝、肘、手関節の関節炎（関節リウマチ、感染性関節炎は除く）患者、評価対象127例（本剤62例、イブプロフェン65例）

主な除外基準：15歳未満の小児。妊娠中、授乳中及び試験中に妊娠の可能性のある婦人。消化器潰瘍又はその既往歴のある患者。

投与方法：本剤1日750mg分3、イブプロフェン1日600mg分3

投与期間：2週間

評価項目：自発痛、圧痛、運動痛、運動制限、腫脹、局所熱感、関節液貯留

解析方法：1週後評価例（123例）、2週後評価例（108例）及び1、2週後継続評価例（104例）に分類して効果を検討し、検定法はWilcoxonの順位和検定及び $\chi^2$ 検定法を用いた。

結 果：投与1週後評価例では、本剤群はイブプロフェン群に比し、医師による全般改善度で改善度が有意に高く（ $p < 0.05$ 、Wilcoxonの順位和検定）、患者の印象においても改善傾向を示した（ $p < 0.10$ 、Wilcoxonの順位和検定）。症状別改善度について、改善とその他（不変・悪化）に分けた結果、自発痛、運動痛及び運動制限の3症状で本剤群はイブプロフェン群に比し改善度が有意に高かった（ $p < 0.05$ 、 $\chi^2$ 検定）。投与2週間後では医師による全般改善度、患者の印象及び症状別改善度いずれにおいても両群間に有意差はなかった。

副作用は130例中9例（本剤群4.8%（3/63例）、イブプロフェン群9.0%（6/67例））に発現し、本剤群の内訳は胃痛・嘔吐、胃重感、嘔気各1例であった。

###### ② 本剤750mgと塩酸チノリジン300mgとの比較<sup>2)</sup> (二重盲検試験)

対 象：退行変性疾患（変形性頸椎症、肩関節周囲炎、変形性腰椎症・腰痛症、変形性股関節症、変形性膝関節症・膝内障）患者、評価対象90例（本剤47例、塩酸チノリジン43例）

主な除外基準：鎮痛剤、筋弛緩剤、末梢循環改善剤、トランキライザー、ビタミン剤及び他の抗炎症剤など評価に影響を及ぼす薬剤の併用が必要な患者

投与方法：本剤1日750mg分3、塩酸チノリジン1日300mg分3

投与期間：1週間もしくは2週間

評価項目：頸、肩、腰、股、膝の疾患部位毎の臨床評価（運動性、疼痛、筋緊張、知覚異常、ADL、歩行など）

解析方法：医師の概括判定及び患者の満足度、症状の変化を主眼とした10項目の合計改善度及び症状群別平均改善度の4項目を症例ごとの最終評価と、投与1週後及び2週後の評価（各週評価）について、検定を行った。

結 果：最終評価（投与1週間後もしくは2週間後）において、医師の概括判定、患者の満足度、合計改善度及び症状群別平均改善度では、両群に有意差はなかった。投与1週後の疼痛、投与1週後及び2週後のADLの改善において、本剤群は塩酸チノリジン群と比較し有意に高い改善率を示した（ $p < 0.05$ ）。

副作用は、本剤群12.5%（6/48例）、塩酸チノリジン群21.3%（10/47例）に発現し、本剤群の内訳は、胃腸障害4例及び発疹2例であった。

## V. 治療に関する項目

- ③ 本剤750mgとフルフェナム酸729.6mg（等モル量）との比較<sup>3)</sup>（二重盲検試験）
- 対 象：頸肩腕症候群、腰痛・坐骨神経痛、関節痛、外傷、術後などの整形外科領域の疼痛性患者、評価対象102例（本剤52例、フルフェナム酸50例）
- 主な除外基準：筋弛緩剤、末梢循環改善剤、トランキライザー、ビタミン剤、他の鎮痛剤及び抗炎症剤など評価に影響を及ぼす薬剤の併用が必要な患者
- 投与方法：本剤1日750mg分3、フルフェナム酸1日729.6mg（等モル量）分3
- 投与期間：1週間
- 評価項目：頸肩腕症候群（疼痛、上肢tension test、腱反射、握力）、腰痛・坐骨神経痛（疼痛、下肢tension test、腱反射、指床間距離、運動制限）、関節痛（疼痛、炎症、関節腫脹、運動制限）、外傷・術後（疼痛、炎症、運動制限）
- 解析方法：安静時痛、運動痛、圧痛について、投与前に少なくとも1項目以上疼痛があった症例の合計評点と、投与後の合計評点との差を改善点数とし、その平均値を両群間で比較した。総合評価（著明改善、改善、やや改善、不変、悪化）は両群間でWilcoxonの順位和検定を行った。
- 結 果：総合評価でやや改善以上を有効と判定した場合の有効率は、本剤群で84.6%、フルフェナム酸投与群で78.0%で、両群に有意な差は認められなかった。安静時痛、運動痛、圧痛の改善度の合計でも両群に有意差はなかった。
- 副作用は、本剤群52例中3例に胃腸障害が認められたが、いずれも程度が弱く、継続投与できた。
- ④ 本剤750mgとプラセボ群との比較<sup>4)</sup>（二重盲検試験）
- 対 象：原則として腰痛を主訴とする患者、場合により関節症、神経痛疼痛、頸肩腕症候群患者も組み入れた。評価対象93例（本剤47例、プラセボ46例）
- 主な除外基準：鎮痛剤、筋弛緩剤、トランキライザー、ビタミン剤、他の抗炎症剤など評価に影響を及ぼす薬剤の併用が必要な患者
- 投与方法：本剤1日750mg分3
- 投与期間：1週間
- 評価項目：疼痛（自発痛、運動痛、圧痛）、炎症（腫脹、発赤、熱感）、運動制限、その他（指床間距離、腱反射、側弯、知覚障害、握力など）
- 解析方法：医師の概括判定の改善以上を有効として本剤群とプラセボ群をフィッシャーの直接確率計算で比較した。評価項目のうち、自発痛、運動痛、圧痛及び運動制限について検定した。
- 結 果：医師の概括判定での有効率は本剤で46.8%、プラセボ群32.6%であった。運動制限の評価項目において本剤投与により有意な改善がみられた（ $p < 0.05$ ）。副作用は、本剤群8.5%（4/47例）、プラセボ群4.3%（2/46例）に発現した。本剤群にみられた副作用はすべて胃腸障害で、程度は軽度であった。
- ⑤ 本剤750mgとアスピリン1500mgとの比較<sup>5)</sup>（二重盲検試験）
- 対 象：後頭神経痛、上腕神経痛、肋間神経痛、坐骨神経痛などの症候性神経痛を主訴とする患者、評価対象104例（本剤52例、アスピリン52例）
- 主な除外基準：13歳以下の小児及び80歳以上の老人。妊娠中、授乳中及び試験中に妊娠の可能性のある婦人。消化器潰瘍又はその既往歴のある患者。
- 投与方法：本剤1日750mg分3、アスピリン1日1500mg分3
- 投与期間：2週間
- 評価項目：自発痛、圧痛、運動痛、運動制限、しびれ感、知覚障害、ラセグー徴候（右/左）
- 解析方法：両群間の全般改善度及び症状別効果の比較は症例ごとの最終評価日における評価（最終評価）で行い、さらに1週後に評価された症例ならびに2週後に評価された症例（週別評価）の比較検討を行なった。検定法はWilcoxonの順位和検定法及び $\chi^2$ 検定法を用いた。
- 結 果：最終評価での医師の全般改善度に対する概括判定結果は、本剤群51.9%、アスピリン群42.3%で、両薬剤間に有意差は認められなかった。また、自発痛、圧痛、運動痛、運動制限、しびれ感、知覚障害、ラセグー徴候の7項目について、症状別の改善度を検討した結果、いずれの症状においても両群に有意差はなかった。副作用は、本剤群9.6%（5/52例）、アスピリン群25.0%（13/52例）に発現した。本剤群にみられた副作用は胃腸障害4例、顔面浮腫1例であった。



## V. 治療に関する項目

- ⑥ 本剤250mgと塩酸チノリジン100mgとの比較<sup>6)</sup> (二重盲検試験)  
対 象: 抜歯後疼痛患者、評価対象142例 (本剤72例、塩酸チノリジン70例)  
主な除外基準: 妊婦、内科的に著変がある者ならびに薬剤アレルギーのある者  
投与方法: 本剤250mg分1、塩酸チノリジン100mg分1  
投与期間: 1回  
評価項目: 服用後鎮痛効果の発現時間、鎮痛効果、疼痛の再発  
解析方法:  $\chi^2$ 検定ならびにWilcoxon順位和検定により本剤群と塩酸チノリジン群の効果差を判定した。  
結 果: 医師の判断による概括評価において、本剤が有意に高い改善率を示した ( $p < 0.001$ )。また、服用時疼痛の程度による効果差は、激しい痛み、中等度の痛みで本剤群の優位性が証明されたが ( $p < 0.05$ )、軽度の痛みでは両群間に有意差が認められなかった。  
副作用は本剤群の8例 (頭重・頭痛4例、咽頭痛1例、悪心1例、肩こり・腰痛1例、出血・断続的鈍痛1例) に認められたが、いずれも軽度であった。
- ⑦ 本剤750mgと塩酸チノリジン300mgとの比較<sup>7)</sup> (二重盲検試験)  
対 象: 単純性歯髄炎及び単純性歯根膜炎患者、評価対象72例 (本剤36例、塩酸チノリジン36例)  
主な除外基準: 内科的に著変のある患者、妊娠中の患者及び薬剤アレルギーのある患者  
投与方法: 本剤1日750mg分3、塩酸チノリジン1日300mg分3  
投与期間: 5日間  
評価項目: 打診痛、温痛、冷痛、自覚的違和感  
解析方法:  $\chi^2$ 検定及びWilcoxon順位和検定により両薬剤群の有効率を比較した。  
結 果: 薬剤別の概括効果は、本剤群で有効率が75%、塩酸チノリジン群で69.5%であり、有効性では両群に有意差はなかった。  
副作用は、本剤群の3例に4件、塩酸チノリジン群の4例に5件認められた。本剤群にみられた副作用は嘔気1件、「便が硬くなった」1件、下痢2件であった。
- ⑧ 本剤750mgとイブプロフェン600mgとの比較<sup>8)</sup> (二重盲検試験)  
対 象: 急性上気道炎 (かぜ症候群、急性咽・喉頭炎、急性扁桃炎) 患者、評価対象183例 (本剤91例、イブプロフェン92例)  
主な除外基準: 年齢15歳未満及び75歳以上のもの。受診前に消炎・鎮痛・解熱剤 (抗炎症剤) を服用していたもの。発熱が39°C以上のもの。消化管出血、消化性潰瘍の合併又はその既往の明らかなもの。妊娠・授乳婦及び妊娠している可能性のあるもの。  
投与方法: 本剤1日750mg分3、イブプロフェン1日600mg分3  
投与期間: 4日間  
評価項目: 疼痛症状 (咽・喉頭痛、頭痛、嚥下痛、関節痛、腰痛、筋肉痛)、局所炎症症状 (咽頭発赤、咽頭腫脹、扁桃発赤、扁桃腫脹)、全身・気道症状 (全身倦怠感、悪寒、熱感、くしゃみ、鼻汁、鼻閉、嘔声、咳、痰)  
解析方法: 順位尺度データについてはWilcoxonの順位和検定を、その他のデータについては $\chi^2$ 検定又はFischerの直接確率計算法を用いた。これらの検定はすべて両側検定とし、危険率5%を有意水準とした。  
結 果: 最終全般改善度 (中等度改善以上) は、本剤群67.0% (61/91)、イブプロフェン群56.3% (52/92) で有意差はないが本剤の方が高かった。症状別改善度では、本剤は2日後評価で咽頭発赤、痰においてイブプロフェンより有意に高く ( $p < 0.05$ )、4日後評価では嚥下痛、痰においてイブプロフェンより有意に高かった ( $p < 0.05$ )。  
副作用は、本剤群で98例中2例 (2%) に悪心が、イブプロフェン群では97例中1例 (1.0%) に浮遊感が認められたが、いずれも軽度かつ一過性であった。

## V. 治療に関する項目

---

- ⑨ 本剤750～1125mg、塩酸ベンジダミン150～225mgとプラセボ群の比較<sup>9)</sup>（二重盲検試験）  
対 象：かぜ症候群患者、評価対象118例（本剤40例、塩酸ベンジダミン39例、プラセボ39例）  
投与方法：本剤1日750～1125mg分3、塩酸ベンジダミン1日150～225mg分3  
投与期間：3日間  
評価項目：鼻汁、鼻閉、咽頭痛、咳、痰、頭痛、発熱、悪寒、倦怠感  
解析方法：著効、有効、やや有効、無効を、それぞれ3、2、1、0という離散的な数に置き換え、平均値を出し、その二群の平均値の差の有意差を検定した。  
結 果：咽頭痛に対し、プラセボと比べ本剤は有意な改善効果を示した（ $p < 0.02$ ）。

注）本剤の上記疾患の消炎、鎮痛、解熱に対して承認されている用法及び用量は「V-3. 用法及び用量」の項参照。

### 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

「新医薬品等の再審査の申請のために行う使用の成績等に関する調査の実施方法に関するガイドラインについて」（平成5年6月28日 薬安第54号）、「医療用医薬品の使用成績調査等の実施方法に関するガイドラインについて」（平成9年3月27日 薬安第34号）、GPSP省令に基づく調査・試験を実施していない。

#### 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

該当しない

## V. 治療に関する項目

### (7) その他

承認・効能追加時及び再評価終了時までの二重盲検比較試験を含む国内臨床試験の成績を疾患ごとに合算した有効率は以下のとおりである<sup>2~4), 8), 10)</sup>。

疾患名	有効率 (%) 【有効以上】
関節リウマチ	58.9 ( 346 / 587 )
変形性関節症	59.1 ( 143 / 242 )
変形性脊椎症	49.4 ( 133 / 269 )
腰痛症	60.3 ( 316 / 524 )
肩胛関節周囲炎	64.2 ( 120 / 187 )
関節炎	69.7 ( 202 / 290 )
症候性神経痛	62.0 ( 127 / 205 )
抜歯後疼痛及び炎症	82.8 ( 1451 / 1752 )
歯髄炎	83.1 ( 630 / 758 )
歯根膜炎	79.5 ( 778 / 979 )
膀胱炎	75.0 ( 84 / 112 )
前立腺炎	81.1 ( 43 / 53 )
帯状疱疹	84.6 ( 335 / 396 )
湿疹・皮膚炎	79.6 ( 284 / 357 )
紅斑症	84.6 ( 225 / 266 )
各科領域の手術後ならびに外傷後の炎症性反応	72.6 ( 291 / 401 )
急性上気道炎	70.1 ( 190 / 271 )

承認用量と異なる症例を含む。

## VI. 薬効薬理に関する項目

---

### 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

メフェナム酸

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子化された添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

非ステロイド性抗炎症剤に共通するプロスタグランジン生合成阻害作用が考えられる<sup>11)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 抗炎症作用

モルモット紫外線紅斑に対して、フルフェナム酸アルミニウム（5及び15mg/kg 経口投与、各群n=6）はフェニルブタゾンより強い抑制作用を示し、ラットカラゲニン浮腫抑制に対して、フルフェナム酸アルミニウム（6.25、12.5及び25mg/kg経口投与、各群n=10）はフェニルブタゾン、アスピリンより強い抑制作用を示した<sup>12)</sup>。

また、ラットクロトン油肉芽嚢への滲出液貯留、綿球肉芽腫増殖及びアジュバント関節炎に対しても抑制作用が認められた<sup>12)、13)</sup>。

ラット実験的歯髄炎に対する抗炎症作用はインドメタシンより強く、フェニルブタゾンと同等であった<sup>14)</sup>。

##### 2) 鎮痛作用

マウス酢酸Writhing法において、フルフェナム酸アルミニウム（100、200及び400mg/kg経口投与、各群n=14～15）の鎮痛作用は、アミノピリン及びメフェナム酸には及ばなかったが、フェニルブタゾン及びアスピリンより強いものであった<sup>15)</sup>。

ラットRandall-Selitto法における薬物後投与試験ではフルフェナム酸アルミニウム（50、100及び200mg/kg経口投与、各群n=8～10）の鎮痛作用はアミノピリン、フェニルブタゾン、アスピリン及びメフェナム酸より弱い、薬物前投与試験ではフルフェナム酸アルミニウム（200mg/kg経口投与、各群n=7）はフェニルブタゾン及びアミノピリンに次いで、メフェナム酸及びアスピリンより強い作用を示した<sup>15)</sup>。

マウス熱板法において、フルフェナム酸アルミニウム（250及び500mg/kg経口投与、各群n=11～15）は鎮痛効果を示した<sup>15)</sup>。

また、ラットアジュバント関節炎及びイヌ尿酸関節炎による炎症性疼痛に対しても抑制作用が認められた<sup>16)、17)</sup>。

##### 3) 解熱効果

ウサギにおいて、正常体温には影響しないが、TTG（発熱物質）による異常体温には解熱作用を示した<sup>18)</sup>。

#### (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

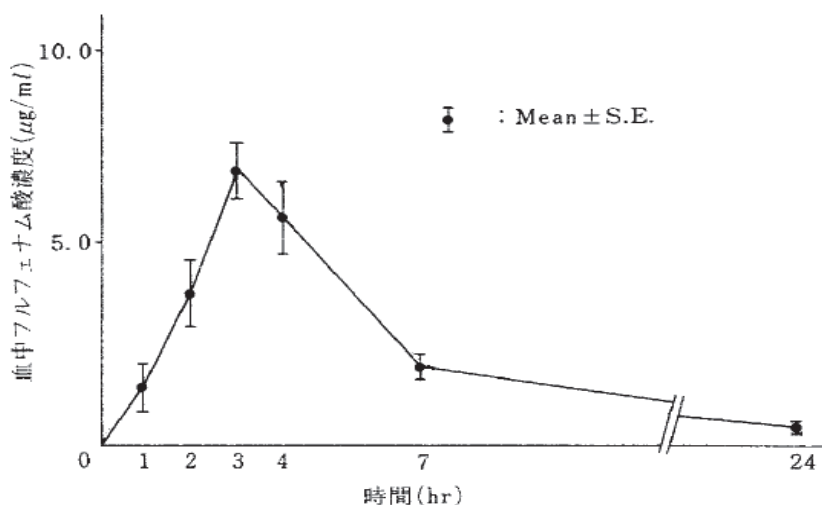
#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>19)</sup>

健康成人男性に250mgを食後単回経口投与した場合、フルフェナム酸の薬物動態パラメータは以下のとおりであった。

フルフェナム酸アルミニウム経口投与後の血中フルフェナム酸濃度推移



フルフェナム酸アルミニウム経口投与後の薬物動態パラメータ (健康成人男性)

	Cmax (µg/mL)	Tmax (hr)	AUC (µg · hr/mL)
健康成人男性	7.85±0.69	3.00±0.21	47.54±3.98

平均±S.E. (n=12)

なお、本剤に含まれるアルミニウムは、血中及び尿中のいずれにも検出されなかった。

#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

### 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

該当資料なし

#### (3) 消失速度定数

該当資料なし

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

(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

本剤は消化管内でフルフェナム酸とアルミニウムに解離し、遊離したフルフェナム酸が吸収され、アルミニウムは吸収されない<sup>19)</sup>。

（ラット）

ラットの結紮胃及び腸管内に投与した場合、投与30分後において消化管の広範な部位から速やかに吸収された<sup>20)</sup>。

フルフェナム酸アルミニウム（2.5mg/組織）投与30分後の吸収率（ラット）

組織	吸収率 (%)
胃	92.5
上部小腸	96.9
中部小腸	97.5
下部小腸	89.4

(n=5)

### 5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性  
（ラット）

妊娠ラットに<sup>14</sup>C-フルフェナム酸アルミニウム15mg/kgを経口投与し、2時間後の脳への移行は血漿中濃度の2.7%であった<sup>21)</sup>。

(2) 血液－胎盤関門通過性  
（ラット）

妊娠ラットに<sup>14</sup>C-フルフェナム酸アルミニウム15mg/kgを経口投与し、2時間後の胎盤と胎仔への移行は、血漿中濃度のそれぞれ15.4%、11.1%であった<sup>21)</sup>。

(3) 乳汁への移行性  
（ラット）

分娩後10日目の授乳ラットに<sup>14</sup>C-フルフェナム酸アルミニウム15mg/kgを経口投与し、乳汁中濃度を測定したところ、9時間後に最高濃度11.01µg/mLに達し、血中濃度に近い乳汁中移行が認められた<sup>21)</sup>。  
24時間後には3.5µg/mLに減少し、長時間乳汁中に蓄積することはなかった。

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

### (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

(ラット)

1) ラット (n=3) に<sup>14</sup>C-フルフェナム酸アルミニウム50mg/kgを経口投与した場合、胃では6時間後に組織内放射活性が最高値となったが、それ以外の臓器では12時間後に最高値となった。

12時間後の放射活性は、血液と肝に最も高く、次いで腎、肺、副腎、心の順であった。特定組織への残存は認められなかった<sup>20)</sup>。

2) ラット (n=6) に0.5%クロトン綿実油1mLを背部皮下に注入して肉芽嚢を形成後、100mg/kg及び50mg/kgのフルフェナム酸アルミニウムを経口投与し、各組織及び肉芽組織中のフルフェナム酸濃度を測定した。その結果、各組織と比べ炎症組織である肉芽組織に多く取り込まれる傾向が認められた<sup>12)</sup>。

### (6) 血漿蛋白結合率

(ラット)

ラットに<sup>14</sup>C-フルフェナム酸アルミニウム15mg/kgを経口投与した場合の2時間後の血漿蛋白結合率は99.6%であった<sup>21)</sup>。

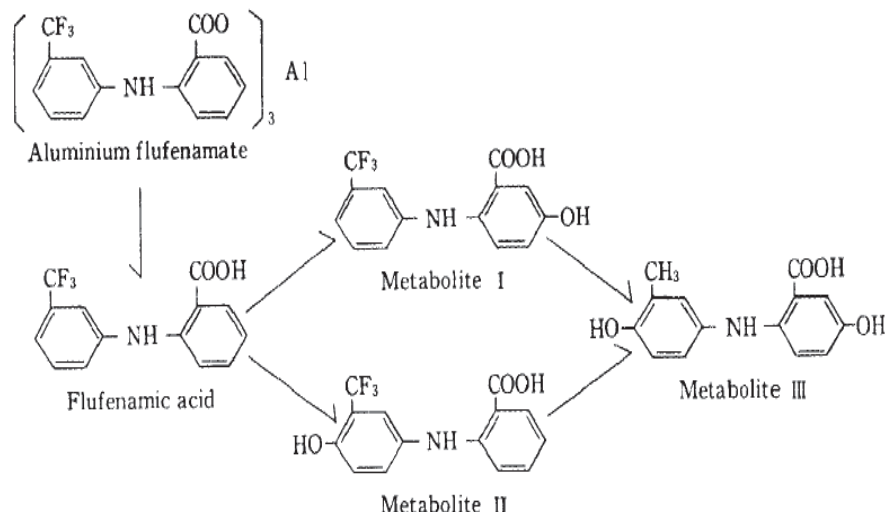
## 6. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

外国人でのデータでは、健康成人にフルフェナム酸200mgを経口投与した場合、フェニル基に水酸基1個（5位水酸化体=Metabolite I 及び4'位水酸化体=Metabolite II）又は2個（4'位、5位水酸化体=Metabolite III）が導入された3種の代謝物が認められた<sup>22)</sup>。

尿、糞中には主として未変化体及び4'位水酸化体が排泄され、それらの一部はグルクロン酸抱合体であった<sup>22)</sup>。

フルフェナム酸アルミニウムの推定代謝経路



### (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

## VII. 薬物動態に関する項目

---

(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

健康成人男性 (n=12) に250mgを食後単回経口投与した場合、72時間までの平均値としてフルフェナム酸30.47mgが尿中に排泄された。アルミニウムは尿中に排泄されなかった<sup>19)</sup>。

(ラット)

ラット (n=3) に<sup>14</sup>C-フルフェナム酸アルミニウム (50mg/kg) を経口投与した場合、24時間までに尿中に17.5%、糞中に64.1%が排泄され、5日後までに尿中に21.0%、糞中に74.4%が排泄された。胆汁中には8時間までに5.1%が排泄された<sup>20)</sup>。

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 消化性潰瘍のある患者〔消化性潰瘍を悪化させるおそれがある。〕

2.2 重篤な血液の異常のある患者〔副作用として血液障害が報告されているため、血液の異常を悪化させるおそれがある。〕

2.3 重篤な肝機能障害のある患者〔9.3.1参照〕

2.4 重篤な腎機能障害のある患者〔9.2.1参照〕

2.5 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.6 アスピリン喘息（非ステロイド性消炎鎮痛剤等による喘息発作の誘発）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。〕

（解説）

2.1 プロスタグランジン合成阻害作用による胃粘膜防御能の低下により、消化性潰瘍を悪化させるおそれがあるため設定した。

### 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 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。

8.2 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尿検査、血液検査及び肝機能検査等を行うこと。
- ・薬物療法以外の療法も考慮すること。

8.3 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、発熱の程度を考慮し投与すること。
- ・原則として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。

8.4 過度の体温下降、虚脱、四肢冷却等があらわれることがあるので、特に高熱を伴う小児及び高齢者又は消耗性疾患の患者においては、投与後の患者の状態に十分注意すること。

（解説）

8.1 消炎鎮痛剤共通の基本的注意事項として設定した。抗炎症療法は一種の対症療法であり、これのみで疾患の治癒は期待できないことに留意するよう注意喚起した。

8.2 消炎鎮痛剤共通の基本的注意事項として設定した。消炎鎮痛剤は慢性疾患に対し長期に使用されることも多いため、有効性に関しては常に臨床効果があるか評価しながら使用し、無効であるのに漫然と連用せず、必要に応じ薬物療法以外についても考慮するよう注意喚起した。

8.3 消炎鎮痛剤共通の基本的注意事項として設定した。頓用で済むものを同じ用量で漫然と続けることは、生体の治癒反応を妨げたり、感染症の招来を助長する恐れもあるため、原則として同一の薬剤の長期投与は避け、原因療法があればこれを行うよう注意喚起した。

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 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 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おそれがある。

##### 9.1.2 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

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。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。

##### 9.1.3 血液の異常又はその既往歴のある患者（重篤な血液の異常のある患者を除く）

血液の異常を悪化又は再発させるおそれがある。

##### 9.1.4 出血傾向のある患者

血小板機能低下が起こることがあるため、出血傾向を助長させるおそれがある。

##### 9.1.5 気管支喘息の患者（アスピリン喘息又はその既往歴のある患者を除く）

喘息発作を誘発させるおそれがある。

##### 9.1.6 潰瘍性大腸炎の患者

症状を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.7 クロウン病の患者

症状を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.8 感染症を合併している患者

必要に応じて適切な抗菌剤を併用し、観察を十分に行い慎重に投与すること。感染症を不顕性化するおそれがある。

(解説)

9.1.2 「非ステロイド性消炎鎮痛剤の長期投与にみられる胃潰瘍及び十二指腸潰瘍」を効能又は効果として有するミソプロストールと非ステロイド性消炎鎮痛剤間における使用上の注意の整合を図る平成10年2月3日付の厚生省（現厚生労働省）医薬安全局安全対策課事務連絡により設定した。

9.1.6、9.1.7 潰瘍性大腸炎、クロウン病は炎症性腸疾患であり、非ステロイド性消炎鎮痛剤の投与はプロスタグランジンの生合成を抑制し、粘膜防御機構を脆弱にすることにより、病態を悪化させるおそれがある。また、潰瘍性大腸炎やクロウン病の患者に非ステロイド性消炎鎮痛剤を投与した場合に、症状を悪化させることが報告されている。本剤をこれらの患者に投与し症状が悪化した症例の報告はないが、安全性を重視し、注意喚起することとした。

#### (2) 腎機能障害患者

##### 9.2 腎機能障害患者

##### 9.2.1 重篤な腎機能障害のある患者

投与しないこと。腎血流量を低下させ、腎機能障害を悪化させるおそれがある。[2.4参照]

##### 9.2.2 腎機能障害又はその既往歴のある患者（重篤な腎機能障害のある患者を除く）

腎血流量を低下させ、腎機能障害を悪化又は再発させるおそれがある。

(解説)

9.2.1 重篤な腎機能障害のある患者に対しては、腎血流量を低下させ腎障害を悪化させるおそれがあるため投与は禁忌である。

9.2.2 腎機能障害又はその既往歴のある患者に対しては、腎血流量を低下させ腎機能障害を悪化又は再発させることがあるため注意喚起した。

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### (3) 肝機能障害患者

#### 9.3 肝機能障害患者

##### 9.3.1 重篤な肝機能障害のある患者

投与しないこと。副作用として肝機能障害が報告されているため、肝機能障害を悪化させるおそれがある。

[2.3参照]

##### 9.3.2 肝機能障害又はその既往歴のある患者（重篤な肝機能障害のある患者を除く）

肝機能障害を悪化又は再発させるおそれがある。

(解説)

9.3.1 重篤な肝機能障害のある患者に対しては、肝機能障害を悪化させるおそれがあるため投与は禁忌である。

9.3.2 肝機能障害又はその既往歴のある患者に対しては、肝機能障害を悪化又は再発させることがあるため注意喚起した。

### (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。投与する際には、必要最小限にとどめ、適宜羊水量を確認するなど慎重に投与すること。シクロオキシゲナーゼ阻害剤（経口剤、坐剤）を妊婦に使用し、胎児の腎機能障害及び尿量減少、それに伴う羊水過少症が起きたとの報告がある。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。

(解説)

非ステロイド性抗炎症薬（以下、NSAIDs）の妊婦への投与例で認められた胎児の腎機能障害及び尿量低下、それに伴う羊水過少症に関するリスクに基づき、妊娠20～30週の妊婦に対するNSAIDsの処方限定的にし、必要な場合にも最小限の用量で可能な限り最短期間の処方とする旨の注意喚起を行うとの米国FDAの措置情報<sup>23)</sup>を受け、PMDAにおいて検討が行われた結果、非臨床試験、臨床試験、観察研究、症例報告等の公表論文において次の報告があることから、当該リスクはシクロオキシゲナーゼ-2（以下、COX-2）阻害作用によるものと考えられ、注意喚起が必要と判断されたため記載した（2021年2月25日付厚生労働省医薬・生活衛生局医薬安全対策課長通知）。

- ・ヒト胎児の腎臓においてCOX-2発現が報告されている<sup>24)、25)</sup>
- ・早期分娩のリスクが高い妊婦を対象とした前向き観察研究において、COX-2選択的阻害剤で用量依存的な amniotic fluid index (AFI<sup>\*</sup>) の減少が認められている<sup>26)</sup>
- ・新生仔ウサギにおいてCOX-2選択的阻害剤の用量依存的に腎血流量及び腎糸球体濾過量の低下が認められることが報告されている<sup>27)</sup>

※子宮腔を4分割し、それぞれの羊水深度（子宮壁から胎児までの距離の最も長い部分）を合計した、羊水量の指標

米国FDAの措置では妊娠20～30週の妊婦が注意喚起の対象とされているが、以下の点から、胎児の腎機能障害等のリスクの対象となる具体的な妊娠時期の目安は明示せず注意喚起することが適切と判断された。

- ・論文等において報告されている症例の妊娠時期は一定の範囲に留まっているものの、早産の予防を目的として短期間投与した報告が多いことが影響していると考えられる
- ・胎児における尿産生は妊娠初期（8～11週）から始まっており、胎児の腎血流量を低下させるNSAIDsの作用が妊娠20週以前には生じないことを積極的に支持する知見は得られていないことから、妊娠時期により当該リスクの有無が異なるとまではいえないと考えられる

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### (6) 授乳婦

#### 9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット）で乳汁中へ移行するとの報告がある。

（解説）

「VII-5. (3) 乳汁への移行性」の項参照

### (7) 小児等

#### 9.7 小児等

9.7.1 小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.7.2 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。

### (8) 高齢者

#### 9.8 高齢者

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。

## 7. 相互作用

### (1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

### (2) 併用注意とその理由

#### 10. 相互作用

#### 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
クマリン系抗凝血剤 〔ワルファリンカリウム等〕	クマリン系抗凝血剤（ワルファリンカリウム等）の作用を増強するおそれがあるので、減量するなど注意すること。	タンパク結合部位での競合により、クマリン系抗凝血剤の非結合型濃度が上昇すると考えられている。
リチウム製剤 〔炭酸リチウム〕	血中濃度を上昇させ、リチウム中毒を起こすおそれがあるので、血中のリチウム濃度に注意し、必要があれば減量すること。	本剤の腎におけるプロスタグランジン生合成阻害作用により、炭酸リチウムの腎排泄が減少するためと考えられている。
チアジド系利尿剤 〔ヒドロクロロチアジド等〕	チアジド系利尿剤の作用を減弱するおそれがあるので、減量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合成阻害作用により、水、ナトリウムの腎排泄が減少するためと考えられている。
コレスチラミン	本剤の血中濃度が低下するおそれがある。	コレスチラミンの薬物吸着作用により、コレスチラミンと本剤が消化管内で結合して、本剤の吸収率が低下すると考えられている。

（解説）

■クマリン系凝血剤（ワルファリンカリウム等）

ワルファリンカリウムの併用注意にNSAIDsがあるため、他のNSAIDsにならって記載している。

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### ■ コレスチラミン

ラットにおいて、フルフェナム酸（50mg/kg）とコレスチラミン（500mg/kg）を同時に経口投与したとき、フルフェナム酸の血中濃度が最大72%低下（投与後0.25～4.5時間に測定、低下率は0.5時間をピークに漸減）したとの文献報告<sup>28)</sup>があることから、2004年9月に使用上の注意を自主改訂し、相互作用の併用注意の項に記載して併用する際の注意を喚起した。

ヒトでの検討結果はないが、コレスチラミンが有する薬物吸着作用（作用機序の一つ）から考えて、ヒトでも同様の相互作用発現が考えられる。

## 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 出血性大腸炎（頻度不明）

### (2) その他の副作用

#### 11.2 その他の副作用

	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明
精神神経系	めまい・ふらつき	頭痛・頭重感 ねむけ	
消化器	胃腸障害 腹痛・胃痛 胃部不快感 下痢 嘔気 食欲不振 悪心	口内炎・舌のあれ 便秘 軟便 消化不良 嘔吐 胸やけ 腹部膨満感 胃重感	
血液			溶血性貧血 白血球減少 紫斑病 血小板機能低下（出血時間の延長）
過敏症	発疹	そう痒感 皮膚炎	
肝臓			AST・ALT上昇 Al-P上昇
その他	浮腫・腫脹感	倦怠感	排尿痛

発現頻度は承認・効能追加時の国内臨床試験及び再評価終了時までの製造販売後の調査結果を合わせて算出した。

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### ◆ 副作用頻度一覧表等

#### 項目別副作用発現頻度一覧

総症例15,620例中447例（2.86%）548件の副作用が認められた。その主なものは胃腸障害123件、腹痛・胃痛59件、胃部不快感53件、下痢48件であった。[再評価終了時]

	承認時の状況 (効能追加を含む)	使用成績調査 (再評価終了時/ 承認時含まず)	合計
調査症例数	3,708	11,912	15,620
副作用発現例数	229	218	447
副作用発現件数	305	243	548
副作用発現症例率	6.18%	1.83%	2.86%

種 類	発 現 件 数 (%)					
胃腸障害	248	(6.69)	184	(1.54)	432	(2.77)
胃腸障害	59	(1.59)	64	(0.54)	123	(0.79)
腹痛・胃痛	39	(1.05)	20	(0.17)	59	(0.38)
胃部不快感	39	(1.05)	14	(0.12)	53	(0.34)
下痢	27	(0.73)	21	(0.18)	48	(0.31)
嘔気	19	(0.51)	25	(0.21)	44	(0.28)
食欲不振	20	(0.54)	13	(0.11)	33	(0.21)
悪心	10	(0.27)	5	(0.04)	15	(0.10)
口内炎・舌のあれ	7	(0.19)	6	(0.05)	13	(0.08)
便秘	7	(0.19)	2	(0.02)	9	(0.06)
軟便	5	(0.13)	3	(0.03)	8	(0.05)
消化不良	3	(0.08)	3	(0.03)	6	(0.04)
嘔吐	2	(0.05)	4	(0.03)	6	(0.04)
胸やけ	5	(0.13)	1	(0.01)	6	(0.04)
腹部膨満感	2	(0.05)	3	(0.03)	5	(0.03)
胃重感	3	(0.08)			3	(0.02)
硬便	1	(0.03)			1	(0.01)
精神神経系	16	(0.43)	19	(0.16)	35	(0.22)
めまい・ふらつき	2	(0.05)	14	(0.12)	16	(0.10)
頭重・頭重感	10	(0.27)	1	(0.01)	11	(0.07)
ねむけ	1	(0.03)	4	(0.03)	5	(0.03)
不眠	2	(0.05)			2	(0.01)
手のしびれ	1	(0.03)			1	(0.01)
過敏症	15	(0.40)	22	(0.18)	37	(0.24)
発疹	12	(0.32)	15	(0.13)	27	(0.17)
そう痒感	3	(0.08)	2	(0.02)	5	(0.03)
皮膚炎			3	(0.03)	3	(0.02)
蟻走感			1	(0.01)	1	(0.01)
熱感			1	(0.01)	1	(0.01)
その他	26	(0.70)	18	(0.15)	44	(0.28)
浮腫・腫脹感	18	(0.49)	14	(0.12)	32	(0.20)
倦怠感	1	(0.03)	2	(0.02)	3	(0.02)
血尿・蛋白尿	2	(0.05)			2	(0.01)
悪寒			1	(0.01)	1	(0.01)
口内乾燥			1	(0.01)	1	(0.01)
発熱	1	(0.03)			1	(0.01)
排尿痛	1	(0.03)			1	(0.01)
尿量減少	1	(0.03)			1	(0.01)
頻尿傾向	1	(0.03)			1	(0.01)
鼻出血	1	(0.03)			1	(0.01)

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

---

### 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

設定されていない

### 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。

(解説)

日薬連発第240号（平成8年3月27日付）「PTPの誤飲対策について」の申し合わせ事項に基づいて記載した。

### 12. その他の注意

#### (1) 臨床使用に基づく情報

#### 15. その他の注意

##### 15.1 臨床使用に基づく情報

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。

(解説)

他の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ことから、注意喚起した（平成13年4月25日付厚生労働省医薬局安全対策課事務連絡）。

#### (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」参照

#### (2) 安全性薬理試験<sup>18), 29)</sup>

##### 1) 呼吸・循環器系

ウサギ、ネコ、イヌに10mg/kgを静脈内投与し、心拍数、心電図、血圧、心律動を測定したところ、作用は認められなかった。

##### 2) 末梢神経系

- 1) カエル摘出心臓に対して、 $1.5 \times 10^{-5}$ g/mL添加で心拍動振幅の増大及び抑制がみられた。
- 2) ガマ後足血管に対して、0.1%添加で拡張作用がみられた。
- 3) モルモット摘出回腸に対して、 $1 \times 10^{-5}$ g/mL添加で弱い収縮、 $3 \times 10^{-5}$ g/mLでは弛緩がみられ、さらに $3 \times 10^{-5}$ g/mLでは抗ヒスタミン作用、アトロピン様作用及びパパペリン作用があったが、抗セロトニン作用はみられなかった。
- 4) ウサギ眼粘膜に対して、0.3%及び1.0%滴下での刺激性はフルフェナム酸と比べてはるかに軽度であった。
- 5) ラット直腸粘膜に対して、5%注入での刺激性はフルフェナム酸と比べてはるかに軽度であった。

#### (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<sup>30)</sup>

急性毒性：LD<sub>50</sub>値 (mg/kg)

動物 投与経路	マウス雄 (dd系)	ラット雄 (Wistar系)
経口	1,460	550
皮下	>1,400	725
腹腔内	1,560	420

マウス：中毒症状として、自発運動抑制、歩行異常、立毛、呼吸抑制・呼吸麻痺を呈した。剖検所見では肺のうっ血が認められた。

ラット：呼吸切迫、横臥、血便がみられた。剖検所見では肺出血、腸間膜癒着、腹水貯留、消化管に出血斑が認められた。

#### (2) 反復投与毒性試験<sup>30)</sup>

雌雄ラットに50mg/kg、100mg/kgを35日間投与したところ、雄の100mg/kg投与群にのみ投与初期に体重増加抑制がみられたが、雌では影響がなかった。さらに、ラットの感受性は雄では強く、雌では弱いように見受けられ、動物の性差が認められた。

雌雄ラットに0.03% (約20mg/kg)、0.05% (約30mg/kg)、0.08% (約50mg/kg) を添加した飼料を6ヵ月間投与したところ、0.08%添加飼料を投与した雌雄ラットで腎重量の増加がみられたが、その他に影響は認められなかった。

#### (3) 遺伝毒性試験

該当資料なし



## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

妊娠マウスに50mg/kg、150mg/kgを、妊娠ラットに30mg/kg、80mg/kgを経口投与した催奇形性試験において、胎児・生後発育の所見など本剤に起因する影響は認められず催奇形性は示さないと考えられた<sup>31)</sup>。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

胃障害作用

絶食ラットに50mg/kg、150mg/kg、450mg/kgを経口投与し、その4時間後に胃を摘出して胃損傷部位面積を測定し胃障害用量ID<sub>30</sub>を求めた。その結果、胃障害作用はフルフェナム酸に比べ弱かった<sup>32)</sup>。

胃障害作用におけるフルフェナム酸アルミニウムと他剤との比較（絶食ラット）

薬剤	投与量 (mg/kg)	障害率 (%)	ID <sub>30</sub> (mg/kg)
フルフェナム酸 アルミニウム	50	14.8	500
	150	18.5	
	450	29.6	
フルフェナム酸	17	18.5	110
	50	22.2	
	150	33.3	

(n=9)

## X. 管理的事項に関する項目

---

### 1. 規制区分

製 剤：オパイリン錠125mg、オパイリン錠250mg 劇薬  
有効成分：フルフェナム酸アルミニウム 劇薬

### 2. 有効期間

有効期間：5年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

該当しない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし  
くすりのしおり：あり

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

### 7. 国際誕生年月日

1967年7月24日（日本）

### 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
オパイリン錠125mg	2006年1月30日	21800AMX10095000	2006年6月9日	1967年8月1日
オパイリン錠250mg	2006年1月30日	21800AMX10096000	2006年6月9日	1984年6月4日

旧販売名：オパイリン錠

承認年月日：1967年7月24日、承認番号：42A-5354、薬価基準収載年月日：1968年3月1日

旧販売名：オパイリン250

承認年月日：1983年10月17日、承認番号：58AM-657、薬価基準収載年月日：1984年6月2日

## X. 管理的事項に関する項目

### 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

オパイリン錠125mg :

1970年4月30日 ○下記疾患の消炎、鎮痛、解熱

腰痛症

○下記炎症性疾患の消炎

膀胱炎、前立腺炎、帯状疱疹、湿疹・皮膚炎、紅斑症、  
各科領域の手術後ならびに外傷後の炎症性反応

○下記疾患の解熱・鎮痛

感冒に伴う咽頭炎

1979年3月8日 ○下記疾患の消炎、鎮痛

拔牙後、歯髄炎、歯根膜炎

1981年2月20日 ○下記疾患の消炎、鎮痛、解熱

関節炎、症候性神経痛

### 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：1977年7月6日（その12）

オパイリン錠125mg

	再評価結果
効能又は効果	下記炎症性疾患の消炎： 慢性関節リウマチ、変形性関節症、変形性脊椎症、腰痛症、肩胛関節周囲炎 <u>感冒に伴う咽頭炎</u> <u>膀胱炎、前立腺炎</u> <u>帯状疱疹、湿疹・皮膚炎、紅斑症</u> <u>各科領域の手術後ならびに外傷後の炎症性反応</u>
用法及び用量	フルフェナム酸アルミニウムとして、通常成人1回125～250mgを1日3回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

下線は再評価対象外の効能又は効果

再評価結果公表年月日：1994年9月8日（94年度その2）

オパイリン錠125mg、オパイリン錠250mg

	再評価前の承認内容	再評価結果
効能又は効果	下記疾患の消炎、鎮痛、解熱 慢性関節リウマチ、変形性関節症、変形性脊椎症、腰痛症、肩胛関節周囲炎、関節炎、症候性神経痛 下記疾患の消炎、鎮痛 拔牙後、歯髄炎、歯根膜炎 下記炎症性疾患の消炎 感冒に伴う咽頭痛、膀胱炎、前立腺炎、帯状疱疹、湿疹・皮膚炎、紅斑症、各科領域の手術後ならびに外傷後の炎症性反応	①下記疾患の消炎、鎮痛、解熱 慢性関節リウマチ、変形性関節症、変形性脊椎症、腰痛症、肩胛関節周囲炎、関節炎、症候性神経痛 ②下記疾患の消炎、鎮痛 拔牙後、歯髄炎、歯根膜炎 ③下記炎症性疾患の消炎 膀胱炎、前立腺炎、帯状疱疹、湿疹・皮膚炎、紅斑症、各科領域の手術後ならびに外傷後の炎症性反応 ④下記疾患の解熱・鎮痛 急性上気道炎（急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む）
用法及び用量	通常、成人にはフルフェナム酸アルミニウムとして1回125～250mgを1日3回経口投与する。また、頓用する場合には、1回フルフェナム酸アルミニウムとして、250mgとする。なお、年齢、症状により適宜増減する。	①～③ 承認内容に同じ ④通常、成人にはフルフェナム酸アルミニウムとして、1回250mgを頓用する。なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、原則として1日2回までとし、1日最大750mgを限度とすること。また、空腹時の投与は避けさせることが望ましい。

## X. 管理的事項に関する項目

---

### 11. 再審査期間

該当しない

### 12. 投薬期間制限に関する情報

該当しない

### 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
オパイリン錠125mg	1141004F1086	1141004F1086	100679701	620003523
オパイリン錠250mg	1141004F2058	1141004F2058	100682701	620003524

### 14. 保険給付上の注意

該当しない

## X I . 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) 広畑和志ほか：基礎と臨床. 1979 ; 13 (11) : 3595-3606
- 2) 広畑和志ほか：基礎と臨床. 1974 ; 8 (7) : 2214-2230
- 3) 永井 隆ほか：基礎と臨床. 1974 ; 8 (1) : 198-206
- 4) 青木虎吉ほか：基礎と臨床. 1973 ; 7 (13) : 3407-3416
- 5) 山室隆夫ほか：基礎と臨床. 1979 ; 13 (11) : 3607-3618
- 6) 高井 宏ほか：日本口腔外科学会雑誌. 1974 ; 20 (5) : 529-536
- 7) 斉藤 毅ほか：歯界展望. 1974 ; 44 (4) : 623-629
- 8) 興石義晴ほか：Prog.Med. 1984 ; 4 (3) : 791-805
- 9) 水島 裕ほか：治療. 1969 ; 51 (11) 2225-2228
- 10) 津山直一ほか：臨床評価 1977 ; 5 (3) : 493-533
- 11) Roderick,J.F.et al. : Biochem.Pharmacol. 1974 ; 23 : 1439-1450 (PMID : 4603208)
- 12) 丸山穂高ほか：東邦医会誌. 1969 ; 16 (5) : 558-565
- 13) 藤平栄一ほか：リウマチ. 1968 ; 8 (2) : 14-22
- 14) 田村豊幸ほか：基礎と臨床. 1975 ; 9 (6) : 1241-1249
- 15) 笹島道忠ほか：応用薬理. 1978 ; 15 (4) : 619-625
- 16) 藤平栄一 : 応用薬理. 1971 ; 5 (2) : 169-183
- 17) Fujihira,E.et al. : Chem.Pharm.Bull. 1971 ; 19 (7) : 1506-1508 (PMID : 5567060)
- 18) 承認時資料：オパイリンの一般薬理作用-1-
- 19) 景山孝正 : 基礎と臨床. 1984 ; 18 (12) : 6478-6490
- 20) 野津隆司ほか：基礎と臨床. 1977 ; 11 (10) : 2745-2758
- 21) 社内資料：ラットにおける胎仔・乳汁中移行及びタンパク結合率 [T030001a]
- 22) Glazko,A.J. : Ann.Phys.Med. 1966 ; Suppl : 23-26 (PMID : 4979052)
- 23) Drug Safety Communication (2020年10月15日 FDA)  
(<https://www.fda.gov/drugs/drug-safety-and-availability/fda-recommends-avoiding-use-nsaids-pregnancy-20-weeks-or-later-because-they-can-result-low-amniotic>)
- 24) Khan KN, et al. : Pediatr Develop Pathol. 2001 ; 4 (5) : 461-466 (PMID : 11779048)
- 25) Khan KN, et al. : Kidney Int. 2002 ; 61 (4) : 1210-1219 (PMID : 11918727)
- 26) Sawdy RJ, et al. : J Obstet Gynaecol. 2004 ; 24 (3) : 226-229 (PMID : 15203612)
- 27) Prévot A, et al. : Pediatr Res. 2004 ; 55 (2) : 254-260 (PMID : 14605244)
- 28) Rosenberg HA, et al. : Proc Soc Exp Biol Med. 1974 ; 145 : 93-98 (PMID : 4812876)
- 29) 承認時資料：オパイリンの一般薬理作用-2-
- 30) 丸山穂高ほか：東邦医会誌. 1970 ; 17 (12) : 153-158
- 31) 丸山穂高ほか：東邦医会誌. 1970 ; 17 (12) : 159-163
- 32) 笹島道忠ほか：現代の診療. 1978 ; 20 (10) : 1691-1694

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 参考資料

---

### 1. 主な外国での発売状況

本剤は、台湾、大韓民国、ドイツ、オーストリアで発売されている（2011年現在）。

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## ⅩⅢ. 備考

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関するQ&Aについて（その3）」  
（令和元年9月6日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡）

オパイリン錠を粉砕して経口投与、又は粉砕法により経管投与することは適応外の用法である。また、これらの方法で投与した場合の、有効性・安全性・体内動態を検討したデータはないため、原則として粉砕して投与することは推奨できない。

#### (1) 粉砕

オパイリン錠125mg粉砕後の安定性試験を、下記条件につき実施した。

オパイリン錠125mg粉砕後の安定性試験結果

保存条件		試験項目	包装	保存期間			
				直後	1週間	2週間	4週間
加温	40°C	外観	瓶（開放）	*1	—	*1	—
		定量（%）*2		100.0	—	100.0	—
		重量変化（%）		—	—	-0.40	—
加湿	25°C 60%RH	外観	瓶（開放）	*1	—	*1	*1
			ポリセロ		—	*1	*1
		定量（%）*2	瓶（開放）	100.0	—	99.8	102.1
			ポリセロ		—	97.5	98.6
		重量変化（%）	瓶（開放）	—	—	0.84	0.81
			ポリセロ		—	0.32	0.23
	25°C 75%RH	外観	瓶（開放）	*1	—	*1	*1
			ポリセロ		—	*1	*1
		定量（%）*2	瓶（開放）	100.0	—	99.8	102.3
			ポリセロ		—	101.6	98.7
		重量変化（%）	瓶（開放）	—	—	1.52	1.41
			ポリセロ		—	1.45	1.33
25°C 90%RH	外観	瓶（開放）	*1	—	*1	*1	
		ポリセロ		—	*1	*1	
	定量（%）*2	瓶（開放）	100.0	—	100.7	101.7	
		ポリセロ		—	101.9	99.0	
	重量変化（%）	瓶（開放）	—	—	4.38	4.19	
		ポリセロ		—	3.51	3.54	
光照射 1000Lux	—	外観	ポリセロ	*1	*1	*1	*1
		定量（%）*2		100.0	100.9	99.8	97.9
		重量変化（%）		—	-0.49	-0.81	-1.09

\*1：淡帯緑黄色の粉末で、においはなかった（刺激性有）。

\*2：数字は重量補正を行い、対直後%で示した。

—：測定せず

## XIII. 備考

オパイリン錠250mg粉砕後の安定性試験を、下記条件につき実施した。

オパイリン錠250mg粉砕後の安定性試験結果

保存条件		試験項目	包装	保存期間			
				直後	1週間	2週間	4週間
加温	40°C	外観	瓶 (開放)	*1	—	*1	—
		定量 (%) *2		100.0	—	99.2	—
		重量変化 (%)		—	—	-0.84	—
加湿	25°C 60%RH	外観	瓶 (開放)	*1	—	*1	*1
			ポリセロ		—	*1	*1
		定量 (%) *2	瓶 (開放)	100.0	—	101.6	102.0
			ポリセロ		—	99.2	101.2
		重量変化 (%)	瓶 (開放)	—	—	0.22	0.18
			ポリセロ		—	0.99	0.82
	25°C 75%RH	外観	瓶 (開放)	*1	—	*1	*1
			ポリセロ		—	*1	*1
		定量 (%) *2	瓶 (開放)	100.0	—	100.5	102.2
			ポリセロ		—	103.1	102.0
		重量変化 (%)	瓶 (開放)	—	—	0.76	0.70
			ポリセロ		—	0.88	0.74
25°C 90%RH	外観	瓶 (開放)	*1	—	*1	*1	
		ポリセロ		—	*1	*1	
	定量 (%) *2	瓶 (開放)	100.0	—	96.0	103.0	
		ポリセロ		—	100.6	100.2	
	重量変化 (%)	瓶 (開放)	—	—	3.66	3.16	
		ポリセロ		—	1.30	0.64	
光照射	蛍光灯 1000Lux	外観	ポリセロ	*1	*1	*1	*1
		定量 (%) *2		100.0	103.5	101.1	101.9
		重量変化 (%)		—	0.93	0.52	0.33

\*1：淡帯緑黄色の粉末で、においはなかった（刺激性有）。

\*2：数字は重量補正を行い、対直後%で示した。

—：測定せず

### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

### 2. その他の関連資料

該当資料なし





**大正製薬株式会社**

〒170-8633東京都豊島区高田3-24-1  
<https://www.taisho.co.jp/>

2022年8月改訂