

** 2019年 4月改訂 (第10版、販売会社変更に伴う改訂)
* 2009年 7月改訂 (規制区分の変更等)

日本標準商品分類番号
871141

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示

	錠125mg	錠250mg
承認番号	21800AMX10095000	21800AMX10096000
薬価収載	2006年 6月	2006年 6月
販売開始	1967年 8月	1984年 6月
再評価結果	1994年 9月	
効能追加	1981年 2月	

非ステロイド性消炎・鎮痛・解熱剤

* 劇薬 **オピリン®錠125mg**
* 劇薬 **オピリン®錠250mg**
OPYRIN® tab.125mg/tab. 250mg
フルフェナム酸アルミニウム製剤

【禁忌 (次の患者には投与しないこと)】

1. 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おそれがある。]
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 (「副作用」の項参照)。]
3. 重篤な肝障害のある患者 [副作用として肝障害が報告されているため、肝障害を悪化させるおそれがある。]
4. 重篤な腎障害のある患者 [腎血流量を低下させ、腎障害を悪化させるおそれがある。]
5. 本剤の成分に対し過敏症の患者
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。]

販売名	識別コード	剤形	外形・サイズ等		
			上面	下面	側面
オピリン錠 125 mg	T 135	白色 フィルム コーティ ング錠			
			直径 (mm)	厚み (mm)	重量 (mg)
			約 9	約 4.3	約 250
オピリン錠 250 mg	T 137	白色 フィルム コーティ ング錠			
			直径 (mm)	厚み (mm)	重量 (mg)
			約 10	約 5.0	約 375

【組成・性状】

販売名	オピリン錠 125 mg	オピリン錠 250 mg
成分・含量	1錠中 フルフェナム酸 アルミニウム 125 mg	1錠中 フルフェナム酸 アルミニウム 250 mg
添加物	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) シヨ糖脂肪酸エステル 軽質無水ケイ酸	低置換度ヒドロキシブ 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 シヨ糖脂肪酸エステル 軽質無水ケイ酸

【効能・効果、用法・用量】

効能・効果	用法・用量
○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	通常、成人にはフルフェナム酸 アルミニウムとして1回 125~250 mg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、250 mgとする。 なお、年齢、症状により適宜増 減する。
○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 管炎を伴う急性上気 道炎を含む)	通常、成人にはフルフェナム酸 アルミニウムとして、1回 250 mg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750 mg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。

【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) 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。]

- (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 [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。]
- (3) 血液の異常又はその既往歴のある患者 [血液の異常を悪化又は再発させるおそれがある。]
- (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。]
- (5) 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。]
- (6) 腎障害又はその既往歴のある患者 [腎血流量を低下させ、腎障害を悪化又は再発させるおそれがある。]
- (7) 過敏症の既往歴のある患者
- (8) 気管支喘息の患者 [喘息発作を誘発させるおそれがある。]
- (9) 潰瘍性大腸炎の患者 [症状を悪化させるおそれがある。]
- (10) クローン病の患者 [症状を悪化させるおそれがある。]
- (11) 高齢者 [「重要な基本的注意」、「高齢者への投与」の項参照]

2. 重要な基本的注意

- (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。
- (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。
 - 1) 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。
 - 2) 薬物療法以外の療法も考慮すること。
- (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。
 - 1) 急性炎症、疼痛、発熱の程度を考慮し投与すること。
 - 2) 原則として同一の薬剤の長期投与を避けること。
 - 3) 原因療法があればこれを行うこと。
- (4) 患者の状態を十分観察し、副作用の発現に留意すること。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。
- (5) 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。
- (6) 他の消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい。
- (7) 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。

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
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	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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
チアジド系利尿剤	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。
コレステラミン	本剤の血中濃度が低下するおそれがある。	コレステラミンの薬物吸着作用により、コレステ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。

4. 副作用

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〕

(1) 重大な副作用

出血性大腸炎（頻度不明）：出血性大腸炎があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止すること。

(2) その他の副作用

下記のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	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 ^{注1)}			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 ^{注2)}	掻痒感 皮膚炎	
肝臓			AST(GOT)・ALT(GPT)の上昇 Al-P 上昇
その他	浮腫・腫脹感	倦怠感	排尿痛

注 1) 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、直ちに投与を中止すること。

注 2) 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

高齢者には慎重に投与すること（「重要な基本的注意」の項参照）。

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まわ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。また、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。〕

(2) 授乳中の婦人には授乳を中止させること。〔母乳中へ移行するとの報告がある。〕

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. 血中濃度¹⁾

健常成人に250 mgを食後単回経口投与した場合、血中濃度パラメータは以下の通りであった。

	C _{max} ($\mu\text{g/mL}$)	T _{max} (hr)	AUC ($\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$)
成人(n=12)	7.85	3.00	47.54

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。

2. 組織中濃度²⁾

(参考) 動物による成績：

ラットに¹⁴C-フルフェナム酸アルミニウムを経口投与した場合、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。

3. 代謝³⁾

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る。

外国人でのデータでは、健常成人にフルフェナム酸200 mgを経口投与した場合、フェニル基に水酸基1又は2個が導入された3種の代謝物が認められた。また、尿中に排泄された未変化体及び代謝物の一部はグルクロン酸抱合体であった。

4. 排泄¹⁾

健常成人に250 mgを食後単回経口投与した場合、72時間でフルフェナム酸30.47 mg(約12%)が尿中に排泄された。

【臨床成績】^{4)~8)}

再評価時の臨床試験の成績は以下の通りである。

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)

【薬効薬理】

1. 抗炎症作用^{9)~11)}

モルモット紫外線紅斑抑制作用はフェニルブタゾンより強く、ラットカラゲニン浮腫抑制作用はフェニルブタゾン、アスピリンより強い。

また、ラットクロトン油肉芽腫への滲出液貯留、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る。

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る。

2. 鎮痛作用^{12)~14)}

マウス酢酸Writhing法、ラットRandall-Selitto法においてはメフェナム酸と同等、マウス熱板法においてはアミノピリン、フェニルブタゾンと同等の鎮痛効果を示す。

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ている。

3. 解熱効果¹⁵⁾

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す。

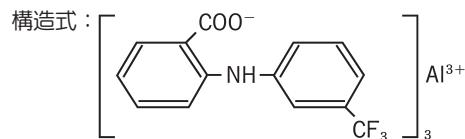
4. 作用機序¹⁶⁾

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合成阻害作用が考えられる。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：フルフェナム酸アルミニウム (flufenamate aluminum) (JAN)

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



分子式：C₄₂H₂₇AlF₉N₃O₆

分子量：867.66

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。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。

融点：120℃付近より褐変しはじめ250℃まで昇温しても融解しない。

【包装】

オパイリン錠 125 mg：PTP 100錠

オパイリン錠 250 mg：PTP 100錠

*【主要文献】

- 1) 景山孝正：基礎と臨床, **18** (12), 6478 (1984)
- 2) 野津隆司ほか：基礎と臨床, **11** (10), 2745 (1977)
- 3) Glazko, A. J.: Ann. Phys. Med., Suppl, **23** (1966)
- 4) 津山直一ほか：臨床評価, **5** (3), 493 (1977)
- 5) 広畑和志ほか：基礎と臨床, **8** (7), 2214 (1974)
- 6) 永井 隆ほか：基礎と臨床, **8** (1), 198 (1974)
- 7) 青木虎吉ほか：基礎と臨床, **7** (13), 3407 (1973)
- 8) 輿石義晴ほか：Prog. Med., **4** (3), 791 (1984)
- 9) 丸山穂高ほか：東邦医会誌, **16** (5), 558 (1969)
- 10) 藤平栄一ほか：リウマチ, **8** (2), 14 (1968)
- 11) 田村豊幸ほか：基礎と臨床, **9** (6), 1241 (1975)
- 12) 笹島道忠ほか：応用薬理, **15** (4), 619 (1978)
- 13) 藤平栄一：応用薬理, **5** (2), 169 (1971)
- 14) Fujihira, E. et al.: Chem. Pharm. Bull., **19** (7), 1506 (1971)
- 15) 社内資料 (解熱効果に関する資料)
- 16) Roderick, J. F. et al.: Biochem. Pharmacol., **23**, 1439 (1974)

**【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

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
〒170-8633 東京都豊島区高田 3-24-1
電話 0120-591-818



製造販売
大正製薬株式会社
東京都豊島区高田3-24-1