

oxaprozin (JP)
オキサプロジン
プロピオン酸系消炎鎮痛剤

114

【基本電子添文】 アルボ錠2024年10月改訂

【製品】 規制等：[劇] 《アルボ100・200 1985.08.22承認》
アルボ Alvo 錠100・200mg（大正）

【組成】 [錠剤]：1錠中100mg，200mg

【効能・効果】 ①次の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，変形性脊椎症，頸肩腕症候群，肩関節周囲炎，痛風発作 ②外傷後及び手術後の消炎・鎮痛

【用法・用量】 オキサプロジンとして1日400mg，1～2回に分服（増減）。1日最高量600mg

用法関連注意：他の非ステロイド性消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい

【禁忌】 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〕（重大な副作用⑥参照） ②重篤な肝機能障害のある患者（特定背景関連注意③④参照） ③重篤な腎機能障害のある患者（特定背景関連注意②④参照） ④本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者 ⑤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〕（特定背景関連注意①④参照） ⑥妊婦又は妊娠している可能性のある女性（特定背景関連注意④参照）

【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 ②慢性疾患（関節リウマチ，変形性関節症等）に対し用いる場合には，次の事項を考慮する ③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 ④薬物療法以外の療法も考慮する ⑤外傷後及び手術後に対し用いる場合には，次の事項を考慮する ⑥炎症及び疼痛の程度を考慮し投与する ⑦原則として長期投与を避ける 【特定背景関連注意】 ①合併症・既往歴等のある患者 ②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（重大な副作用⑥参照） ③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。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 ④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（禁忌⑤参照） ⑤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 ⑥潰瘍性大腸炎の患者：症状を悪化させるおそれがある ⑦クローン病の患者：症状を悪化させるおそれがある 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。感染症を不顕性化させるおそれがある ⑨腎機能障害患者 ⑩重篤

な腎機能障害のある患者：投与しない。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（禁忌③，重大な副作用④参照） ⑪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（重大な副作用④参照） ⑫肝機能障害患者 ⑬重篤な肝機能障害のある患者：投与しない。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（禁忌②参照） ⑭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 ⑮妊婦：妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しない。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（禁忌⑥参照） ⑯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。動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている ⑰小児等 ⑱小児等を対象とした臨床試験は実施していない ⑲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 ⑳高齢者：副作用の発現に特に注意し，少量から開始するなど必要最小限の使用にとどめ患者の状態を観察しながら慎重に投与する。本剤は，主として腎臓から排泄され，また血漿アルブミンとの結合性が強い薬物であるので，腎機能の低下により高い血中濃度が持続したり，血漿アルブミンの減少により，遊離の薬物の血中濃度が高くなるおそれがある

【相互作用】 併用注意

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
経口抗凝血剤 ・ワルファリン	抗凝血作用を増強するおそれがあるので注意し，必要があれば減量する	本剤は血漿アルブミンと高率に結合するので，血漿アルブミン結合率の高い薬剤と併用すると，血中に活性型の併用薬が増加し，その薬剤の作用が増強されるためと考えられている
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	本剤の腎におけるプロスタグランジン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
ニューキノロン系抗菌剤 ・シプロフロキサシン等	動物実験で痙攣が現れたとの報告がある	ニューキノロン系抗菌剤は中枢神経系の抑制性神経伝達物質であるGABAの受容体への結合を阻害し，痙攣誘発作用を起こす。本剤の併用によりその阻害作用を増強するためと考えられている

【副作用】 次の副作用が現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中止するなど適切な処置を行う

①重大な副作用 ②ショック，アナフィラキシー（いずれも頻度不明）：蕁麻疹，呼吸困難，血圧低下等が認められた場合には中止し，適切な処置を行う ③消化性潰瘍（頻度不明）：胃痛，嘔吐，吐血・下血等を伴う胃腸出血が認められた場合には必要に応じて減量，休薬，中止等の適切な処置を行う（禁忌①，特定背景関連注意①④参照） ④皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）（頻度不明） ⑤急性腎障害（頻度不明）：（特定背景関連注意②④⑥参照） ⑥心筋梗塞，

脳血管障害（いずれも頻度不明）：心筋梗塞、脳血管障害等の心血管系血栓塞栓性事象が現れることがある

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		眠気、めまい、頭痛	
消化器	胃部不快感、胃痛	嘔気、食欲不振、便秘、下痢、口内炎、胃炎、腹痛、腹部不快感、舌の荒れ、口渇、嘔吐	
血液			貧血、白血球減少
皮膚	発疹	かゆみ	
肝臓		AST上昇、ALT上昇、ALP上昇	肝炎
その他		浮腫、倦怠感、胸部圧迫感、霞目、発汗、耳鳴り、尿沈渣異常	

発現頻度は承認時の臨床試験及び製造販売後の使用成績調査の合算に基づいている

【その他の注意】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 【保存等】室温保存。有効期間：5年

【薬物動態】①血中濃度（健康成人）③6例に400mgを単回経口投与時、 C_{max} 66.9 μ g/mL、 T_{max} 3.7時間、 $T_{1/2}$ 49.5時間、AUC 4,001.8 μ g $\cdot$ hr/mL ⑤400mgを1日1回又は2回に分割して10日間連続経口投与時の血中濃度は、いずれも4～6日間で定常状態に達し、その平均血中濃度はいずれの投与方法でもほぼ一定値（約100 μ g/mL）を示した ②吸収 食事の影響：健康成人に400mgを単回経口投与時、食事前後の投与で体内動態に有意な差異は認められなかった ③分布：ラットに¹⁴C-標識体を経口投与2時間後の放射活性は、消化管、腎、肝、血漿の順に高かった。その他の組織はいずれも血液レベル以下で、脳は最も低かった。ウサギの場合、投与2時間後の放

射活性は、血漿が最も高く、消化管、腎、血液、肝に比較的高濃度の分布が見られた。いずれの場合も特定臓器への残留性は認められなかった ④代謝：健康成人に400mgを単回経口投与時、尿中主代謝物はオキサプロジンのエステル型グルクロニドで、ほかにフェニル基の水酸化体及びそれらのグルクロニドを検出 ⑤排泄：健康成人に400mgを単回経口投与時、5日間で尿中に約32%が排泄 【臨床成績】有効性及び安全性に関する試験：承認時に実施された二重盲検比較試験を含む臨床試験及び製造販売後の使用成績調査の成績〔改善率（改善以上）〕は、関節リウマチ52.1%（894/1,715）、変形性関節症67.8%（2,172/3,203）、腰痛症84.6%（11,065/13,076）、変形性脊椎症67.9%（2,153/3,170）、頸肩腕症候群80.5%（2,712/3,369）、肩関節周囲炎77.0%（2,100/2,727）、痛風発作86.3%（176/204）、外傷後及び手術後の炎症・疼痛84.0%（1,549/1,844） 【薬効薬理】①作用機序：*in vitro*試験（ウシ精囊腺）において、プロスタグランジン合成を抑制することが報告されており、シクロオキシゲナーゼ阻害による消炎・鎮痛効果を示すものと考えられる ②抗炎症作用：ラットでカラゲニン急性足浮腫法、綿球肉芽腫法、アジュバント関節炎法などの急性・慢性炎症に対する抑制作用はアスピリンと同程度。また、マウスでカラゲニン急性足浮腫法による炎症に対しては、イブプロフェン、フェンブフェン、スリンダクより強い抑制作用を示し、酢酸惹起血管透過性亢進に対しても、フェニルブタゾン、アスピリン、イブプロフェンより強い抑制作用 ③鎮痛作用：ラットでRandall-Selitto法、硝酸銀関節炎法、アジュバント関節炎法などの急性・慢性炎症性疼痛に対する抑制作用はアスピリンより若干強い程度であったが、マウスで酢酸・フェニルキノリン・アセチルコリンwrithing法、イースト投与圧刺激法では、フェニルブタゾン、アスピリンよりはるかに強い抑制作用。また、イヌでオキサプロジン投与20時間後に誘発した尿酸関節炎に対しても疼痛抑制作用が認められた

【性状】オキサプロジンは白色～帯黄白色の結晶性の粉末である。メタノール又はエタノール（95）にやや溶けにくく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。光によって徐々に変化する。融点：161～165℃