

zaltoprofen (JP)
ザルトプロフェン
プロピオン酸系消炎鎮痛剤

114

【基本電子添文】 ソレトン錠2024年10月改訂

【製品】 規制等：[劇] 《ソレトン錠80 1993.07.02承認》
ザルトプロフェン [局] 錠80mg（沢井 日医工 陽進堂一共創未来、日本ジェネリック）
ソレトン [局] Soleton 錠80mg（日本ケミファ）
ペオン [局] Peon 錠80mg（ゼリア新薬）

【組成】 [錠剤]：1錠中80mg

【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、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群
②手術後、外傷後並びに抜歯後の消炎・鎮痛

【用法・用量】 ザルトプロフェンとして1回80mg、1日3回経口投与。頓用には1回80～160mg経口投与

用法関連注意 ①他の消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい ②高齢者に投与する際には消化器症状等患者の状態を観察しながら、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必要最低限の使用にとどめるよう慎重に投与する。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（薬物動態④参照）

【禁忌】 ①消化性潰瘍のある患者〔消化性潰瘍を悪化させることがある〕（特定背景関連注意①⑥参照） ②重篤な血液の異常のある患者〔血液の異常を更に悪化させるおそれがある〕 ③重篤な肝機能障害のある患者（特定背景関連注意③④参照） ④重篤な腎機能障害のある患者（特定背景関連注意②④参照） ⑤重篤な心機能不全のある患者〔心機能不全を更に悪化させるおそれがある〕 ⑥本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者 ⑦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〕

【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（重大な副作用⑥⑦⑧参照） ④薬物療法以外の療法も考慮する ⑤急性疾患に対し用いる場合には、次の事項を考慮する ⑥急性炎症、疼痛及び発熱の程度を考慮し、投与する ⑦原則として長期投与を避ける ⑧原因療法があればこれを行う 【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ことがある 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（禁忌①参照） ④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 ⑤心機能障害のある患者（重篤な心機能不全のある患者を除く）：心機能障害を悪化させるおそれがある ⑥気管支喘息のある患者（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 ⑦潰瘍性大腸炎の患者：症状を悪化させるおそれがある ⑧クローン病の患者：症状を悪化させるおそれがある ⑨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。感染症を不顕性化するおそれがある ⑩腎機能障害患者 ⑪重篤な腎機能障害のある患者：投与しない。腎機能障害を更に悪化させるおそれがある（禁忌④参照） ⑫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）：腎機能障害を悪化又は再発させるおそれがある ⑬肝機能障害患者 ⑭重篤な肝機能障害のある患者：投与しない。肝機能障害を更に悪化させるおそれがある（禁忌③参照） ⑮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 ⑯妊婦 妊婦又は妊娠している可能性のある女性：治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与する。投与する際には、必要最小限にとどめ、羊水量、胎児の動脈管収縮を疑う所見を妊娠週数や投与日数を考慮して適宜確認するなど慎重に投与する。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。シクロオキシゲナーゼ阻害剤を妊娠中期以降の妊婦に使用し、胎児の動脈管収縮が起きたとの報告があり、また妊娠後期はその発現リスクがより高くなることが知られている。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 ⑰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）で乳汁中に移行することが報告されている ⑱小児等：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。小児等を対象とした臨床試験は実施していない

【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
ニューキノロン系抗菌剤・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	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
クマリン系抗凝固剤・ワルファリンカリウム等	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	本剤のヒトにおける血漿蛋白結合率（ <i>in vitro</i> ）は99%以上と高く、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・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	
チアジド系利尿剤・ヒドロクロチアジド	チアジド系利尿剤の作用を減弱するとの報告があ	本剤のプロスタグランジン合成抑制作用によ

等	る	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・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	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	

【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** ③**ショック**（頻度不明）、**アナフィラキシー**（頻度不明）：呼吸困難、血圧低下、冷汗、悪寒、発疹、かゆみ、紅潮、顔面浮腫、蕁麻疹等が現れた場合には中止し、適切な処置を行う ⑥**急性腎障害**（頻度不明）、**ネフローゼ症候群**（頻度不明）：急性腎障害、ネフローゼ症候群等の腎機能障害が現れることがあるので、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中止し、適切な処置を行う（重要な基本的注意②参照） ⑦**肝機能障害**（頻度不明）：黄疸、AST上昇、ALT上昇、ALP上昇、 γ -GTP上昇が現れることがある（重要な基本的注意②参照） ④**消化性潰瘍**（0.1%未満）、**小腸・大腸潰瘍**（頻度不明）、**出血性大腸炎**（頻度不明）：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）、出血性大腸炎が現れることがある ⑤**無顆粒球症**（頻度不明）、**白血球減少**（0.1%未満）、**血小板減少**（頻度不明）：（重要な基本的注意②参照） ⑧**皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）**（頻度不明） ⑨**溶血性貧血**（頻度不明）、**再生不良性貧血**（頻度不明）：（重要な基本的注意②参照） ⑩**心筋梗塞**（頻度不明）、**脳血管障害**（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%	0.1%未満	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	発疹、皮疹	湿疹、痒疹	光線過敏症
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上昇、AST上昇、ALP上昇、 γ -GTP上昇		
腎臓	BUN上昇	血中クレアチニン上昇、血尿	
その他	浮腫	倦怠感、排尿痛、排尿障害、発熱	ほてり、頻尿

発現頻度は使用成績調査の結果を含む

【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：3年

【薬物動態】 ①血中濃度 ③単回投与：健康成人男子6例に80mg単回経口投与時、未変化体の血漿中濃度は速やかに上昇し、投与1.17 ± 0.49時間後に最高値5.00 ± 1.65 μ g/mLに達し、その後二相性（ $T_{1/2\alpha}$ 0.87 ± 0.36時間、 $T_{1/2\beta}$ 9.08 ± 6.79時間）で低下、AUCは12.77 ± 1.56 μ g・hr/mL ⑥反復投与：健康成人男子6例に1回100mg 7日間反復投与[#]（1日目は朝食1時間後に1回投与、2～6日目は1日3回投与、7日目は絶食下、朝1回投与）した結果、蓄積性は認められていない。[#]：承認用量は1回80mg、1日3回、頓用の場合は1回80～160mg ②吸収：健康成人男子6例に80mg単回経口投与時、吸収率は82%以上と推察 ③分布：ラット、ウサギ、イヌ及びヒトの血清に、¹⁴C-標識体を3 μ g/mL及び30 μ g/mLの濃度で添加して血清蛋白結合率を求めた結果、いずれの種及び濃度でも98%以上（*in vitro*） ④排泄：健康成人男子6例に80mg単回経口投与24時間以内に約82%が尿中排泄、その大部分が未変化体の抱合体（用法関連注意②参照） 【臨床成績】 有効性及び安全性に関する試験 国内臨床試験：国内で実施された、二重盲検比較試験を含む臨床試験で効果判定が行われた総症例1,393例（一般臨床試験793例、二重盲検試験600例）の臨床成績の概要は次のとおり

疾患名	投与量（mg/日）； 投与期間	改善率（%） 改善以上	改善率（%） やや改善以上
関節リウマチ	240；～52週	26.9（90/334）	54.8（183/334）
変形性関節症	240；4週	62.9（144/229）	84.3（193/229）
腰痛症	240；2週	71.4（120/168）	87.5（147/168）
肩関節周囲炎	240；2週	59.2（71/120）	77.5（93/120）
頸肩腕症候群	240；2週	68.6（81/118）	85.6（101/118）
手術後・外傷後	240；7日	82.4（173/210）	96.2（202/210）
抜歯後	160；頓用	91.1（195/214） ※1	98.1（210/214） ※2

※1：有効以上。 ※2：やや有効以上

【薬効薬理】 ①作用機序：アラキドン酸代謝系でのシクロオキシゲナーゼ阻害によりプロスタグランジン合成を抑制することで鎮痛及び抗炎症作用を現す。また、白血球遊走抑制作用及びリソソーム酵素遊離抑制作用等の白血球細胞膜安定化作用も抗炎症作用の一機序になっているものと考えられる ②プロスタグランジン合成抑制作用：選択的に炎症反応にかかわる細胞からのプロスタグランジン合成を強く抑制し（*in vitro*）、ラット胃組織ではインドメタシンより弱く、尿中プロスタグランジン排泄の抑制も軽度 ③鎮痛作用：酢酸ライジング法（マウス、ラット）、ブラジキニン動注法（ラット）、ランダル-セリット法（ラット）及びアジュバント関節痛（ラット）の各種疼痛モデルに対し鎮痛作用。特にブラジキニン疼痛反応に対し、インドメタシン、プラノプロフェン、ジクロフェナクナトリウム、ケトプロフェン、メフェナム酸、ロキソプロフェンナトリウムの約3～28倍強い効果 ④抗炎症作用：カラゲニン足趾浮腫（ラット）、血管透過性亢進（ラット）、紫外線紅斑（モルモット）、コットンペレット法（ラット）、CMC空気囊炎モデル（ラット）及びアレルギー性空気囊炎モデル（ラット）等の急性、亜急性及び慢性の各種炎症モデルで抗炎症作用。関節リウマチ病態モデルのアジュバント関節炎モデル（ラット）に対し治療効果

【性状】 ザルトプロフェンは白色～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。光によ

って徐々に分解する。アセトン溶液（1→10）は旋光性を示さない。融点：135～139℃