

flufenamate aluminum (JAN)
フルフェナム酸アルミニウム
解熱消炎鎮痛剤

114

【基本電子添文】 オパイリン錠2024年10月改訂

【製品】 規制等：[劇] 《オパイリン錠 1967.07.24承認》
オパイリン *Opyrin* [経] 錠125・250mg（大正）

【組成】 [錠剤]：1錠中125mg, 250mg

【効能・効果】 ①次の疾患の消炎、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、肩甲関節周囲炎、関節炎、症候性神経痛 ②次の疾患の消炎、鎮痛：抜歯後、歯髄炎、歯根膜炎 ③次の炎症性疾患の消炎：膀胱炎、前立腺炎、帯状疱疹、湿疹・皮膚炎、紅斑症、各科領域の手術後並びに外傷後の炎症性反応 ④次の疾患の解熱・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・用量】 フルフェナム酸アルミニウムとして 効能・効果①（関節リウマチ、変形性関節症、変形性脊椎症、腰痛症、肩甲関節周囲炎、関節炎、症候性神経痛の消炎、鎮痛、解熱）、効能・効果②（抜歯後、歯髄炎、歯根膜炎の消炎、鎮痛）、効能・効果③（膀胱炎、前立腺炎、帯状疱疹、湿疹・皮膚炎、紅斑症、各科領域の手術後並びに外傷後の炎症性反応の消炎）には1回125～250mgを1日3回経口投与（増減）。頓用する場合には1回250mg（増減）。効能・効果④（急性上気道炎の解熱・鎮痛）には1回250mg頓用（増減）、原則として1日2回まで、1日最大750mgを限度とする。空腹時の投与は避けさせることが望ましい

用法関連注意：他の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〕 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〕 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本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者 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〕

【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、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 ⑨過度の体温下降、虚脱、四肢冷却等が現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 【特定背景関連注意】 ①合併症・

既往歴等のある患者 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：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 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 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 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。感染症を不顕性化するおそれがある ⑨腎機能障害患者 ①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④参照） 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 ③肝機能障害患者 ①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③参照） 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 ④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。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 ⑤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）で乳汁中へ移行するとの報告がある ⑥小児等 ①小児等を対象とした臨床試験は実施していない 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 ⑦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

【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
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	蛋白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	本剤の腎におけるプロstaglandin生成阻害作用により、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	本剤の腎におけるプロス タグランジン生成阻害 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

【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**出血性大腸炎**（頻度不明） ③**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

④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、眠 気	
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	掻痒感、皮膚炎	
肝臓			AST・ALTの上 昇、ALP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

【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（12例）に本剤250mgを
食後単回経口投与時、血中濃度パラメータはC_{max}
7.85μg/mL、T_{max} 3.00時間、AUC 47.54μg・hr/mL。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分布：ラットに¹⁴C-標識体を経口投与

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。特定組織への残存は認められなかった ③代謝
④a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 ⑤健康成人にフルフェ
ナム酸200mgを経口投与時、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（外国人データ）。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 ⑥排泄：健康成人に本剤250mgを食後単回経口投与72時間
でフルフェナム酸30.47mgが尿中に排泄 【臨床成績】 有効性
及び安全性に関する試験 国内臨床試験：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（有効以上）は次のとおり
（承認用量と異なる症例を含む）。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）、肩甲関節周
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%（1,451/1,752）、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
後並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作用機序：非ステロイド性
抗炎症剤に共通のプロスタグランジン生成阻害作用が考えら
れる ②抗炎症作用：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
芽嚢への浸出液貯留、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。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 ③鎮痛
作用：マウス酢酸Writhing法、ラットRandall-Selitto法ではメフ
ェナム酸と同等、マウス熱板法ではアミノピリン、フェニルブ
タゾンと同等の鎮痛効果。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も抑制作用 ④解熱効
果：ウサギで、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

【性状】 フルフェナム酸アルミニウムは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