

鎮痛・消炎・解熱剤

劇薬

処方箋医薬品(注意-医師等の
処方箋により使用すること)

ケトプロフェン筋注50mg「日新」

Ketoprofen IM Inj. 50mg "NISSIN"

貯法: 遮光・室温保存
使用期限: 3年(外箱に記載)
注意: 【取扱上の注意】の項参照

(ケトプロフェン製剤)

** 承認番号	22700AMX00201000
** 薬価収載	2015年6月
** 販売開始	

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- 消化性潰瘍のある患者 [プロスタグランジン生合成抑制作用により、消化性潰瘍を悪化させることがある。]
 - 重篤な血液の異常のある患者 [血液の異常を悪化させるおそれがある。]
 - 重篤な肝障害のある患者 [肝障害を悪化させるおそれがある。]
 - 重篤な腎障害のある患者 [プロスタグランジン生合成抑制作用による腎血流量の低下等により、腎障害を悪化させるおそれがある。]
 - 重篤な心機能不全のある患者 [腎のプロスタグランジン生合成抑制作用により浮腫、循環体液量の増加が起こり、心臓の仕事量が増加するため症状を悪化させることがある。]
 - 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
 - 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 [アスピリン喘息発作を誘発することがある。]
 - シプロフロキサシンを投与中の患者(「相互作用」の項参照)
- * 9. 妊娠後期の女性(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)

**【組成・性状】

販売名	ケトプロフェン筋注50mg「日新」
容量	1管 2.5mL
有効成分・含量(1管中)	日本薬局方ケトプロフェン50mg
添加物(1管中)	L-アルギニン36mg、ベンジルアルコール25mg、等張化剤、pH調整剤
性状	無色澄明の液
pH	6.0~8.0
浸透圧比	0.9~1.1(生理食塩液に対する比)

【効能・効果】

- 下記の疾患並びに状態における鎮痛・消炎
術後、外傷、各種癌、痛風発作、症候性神経痛
- 緊急に解熱を必要とする場合

【用法・用量】

- 鎮痛・消炎の目的に用いる場合
通常、成人にはケトプロフェンとして1回50mgを殿部筋肉内に注射し、その後必要に応じて1日1~2回反復注射する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。
- 解熱の目的に用いる場合
通常、成人にはケトプロフェンとして1回50mgを1日1~2回殿部筋肉内に注射する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

- 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)
 - 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。]
 - 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。]
 - 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ので、出血傾向を助長することがある。]
 - 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。]
 - 腎障害又はその既往歴のある患者 [腎障害を悪化又は再発させるおそれがある。]

- (6) 心機能異常のある患者 [心機能を悪化させるおそれがある。]
- (7) 過敏症の既往歴のある患者
- (8) 気管支喘息のある患者 [アスピリン喘息を誘発することがある。]
- (9) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)
- (10) 潰瘍性大腸炎の患者 [症状が悪化するおそれがある。]
- (11) クロウン病の患者 [症状が悪化するおそれがある。]

2. 重要な基本的注意

- (1) 過敏症状を予測するため十分な問診を行うこと。
- (2) 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。
- (3) 症候性神経痛等の慢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) 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、休業等の適切な処置を行うこと。
 - 2) 薬物療法以外の療法も考慮すること。
- (4) 術後、外傷及び解熱時に本剤を用いる場合には、次の事項を考慮すること。
 - 1) 炎症、疼痛及び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) 感染による発熱に対する抗菌剤の投与等、原因療法があればこれを行うこと。
- (5) 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。
- (6) 感染症を不顕性化するおそれがあるため、感染症を合併している患者に対し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。
- (7) 他の消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい。
- (8) 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(「高齢者への投与」及び「小児等への投与」の項参照)。

3. 相互作用

(1) 併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
シプロフロキサシン シプロキサシン	痙攣を起こすことがある。	シプロフロキサシンのGABA受容体結合阻害作用が併用により増強され、中枢神経系の興奮性を増大すると考えられる。

(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
ニューキノロン系抗菌剤(シプロフロキサシンは併用禁忌) エノキサシン水和物等	痙攣を起こすおそれがある。	ニューキノロン系抗菌剤のGABA受容体結合阻害作用が併用により増強され、中枢神経系の興奮性を増大すると考えられる。
メトトレキサート	メトトレキサートの作用が増強されることがあるので、必要があれば減量すること。	プロスタグランジン生合成阻害作用により腎血流量が減少し、メトトレキサートの腎排泄を減少させ、メトトレキサートの血中濃度を上昇させると考えられる。

薬 剤 名 等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
リチウム製剤 炭酸リチウム	リチウム中毒を起こすおそれがあるので、必要があれば減量すること。	プロスタグランジン生合成阻害作用によりリチウムの腎排泄を減少させ、リチウムの血中濃度を上昇させると考えられる。
クマリン系抗凝血剤 ワルファリン	抗凝血作用を増強することがあるため、必要があれば減量すること。	プロスタグランジン生合成阻害作用により血小板凝集が抑制されるため、また、ワルファリンの蛋白結合と競合し、遊離型ワルファリンが増加するためと考えられる。
血小板凝集抑制作用を有する薬剤 クロビドグレル	出血傾向を助長するおそれがある。	相互に作用を増強すると考えられる。
選択的セロトニン再取り込み阻害剤 (SSRI) フルボキサミン パロキセチン等	消化管出血のおそれがある。	相互に作用を増強すると考えられる。
チアジド系利尿剤 トリクロルメチアジド ヒドロクロロチアジド等	利尿・降圧作用を減弱させるおそれがある。	プロスタグランジン生合成阻害作用により、水、ナトリウムの体内貯留が生じ、利尿剤の水、ナトリウム排泄作用に拮抗するためと考えられる。
カリウム保持性利尿剤 スピロラクトン等	本剤との併用により、降圧作用の減弱、腎機能障害患者における重度の高カリウム血症が発現するおそれがある。	本剤の腎におけるプロスタグランジン生合成阻害によるためと考えられている。
エブレレノン		
ACE阻害剤 A-II受容体拮抗剤	腎機能が悪化している患者では、さらに腎機能が悪化するおそれがある。	機序不明

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用（頻度不明）

- * 1) ショック、アナフィラキシー：ショック、アナフィラキシー（蕁麻疹、呼吸困難等）があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) 中毒性表皮壊死症：中毒性表皮壊死症（Lyell症候群）があらわれることがあるので、観察を十分に行い、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。
- 3) 急性腎不全、ネフローゼ症候群：急性腎不全、ネフローゼ症候群があらわれることがあるので、定期的に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投与を中止すること。

(2) その他の副作用

	頻 度 不 明
過敏症 ^{注1)}	発疹、痒痒感等
消化器	消化性潰瘍 ^{注1)} 、胃腸出血 ^{注1)} 、悪心・嘔吐、胸やけ等
肝 臓	AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇等
血 液 ^{注2)}	貧血、顆粒球減少、白血球減少、血小板減少、血小板機能低下（出血時間の延長）等
精神神経系	めまい、眠気
その他	注射部位の痛み、硬結、浮腫等

注1) 発現した場合には、投与を中止すること。

注2) 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。

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、用量並びに投与間隔に留意するなど、慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- * (1) 妊婦（妊娠後期以外）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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
- * (2) 妊娠後期の女性には投与しないこと。[外国で妊娠後期の女性に投与したところ、胎児循環持続症(PFC)、胎児腎不全が起きたとの報告がある。]
- * (3) ケトプロフェンの外用剤を妊娠中期の女性に使用し、羊水過少症が起きたとの報告があるので、必要最小限の使用にとどめるなど慎重に使用すること。
- (4) 動物実験（ラット）で周産期投与による分娩遅延、妊娠末期投与による胎児の動脈管収縮が報告されている。
- * (5) 授乳中の女性に投与する場合には授乳を避けさせること。[授乳中の投与に関する安全性は確立していないが、動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。]

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

8. 適用上の注意

- (1) 投与経路：筋注にのみ使用すること。
- (2) 調製時：他剤との混合注射を避けることが望ましい。
- (3) 筋肉内投与時：
 - 1) 神経走行部位を避けるように注意して注射すること。
 - 2) 繰り返し注射する場合には、例えば左右交互に注射するなど、注射部位をかえて行うこと。
 - 3) 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり血液の逆流をみた場合には直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。
- (4) 保存時：本剤は光により白濁することがあるので、紙箱から取り出した際は、遮光して保存すること。なお、白濁が認められた場合は使用しないこと。
- (5) アンプルカット時：本剤はワンポイントアンプルであるが、アンプルカット部分をエタノール綿等で清拭し、カットすることが望ましい。

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。

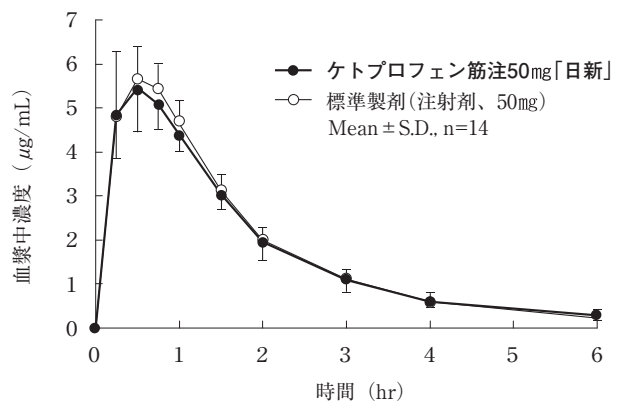
【薬物動態】

** 生物学的同等性試験¹⁾

ケトプロフェン筋注50mg「日新」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1管2.5mL(ケトプロフェンとして50mg)健康成人男子に絶食時単回臀部筋肉内投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両製剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₆ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ケトプロフェン筋注 50mg「日新」	10.77±1.01	5.63±0.95	0.54±0.17	1.23±0.21
標準製剤 (注射剤、50mg)	10.99±1.00	5.71±0.70	0.57±0.12	1.13±0.10

(Mean ± S.D., n=14)



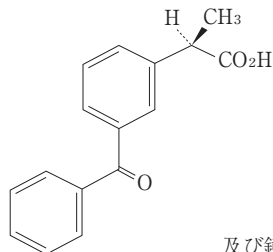
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

【薬効薬理】²⁾

ケトプロフェンは酸性非ステロイド性抗炎症薬(NSAIDs)である。プロスタグランジン生合成の律速酵素であるシクロオキシゲナーゼ(COX)を阻害し、プロスタグランジンの産生を抑制することにより、抗炎症作用、解熱作用、鎮痛作用をあらわす。構成型COX(COX-1)と誘導型COX(COX-2)に対する選択性はない。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ケトプロフェン (Ketoprofen)
化学名：(2RS)-2-(3-Benzoylphenyl)propanoic acid
分子式：C₁₆H₁₄O₃
分子量：254.28
構造式：



及び鏡像異性体

性状：本品は白色の結晶性の粉末である。メタノールに極めて溶けやすく、エタノール(95)又はアセトンに溶けやすく、水にほとんど溶けない。
本品のエタノール(99.5)溶液(1→100)は旋光性を示さない。
本品は光によって微黄色になる。

融点：94～97℃

【取扱い上の注意】

1. 取扱い上の注意

本品は直射日光や室内散光によってケトプロフェンの分解物を生じて白濁することがあるので、使用時まで遮光袋の状態で保存し、開封後も遮光袋に戻して保存すること。なお、白濁が認められた場合は使用しないこと。

**2. 安定性試験³⁾

ケトプロフェン筋注50mg「日新」は、最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、遮光・室温保存において3年間安定であることが推測された。また、最終包装製品を用いた長期保存試験(遮光・室温保存、3年)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、遮光・室温保存における3年間の安定性が確認された。

**【包装】

ケトプロフェン筋注50mg「日新」 (2.5mL) 50管

【主要文献】

- 1) 日新製薬株式会社 社内資料：生物学的同等性に関する資料
- 2) 第十六改正日本薬局方解説書, C-1609, 廣川書店(2011)
- 3) 日新製薬株式会社 社内資料：安定性に関する資料

【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。
日新製薬株式会社 安全管理部
〒994-0069 山形県天童市清池東二丁目3番1号
TEL 023-655-2131 FAX 023-655-3419
E-mail : d-info@yg-nissin.co.jp

製造販売元

 **日新製薬株式会社**

山形県天童市清池東二丁目3番1号