

日本標準商品分類番号	8 7 1 1 4 8	
	100mg	200mg
承認番号	15800AMZ00431000	15800AMZ00432000
薬師収載	1984年3月	1984年3月
販売開始	1984年3月	1984年3月
効能追加	1986年11月	1986年11月
再審査結果	1992年6月	

貯 法：遮光、室温保存
使用期限：包装に表示

非酸性消炎・鎮痛剤

ペントイル錠100mg

ペントイル錠200mg

Pentoil Tablets 100mg・200mg

** 日本薬局方 エモルファゾン錠

 **SANDOZ**

【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〔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〔血液異常を悪化させるおそれがある。〕
- (3)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。〕
- (4)重篤な腎障害のある患者〔腎障害を悪化させるおそれがある。〕
- (5)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人（「5.妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）
- (6)本剤の成分に対し過敏症の患者

***【組成・性状】**

販売名	ペントイル錠100mg	ペントイル錠200mg				
有効成分	日局 エモルファゾン					
含量 （1錠中）	100mg	200mg				
添加物	乳糖水和物、バレイシヨデンブ、結晶セルロース、カルメロースナトリウム、タルク、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール1500、カルナウバロウ					
色・剤形 （又は性状）	白色のフィルムコーティング錠					
外形	表	裏	側面	表	裏	側面
						
大きさ	直径	7.1mm	9.1mm			
	厚さ	3.0mm	4.2mm			
重量	135mg	270mg				
識別コード(PTP)	MM718	MM719				

【効能又は効果】

1. 下記疾患並びに症状の消炎・鎮痛
腰痛症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、変形性関節症、会陰裂傷
2. 手術後並びに外傷後の消炎・鎮痛

【用法及び用量】

1. ペントイル錠100mg
通常成人には1回2錠、1日3回経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。
2. ペントイル錠200mg
通常成人には1回1錠、1日3回経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

【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〔消化性潰瘍が再発するおそれがある。〕
 - (2)過敏症の既往歴のある患者
 - (3)高齢者（「4.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)患者の状態を十分観察し、副作用の発現に留意すること。
 - (3)慢性疾患（変形性関節症等）に対し本剤を使用する場合には、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、休薬等の適切な処置を講ずること。
 - 2)薬物療法以外の療法も考慮すること。
 - (4)術後又は外傷後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)疼痛の程度を考慮し、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。
 - (5)感染症を不顕性化するおそれがあるので、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、観察を十分に行い慎重に投与すること。
 - (6)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。
 - (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. 副作用

総症例13,475例中、509例(3.78%)に副作用が認められ、主な副作用は胃部不快感221件(1.64%)、食欲不振94件(0.70%)、悪心・嘔吐90件(0.67%)、胃痛63件(0.47%)、胸やけ54件(0.40%)、発疹24件(0.18%)等であった。（再審査終了時）

種類	副作用発現頻度	
	0.1～5%未満	0.1%未満
消化器	胃部不快感、食欲不振、悪心・嘔吐、胃痛、胸やけ、下痢等	口渇、口内のあれ、便秘、舌あれ、口内炎、心窩部痛等
肝臓 ^{注1)}		AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇等
過敏症 ^{注2)}	発疹	痒痒等
精神神経系		眠気、頭痛、めまい、ふらつき等
循環器		心悸亢進、胸痛等

注1)異常が認められた場合には投与を中止すること。
注2)このような場合には投与を中止すること。

4. 高齢者への投与

高齢者では副作用があらわれやすいので、少量から投与を開始するなど、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。

(2) 授乳中の投与に関する安全性は確立していないので、授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。

6. 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（使用経験が少ない）。

7. 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、さらには穿孔を起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。]

【薬物動態】

健康成人男子に経口投与したとき、血中濃度は30分～1時間後に最高に達し、生物学的半減期は105分である。また、投与後24時間以内に総投与量の70～80%が尿中へ排泄され、そのうち約80%（投与量の約60%）は5位モルホリノ基が酸化的に開裂した5-(N-カルボキシメチル-N-2ヒドロキシエチルアミノ)-4-エトキシ-2-メチル-3(2H)-ピリダジノンである。¹⁾

【臨床成績】

下記の疾患並びに症状に対する二重盲検比較試験を含む臨床試験は以下の通りである。^{2)~7)}

1. 腰痛症

対象患者337症例中「中等度改善」以上は61.8%、「軽度改善」以上は87.3%であり、二重盲検比較試験等で本剤の有用性が認められている。

2. 頸肩腕症候群

対象患者71症例中「中等度改善」以上は66.2%、「軽度改善」以上は87.3%であり、二重盲検比較試験等で本剤の有用性が認められている。

3. 肩関節周囲炎

対象患者127症例中「中等度改善」以上は57.4%、「軽度改善」以上は90.5%であり、二重盲検比較試験等で本剤の有用性が認められている。

4. 変形性関節症

対象患者166症例中「中等度改善」以上は51.2%、「軽度改善」以上は75.3%であり、二重盲検比較試験等で本剤の有用性が認められている。

5. 会陰裂傷

対象患者128症例中「中等度改善」以上は47.7%、「軽度改善」以上は89.1%であり、二重盲検比較試験等で本剤の有用性が認められている。

6. 手術後

対象患者353症例中「中等度改善」以上は68.6%、「軽度改善」以上は93.8%であり、二重盲検比較試験等で本剤の有用性が認められている。

7. 外傷後

対象患者252症例中「中等度改善」以上は71.4%、「軽度改善」以上は95.6%であり、二重盲検比較試験等で本剤の有用性が認められている。

【薬効薬理】

1. 作用機序^{8),9)}

本剤は血管壁安定化作用により血管透過性亢進を抑制し、白血球の遊走を抑制するほか、特にキニンの遊離を抑制し、また発痛物質ブラジキニンの発痛作用に拮抗することが認められている。なお、本剤にはプロスタグランジン生合成阻害作用は認められない。

2. 薬理^{10),11)}

(1) 鎮痛作用

マウス、ラット、ウサギ及びイヌを用いた機械的刺激法(Haffner法、Randall-Selitto法)、熱刺激法(熱板法)、電気刺激法及び化学的刺激法(酢酸ストレッチング法、ブラジキニン動脈内注射法)等の実験において鎮痛効果が認められている。

また、ヒトでの指先電気刺激法による試験で鎮痛効果が認められている。

(2) 抗炎症作用

各種起炎物質によるラットの急性足浮腫、酢酸によるマウスの血管透過性亢進、抗ラット・ウサギ血清によるラットの皮膚浮腫に対し抑制効果が認められている。

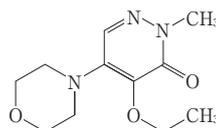
また、マスタードによるラットの持続性浮腫、CMCの用法によるラットの白血球遊走及び蛋白浸出に対して抑制効果が認められている。

(3) 解熱作用

ビール酵母によるラット発熱に対し、解熱効果が認められている。

*【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：エモルファゾン (Emorfazone)

化学名：4-Ethoxy-2-methyl-5-(morpholin-4-yl)pyridazin-3(2H)-one

分子式：C₁₁H₁₇N₃O₃

分子量：239.27

性状：無色の結晶又は白色～淡黄色の結晶性の粉末である。

エタノール(99.5)に極めて溶けやすく、水又は無水酢酸に溶けやすい。

1 mol/L塩酸試液に溶ける。

光によって徐々に黄色となり、分解する。

融点：89～92℃(乾燥後)

【包装】

ベントイル錠100mg：1000錠(PTP)

ベントイル錠200mg：100錠(PTP)

1000錠(PTP)

【主要文献】

- 1) 関隆他：臨床薬理 9(2), 149(1978)
- 2) 景山孝正他：診療と新薬 17(7), 1761(1980)
- 3) 景山孝正他：診断と治療 71(5), 1111(1983)
- 4) 景山孝正他：臨床と研究 62(7), 2335(1985)
- 5) 尾崎公巳：産婦人科の世界 32(5), 517(1980)
- 6) 吉雄敏文他：薬理と治療 8(1), 102(1980)
- 7) 井上駿一他：基礎と臨床 14(6), 1625(1980)
- 8) 佐藤誠他：Arzneim.-Forsch. 32(4), 379(1982)
- 9) 佐藤誠他：Arch. Int. Pharmacodyn. 257, 200(1982)
- 10) 佐藤誠他：日薬理誌 74, 841(1978)
- 11) 佐藤誠他：日薬理誌 75, 127(1979)

***【文献請求先】**

サンド株式会社 カスタマーケアグループ

〒106-0031 東京都港区西麻布4-16-13

 **0120-982-001**

FAX 03-5469-0366

製造販売元

サンド株式会社

山形県上山市新金谷827-7

URL:<http://www.sandoz.jp>