

抗リウマチ剤

処方箋医薬品*

アクタリット錠 100mg「サワイ」

ACTARIT

アクタリット錠

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示

日本標準商品分類番号
871149

承認番号	21700AMZ00800000
薬価収載	2006年7月
販売開始	2006年7月

※注意 - 医師等の処方箋により使用すること

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人、授乳婦(妊婦、産婦、授乳婦等への投与)の項参照(妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。)


【組成・性状】

組成

アクタリット錠100mg「サワイ」は、1錠中にアクタリット100mgを含有する。

添加物として、カルナウバロウ、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、トウモロコシデンプン、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、マクロゴール6000を含有する。

製剤の性状

剤形	外形 直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)	性状
フィルムコーティング錠	 7.6 約181 4.2 [識別コード：SW ACT]	白色

【効能・効果】

関節リウマチ

【用法・用量】

通常、他の消炎鎮痛剤等とともに、アクタリットとして成人1日300mgを3回に分経口投与する。

【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)

- 腎障害又はその既往歴のある患者(腎障害が悪化するおそれがある。)
- 肝障害のある患者(肝障害が悪化するおそれがある。)
- 消化性潰瘍又はその既往歴のある患者(消化性潰瘍が悪化するおそれがある。)

2. 重要な基本的注意

- 本剤の投与に際しては、関節リウマチの治療法に十分精通し、患者の病態並びに副作用の出現に注意しながら使用すること。
- 本剤は鎮痛消炎作用を持たないため従来より投与している消炎鎮痛剤等を併用すること。ただし、本剤を6ヵ月間継続投与しても効果があらわれない場合は投与を中止すること。
- 本剤は比較的発症早期の関節リウマチ患者に使用することが望ましい。
- 本剤投与中は臨床症状を十分観察するとともに、定期的に臨床検査(血液検査、肝機能・腎機能検査等)を行うこと。

3. 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)

- ネフローゼ症候群**：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、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 間質性肺炎**：発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常を伴う間質性肺炎があらわれることがあるので、患者の状態を十分に観察し、このような症状があらわれた場合には、投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤投与等の適切な処置を行うこと。
- 再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少**：再生不良性貧血、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少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、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 肝機能障害**：AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-Pの上昇等を伴う肝機能障害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、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 消化性潰瘍、出血性大腸炎**：消化性潰瘍(出血を伴うことがある)、出血性大腸炎があらわ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、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

2) 重大な副作用(頻度不明)

他の抗リウマチ剤で、急性腎不全、肺線維症、天疱瘡様症状が報告されているので、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、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

3) その他の副作用

	頻度不明
腎臓 ^{注)}	腎機能異常(蛋白尿、BUN、クレアチニン、尿中NAGの上昇等)、血尿
肝臓	肝機能異常(AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-Pの上昇等)
血液	貧血、血小板減少、白血球減少、顆粒球減少
消化器	腹痛、嘔気・嘔吐、口内炎、舌炎、食欲不振、消化不良、下痢、胃潰瘍、口内乾燥、口唇腫脹
皮膚	発疹、痒痒感、湿疹、蕁麻疹、脱毛、紅斑性発疹
精神神経系	頭痛、めまい、しびれ感、傾眠
その他	浮腫、倦怠感、発熱、耳鳴、視力異常、複視、味覚異常、動悸

注) 異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

4. 高齢者への投与

本剤は主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため高い血中濃度が持続するおそれがあるので、低用量(例えば1回1錠1日2回)から投与を開始するなど注意すること。なお、定期的に臨床症状の観察、臨床検査(肝機能・腎機能検査等)を行い、異常が認められた場合には、減量か又は休薬等の適切な処置を行うこと。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 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。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、動物実験(ラット)で胎児への移行が認められている。〕
- 2) 授乳中の婦人には投与しないこと。〔動物実験(ラット)で乳汁中への移行が認められている。〕

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、更には穿孔をお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】

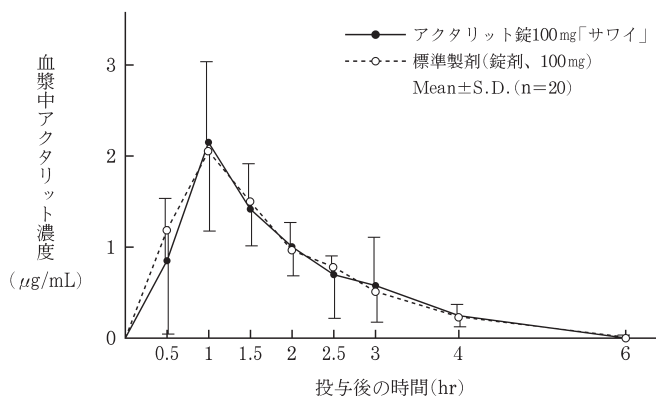
1. 生物学的同等性試験

アクタリット錠100mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(アクタリットとして100mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中アクタリット濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、 C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。¹⁾

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C_{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	AUC 0-6hr ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)
アクタリット錠100mg「サワイ」	2.32±0.71	1.2±0.5	0.9±0.1	3.87±0.52
標準製剤(錠剤、100mg)	2.48±0.60	1.1±0.6	0.9±0.2	3.99±0.55

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびにAUC、 C_{max} 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。

2. 溶出挙動

本製剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

関節リウマチに關するⅢ型、Ⅳ型アレルギー反応を抑制する。主として胸腺中の前駆Tリンパ球に作用することによりサブレッサーTリンパ球の分化誘導を促進し、サブレッサーTリンパ球を増加させ、Bリンパ球が形質細胞に分化する過程を抑制することによって考えられている。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名: アクタリット (Actarit)

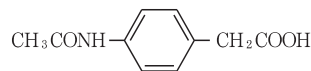
化学名: 4-Acetylamino phenylacetic acid

分子式: $\text{C}_{10}\text{H}_{11}\text{NO}_3$

分子量: 193.20

融点: 164~177℃

構造式:



性状: アクタリットは白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味はわずかに酸味がある。メタノールに溶けやすく、エタノール(95)又はエタノール(99.5)にやや溶けやすく、アセトンにやや溶けにくく、水に溶けにくい。旋光性を示さない。

【取扱い上の注意】

- ・安定性試験
PTP包装したものをを用いた長期保存試験(室温、3年間)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。²⁾

**【包装】

PTP: 100錠(10錠×10)

【主要文献及び文献請求先】

・主要文献

- 1) 水山和之他, 診療と新薬, 43(5), 515(2006).
- 2) 沢井製薬(株)社内資料 [安定性試験]

・文献請求先 [主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい]

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL: 0120-381-999 FAX: 06-6394-7355

* 製造販売元

沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K06 A150506