

貯法：室温保存

有効期間：3年

| | 250mg | 500mg |
|------|------------------|------------------|
| 承認番号 | 22400AMX00091000 | 22400AMX00092000 |
| 販売開始 | 1985年5月 | 1985年5月 |

解熱剤

処方箋医薬品^注

日本薬局方 スルピリン注射液

スルピリン注射液250mg 「日医工」

スルピリン注射液500mg 「日医工」

Sulpyrine Injection

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

1. 警告

ショック等の重篤な副作用が発現することがあるので、「4.効能又は効果」、「2.禁忌」、「8.重要な基本的注意」、「9.特定の背景を有する患者に関する注意」に特に留意すること。[11.1.1 参照]

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 本剤の成分又はピラゾロン系化合物に対し過敏症の既往歴のある患者
- 先天性G-6PD欠乏症の患者〔海外で溶血性貧血が発現したとの報告がある。〕
- 消化性潰瘍のある患者〔PG合成抑制により胃の血流量が減少し、消化性潰瘍が悪化することがある。〕
- 重篤な血液の異常のある患者 [9.1.2 参照]
- 重篤な肝機能障害のある患者 [9.3.1 参照]
- 重篤な腎機能障害のある患者 [9.2.1 参照]
- 重篤な心機能不全のある患者〔重篤な副作用（ショック等）が発現した場合、極めて危険な状態にいたるおそれがある。〕 [9.1.4、11.1.1 参照]
- 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〔発作を誘発させることがある。〕

3. 組成・性状

3.1 組成

| 販売名 | スルピリン注射液 250mg 「日医工」 | スルピリン注射液 500mg 「日医工」 |
|------|--|--|
| 有効成分 | 1管 (1mL) 中 スルピリン水和物 250mg | 1管 (2mL) 中 スルピリン水和物 500mg |
| 添加剤 | 1管中 亜硫酸水素ナトリウム 2mg、ベンジルアルコール 15mg | 1管中 亜硫酸水素ナトリウム 4mg、ベンジルアルコール 30mg |

3.2 製剤の性状

| 販売名 | スルピリン注射液 250mg 「日医工」 | スルピリン注射液 500mg 「日医工」 |
|-------|-------------------------|-------------------------|
| 剤形・性状 | 水性注射液 無色～微黄色澄明の液 | |
| pH | 5.0～8.5 | |
| 浸透圧比 | 約7 (生理食塩液に対する比) | |

4. 効能又は効果

他の解熱剤では効果が期待できないか、あるいは他の解熱剤の投与が不可能な場合の緊急解熱

6. 用法及び用量

スルピリン水和物として、通常、成人1回0.25g、症状により最大0.5gを皮下又は筋肉内に注射する。症状の改善が認められない時には1日2回を限度として皮下又は筋肉内に注射する。経口投与、直腸内投与が可能になった場合にはすみやかに経口投与又は直腸内投与にきりかえること。長期連用は避けるべきである。

7. 用法及び用量に関連する注意

他の解熱鎮痛消炎剤との併用は避けることが望ましい。

8. 重要な基本的注意

- 本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。
- 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、特に高熱を伴う高齢者及び小児等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。[9.7.1、9.8.1、9.8.2 参照]
- 急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。
 - 発熱の程度を考慮し投与すること。
 - 同一の薬剤の長期投与を避けること。（原則として5日以内に限ること。）
 - 原因療法があればこれを行うこと。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

- 合併症・既往歴等のある患者
 - 消化性潰瘍の既往歴のある患者
消化性潰瘍が再発することがある。
 - 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）
再生不良性貧血、無顆粒球症等の血液障害があらわれるおそれがある。[2.4、11.1.3 参照]
 - 出血傾向のある患者
血小板機能異常があらわれることがある。
 - 心機能異常のある患者（重篤な心機能不全のある患者を除く）
症状が悪化するおそれがある。[2.7 参照]
 - 気管支喘息のある患者（アスピリン喘息のある患者を除く）
喘息発作を誘発するおそれがある。
 - 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こと。感染症を不顕性化するおそれがある。
- 腎機能障害患者
 - 重篤な腎機能障害のある患者
投与しないこと。症状が悪化するおそれがある。[2.6 参照]
 - 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）
症状が悪化又は再発するおそれがある。
- 肝機能障害患者
 - 重篤な肝機能障害のある患者
投与しないこと。症状が悪化するおそれがある。[2.5 参照]
 - 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）
症状が悪化又は再発するおそれがある。

* 9.5 妊婦

9.5.1 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こと。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こと。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。妊娠後期に投与したところ、胎児循環持続症（PFC）が起きたとの報告がある。妊娠後期のラット

に投与した実験で、弱い胎児の動脈管収縮が報告されている。また、動物実験（マウス）で催奇形作用が報告されている。

9.6 授乳婦

授乳を避けさせること。ヒト母乳中へ移行することがある。

9.7 小児等

9.7.1 小児等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。[8.2、14.1.1 参照]

9.7.2 低出生体重児、新生児に使用する場合には十分注意すること。外国において、ベンジルアルコールの静脈内大量投与（99～234mg/kg）により、中毒症状（あえぎ呼吸、アシドーシス、痙攣等）が低出生体重児に発現したとの報告がある。本剤は添加剤としてベンジルアルコールを含有している。

9.8 高齢者

9.8.1 高齢者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。[8.2、14.1.1 参照]

9.8.2 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。副作用があらわれやすい。[8.2、14.1.1 参照]

10. 相互作用

10.2 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 |
|--|-------------------------|--|
| リチウム | リチウム中毒があらわれるおそれがある。 | PG合成抑制によりリチウムの腎排泄が減少し、血中濃度が上昇すると考えられている。 |
| チアジド系利尿薬 トリクロルメチアジド、 ヒドロクロロチアジド等 | これらの薬剤の利尿作用を減弱するおそれがある。 | PG合成抑制により、水、塩類の排泄を抑制すると考えられている。 |

11. 副作用

次の副作用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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック（頻度不明）

胸内苦悶、血圧低下、顔面蒼白、脈拍異常、呼吸困難等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。[1、2.7 参照]

11.1.2 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）、剥脱性皮膚炎（いずれも頻度不明）

11.1.3 再生不良性貧血、無顆粒球症（いずれも頻度不明）
[9.1.2 参照]

11.1.4 黄疸（頻度不明）

11.1.5 急性腎障害（頻度不明）

急性間質性腎炎等により、乏尿、血尿等の症状及び尿蛋白、BUN・血中クレアチニン上昇、高カリウム血症等の検査所見が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.2 その他の副作用

| | 0.1～5%未満 | 0.1%未満 |
|-----|--------------------------|-----------------------------|
| 過敏症 | 発疹・紅斑、浮腫、小疱性角膜炎、結膜炎、そう痒等 | |
| 血液 | | 貧血、血小板減少、血小板機能の低下（出血時間の延長）等 |
| 肝臓 | | AST上昇、ALT上昇、ALP上昇等 |
| 消化器 | 胃痛、食欲不振、悪心・嘔吐、下痢 | |
| その他 | 頭痛、倦怠感 | |

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

14.1.1 低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児、高齢者、衰弱者に投与する場合には、5w/v%ブドウ糖液又は注射用水で適宜希釈し注射すること。[9.7.1、9.8.1、9.8.2 参照]

14.2 薬剤投与時の注意

14.2.1 皮下・筋肉内投与後、神経麻痺又は硬結等をきたすことがあるので、下記のことには注意すること。なお、低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児、高齢者、衰弱者においては、特に注意すること。

(1) 注射部位については、神経走行部位（特に橈骨神経、尺骨神経、坐骨神経等）を避けて慎重に投与すること。

(2) くりかえし注射する場合には、同一注射部位を避けること。な

お、低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児においては連用しないことが望ましい。

(3) 注射針刺入時、激痛を訴えたり、血液の逆流を見た場合は、直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。

15. その他の注意

15.1 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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 血漿中濃度の推移（海外データ）

成人男性にスルピリン水和物1.0gを大殿筋筋内投与した場合、血漿中に未変化体は検出されず、代謝物である4-methylaminoantipyrine、4-aminoantipyrine、4-acetylaminoantipyrineが検出された。

これらの最高血漿中濃度は、4-methylaminoantipyrineで投与1時間後に $12.0 \pm 2.3 \mu\text{g}/\text{mL}$ 、4-aminoantipyrineで投与4時間後に $1.9 \pm 0.7 \mu\text{g}/\text{mL}$ 、また、4-acetylaminoantipyrineで投与8時間後に $1.1 \pm 0.7 \mu\text{g}/\text{mL}$ であった¹⁾。

16.4 代謝

16.4.1 薬物の肝代謝に関与するチトクロームP450分子種（海外データ）
CYP2B²⁾

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

スルピリン水和物は、プロスタグランジン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、解熱作用を現す³⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：スルピリン水和物（Sulpyrine Hydrate）

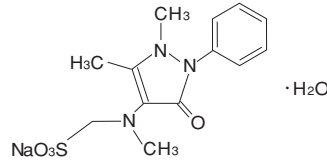
化学名：Monosodium[(1,5-dimethyl-3-oxo-2-phenyl-2,3-dihydro-1H-pyrazol-4-yl)(methylamino)] methanesulfonate monohydrate

分子式： $\text{C}_{13}\text{H}_{16}\text{N}_3\text{NaO}_4\text{S} \cdot \text{H}_2\text{O}$

分子量：351.35

性状：白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。水に極めて溶けやすく、エタノール（95）に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。光によって着色する。

化学構造式：



20. 取扱い上の注意

外箱開封後は遮光して保存すること。

22. 包装

（スルピリン注射液250mg「日医工」）

1mL×50管

（スルピリン注射液500mg「日医工」）

2mL×50管

23. 主要文献

- 1) Weiss R, et al : Arzneimittelforschung. 1974 ; 24 (3) : 345-348
- 2) Kraul H, et al : Eur. J. Clin. Pharmacol. 1991 ; 41 (5) : 475-480
- 3) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店 2021 : C2612-C2616

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

TEL (0120) 517-215

FAX (076) 442-8948

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

 **日医工株式会社**
NICHIKO 富山市総曲輪1丁目6番21