

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

尿酸排泄薬

※ **ベンズブロマロン錠25mg「NM」**

※ **ベンズブロマロン錠50mg「NM」**

Benzbromarone Tab. 25mg「NM」・50mg「NM」

(ベンズブロマロン錠)

	錠25mg	錠50mg
※ 承認番号	23000AMX00892	23000AMX00893
※ 薬価収載	2019年6月	
販売開始	2001年10月	

貯 法：遮光、室温保存
 使用期限：容器に表示の使用期限内
 に使用すること

【警告】




- (1)劇症肝炎等の重篤な肝障害が主に投与開始6ヶ月以内に発現し、死亡等の重篤な転帰に至る例も報告されているので、投与開始後少なくとも6ヶ月間は必ず、定期的に肝機能検査を行うこと。また、患者の状態を十分観察し、肝機能検査値の異常、黄疸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)副作用として肝障害が発生する可能性があることをあらかじめ患者に説明するとともに、食欲不振、悪心・嘔吐、全身倦怠感、腹痛、下痢、発熱、尿濃染、眼球結膜黄染等があらわれた場合には、本剤の服用を中止し、直ちに受診するよう患者に注意を行うこと。

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】




- (1)肝障害のある患者〔肝障害を悪化させることがある。〕
- (2)腎結石を伴う患者、高度の腎機能障害のある患者〔尿中尿酸排泄量の増大により、これらの症状を悪化させるおそれがある。また、効果が期待できないことがある。〕
- (3)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)
- (4)本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

※ **【組成・性状】**

※ **ベンズブロマロン錠25mg「NM」**

成分・含量 (1錠中)		日本薬局方 ベンズブロマロン25mg含有					
添加物		乳糖水和物、カルメロースカルシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム					
外形			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)	色調 剤形	識別 コード
表面	裏面	側面					
			6.5	2.2	100	白 素 錠	TKS 258

※ **ベンズブロマロン錠50mg「NM」**

成分・含量 (1錠中)		日本薬局方 ベンズブロマロン50mg含有					
添加物		乳糖水和物、バレイショデンプン、結晶セルロース、カルメロースカルシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム					
外形			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)	色調 剤形	識別 コード
表面	裏面	側面					
			7.0	2.4	120	白 割線入り 素 錠	TKS 257

【効能・効果】

下記の場合における高尿酸血症の改善
 痛風、高尿酸血症を伴う高血圧症

※ **【用法・用量】**

※ **ベンズブロマロン錠25mg「NM」**

1. 痛風

通常成人1日1回1錠または2錠(ベンズブロマロンとして25mgまたは50mg)を経口投与し、その後維持量として1回2錠を1日1～3回(ベンズブロマロンとして50～150mg)経口投与する。
 なお、年齢、症状により適宜増減する。

2. 高尿酸血症を伴う高血圧症

通常成人1回2錠を1日1～3回(ベンズブロマロンとして50～150mg)経口投与する。
 なお、年齢、症状により適宜増減する。

※ **ベンズブロマロン錠50mg「NM」**

1. 痛風

通常成人1日1回1/2錠または1錠(ベンズブロマロンとして25mgまたは50mg)を経口投与し、その後維持量として1回1錠を1日1～3回(ベンズブロマロンとして50～150mg)経口投与する。
 なお、年齢、症状により適宜増減する。

2. 高尿酸血症を伴う高血圧症

通常成人1回1錠を1日1～3回(ベンズブロマロンとして50～150mg)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. 重要な基本的注意

(1)投与開始前に肝機能検査を実施し、肝障害のないことを確認すること。(「禁忌」の項参照)

- (2)本剤の投与にあたっては、重篤な肝障害が主に投与開始6ヶ月以内に発現しているため、投与開始後少なくとも6ヶ月間は必ず定期的な検査を行うこと。また、投与開始後6ヶ月以降も定期的に肝機能検査を行うこと。〔「警告」の項参照〕
- (3)急性痛風発作がおさまるまで、本剤の投与を開始しないこと。
- (4)本剤の血中尿酸低下作用は著しく、本剤の投与初期に痛風発作を誘発することがある。
- (5)尿が酸性の場合、患者に尿酸結石及びこれに由来する血尿、腎仙痛等の症状を起こしやすいので、これを防止するため、水分の摂取による尿量の増加及び尿のアルカリ化を図ること。
- なお、この場合には、患者の酸・塩基平衡に注意すること。

2. 相互作用

本剤は、主として肝代謝酵素CYP2C9によって代謝される。また、CYP2C9の阻害作用をもつ。

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
クマリン系抗凝血薬 ワルファリン	クマリン系抗凝血薬の作用を増強することがあるので、プロトロンビン時間を測定するなど観察を十分に行い、注意すること。	本剤は、CYP2C9を阻害するため、CYP2C9によって代謝されるクマリン系抗凝血薬の血中濃度を上昇させるなどの機序が考えられる。
抗結核薬 ピラジナミド	本剤の効果が減弱することがある。	ピラジナミドが腎尿細管における尿酸の分泌を抑制することが知られているため、本剤の効果が減弱することが考えられる。
サリチル酸製剤 アスピリン	本剤の効果が減弱することがある。	サリチル酸製剤は尿酸の排泄を抑制することが知られているため、本剤の効果が減弱することが考えられる。

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)

重篤な肝障害 劇症肝炎等の重篤な肝障害、黄疸があらわれることがあるので、定期的に肝機能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し、適切な処置を行うこと。〔「警告」の項参照〕

(2)その他の副作用

	頻度不明
1)過敏症 ^(注1)	そう痒感、発疹、蕁麻疹、顔面発赤、紅斑、光線過敏症
2)肝臓 ^(注2)	AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-Pの上昇、黄疸
3)消化器	胃部不快感、胃腸障害、下痢、軟便、胸やけ、胃痛、腹痛、悪心、口内の荒れ
4)その他	浮腫、心窩部不快感、頭痛

注1)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。

注2)このような症状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。〔「警告」の項参照〕

4. 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ため減量するなど注意すること。

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。〔動物実験で催奇形作用が報告されている。〕
- (2)授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、やむを得ず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。〕

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、更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。〕

8. その他の注意

ラットに長期間経口投与〔50mg/kg/day(臨床用量の約17倍)、104週間〕したところ、肝細胞癌が発生したとの報告がある。

*【薬物動態】

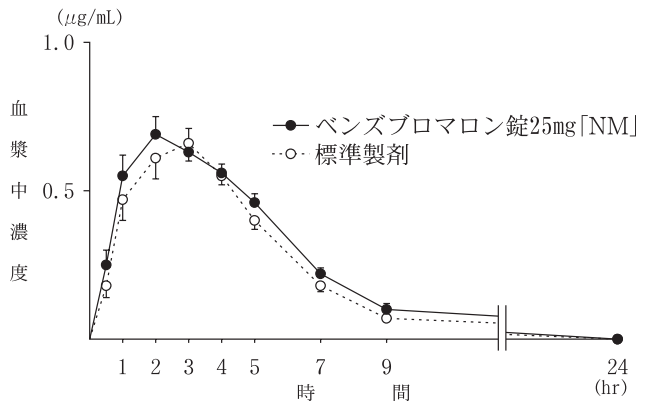
*1. 生物学的同等性試験

ベンズプロマロン錠25mg〔NM〕と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(ベンズプロマロンとして25mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して、血漿中未変化体濃度を測定した。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、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。

薬物動態パラメータ

	AUC _{0-24hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)
ベンズプロマロン錠 25mg〔NM〕	4.40 \pm 0.17	0.80 \pm 0.04	2.7 \pm 0.3
標準製剤	3.83 \pm 0.24	0.75 \pm 0.05	3.0 \pm 0.2

(Mean \pm S. E., n=20)



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。

*2. 溶出挙動

ベンズプロマロン錠25mg〔NM〕及びベンズプロマロン錠50mg〔NM〕は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたベンズプロマロン錠の溶出規格に適合していることが確認されている²⁾³⁾。

【薬効薬理】

尿酸排泄促進薬。尿管における尿酸の再吸収を阻害して尿酸排泄を促進する。この作用は尿酸に選択的である。臨床的には、痛風及び高尿酸血症を伴う高血圧に用いられる⁴⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

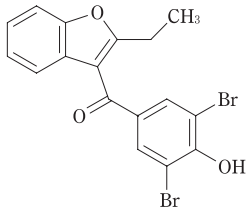
一般名：〔日局〕ベンズブロマロン(Benzbromarone)

化学名：3, 5-Dibromo-4-hydroxyphenyl 2-ethylbenzo[*b*]furan-3-yl ketone

分子式：C₁₇H₁₂Br₂O₃

分子量：424.08

構造式：



性状：本品は白色～淡黄色の結晶性の粉末である。

本品は*N,N*-ジメチルホルムアミドに極めて溶けやすく、アセトンに溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

本品は希水酸化ナトリウム試液に溶ける。

融点：149～153℃

※【取扱い上の注意】

※安定性試験

最終包装製品を用いて長期保存試験(室温、3年間)を実施した結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、ベンズブロマロン錠25mg〔NM〕及びベンズブロマロン錠50mg〔NM〕は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⁵⁾⁶⁾。

※【包装】

※ベンズブロマロン錠25mg〔NM〕 PTP 100錠(10錠×10)
1000錠(10錠×100)

※ベンズブロマロン錠50mg〔NM〕 PTP 100錠(10錠×10)
1000錠(10錠×100)

【主要文献】

- 1) 社内資料：ベンズブロマロン錠25mg〔NM〕の生物学的同等性試験 (NM0019)
- 2) 社内資料：ベンズブロマロン錠25mg〔NM〕の溶出試験 (NM0020)
- 3) 社内資料：ベンズブロマロン錠50mg〔NM〕の溶出試験 (NM0021)
- 4) 第十六改正日本薬局方解説書 C-4558、廣川書店
- 5) 社内資料：ベンズブロマロン錠25mg〔NM〕の長期保存試験 (NM0252)
- 6) 社内資料：ベンズブロマロン錠50mg〔NM〕の長期保存試験 (NM0253)

※※【文献請求先及び問い合わせ先】

「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ください。

ヴィアトリス製薬株式会社 メディカルインフォメーション部
〒105-0001 東京都港区虎ノ門5丁目11番2号
フリーダイヤル 0120-419-043

※※製造販売元
シオノギファーマ株式会社
大阪府摂津市三島2丁目5番1号

※※販売元
ヴィアトリス製薬株式会社
東京都港区虎ノ門5丁目11番2号