

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018(2019年更新版)に準拠して作成

鎮痛・抗炎症・解熱剤

日本薬局方 ロキソプロフェンナトリウム錠

ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」

ロキソプロフェンナトリウム細粒

ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」

LOXOPROFEN Na Tablets, Fine Granules [SAWAI]

剤形	錠60mg : 割線入り素錠 細粒10% : 細粒剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	錠60mg : 1錠中日局ロキソプロフェンナトリウム水和物68.1mg(無水物として60mg)含有 細粒10% : 1g中日局ロキソプロフェンナトリウム水和物113.4mg(無水物として100mg)含有
一般名	和名 : ロキソプロフェンナトリウム水和物(JAN) 洋名 : Loxoprofen Sodium Hydrate(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日 : 2011年12月14日(販売名変更) 薬価基準収載年月日 : 2012年12月14日(販売名変更) 販売開始年月日 : 1998年7月10日
製造販売(輸入)・提携・販売会社名	発売元 : 沢井製薬株式会社 製造販売元 : メディサ新薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL : 0120-381-999、FAX : 06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト : https://med.sawai.co.jp/

本IFは2024年10月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書(以下、添付文書)がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020年4月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	26
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	26
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	26
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	26
4. 適正使用に関して周知すべき特性	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	26
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	5. 重要な基本的注意とその理由	26
6. RMPの概要	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	27
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	28
1. 販売名	3	8. 副作用	29
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	31
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	31
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	31
5. 化学名(命名法)又は本質	3	12. その他の注意	31
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	IX. 非臨床試験に関する項目	32
III. 有効成分に関する項目	4	1. 薬理試験	32
1. 物理化学的性質	4	2. 毒性試験	32
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	X. 管理的事項に関する項目	33
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	1. 規制区分	33
IV. 製剤に関する項目	5	2. 有効期間	33
1. 剤形	5	3. 包装状態での貯法	33
2. 製剤の組成	6	4. 取扱い上の注意	33
3. 添付溶解液の組成及び容量	6	5. 患者向け資材	33
4. 力価	6	6. 同一成分・同効薬	33
5. 混入する可能性のある夾雑物	6	7. 国際誕生年月日	33
6. 製剤の各種条件下における安定性	6	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日	34
7. 調製法及び溶解後の安定性	8	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等 の年月日及びその内容	34
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	34
9. 溶出性	8	11. 再審査期間	34
10. 容器・包装	12	12. 投薬期間制限に関する情報	34
11. 別途提供される資材類	12	13. 各種コード	35
12. その他	13	14. 保険給付上の注意	35
V. 治療に関する項目	14	XI. 文献	36
1. 効能又は効果	14	1. 引用文献	36
2. 効能又は効果に関連する注意	14	2. その他の参考文献	37
3. 用法及び用量	14	XII. 参考資料	38
4. 用法及び用量に関連する注意	14	1. 主な外国での発売状況	38
5. 臨床成績	14	2. 海外における臨床支援情報	38
VI. 薬効薬理に関する項目	18	XIII. 備考	39
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	18	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たっての参考情報	39
2. 薬理作用	18	2. その他の関連資料	40
VII. 薬物動態に関する項目	19		
1. 血中濃度の推移	19		
2. 薬物速度論的パラメータ	23		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	24		
4. 吸収	24		
5. 分布	24		
6. 代謝	24		
7. 排泄	25		
8. トランスポーターに関する情報	25		
9. 透析等による除去率	25		
10. 特定の背景を有する患者	25		
11. その他	25		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ロキソプロフェンNa錠60mg／細粒10%「サワイ」は、日局ロキソプロフェンナトリウム水和物を含有する鎮痛・抗炎症・解熱剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

	ケンタン錠(旧販売名)	ケンタン細粒(旧販売名)
承認申請に際し準拠した通知名	昭和55年5月30日 薬発第698号	
承認	1997年5月	1998年1月
上市	1998年7月	

「急性上気道炎(急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む)の解熱・鎮痛」の効能又は効果が、ケンタン錠は1998年11月に、ケンタン細粒は1999年1月にそれぞれ追加承認された。(X. -9. 参照)

また、「適応外使用に係る医療用医薬品の取扱いについて」(平成11年2月1日付 研第4号 医薬審第104号、厚生省健康政策局研究開発振興課長及び医薬安全局審査管理課長通知)に基づき、「歯痛」について臨床試験を実施することなく、医薬品製造販売承認事項一部変更承認申請を行い、2005年12月に効能又は効果が追加承認された。(X. -9. 参照)

「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」(平成12年9月19日付 医薬発第935号)に基づき、2007年6月に「ケンタン錠60mg」及び「ケンタン細粒10%」へ、また、2012年12月に「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号)に基づき、『ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」』及び『ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」』に販売名を変更した。(X. -8. 参照)

2. 製品の治療学的特性

1)ロキソプロフェンナトリウム水和物は経口投与されたとき、胃粘膜刺激作用の弱い未変化体のまま消化管より吸収され、その後速やかにプロスタグランジン生合成抑制作用の強い活性代謝物trans-OH体(SRS配位)に変換されて作用する。シクロオキシゲナーゼを作用点としたプロスタグランジン生合成抑制作用により、すぐれた鎮痛・抗炎症・解熱作用を有し、特に鎮痛作用が強力である^{1,2)}。(VI. -2. 参照)

2)重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、無顆粒球症、白血球減少、溶血性貧血、再生不良性貧血、血小板減少、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)、多形紅斑、急性汎発性発疹性膿疱症、急性腎障害、ネフローゼ症候群、間質性腎炎、うっ血性心不全、心筋梗塞、脳血管障害、間質性肺炎、消化性潰瘍、消化管出血、消化管穿孔、小腸・大腸の狭窄・閉塞、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、喘息発作、無菌性髄膜炎、横紋筋融解症が報告されている。(VIII. -8. 参照)

3. 製品の製剤学的特性

「IV. 製剤に関する項目」及び沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」
<https://med.sawai.co.jp/> 参照

I. 概要に関する項目

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

(2025年10月 1 日時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

1) 承認条件

該当しない

2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」

ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」

2) 洋名

LOXOPROFEN Na Tablets, Fine Granules [SAWAI]

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

ロキソプロフェンナトリウム水和物(JAN)

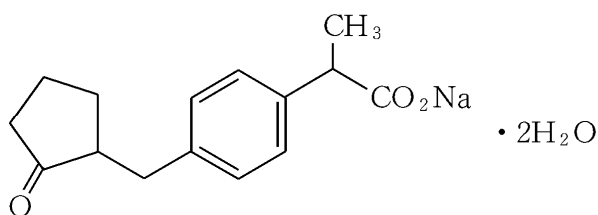
2) 洋名(命名法)

Loxoprofen Sodium Hydrate(JAN)

3) ステム(stem)

-profen(x) : anti-inflammatory agents, ibuprofen derivatives

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{15}H_{17}NaO_3 \cdot 2H_2O$

分子量 : 304.31

5. 化学名(命名法)又は本質

Monosodium 2-{4-[(2-oxocyclopentyl)methyl]phenyl}propanoate dihydrate
(IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

1) 外観・性状

白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

2) 溶解性

水又はメタノールに極めて溶けやすく、エタノール(95)に溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

溶解度³⁾：pH1.2：1.5mg/mL、pH4.0：1000mg/mL以上、pH6.8：1000mg/mL以上、

水：1000mg/mL以上

3) 吸湿性

水分：11.0～13.0%(0.2g、容量滴定法、直接滴定)

4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

該当資料なし

5) 酸塩基解離定数

pKa=4.20³⁾

6) 分配係数

該当資料なし

7) その他の主な示性値

水溶液(1→20)は旋光性を示さない。

pH：本品1.0gを新たに煮沸して冷却した水20mLに溶かした液のpHは6.5～8.5である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

液性(pH)：酸性～中性は安定。pH13でやや不安定³⁾。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

<確認試験法>

日局「ロキソプロフェンナトリウム水和物」の確認試験に準ずる。

1) 紫外可視吸光度測定法

2) 赤外吸収スペクトル測定法

3) ナトリウム塩の定性反応

<定量法>

日局「ロキソプロフェンナトリウム水和物」の定量法に準ずる。(液体クロマトグラフィー)

IV. 製剤に関する項目




1. 剤形

1) 剤形の区別

ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」：割線入り素錠

ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」：細粒剤

2) 製剤の外観及び性状

品名	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」	 8.0	 約201	 4.3	ごくうすい紅色
ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」	—————			ごくうすい紅色 わずかに特異な においがある

3) 識別コード

●ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW 110

●ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」

表示部位：分包包装

表示内容：SW 109

4) 製剤の物性

●ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」

製剤均一性：日局ロキソプロフェンナトリウム錠 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局ロキソプロフェンナトリウム錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。(水、30分：85%以上)

●ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」

製剤均一性(分包品)：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により質量偏差試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日本薬局方外医薬品規格第3部 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。(水、15分：85%以上)

粒度試験：日局一般試験法 製剤の粒度の試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。(18号全通、30号残留10%以下、200号通過10%以下)

安息角：32.2° (実測値)

IV. 製剤に関する項目

5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

品名	ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」
有効成分 [1錠中]	日局ロキソプロフェンナトリウム水和物 68.1mg (無水物として60mg)
添加剤	軽質無水ケイ酸、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース

品名	ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」
有効成分 [1g中]	日局ロキソプロフェンナトリウム水和物 113.4mg (無水物として100mg)
添加剤	軽質無水ケイ酸、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、フマル酸、D-マンニトール

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

●ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)⁴⁾

ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	ごくうすい紅色の割線入り素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	103.1	101.4

※：表示量に対する含有率(%)

2) バラ包装品の安定性(加速試験)⁴⁾

ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	ごくうすい紅色の割線入り素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.7	100.8

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性試験⁵⁾

ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度の条件下で性状変化が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C3ヵ月)	湿度(25°C75%RH)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	ごくうすい紅色の割線入り素錠	変化なし	表面に荒れが生じる	表面に荒れが生じる
硬度(kg)	4.8	4.8	4.5	4.2
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	102.2	102.0	101.0

保存条件	イニシャル	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温散光下 (なりゆき 3ヵ月)
性状	ごくうすい紅色の割線入り素錠	変化なし	変化なし
硬度(kg)	4.8	4.1	5.2
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	101.5	100.6

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」

1) バラ包装品の安定性(加速試験)⁶⁾

ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	ごくうすい紅色の細粒であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
粒度試験	規格に適合	同左
定量試験※	103.6	103.3

※：表示量に対する含有率(%)

IV. 製剤に関する項目

2) 無包装下の安定性試験⁷⁾

ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度の条件下で性状変化及び含量低下、光の条件下で含量低下が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3 ヶ月)	湿度 (25°C75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)
性状	ごくうすい紅色 の細粒	変化なし	わずかに脱色	変化なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	98.1	94.0	95.7

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。
※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

<配合変化試験>

●ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」

XIII. - 2. 参照

9. 溶出性

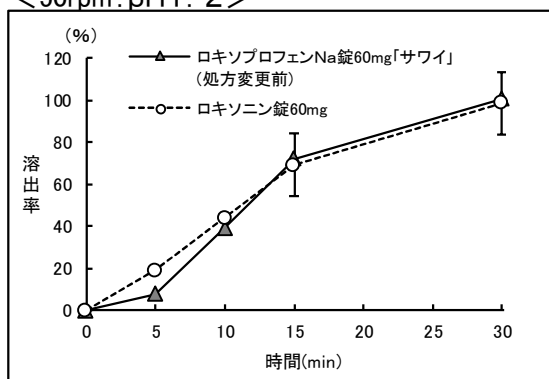
<溶出挙動における同等性及び類似性>

●ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」⁸⁾

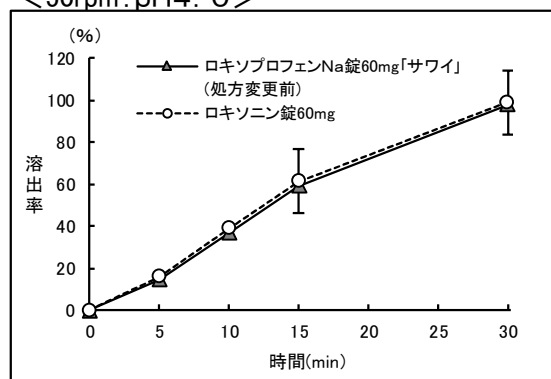
【先発医薬品との比較】

品質再評価結果通知日	1999年10月7日	オレンジブック掲載	No. 2
通知等	「医療用医薬品の品質再評価に係る公的溶出試験(案)等について」:平成11年3月25日 医薬審第601号		
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水)	
試験回数	6ベッセル		
試験製剤	ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」(処方変更前)		
標準製剤	ロキソニン錠60mg		
結果及び考察	<50rpm : pH1.2> 標準製剤の平均溶出率が60%(15分)及び85%(30分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。 <50rpm : pH4.0> 標準製剤の平均溶出率が60%(15分)及び85%(30分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。 <50rpm : pH6.8> 標準製剤の平均溶出率が60%(15分)及び85%(30分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。 <50rpm : 水> 標準製剤の平均溶出率が60%(15分)及び85%(30分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。 以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。		

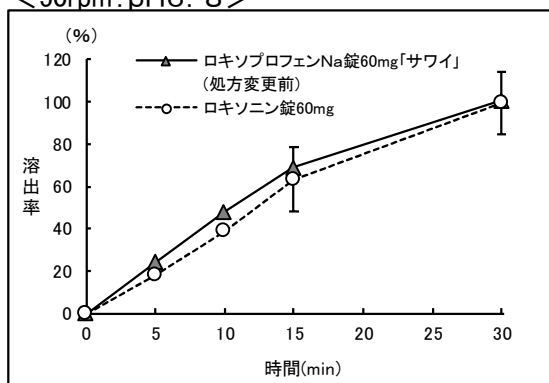
<50rpm: pH1. 2>



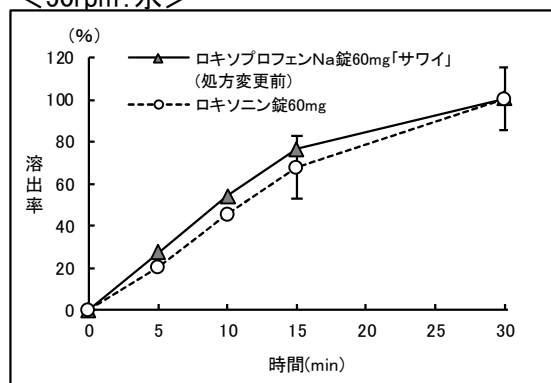
<50rpm: pH4. 0>



<50rpm: pH6. 8>



<50rpm: 水>



([] : 判定基準の適合範囲)

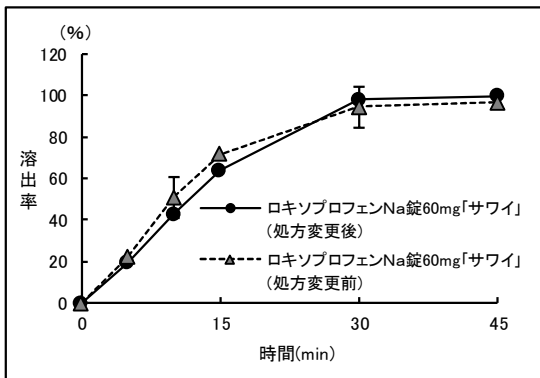
【処方変更前後の比較】

通知等	「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドラインについて」： 平成 13 年 5 月 31 日 医薬審発第 786 号	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1. 2、3. 0、6. 8、水)、100rpm (pH3. 0)
試験回数	12 ベッセル	
試験製剤	ロキソプロフェンNa錠 60mg「サワイ」(処方変更後)	
標準製剤	ロキソプロフェンNa錠 60mg「サワイ」(処方変更前)	
結果及び考察	<p>本剤は平成 16 年に処方変更を行った。</p> <p><50rpm : pH1. 2> 標準製剤の平均溶出率が 60% (10 分) 及び 85% (30 分) 付近の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。最終比較時点 (30 分) における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p><50rpm : pH3. 0> 標準製剤の平均溶出率が 60% (15 分) 及び 85% (30 分) 付近の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。最終比較時点 (30 分) における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p>	

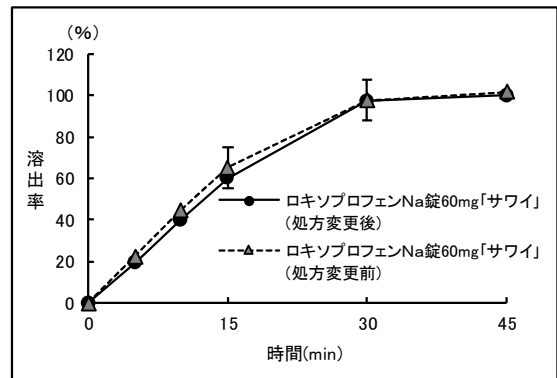
IV. 製剤に関する項目

<p>結果及び考察</p>	<p><50rpm : pH6.8> 標準製剤の平均溶出率が 60% (15 分) 及び 85% (30 分) 付近の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。最終比較時点 (30 分) における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p><50rpm : 水> 標準製剤の平均溶出率が 60% (10 分) 及び 85% (15 分) 付近の 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。最終比較時点 (30 分) における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p><100rpm : pH3.0> 両製剤とも 15 分以内に平均 85%以上溶出した。 最終比較時点 (15 分) における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。</p>
---------------	---

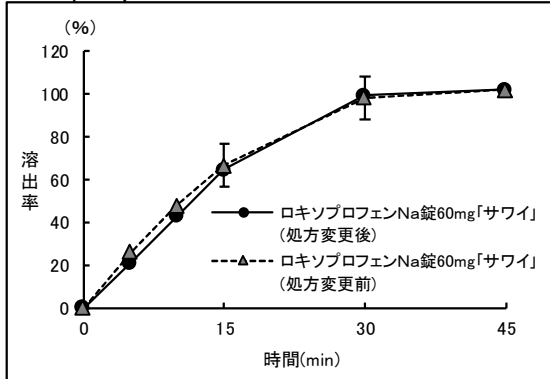
<50rpm : pH1.2>



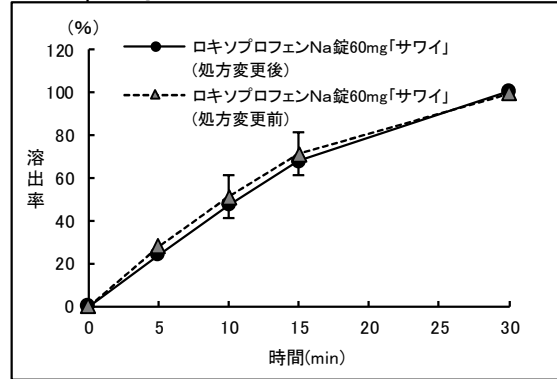
<50rpm : pH3.0>



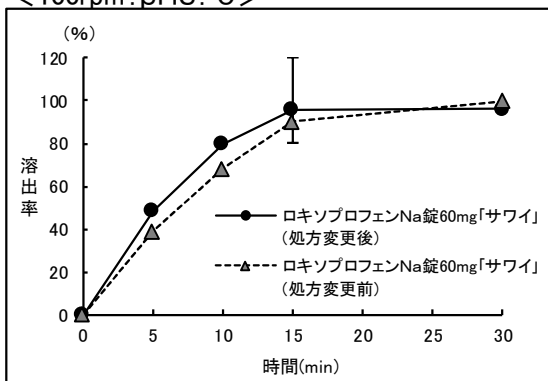
<50rpm : pH6.8>



<50rpm : 水>



<100rpm:pH3.0>

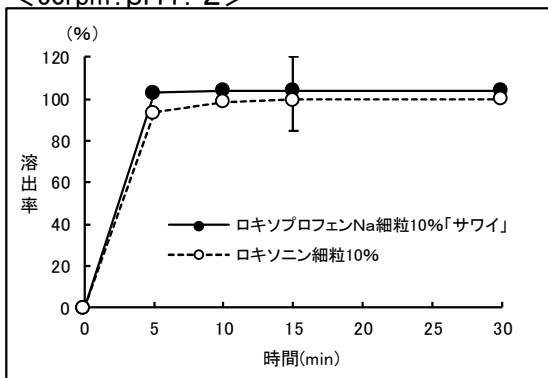


(I : 判定基準の適合範囲)

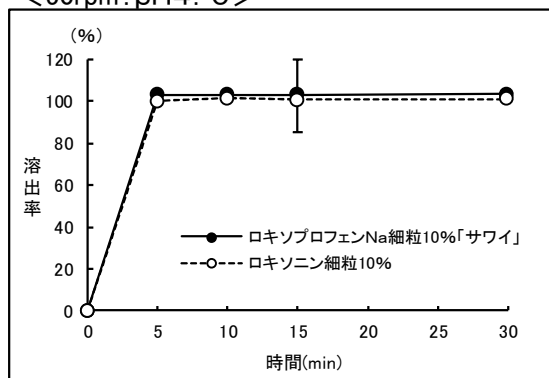
●ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」⁹⁾

品質再評価結果通知日	1999年10月7日	オレンジブック収載	No. 2
通知等	「医療用医薬品の品質再評価に係る公的溶出試験(案)等について」:平成11年3月25日 医薬審第601号		
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、4.0、6.8、水)	
試験回数	6ベッセル		
試験製剤	ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」		
標準製剤	ロキソニン細粒10%		
結果及び考察	<50rpm : pH1.2> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : pH4.0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 <50rpm : 水> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。		

<50rpm:pH1.2>

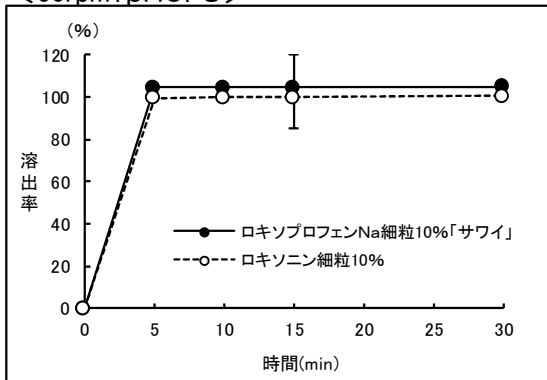


<50rpm:pH4.0>

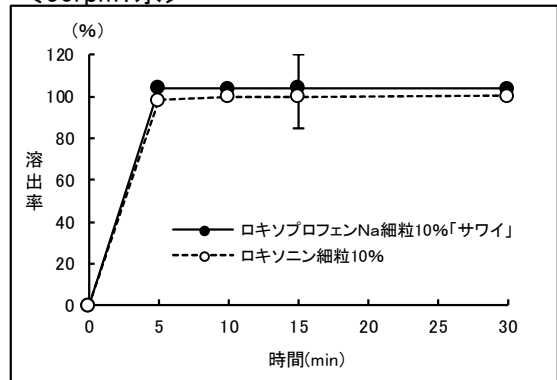


IV. 製剤に関する項目

<50rpm: pH6. 8>



<50rpm: 水>



([] : 判定基準の適合範囲)

10. 容器・包装

1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

2) 包装

22. 包装

<ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」>

PTP : 100錠 (10錠×10)、1,000錠 (10錠×100)

バラ : 1,000錠

<ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」>

バラ [乾燥剤入り] : 100g

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

●ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」

PTP : [PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

バラ : [本体]ポリエチレン瓶、[キャップ]ポリプロピレン

●ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」

分包 : [本体]アルミニウム・ポリエチレンテレフタレートラミネートフィルム

[ピロー]ポリエチレンフィルム

バラ : [本体]ポリエチレン瓶、[中蓋]ポリエチレン

[キャップ]ポリプロピレン、ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他.....
 該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

- 下記疾患並びに症状の消炎・鎮痛
関節リウマチ、変形性関節症、腰痛症、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群、歯痛
- 手術後、外傷後並びに抜歯後の鎮痛・消炎
- 下記疾患の解熱・鎮痛
急性上気道炎(急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む)

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

効能又は効果	用法及び用量
下記疾患並びに症状の消炎・鎮痛 関節リウマチ、変形性関節症、腰痛症、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群、歯痛	通常、成人にロキソプロフェンナトリウム(無水物として) 1回60mg、1日3回経口投与する。頓用の場合は、1回60～120mgを経口投与する。 なお、年齢、症状により適宜増減する。また、空腹時の投与は避けさせることが望ましい。
手術後、外傷後並びに抜歯後の鎮痛・消炎	
下記疾患の解熱・鎮痛 急性上気道炎(急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む)	通常、成人にロキソプロフェンナトリウム(無水物として) 1回60mgを頓用する。 なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、原則として1日2回までとし、1日最大180mgを限度とする。また、空腹時の投与は避けさせることが望ましい。

2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意

- 7.1 他の消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい。

5. 臨床成績

1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

2) 臨床薬理試験

該当資料なし

3) 用量反応探索試験

該当資料なし

4) 検証的試験

(1) 有効性検証試験

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 二重盲検比較試験

〈関節リウマチの消炎・鎮痛〉

(1) 国内第Ⅲ相試験

慢性関節リウマチ患者を対象とした二重盲検試験において、インドメタシン75mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム180mg/日を6週間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウムでの最終全般改善度の改善以上は23.2% (22/95例)、やや改善以上は55.8% (53/95例)であった。副作用は、ロキソプロフェンナトリウム群で15.5% (17/110例)に認められ、主なものは胃痛3.6% (4/110例)、発疹・皮疹2.7% (3/110例)であった¹⁰⁾。

〈変形性関節症の消炎・鎮痛〉

(2) 国内第Ⅲ相試験

変形性関節症患者を対象とした二重盲検試験において、ジクロフェナク75mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム180mg/日を4週間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウムでの最終全般改善度の改善以上は61.8% (68/110例)、軽度改善以上は87.3% (96/110例)であった。副作用は、ロキソプロフェンナトリウム群で17.9% (22/123例)に認められ、主なものは胃・腹部不快感6.5% (8/123例)、胃痛4.1% (5/123例)であった¹¹⁾。

〈腰痛症の消炎・鎮痛〉

(3) 国内第Ⅲ相試験

腰痛症患者を対象とした二重盲検試験において、イブプロフェン900mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム180mg/日を2週間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウムでの最終全般改善度の改善以上は62.7% (52/83例)、やや改善以上は77.1% (64/83例)であった。副作用は、ロキソプロフェンナトリウム群で16.5% (16/97例)に認められ、主なものは胃・腹部不快感5.2% (5/97例)、胃痛3.1% (3/97例)であった¹²⁾。

〈肩関節周囲炎・頸肩腕症候群の消炎・鎮痛〉

(4) 国内第Ⅲ相試験

肩関節周囲炎・頸肩腕症候群患者を対象とした二重盲検試験において、イブプロフェン900mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム180mg/日を2週間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウムでの肩関節周囲炎患者の最終全般改善度の改善以上は57.4% (35/61例)、やや改善以上は85.2% (52/61例)、また頸肩腕症候群患者の最終全般改善度の改善以上は61.9% (39/63例)、やや改善以上は88.9% (56/63例)であった。副作用は、ロキソプロフェンナトリウム群で12.6% (18/143例)に認められ、主なものは胃痛、浮腫・むくみ3.5% (5/143例)、胃・腹部不快感2.8% (4/143例)であった¹³⁾。

〈手術後・外傷後の鎮痛・消炎〉

(5) 国内第Ⅲ相試験

手術後および外傷後の疼痛を発現した患者を対象とした二重盲検試験において、メフェナム酸1000mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム180mg/日を3日間投与した結果、手術後の疼痛を発現した患者におけるロキソプロフェンナトリウムでの最終全般改善度の改善以上は79.1% (53/67例)、やや改善以上は94.0% (63/67例)、外傷後の疼痛を発現した患者におけるロキソプロフェンナトリウムでの最終全般改善度の改善以上は71.4% (30/42例)、やや改善以上は97.6% (41/42例)であった。副作用は、ロキソプロフェンナトリウム群で4.2% (5/119例)に認められ、発疹、薬疹、血便、めまい及び眠気が各1例であった¹⁴⁾。

V. 治療に関する項目

〈抜歯後の鎮痛・消炎〉

(6) 国内第Ⅲ相試験

抜歯術後、疼痛の発現した患者を対象とした二重盲検試験において、メフェナム酸500mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム60mgもしくは120mg/日を投与した結果、ロキソプロフェンナトリウム60mg/日群での有効性の有効以上は88.2% (75/85例)、やや有効以上は98.8% (84/85例)、ロキソプロフェンナトリウム120mg/日群での有効性の有効以上は91.4% (85/93例)、やや有効以上は95.7% (89/93例)であった。副作用は、ロキソプロフェンナトリウム群で3.9% (7/179例)に認められ、主なものは眠気1.7% (3/179例)であった¹⁵⁾。

〈急性上気道炎(急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む)の解熱・鎮痛〉

(7) 国内第Ⅲ相試験

急性上気道炎患者を対象とした二重盲検試験において、イブプロフェン600mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム180mg/日を5日間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウムでの最終全般改善度の改善以上は76.5% (62/81例)、軽度改善以上は90.1% (73/81例)であった。副作用は、ロキソプロフェンナトリウム群でしびれが1例認められた¹⁶⁾。

(8) 国内第Ⅲ相試験

急性上気道炎患者を対象とした二重盲検試験において、イブプロフェン600mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム180mg/日を3日間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウムでの最終全般改善度の改善以上は61.6% (69/112例)、やや改善以上は85.7% (96/112例)であった。副作用は、ロキソプロフェンナトリウム群で6.2% (8/130例)に認められ、主なものは心窩部痛2.3% (3/130例)、腹部膨満感、眠気1.5% (2/130例)であった¹⁷⁾。

(9) 国内第Ⅲ相試験

急性上気道炎患者を対象とした二重盲検試験において、ロキソプロフェンナトリウム60mg/日、もしくはロキソプロフェンナトリウム120mg/日を単回投与した結果、ロキソプロフェンナトリウム60mg/日群での解熱効果の改善以上は75.8% (25/33例)、軽度改善以上は100% (33/33例)、ロキソプロフェンナトリウム120mg/日群での解熱効果の改善以上は75.9% (22/29例)、軽度改善以上は89.7% (26/29例)であった。副作用は認められなかった¹⁸⁾。

(2) 安全性試験

該当資料なし

5) 患者・病態別試験

該当資料なし

6) 治療的使用

(1) 使用成績調査(一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

(2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

7) その他

17.1.2 一般臨床試験		
一般臨床試験828例の臨床成績の概要は次のとおりである ^{15, 19~31)} 。		
疾患名	有効率 (%)	
	有効以上	やや有効以上
関節リウマチ	65/233 (27.9)	132/233 (56.7)
変形性関節症	95/154 (61.7)	129/154 (83.8)
腰痛症	96/127 (75.6)	112/127 (88.2)
肩関節周囲炎	7/14 (50.0)	9/14 (64.3)
頸肩腕症候群	15/24 (62.5)	20/24 (83.3)
手術後・外傷後	4/4 (100.0)	4/4 (100.0)
抜歯後	124/177 (70.1)	170/177 (96.0)
急性上気道炎	64/97 (66.0)	93/97 (95.9)

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

プロスタグランジン生合成阻害作用(プロピオン酸系)：

イブプロフェン、オキサプロジン、ザルトプロフェン、ナプロキセン、フルルビプロフェン³²⁾

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

ロキソプロフェンナトリウム水和物は経口投与されたとき、胃粘膜刺激作用の弱い未変化体のまま消化管より吸収され、その後速やかにプロスタグランジン生合成抑制作用の強い活性代謝物trans-OH体(SRS配位)に変換されて作用する。シクロオキシゲナーゼを作用点としたプロスタグランジン生合成抑制作用により、すぐれた鎮痛・抗炎症・解熱作用を有し、特に鎮痛作用が強力である^{1, 2)}。

2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 鎮痛作用

18.2.1 ロキソプロフェンナトリウム水和物をラットに経口投与したとき、Randall-Selitto法(炎症足加圧法)においてED₅₀値は0.13mg/kgであり、ケトプロフェン、ナプロキセン、インドメタシンに比べ、10~20倍の強い鎮痛作用を示した^{33, 34)}。

18.2.2 ロキソプロフェンナトリウム水和物をラットに経口投与したとき、熱炎症性疼痛法においてID₅₀値は0.76mg/kgであり、ナプロキセンと同等、ケトプロフェン、インドメタシンの3~5倍の鎮痛作用を示した^{33, 34)}。

18.2.3 ロキソプロフェンナトリウム水和物をラットに経口投与したとき、慢性関節炎疼痛法においてED₅₀値は0.53mg/kgと強い鎮痛作用を示し、インドメタシン、ケトプロフェン、ナプロキセンの4~6倍の鎮痛作用を示した³⁴⁾。

18.2.4 ロキソプロフェンナトリウム水和物の鎮痛作用は末梢性である³³⁾。

18.3 抗炎症作用

ロキソプロフェンナトリウム水和物をラットに経口投与したとき、カラゲニン浮腫(急性炎症モデル)、アジュバント関節炎(慢性炎症モデル)等に対して、ケトプロフェン、ナプロキセンとほぼ同等の抗炎症作用を示した^{33, 34)}。

18.4 解熱作用

ロキソプロフェンナトリウム水和物をラットに経口投与したとき、イーストによる発熱に対し、ケトプロフェン、ナプロキセンとほぼ同等、インドメタシンの約3倍の解熱作用を示した³⁴⁾。

3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与時

健康成人男性16例にロキソプロフェンナトリウム錠60mgを単回経口投与したところ、速やかに吸収され、血中にはロキソプロフェン(未変化体)のほか、trans-OH体(活性代謝物)の形で存在した。最高血漿中濃度に到達する時間はロキソプロフェンで約30分、trans-OH体で約50分であり、半減期はいずれも約1時間15分であった³⁵⁾。

ロキソプロフェンナトリウム錠60mgを単回経口投与後の薬物動態パラメータ

	例数	Cmax ($\mu\text{g/mL}$)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)	AUC ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	吸収速度 定数 (hr^{-1})	消失速度 定数 (hr^{-1})
ロキソプロフェン	16	5.04 ± 0.27	0.45 ± 0.03	1.22 ± 0.07	6.70 ± 0.26	11.21 ± 1.82	$\lambda_1=4.04$ ± 0.93 $\lambda_2=0.59$ ± 0.04
trans-OH体	16	0.85 ± 0.02	0.79 ± 0.02	1.31 ± 0.05	2.02 ± 0.05	3.56 ± 0.21	$\lambda_1=0.99$ ± 0.07 $\lambda_2=0.54$ ± 0.02

mean \pm SE

16.1.2 反復投与時

健康成人男性5例にロキソプロフェンナトリウム錠80mgを1日3回5日間反復経口投与したとき、初回投与時と血漿中濃度に大きな差異はなく、蓄積性は認められなかった³⁶⁾。
注)本剤の承認最大用量は180mgである。

<生物学的同等性試験>

●ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」³⁷⁾

【先発医薬品との比較】

通知等	「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱等について」：昭和55年5月30日 薬審第718号
採血時点	0、0.25、0.5、0.75、1、1.5、2、4、6、10hr
休薬期間	7日間
測定方法	高速液体クロマトグラフィー
試験製剤	ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」(処方変更前)
標準製剤	ロキソニン錠60mg

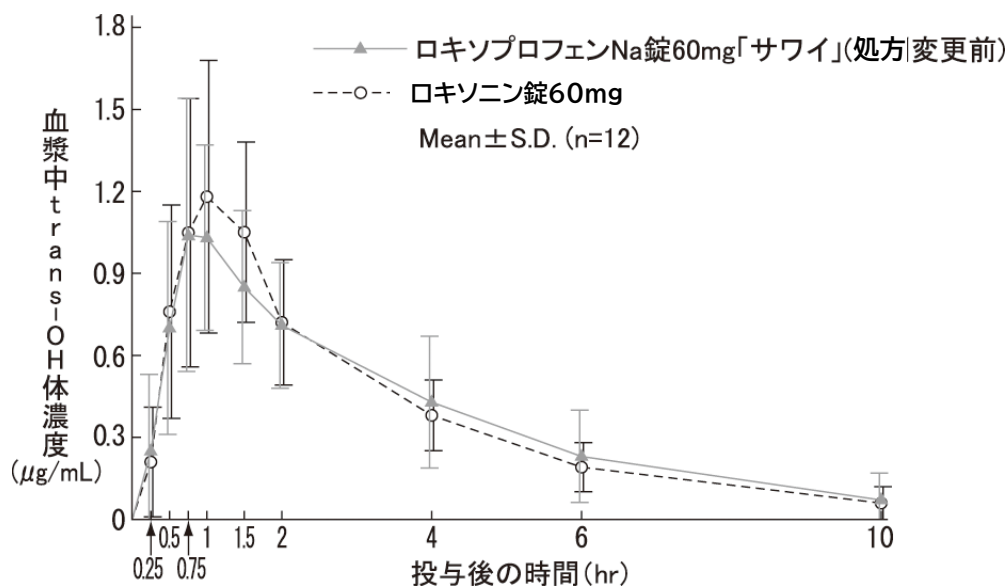
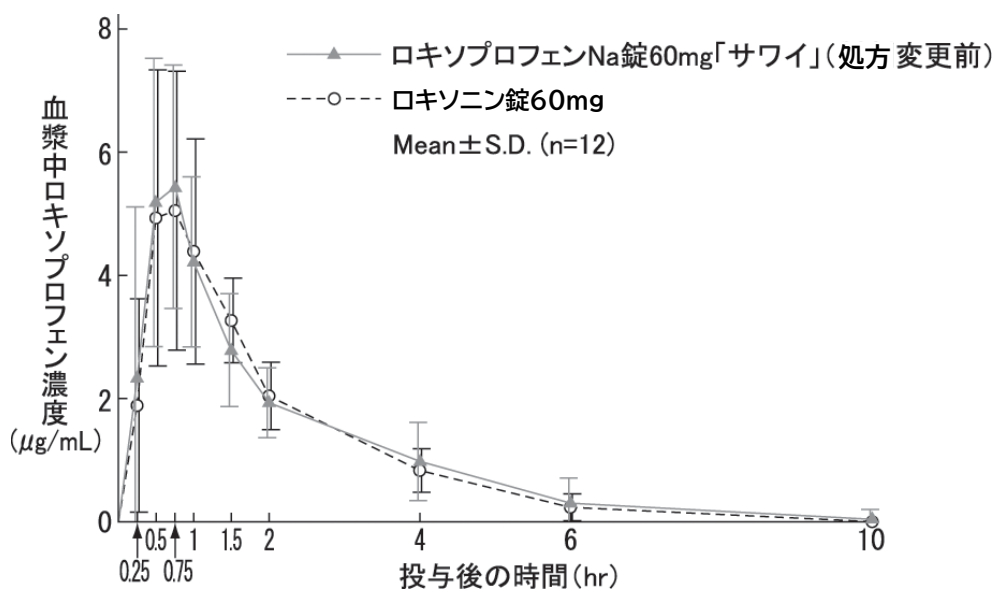
ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」(処方変更前)とロキソニン錠60mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(ロキソプロフェンナトリウム水和物として68.1mg(無水物として60mg))空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ロキソプロフェン濃度及び代謝物trans-OH体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

VII. 薬物動態に関する項目

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax ($\mu\text{g/mL}$)	AUC _{0-10hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$)
ロキソプロフェン	ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」 (処方変更前)	6.22 \pm 2.10	11.54 \pm 4.42
	ロキソニン錠60mg	6.27 \pm 1.80	11.14 \pm 2.80
transi-OH体	ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」 (処方変更前)	1.17 \pm 0.44	3.87 \pm 1.68
	ロキソニン錠60mg	1.28 \pm 0.49	3.81 \pm 1.26

(Mean \pm S.D.)



血漿中濃度ならびにAUC_t、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。

【処方変更前後の比較】

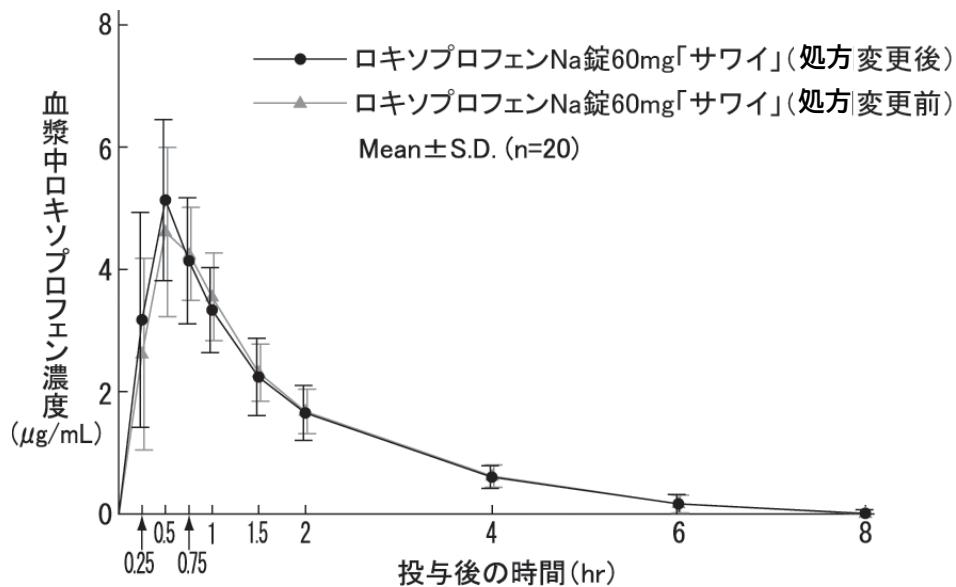
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号 「経口固形製剤の処方変更の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成13年5月31日 医薬審発第786号
採血時点	0、0.25、0.5、0.75、1、1.5、2、4、6、8 hr
休薬期間	7日間
測定方法	高速液体クロマトグラフィー
試験製剤	ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」(処方変更後)
標準製剤	ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」(処方変更前)

ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」(処方変更後)とロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」(処方変更前)を健康成人男子にそれぞれ1錠(ロキソプロフェンナトリウム水和物として68.1mg(無水物として60mg))空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ロキソプロフェン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、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。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax ($\mu\text{g/mL}$)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-8hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$)
ロキソプロフェンNa錠 60mg「サワイ」 (処方変更後)	5.57±0.79	0.55±0.26	1.42±0.26	9.08±1.56
ロキソプロフェンNa錠 60mg「サワイ」 (処方変更前)	4.96±1.18	0.58±0.16	1.35±0.18	8.99±1.65

(Mean±S.D.)



血漿中濃度ならびにAUCt、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。

VII. 薬物動態に関する項目

●ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」³⁸⁾

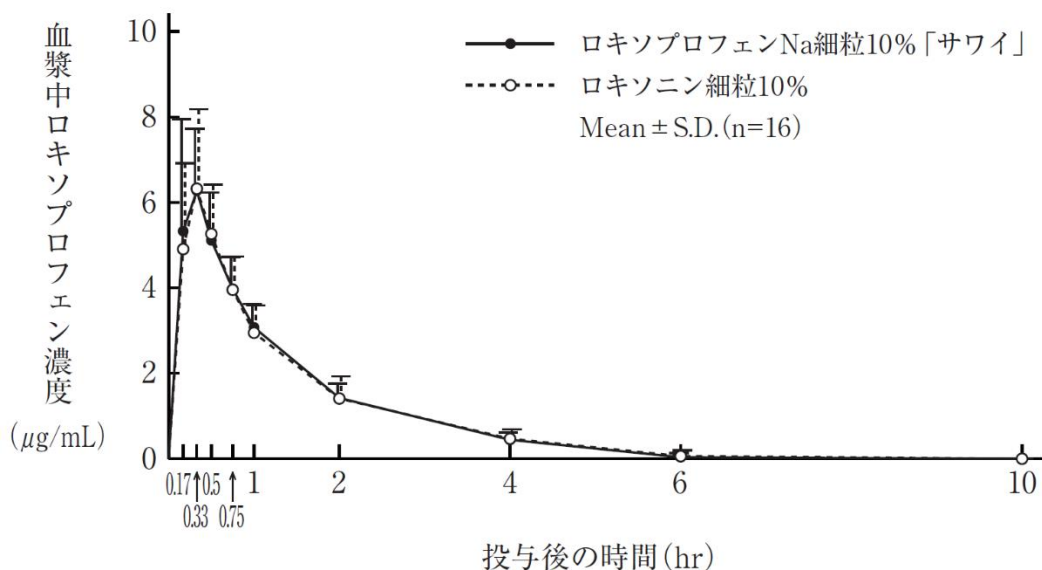
通知等	「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱等について」: 昭和55年5月30日 薬審第718号
採血時点	0、0.17、0.33、0.5、0.75、1、2、4、6、10hr
休薬期間	8日間
測定方法	高速液体クロマトグラフィー
試験製剤	ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」
標準製剤	ロキソニン細粒10%

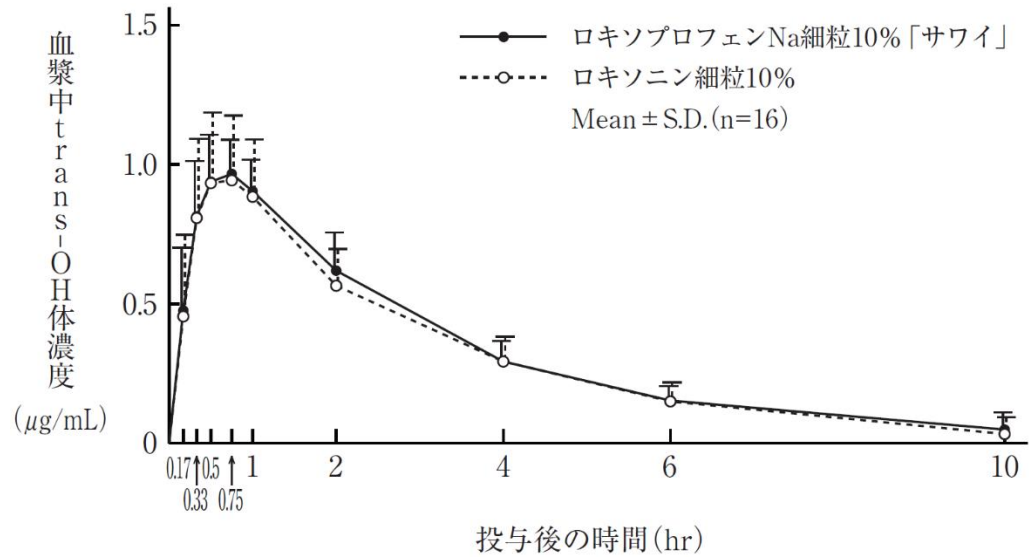
ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」とロキソニン細粒10%を健康成人男子にそれぞれ0.6g(ロキソプロフェンナトリウム水和物として68.04mg(無水物として60mg))空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ロキソプロフェン濃度及び活性代謝物trans-OH体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC_t、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤0.6g投与時の薬物動態パラメータ

		C _{max} ($\mu\text{g/mL}$)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-10hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr/mL}$)
ロキソプロフェン	ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」	6.92 \pm 1.73	0.33 \pm 0.14	1.09 \pm 0.19	9.03 \pm 2.04
	ロキソニン細粒10%	6.74 \pm 1.74	0.32 \pm 0.09	1.15 \pm 0.20	9.02 \pm 2.55
trans-OH体	ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」	0.99 \pm 0.13	0.65 \pm 0.18	2.77 \pm 1.34	3.29 \pm 0.64
	ロキソニン細粒10%	0.98 \pm 0.23	0.64 \pm 0.23	2.47 \pm 0.81	3.14 \pm 0.79

(Mean \pm S.D.)





血漿中濃度ならびにAUC_t、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。

3) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

VIII. -7. 参照

2. 薬物速度論的パラメータ.....

1) 解析方法

該当資料なし

2) 吸収速度定数

該当資料なし

3) 消失速度定数

●ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(ロキソプロフェンナトリウム水和物として68.1mg(無水物として60mg))空腹時単回経口投与した場合のロキソプロフェンの消失速度定数³⁷⁾

$$0.501 \pm 0.081 \text{hr}^{-1}$$

●ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」を健康成人男子に0.6g(ロキソプロフェンナトリウム水和物として68.04mg(無水物として60mg))空腹時単回経口投与した場合のロキソプロフェン及び代謝物trans-OH体の消失速度定数³⁸⁾

$$[\text{未変化体}] 0.652 \pm 0.102 \text{hr}^{-1}、[\text{trans-OH体}] 0.289 \pm 0.091 \text{hr}^{-1}$$

4) クリアランス

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

5) 分布容積

該当資料なし

6) その他

該当資料なし

3. 母集団 (ポピュレーション) 解析

1) 解析方法

該当資料なし

2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

2) 血液-胎盤関門通過性

VIII. -6. -5) 参照

3) 乳汁への移行性

VIII. -6. -6) 参照

4) 髄液への移行性

該当資料なし

5) その他の組織への移行性

該当資料なし

6) 血漿蛋白結合率

16.3 分布

16.3.1 血漿蛋白結合率

血漿中での未変化体及びtrans-OH体の蛋白結合率はそれぞれ97%、93%である³⁹⁾。

6. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

2) 代謝に関与する酵素 (CYP等) の分子種、寄与率

該当資料なし

3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

VII. -1. -2) 参照

7. 排泄

16.5 排泄

健康成人男性6例にロキソプロフェンナトリウム錠60mgを単回経口投与したとき、尿中への排泄は速やかで、尿中に排泄された大部分がロキソプロフェン又はtrans-OH体のグルクロン酸抱合体であった³⁵⁾。

	投与8時間後までの尿中排泄(% of dose)	
	遊離型	グルクロン酸抱合型
ロキソプロフェン	2.07±0.29	21.0±0.4
trans-OH体	2.21±0.47	16.0±0.6

n=6、mean±SE

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

1. 警告内容とその理由……………
設定されていない

2. 禁忌内容とその理由……………

- 2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)**
- 2.1 消化性潰瘍のある患者[プロスタグランジン生合成抑制により、胃の血流量が減少し消化性潰瘍が悪化することがある。][9. 1. 2参照]
 - 2.2 重篤な血液の異常のある患者[血小板機能障害を起こし、悪化するおそれがある。][9. 1. 3参照]
 - 2.3 重篤な肝機能障害のある患者[9. 3. 1参照]
 - 2.4 重篤な腎機能障害のある患者[9. 2. 1参照]
 - 2.5 重篤な心機能不全のある患者[9. 1. 4参照]
 - 2.6 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
 - 2.7 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。][9. 1. 5参照]
 - 2.8 妊娠後期の女性[9. 5. 1参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由……………
設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………
V. -4. 参照

5. 重要な基本的注意とその理由……………

- 8. 重要な基本的注意**
- 8.1 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。
 - 8.2 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又は消耗性疾患を合併している患者においては、投与後の患者の状態に十分注意すること。
 - 8.3 無顆粒球症、白血球減少、溶血性貧血、再生不良性貧血、血小板減少があらわれることがあるので、血液検査を行うなど観察を十分に行うこと。[11. 1. 2参照]
 - 8.4 急性疾患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。
 - ・急性炎症、疼痛及び発熱の程度を考慮し、投与すること。
 - ・原則として同一の薬剤の長期投与を避けること。
 - ・原因療法があればこれを行い、本剤を漫然と投与しないこと。
 - 8.5 慢性疾患(関節リウマチ、変形性関節症等)に対し本剤を用いる場合には、次の事項を考慮すること。
 - ・長期投与する場合には定期的に尿検査、血液検査及び肝機能検査等を行うこと。
 - ・薬物療法以外の療法も考慮すること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 消化性潰瘍の既往歴のある患者

潰瘍を再発させることがある。

9.1.2 非ステロイド性消炎鎮痛剤の長期投与による消化性潰瘍のある患者で、本剤の長期投与が必要であり、かつミソプロストールによる治療が行われている患者

本剤を継続投与する場合には、十分経過を観察し、慎重に投与すること。ミソプロストールは非ステロイド性消炎鎮痛剤により生じた消化性潰瘍を効能・効果としているが、ミソプロストールによる治療に抵抗性を示す消化性潰瘍もある。[2.1参照]

9.1.3 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)

溶血性貧血等の副作用が起こりやすくなる。[2.2参照]

9.1.4 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)

腎のプロスタグランジン生合成抑制により浮腫、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おそれがある。[2.5参照]

9.1.5 気管支喘息の患者(アスピリン喘息又はその既往歴のある患者を除く)

病態を悪化させることがある。[2.7参照]

9.1.6 潰瘍性大腸炎の患者

病態を悪化させることがある。

9.1.7 クロウン病の患者

病態を悪化させることがある。

9.1.8 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。

2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重篤な腎機能障害のある患者

投与しないこと。急性腎障害、ネフローゼ症候群等の副作用を発現することがある。[2.4参照]

9.2.2 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)

浮腫、蛋白尿、血清クレアチニン上昇、高カリウム血症等の副作用が起こることがある。

3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重篤な肝機能障害のある患者

投与しないこと。副作用として肝機能障害が報告されており、悪化するおそれがある。[2.3参照]

9.3.2 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)

肝機能障害を悪化又は再発させることがある。

4) 生殖能を有する者

設定されていない

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

5) 妊婦

9.5 妊婦

9.5.1 妊娠後期の女性

投与しないこと。動物実験(ラット)で分娩遅延及び胎児の動脈管収縮が報告されている。
[2.8参照]

9.5.2 妊婦(妊娠後期を除く)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にのみ投与すること。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(全身作用を期待する製剤)を妊娠中期の妊婦に使用し、胎児の動脈管収縮が起きたとの報告がある。

6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。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

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

8) 高齢者

9.8 高齢者

少量から投与を開始するなど必要最小限の使用にとどめ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。

7. 相互作用

1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

2) 併用注意とその理由

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
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おそれがあるので注意し、必要があれば減量すること。	本剤のプロスタグランジン生合成抑制作用により血小板凝集が抑制され血液凝固能が低下し、抗凝血作用に相加されるためと考えられている。
第Xa因子阻害剤 エドキサバントシル酸塩水和物等	出血の危険性を増大させるおそれがある。	抗血栓作用を増強するためと考えられている。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
スルホニル尿素系血糖降下剤 クロルプロバミド等	血糖降下作用を増強するおそれがあるので注意し、必要があれば減量すること。	本剤のヒトでの蛋白結合率は、ロキソプロフェンで97.0%、trans-OH体で92.8%と高く、蛋白結合率の高い薬剤と併用すると血中に活性型の併用薬が増加し、作用が増強されるためと考えられている。
ニューキノロン系抗菌剤 レボフロキサシン水和物等	痙攣誘発作用を増強することがある。	ニューキノロン系抗菌剤は、中枢神経系の抑制性神経伝達物質であるGABAの受容体への結合を阻害し、痙攣誘発作用を起こす。本剤の併用により阻害作用を増強するためと考えられている。
メトトレキサート	血中メトトレキサート濃度を上昇させ、作用を増強することがあるので、必要があれば減量すること。	機序は不明であるが、本剤の腎におけるプロスタグランジン生合成抑制作用により、これらの薬剤の腎排泄が減少し血中濃度が上昇するためと考えられている。
リチウム製剤 炭酸リチウム	血中リチウム濃度を上昇させ、リチウム中毒を起こすことがあるので血中のリチウム濃度に注意し、必要があれば減量すること。	
チアジド系利尿薬 ヒドロクロチアジド等	利尿・降圧作用を減弱するおそれがある。	本剤の腎におけるプロスタグランジン生合成抑制作用により、水、ナトリウムの排泄を減少させるためと考えられている。
降圧剤 ACE阻害剤 アンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤等	降圧作用を減弱するおそれがある。 腎機能を悪化させるおそれがある。	本剤のプロスタグランジンの生合成抑制作用により、降圧作用を減弱させる可能性がある。 本剤のプロスタグランジンの生合成抑制作用により、腎血流量が低下するためと考えられる。

8. 副作用

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。

1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック(頻度不明)、アナフィラキシー(頻度不明)

ショック、アナフィラキシー(血圧低下、蕁麻疹、喉頭浮腫、呼吸困難等)があらわれることがある。

11.1.2 無顆粒球症(頻度不明)、白血球減少(頻度不明)、溶血性貧血(頻度不明)、再生不良性貧血(頻度不明)、血小板減少(頻度不明)

[8.3参照]

11.1.3 中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis : TEN)(頻度不明)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)(頻度不明)、多形紅斑(頻度不明)、急性汎発性発疹性膿疱症(頻度不明)

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

11.1.4 急性腎障害(頻度不明)、ネフローゼ症候群(頻度不明)、間質性腎炎(頻度不明)	急性腎障害に伴い高カリウム血症があらわれることがあるので、特に注意すること。
11.1.5 うっ血性心不全(頻度不明)	
11.1.6 心筋梗塞(頻度不明)、脳血管障害(頻度不明)	心筋梗塞、脳血管障害等の心血管系血栓塞栓性事象があらわれることがある ⁴⁰⁾ 。
11.1.7 間質性肺炎(頻度不明)	発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常、好酸球増多等を伴う間質性肺炎があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には直ちに投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。
11.1.8 消化性潰瘍(頻度不明)、消化管出血(頻度不明)	重篤な消化性潰瘍又は小腸、大腸からの吐血、下血、血便等の消化管出血が出現し、それに伴うショックがあらわれることがあるので、これらの症状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。
11.1.9 消化管穿孔(頻度不明)	心窩部痛、腹痛等の症状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。
11.1.10 小腸・大腸の狭窄・閉塞(頻度不明)	小腸・大腸の潰瘍に伴い、狭窄・閉塞があらわれることがあるので、悪心・嘔吐、腹痛、腹部膨満等の症状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。
11.1.11 劇症肝炎(頻度不明)、肝機能障害(頻度不明)、黄疸(頻度不明)	肝機能障害(黄疸、AST上昇、ALT上昇、γ-GTP上昇等)、劇症肝炎があらわれることがある。
11.1.12 喘息発作(頻度不明)	喘息発作等の急性呼吸障害があらわれることがある。
11.1.13 無菌性髄膜炎(頻度不明)	無菌性髄膜炎(発熱、頭痛、悪心・嘔吐、項部硬直、意識混濁等)があらわれることがある。特にSLEや混合性結合組織病の患者に発現しやすい。
11.1.14 横紋筋融解症(頻度不明)	筋肉痛、脱力感、CK上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等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。また、横紋筋融解症による急性腎障害の発症に注意すること。

2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	0.1～2%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹、そう痒感		発熱、蕁麻疹
消化器	腹痛、胃部不快感、食欲不振、悪心、下痢、便秘、胸やけ、口内炎、腹部膨満、口渇	嘔吐	消化性潰瘍 ^{注)} 、小腸・大腸の潰瘍 ^{注)} 、消化不良
循環器		動悸、血圧上昇	
精神神経系	眠気	頭痛、めまい、しびれ	
血液		好酸球増多	貧血、白血球減少、血小板減少
肝臓	AST上昇、ALT上昇	ALP上昇	
泌尿器	蛋白尿		血尿、排尿困難、尿量減少
その他	浮腫、顔面熱感		胸痛、倦怠感、発汗

注) 投与を中止すること。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響
設定されていない

10. 過量投与
設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

〈錠〉

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ある。

12. その他の注意

1) 臨床使用に基づく情報

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。

2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験
 - 1) 薬効薬理試験
「VI. 薬効薬理に関する項目」参照
 - 2) 安全性薬理試験
該当資料なし
 - 3) その他の薬理試験
該当資料なし
2. 毒性試験
 - 1) 単回投与毒性試験
該当資料なし
 - 2) 反復投与毒性試験
該当資料なし
 - 3) 遺伝毒性試験
該当資料なし
 - 4) がん原性試験
該当資料なし
 - 5) 生殖発生毒性試験
VIII. -6. -5) 参照
 - 6) 局所刺激性試験
該当資料なし
 - 7) その他の特殊毒性
該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

規制区分	
製剤	該当しない
有効成分	劇薬

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

〈製剤共通〉

20.1 開封後は湿気を避けて保存すること。

〈錠〉

20.2 錠剤表面に使用色素による赤い斑点がみられることがある。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材

XIII. -2. 参照

6. 同一成分・同効薬

同一成分：ロキソニン錠60mg／細粒10％／ゲル1％／テープ50mg／テープ100mg／パップ100mg

同効薬：プロスタグランジン生合成阻害作用(プロピオン酸系)

イブプロフェン、オキサプロジン、ザルトプロフェン、ナプロキセン、フルルビプロフェン³²⁾

7. 国際誕生年月日

該当しない

X. 管理的事項に関する項目

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日……………

●ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」

製品名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 ケンタン錠	1997年5月13日	20900AMZ00403000	1998年7月10日	1998年7月10日
旧販売名 ケンタン錠60mg	2007年2月2日	21900AMX00087000	2007年6月15日	
販売名変更 ロキソプロフェンNa 錠60mg「サワイ」	2011年12月14日	22300AMX01264000	2012年12月14日	

●ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」

製品名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 ケンタン細粒	1998年1月13日	21000AMZ00082000	1998年7月10日	1998年7月10日
旧販売名 ケンタン細粒10%	2007年3月6日	21900AMX00261000	2007年6月15日	
販売名変更 ロキソプロフェンNa 細粒10%「サワイ」	2011年12月14日	22300AMX01265000	2012年12月14日	

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容……………

●ケンタン錠／細粒(旧販売名)

・承認年月日：ケンタン錠(旧販売名)：1998年11月27日

ケンタン細粒(旧販売名)：1999年1月12日

効能又は効果内容：「急性上気道炎(急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む)の解熱・鎮痛」の効能又は効果を追加した。

用法及び用量内容：効能又は効果追加に伴い、関連の用法及び用量を追加した。

・承認年月日：2005年12月22日

効能又は効果内容：「歯痛」の効能又は効果を追加した。

用法及び用量内容：「空腹時の投与は避けさせることが望ましい」と追記した。

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容……………

該当しない

11. 再審査期間……………

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報……………

本剤は、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

製品名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号	レセプト電算処理 システム用コード
ロキソプロフェンNa 錠60mg「サワイ」	1149019F1013	1149019F1587	100993401	620099301
ロキソプロフェンNa 細粒10%「サワイ」	1149019C1157	1149019C1157	100985901	620098501

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 松田啓一他：炎症，1982；2（3）：263-266
- 2) 山口武他：炎症，1983；3（1）：63-67
- 3) 日本公定書協会編，医療用医薬品 品質情報集，No. 2，薬事日報社，1999，p. 62.
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[バラ包装品の安定性(加速試験)] ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」
- 10) 五十嵐三都男他：リウマチ，1985；25（1）：61-72
- 11) 青木虎吉他：医学のあゆみ，1986；136（12）：983-1001
- 12) 広畑和志他：Prog. Med.，1985；5（5）：1487-1505
- 13) 天児民和他：臨牀と研究，1985；62（9）：2938-2953
- 14) 長屋郁郎他：臨床医薬，1985；1（1）：69-89
- 15) 内田安信他：歯科薬物療法，1984；3（1）：32-48
- 16) 藤森一平他：Prog. Med.，1985；5（5）：1469-1485
- 17) 勝正孝他：臨床医薬，1993；9（10）：2299-2320
- 18) 勝正孝他：臨床医薬，1993；9（10）：2321-2331
- 19) 斉藤敏二：臨牀と研究，1984；61（8）：2734-2743
- 20) 原田容治他：臨床医薬，1992；8（5）：1205-1218
- 21) 萩原俊男他：臨床医薬，1992；8（5）：1219-1225
- 22) 菅原幸子他：臨牀と研究，1985；62（10）：3395-3412
- 23) 今井望：臨牀と研究，1985；62（7）：2257-2267
- 24) 比嘉康宏他：薬理と治療，1983；11（8）：3235-3248
- 25) 太田信夫他：新薬と臨牀，1984；33（11）：1535-1546
- 26) 内藤正俊他：診療と新薬，1984；21（12）：2546-2552
- 27) 吉岡利孝：薬理と治療，1984；12（2）：807-819
- 28) 塩川優一他：Prog. Med.，1984；4（12）：2561-2577
- 29) 青木虎吉他：臨牀と研究，1985；62（3）：1015-1024
- 30) 小田裕胤他：新薬と臨牀，1985；34（2）：188-194
- 31) 川上和夫：薬理と治療，1985；13（1）：287-299
- 32) 薬剤分類情報閲覧システム <<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>
(2025/10/1 アクセス)
- 33) 三坂英一他：応用薬理，1981；21（5）：753-771
- 34) 飯塚義夫他：薬理と治療，1986；14（8）：5191-5209
- 35) 長沼英夫他：臨床医薬，1986；2（9）：1219-1237
- 36) 阿部重人他：炎症，1985；5（1）：67-79
- 37) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」
- 38) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」

- 39) 第十八改正日本薬局方解説書, 廣川書店, 2021 ; C-6311-6316
- 40) データベース調査結果の概要 (NDBを用いた非ステロイド性抗炎症薬による心血管系イベント発現のリスク評価) : <https://www.pmda.go.jp/files/000270714.pdf>
- 41) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」
- 42) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」
- 43) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」
- 44) 沢井製薬(株) 社内資料[配合変化試験成績] ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

2. 海外における臨床支援情報.....
 該当資料なし

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報……………

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

1) 粉砕

＜粉砕後の安定性試験＞

●ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」⁴¹⁾

ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	ごくうすい紅色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験*	100.0	98.9	99.7	99.8

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

＜崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験＞

●ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」⁴²⁾

試験方法

1. ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して数回転倒混和し、10分間放置した。
2. 10分後シリンジを再度数回転倒混和し、8Fr. (外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

結 果

懸濁状態	錠剤は完全には崩壊しなかった
チューブ通過性	懸濁液は通過したが、錠剤の一部がシリンジに残留した

●ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」⁴³⁾

試験方法

1. ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」を1包(0.6g)とり、ビーカーに移したものに、温湯(約55℃)20mLを注ぎ、軽く攪拌して懸濁状態を観察した。
2. 得られた液をシリンジで吸い取り、8Fr. (外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

結 果

懸濁状態	ほぼ均一に懸濁した
チューブ通過性	通過した

2. その他の関連資料

患者向け資料

- ・ 痛みの治療手帳

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照

<配合変化試験成績>⁴⁴⁾

目的

ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」(以下、当社製剤)の他剤との配合時の経時変化を確認するため、試験を実施する。

方法

当社製剤と他剤を配合し、性状(外観、におい、湿潤性、流動性)を観察し、含量を測定した。(n=1)
(保存条件)温度：9～20℃ 期間：7日間

貯法：シャーレ開放(ただしゴミが入らないようにする)・散光下

流動性：「良好」、「少し悪化」、「悪化」、「固化」の4段階で評価した。

含量は配合直後のロキソプロフェンナトリウム量を100%とし、()に表示量に対する含有率を%で示した。

※2021年7月作成の配合変化試験成績を掲載した。

ロキソプロフェンNa細粒10%「サワイ」 配合変化試験成績

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量	試験 項目	配合結果			
	品名 (配合前の外観、におい)	成分名	配合量			配合直後	1日後	3日後	7日後
総合感冒剤	PL配合顆粒*1 〔旧販売名：PL顆粒〕 外 観：白色 におい：なし	非ピリン系感冒剤	4 g	1. 8g	外 観	白色	白色	白色	白色
					におい	なし	なし	なし	なし
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	良好	良好	良好	良好
					含量(%)	100. 0(102. 5)	-	-	99. 7
鎮咳剤	メジコン散10%*1 〔旧販売名：メジコン散〕 外 観：白色 におい：特異なにおい	デキストロメ トルファン臭 化水素酸塩水 和物	1. 2g	1. 8g	外 観	白色	白色	白色	白色
					におい	わずかに特異なにおい	なし	なし	なし
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	悪化	悪化	悪化	悪化
					含量(%)	100. 0(103. 3)	-	-	100. 7
鎮咳去たん剤	アスベリン散10%*1 〔旧販売名：アスベリン散〕 外 観：橙色 におい：なし	チペピジンヒ ベンズ酸塩	1. 2g	1. 8g	外 観	橙色	橙色	橙色	橙色
					におい	なし	なし	なし	なし
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	良好	良好	良好	良好
					含量(%)	100. 0(103. 0)	-	-	98. 9
止しゃ剤・整腸剤	ビオフェルミン配合散*1 〔旧販売名：ビオフェルミン〕 外 観：白色 におい：なし	ラクタミン、 糖化菌	9 g	1. 8g	外 観	白色	白色	白色	白色
					におい	なし	なし	なし	なし
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	良好	良好	良好	良好
					含量(%)	100. 0(103. 9)	-	-	99. 8
消化性潰瘍用剤	タガメット細粒20% 外 観：微黄白色 におい：なし	シメチジン	4 g	1. 8g	外 観	微黄白色	微黄白色	微黄白色	微黄白色
					におい	なし	なし	なし	なし
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	良好	良好	良好	良好
					含量(%)	100. 0(102. 2)	-	-	100. 1
	アルサルミン細粒90%*1 〔旧販売名：アルサルミン細粒〕 外 観：白色 におい：なし	スクラルファ ート水和物	3. 6g	1. 8g	外 観	白色	白色	白色	白色
					におい	なし	なし	なし	なし
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	良好	良好	良好	良好
					含量(%)	100. 0(101. 3)	-	-	100. 4
	セルベックス細粒10% 外 観：白色 におい：わずかに特異なにおい	テプレノン	1. 5g	1. 8g	外 観	白色	白色	白色	白色
					におい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
流動性					良好	良好	良好	良好	
含量(%)					100. 0(103. 2)	-	-	98. 4	
テプレノン細粒10%「サワイ」 外 観：帯黄白色 におい：わずかに特異なにおい	テプレノン	1. 5g	1. 8g	外 観	帯黄白色	帯黄白色	帯黄白色	帯黄白色	
				におい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	
				湿潤性	なし	なし	なし	なし	
				流動性	良好	良好	良好	良好	
				含量(%)	100. 0(102. 8)	-	-	99. 6	
コランチル配合顆粒*1 〔旧販売名：コランチル顆粒〕 外 観：白色 におい：なし	ジサイクロミン 塩酸塩、乾燥 水酸化アルミ ニウムゲル、酸 化マグネシウム	8 g	1. 8g	外 観	白色	白色	白色	白色	
				におい	なし	なし	なし	なし	
				湿潤性	なし	なし	なし	なし	
				流動性	良好	良好	良好	良好	
				含量(%)	100. 0(97. 6)	-	-	102. 5	
マーズレンS配合顆粒*1 〔旧販売名：マーズレンS顆粒〕 外 観：帯青色 におい：なし	アズレンスル ホン酸ナトリ ウム水和物、 L-グルタミン	2 g	1. 8g	外 観	帯青色	帯青色	帯青色	帯青色	
				におい	なし	なし	なし	なし	
				湿潤性	なし	なし	なし	なし	
				流動性	良好	良好	良好	良好	
				含量(%)	100. 0(104. 0)	-	-	98. 7	
健胃消化剤	ベリチーム配合顆粒*1 〔旧販売名：ベリチーム顆粒〕 外 観：淡黄褐色 におい：特異なにおい	腭臓性消化酵 素配合剤	3 g	1. 8g	外 観	淡黄褐色	淡黄褐色	淡黄褐色	淡黄褐色
					におい	特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい	わずかに特異なにおい
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	良好	良好	良好	良好
					含量(%)	100. 0(103. 4)	-	-	99. 2

* 1 旧販売名の製剤で試験を実施した。

分類	配合薬剤			当社製剤 配合量	試験 項目	配合結果			
	品名 (配合前の外観、におい)	成分名	配合量			配合直後	1日後	3日後	7日後
健胃 消化 剤	S・M配合散*1 〔旧販売名：S・M散〕 外 観：灰褐色 におい：特異な芳香	タカヂアスタ ーゼ・生薬配 合剤	3.9g	1.8g	外 観	灰褐色	灰褐色	灰褐色	灰褐色
					におい	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香	特異な芳香
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	少し悪化	少し悪化	少し悪化	少し悪化
含量(%)*2	—	—	—	—					
制 酸 剤	マーロックス懸濁用配合顆粒*1 〔旧販売名：マーロックス懸濁内服用〕 外 観：白色 におい：なし	乾燥水酸化アル ミニウムゲ ル、水酸化マ グネシウム	4.8g	1.8g	外 観	白色	白色	白色	白色
					におい	なし	なし	なし	なし
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(102.7)	—	—	99.5				
	マックメット懸濁用配合DS 外 観：白色 におい：ハッカ様芳香	乾燥水酸化アル ミニウムゲ ル、水酸化マ グネシウム	4.8g	1.8g	外 観	白色	白色	白色	白色
					におい	ハッカ様芳香	ハッカ様芳香	なし	なし
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
流動性					良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(103.0)	—	—	99.8					
抗 ヒ ス タ ミ ン 剤	ペリアクチン散1%*1 〔旧販売名：ペリアクチン100倍散〕 外 観：白色 におい：なし	シプロヘプタ ジン塩酸塩水 和物	1.2g	1.8g	外 観	白色	白色	白色	白色
					におい	なし	なし	なし	なし
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	良好	良好	良好	良好
含量(%)	100.0(103.3)	—	—	99.5					
抗 生 物 質	サワシリン細粒10%*1 〔旧販売名：サワシリン細粒〕 外 観：うすい橙色 におい：芳香あり	アモキシシリン 水和物	1g	1.8g	外 観	うすい橙色	うすい橙色	うすい橙色	うすい橙色
					におい	わずかな芳香	わずかな芳香	わずかに特異な芳香	わずかに特異な芳香
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(103.2)	—	—	99.6				
	ケフラール細粒 小児用100mg 外 観：うすい黄色 におい：オレンジ様芳香	セファクロル	7.5g	1.8g	外 観	うすい黄色	うすい黄色	うすい黄色	うすい黄色
					におい	オレンジ様芳香	わずかにオレンジ様芳香	ほぼ無臭	ほぼ無臭
					湿潤性	なし	なし	なし	なし
					流動性	良好	良好	良好	良好
	含量(%)	100.0(103.5)	—	—	99.4				
	セファクロル細粒 小児用10%〔サワイ〕 外 観：うすい橙色 におい：オレンジ様芳香	セファクロル	7.5g	1.8g	外 観	うすい橙色	うすい橙色	うすい橙色	うすい橙色
					におい	オレンジ様芳香	わずかにオレンジ様芳香	なし	なし
湿潤性					なし	なし	なし	なし	
流動性					良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(103.8)	—	—	99.4					
セフゾン細粒小児用10%*1 〔旧販売名：セフゾン細粒小児用〕 外 観：淡赤白色 におい：ストロベリー様芳香	セフジニル	3g	1.8g	外 観	淡赤白色	淡赤白色	淡赤白色	淡赤白色	
				におい	ストロベリー様芳香	わずかにストロベリー様芳香	なし	なし	
				湿潤性	なし	なし	なし	なし	
				流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(102.8)	—	—	101.2					
エリスロシンドライシロップ10%*1 〔旧販売名：エリスロシンドライシロップ〕 外 観：白色 におい：わずかに特異な芳香	エリスロマイシ ンエチルコハク 酸エステル	12g	1.8g	外 観	白色	白色	白色	白色	
				におい	わずかに特異な芳香	わずかに特異な芳香	わずかに特異な芳香	わずかに特異な芳香	
				湿潤性	なし	なし	なし	なし	
				流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(102.9)	—	—	99.4					
ミノマイシン顆粒2%*1 〔旧販売名：ミノマイシン顆粒〕 外 観：淡橙色 におい：わずかにオレンジ様芳香	ミノサイクリ ン塩酸塩	10g	1.8g	外 観	淡橙色	淡橙色	淡橙色	淡橙色	
				におい	わずかにオレンジ様芳香	なし	なし	なし	
				湿潤性	なし	なし	なし	なし	
				流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(103.3)	—	—	100.5					
ミノサイクリン塩酸塩顆粒 2%〔サワイ〕 外 観：淡橙色 におい：なし	ミノサイクリ ン塩酸塩	10g	1.8g	外 観	淡橙色	淡橙色	淡橙色	淡橙色	
				におい	なし	なし	なし	なし	
				湿潤性	なし	なし	なし	なし	
				流動性	良好	良好	良好	良好	
含量(%)	100.0(103.4)	—	—	99.3					

* 1 旧販売名の製剤で試験を実施した。

* 2 配合剤由来のピークと分離できないため、定量できなかった。

