

## 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

ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「日医工」

ロキソプロフェンナトリウム水和物細粒

ロキソプロフェンナトリウム細粒 10% 「日医工」

Loxoprofen Sodium Tablets, Fine Granules

剤形	錠：素錠 細粒：細粒		
製剤の規制区分	なし		
規格・含量	ロキソプロフェンナトリウム水和物を以下の量含有 錠：1錠中68.1mg（無水物として60mg） 細粒：1g中113.4mg（無水物として100mg）		
一般名	和名：ロキソプロフェンナトリウム水和物 洋名：Loxoprofen Sodium Hydrate		
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始 年月日		錠	細粒
	製造販売承認	2012年8月3日	2012年7月12日
	薬価基準収載	2012年12月14日	2012年12月14日
販売開始	1998年7月10日	2000年7月7日	
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>		

本IFは2023年11月改訂（第1版）の添付文書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—

(2020年4月改訂)

## 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（<https://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。

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>9</b>
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 .....	9
2. 製品の治療学的特性 .....	1	2. 薬理作用 .....	9
3. 製品の製剤学的特性 .....	1	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>10</b>
4. 適正使用に関して周知すべき特性 .....	1	1. 血中濃度の推移 .....	10
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 .....	2	2. 薬物速度論的パラメータ .....	13
6. RMP の概要.....	2	3. 母集団（ポピュレーション）解析 .....	13
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>3</b>	4. 吸収 .....	13
1. 販売名 .....	3	5. 分布 .....	13
2. 一般名 .....	3	6. 代謝 .....	13
3. 構造式又は示性式 .....	3	7. 排泄 .....	14
4. 分子式及び分子量 .....	3	8. トランスポーターに関する情報 .....	15
5. 化学名（命名法）又は本質 .....	3	9. 透析等による除去率 .....	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	3	10. 特定の背景を有する患者 .....	15
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>	11. その他 .....	15
1. 物理化学的性質 .....	4	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>16</b>
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	4	1. 警告内容とその理由 .....	16
3. 有効成分の確認試験法、定量法 .....	4	2. 禁忌内容とその理由 .....	16
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ...	16
1. 剤形 .....	5	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 ...	16
2. 製剤の組成 .....	6	5. 重要な基本的注意とその理由 .....	16
3. 添付溶解液の組成及び容量 .....	6	6. 特定の背景を有する患者に関する注意 .....	17
4. 力価 .....	6	7. 相互作用 .....	19
5. 混入する可能性のある夾雑物 .....	6	8. 副作用 .....	20
6. 製剤の各種条件下における安定性 .....	6	9. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	21
7. 調製法及び溶解後の安定性 .....	1	10. 過量投与 .....	21
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	1	11. 適用上の注意 .....	21
9. 溶出性 .....	1	12. その他の注意 .....	21
10. 容器・包装 .....	4	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>22</b>
11. 別途提供される資材類 .....	4	1. 薬理試験 .....	22
12. その他 .....	4	2. 毒性試験 .....	22
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>5</b>	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>23</b>
1. 効能又は効果 .....	5	1. 規制区分 .....	23
2. 効能又は効果に関連する注意 .....	5	2. 有効期間 .....	23
3. 用法及び用量 .....	5	3. 包装状態での貯法 .....	23
4. 用法及び用量に関連する注意 .....	5	4. 取扱い上の注意点 .....	23
5. 臨床成績 .....	5	5. 患者向け資材 .....	23

## 略 語 表

6. 同一成分・同効薬.....	23
7. 国際誕生年月日 .....	23
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.....	23
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.....	23
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容.....	24
11. 再審査期間 .....	25
12. 投薬期間制限に関する情報.....	25
13. 各種コード .....	26
14. 保険給付上の注意 .....	26
<b>X I . 文 献.....</b>	<b>27</b>
1. 引用文献 .....	27
2. その他の参考文献.....	27
<b>X II . 参 考 資 料.....</b>	<b>28</b>
1. 主な外国での発売状況.....	28
2. 海外における臨床支援情報 .....	28
<b>X III . 備 考.....</b>	<b>29</b>
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たつての参考情報.....	29
2. その他の関連資料.....	31

略語	略語内容
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
Cmax	最高血中濃度
Tmax	最高血中濃度到達時間
$t_{1/2}$	消失半減期
S.D.	標準偏差
S.E.	標準誤差
ED <sub>50</sub>	50%有効率
ID <sub>50</sub>	50%阻止濃度

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤は、ロキソプロフェンナトリウム水和物を有効成分とする鎮痛・抗炎症・解熱剤である。

ロキソプロフェンナトリウム水和物製剤の「ロルフェナミン錠」及び「ロルフェナミン細粒」は、日医工株式会社が後発医薬品として開発を企画し、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、1997年4月23日に承認を取得、「ロルフェナミン錠」は1998年7月10日、「ロルフェナミン細粒」は2000年7月7日に販売を開始した。（薬発第698号（昭和55年5月30日）に基づき承認申請）

「ロルフェナミン細粒」は1998年9月16日に、「ロルフェナミン錠」は1998年12月22日に「急性上気道炎」の適応追加をした。

また、2005年12月22日に両製剤は「歯痛」の適応追加をした。

再評価（品質再評価）の結果、1999年10月7日、両製剤は薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないとの再評価結果を得た。

医療事故防止のため、以下の販売名変更を行った。

承認年月日	販売名	旧販売名
2007年8月31日	ロルフェナミン錠 60mg	ロルフェナミン錠
2008年3月7日	ロルフェナミン細粒 10%	ロルフェナミン細粒
2012年7月12日	ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」	ロルフェナミン細粒 10%
2012年8月3日	ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」	ロルフェナミン錠 60mg

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、ロキソプロフェンナトリウム水和物を有効成分とする鎮痛・抗炎症・解熱剤である。
- (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、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. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

### 3. 製品の製剤学的特性

- (1) 錠 60mg の PTP シートはピッチコントロールを行い、1錠ごとに成分名・含量を表示した。

### 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料、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	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	

**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

ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「日医工」  
ロキソプロフェンナトリウム細粒 10% 「日医工」

#### (2) 洋名

Loxoprofen Sodium Tablets  
Loxoprofen Sodium Fine Granules

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 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)

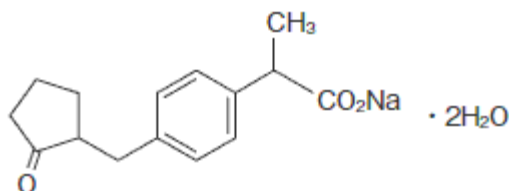
Loxoprofen Sodium Hydrate (JAN)

#### (3) ステム (stem)

イブプロフェン系の抗炎症薬：-profen

### 3. 構造式又は示性式

化学構造式：



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>15</sub>H<sub>17</sub>NaO<sub>3</sub> · 2H<sub>2</sub>O

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。

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約197℃（分解）

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (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。

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

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

##### (1) 確認試験法

###### 1) 紫外可視吸光度測定法

本品の水溶液につき、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

###### 2) 赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

###### 3) 定性反応

本品の水溶液（1→10）はナトリウム塩の定性反応を呈する。

##### (2) 定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：メタノール、水、酢酸、トリエチルアミン混液

#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別

錠：素錠

細粒：細粒

###### (2) 製剤の外観及び性状

販売名		ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「日医工」
剤形		片面に割線の入った素錠
色調		ごく薄い紅色
外形	表面	
	裏面	
	側面	
直径 (mm)		8.0
厚さ (mm)		3.0
質量 (mg)		190
本体コード		n 777
包装コード		Ⓝ777

販売名		ロキソプロフェンナトリウム細粒 10% 「日医工」
剤形		内用細粒
色調		ごく薄い紅色

###### (3) 識別コード

(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)

###### (4) 製剤の物性

(「IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

###### (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

販売名	ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「日医工」	ロキソプロフェンナトリウム細粒 10% 「日医工」
有効成分	1錠中 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)	1g 中 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	乳糖水和物、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、トウモロコシデンプン、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、デンプングリコール酸ナトリウム、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、タルク、三酸化鉄	乳糖水和物、デンプングリコール酸ナトリウム、ヒドロキシプロピルスターチ、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、タルク、三酸化鉄

### (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<sup>1)</sup>

### (1) 加速試験

試験報告日：2013/5/17

◇ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (PTP 包装)]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <片面に割線の入ったごく薄い紅色の素錠>	DI1801 DI1901 DI2001	適合	適合	適合	適合
確認試験 (呈色反応, 紫外可視吸光度測定法, 薄層クロマトグラフィー, 炎色反応)	DI1801 DI1901 DI2001	適合	—	—	適合
製剤均一性 (重量偏差試験) <15.0%以下>	DI1801 DI1901 DI2001	1.9 1.9 3.1	—	—	1.2 1.2 1.7
溶出性 (%) <30 分, 85%以上>	DI1801 DI1901 DI2001	100.4~101.3 100.0~103.5 99.6~103.1	101.2~103.2 101.4~104.5 101.0~103.6	101.7~103.9 101.2~104.1 100.1~103.0	100.1~102.8 99.9~104.3 101.5~104.8
含量 (%) ※ <93.0~107.0%>	DI1801 DI1901 DI2001	100.6 99.6 100.6	100.4 101.8 101.4	100.0 100.8 100.5	99.3 100.7 101.2

※：表示量に対する含有率 (%)

試験報告日：2012/3/1

◇ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (バラ包装)]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <片面に割線の入ったごく薄い紅 色の素錠>	SDN280 SDN290 SDN300	適合	適合	適合	適合
確認試験 (呈色反応, 紫外可視吸光度測定法, 薄層クロマトグラフィー, 炎色反応)	SDN280 SDN290 SDN300	適合	適合	適合	適合
製剤均一性 (重量偏差試験) <15.0%以下>	SDN280 SDN290 SDN300	7.5 2.9 5.3	—	—	2.6 1.4 3.6
溶出性 (%) <30 分, 85%以上>	SDN280 SDN290 SDN300	106.1~108.4 102.3~104.3 99.2~106.3	101.5~103.2 100.8~104.3 101.9~102.8	101.2~102.1 104.1~107.6 105.4~106.6	100.8~103.4 100.6~103.8 101.7~103.5
含量 (%) ※ <93.0~107.0%>	SDN280 SDN290 SDN300	106.6 101.3 102.2	100.0 100.6 101.6	101.5 100.2 101.0	101.0 100.2 100.5

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (バラ包装)]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <ごく薄い紅色の細粒剤>	LK1302	適合	適合	適合	適合
確認試験 (呈色反応, 紫外可視吸光度測定 法, 薄層クロマトグラフィー)	LK1302	適合	適合	—	適合
粒度試験 <No.18 全量通過, No.30 残留 5% 以下, No.200 通過 10%以下>	LK1302	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) <15 分, 85%以上>	LK1302	96.8~102.2	91.1~98.6	89.5~97.3	85.5~94.3
含量 (%) ※ <93.0~107.0%>	LK1302	101.9	104.4	102.3	100.3

※：表示量に対する含有率 (%)

(2) 長期保存試験

◇ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」 長期保存試験 25℃ 60%RH [最終包装形態 (バラ包装)]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	12 ヶ月	24 ヶ月	36 ヶ月
性状 <ごく薄い紅色の細粒剤>	AN1802 DN0502 HN2902	適合	適合	適合	適合
確認試験 (呈色反応, 紫外可視吸光度測定 法, 薄層クロマトグラフィー)	AN1802 DN0502 HN2902	適合	適合	適合	適合
溶出性 (%) <15 分, 85%以上>	AN1802 DN0502 HN2902	99.8~102.3 87.7~92.3 93.6~96.0	101.1~103.2 96.6~98.8 96.0~99.6	93.1~94.2 86.2~89.3 95.5~98.3	101.5~103.8 94.6~98.8 102.7~104.0
含量 (%) ※ <93.0~107.0%>	AN1802 DN0502 HN2902	99.7 98.5 99.6	100.2 97.7 98.1	99.3 95.6 96.6	98.7 95.8 100.1

※：表示量に対する含有率 (%)

(3) 無包装状態の安定性

試験期間：2004/10/1～2005/1/20

◇ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」 無包装 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	0.5 ヶ月	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 <ごく薄い紅色の素錠>	FP1001	ごく薄い紅色	ごく薄い紅色	ごく薄い紅色	ごく薄い紅色	ごく薄い紅色
溶出性 (%) n=6 <30分、85%以上>	FP1001	99.6～101.5	100.5～103.4	101.1～102.7	99.2～101.3	100.4～102.1
含量 (%) ※ n=3 <93.0～107.0%>	FP1001	99.8	99.6	100.0	99.2	99.2
(参考値) n=10 硬度 (kg)	FP1001	11.0	11.0	11.0	11.3	11.1

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」 無包装 25℃・75%RH [遮光、開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	0.5 ヶ月	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 <ごく薄い紅色の素錠>	FP1001	ごく薄い紅色	やや退色(白 っぽい紅色)	やや退色(白 っぽい紅色)	やや退色(白 っぽい紅色)	やや退色(白 っぽい紅色)
溶出性 (%) n=6 <30分、85%以上>	FP1001	99.6～101.5	97.9～103.3	100.5～102.9	99.4～101.9	99.0～102.5
含量 (%) ※ n=3 <93.0～107.0%>	FP1001	99.8	98.8	99.9	99.0	98.6
(参考値) n=10 硬度 (kg)	FP1001	11.0	3.6	4.5	4.0	3.8

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」 無包装 室温、曝光 [気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量		
		開始時	60 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 <ごく薄い紅色の素錠>	FP1001	ごく薄い紅色	ごく薄い紅色	ごく薄い紅色
溶出性 (%) n=6 <30分、85%以上>	FP1001	99.6～101.5	99.6～103.5	100.6～102.7
含量 (%) ※ n=3 <93.0～107.0%>	FP1001	99.8	99.8	99.8
(参考値) n=10 硬度 (kg)	FP1001	11.0	7.1	7.1

※：表示量に対する含有率 (%)

試験期間：2012/5/29～2012/8/31

◇ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」 無包装 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 週	1 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=10 <ごく薄い紅色の細粒剤>	KN1802	ごく薄い紅色の 細粒	ごく薄い紅色の 細粒	ごく薄い紅色の 細粒	ごく薄い紅色の 細粒
溶出性 (%) n=6 <15 分、85%以上>	KN1802	95.1～99.7	102.9～103.9	100.9～105.1	98.4～102.0
含量 (%) ※ n=3 <93.0～107.0%>	KN1802	101.4～103.4	104.3～105.3	102.6～104.8	101.2～103.1

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」 無包装 25℃・75%RH [遮光、開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	2 週	1 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=10 <ごく薄い紅色の細粒剤>	KN1802	ごく薄い紅色の 細粒	ごく薄い紅色の 細粒	ごく薄い紅色の 細粒	ごく薄い紅色の 細粒
溶出性 (%) n=6 <15 分、85%以上>	KN1802	95.1～99.7	93.9～102.2	101.4～102.9	100.6～103.2
含量 (%) ※ n=3 <93.0～107.0%>	KN1802	101.4～103.4	104.2～106.5	104.1～106.8	103.2～104.2

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」 無包装 室温、曝光 [D65 光源 (約 1600Lx、気密容器)]

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40 万 Lx・hr	80 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 n=10 <ごく薄い紅色の細粒剤>	KN1802	ごく薄い紅色の 細粒	ごく薄い紅色の 細粒	ごく薄い紅色の 細粒	ごく薄い紅色の 細粒
溶出性 (%) n=6 <15 分、85%以上>	KN1802	95.1～99.7	101.3～103.5	98.2～101.5	100.6～103.1
含量 (%) ※ n=3 <93.0～107.0%>	KN1802	101.4～103.4	100.3～103.3	99.1～100.2	99.9～100.1

※：表示量に対する含有率 (%)

## 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（物理化学的变化）

該当しない

## 9. 溶出性

### (1) 溶出規格

＜ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」＞

ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」は、日本薬局方医薬品各条に定められたロキソプロフェンナトリウム錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

(試験液に水 900mL を用い、パドル法により、50rpm で試験を行う。)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
60mg	30 分	85%以上

＜ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」＞

ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」は、日本薬局方外医薬品規格第 3 部に定められたロキソプロフェンナトリウム細粒の溶出規格に適合していることが確認されている。

(試験液に水 900mL を用い、溶出試験法第 2 法により、50rpm で試験を行う)

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
100mg/g	15 分	85%以上

(2) 溶出試験<sup>2)</sup>

<ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 9 年 12 月 22 日 医薬審発第 487 号別添）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

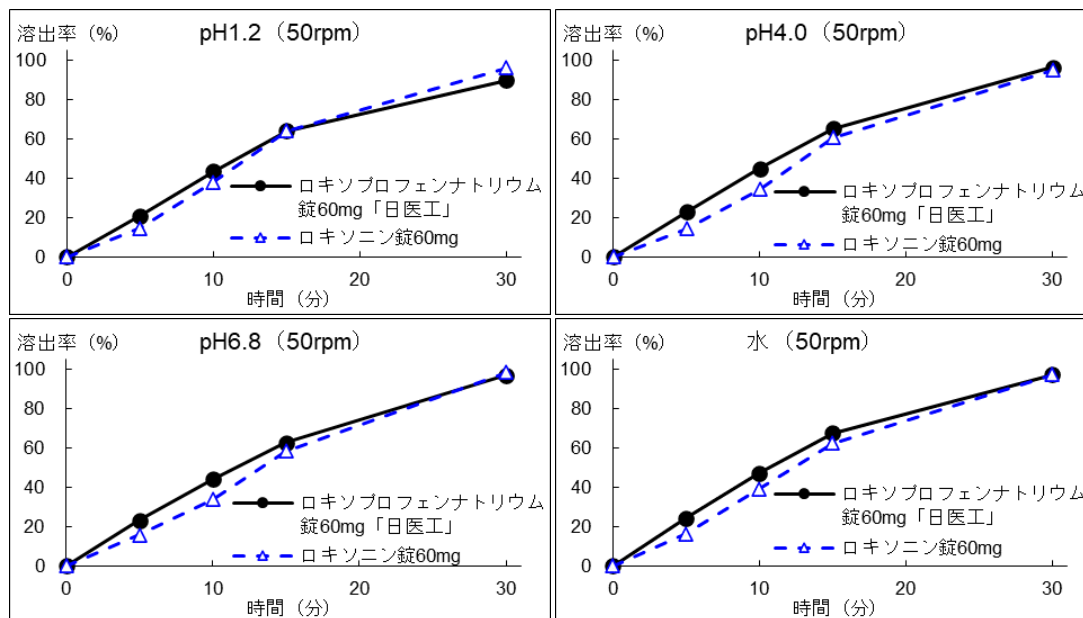
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）

[判定]

- pH1.2（50rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の 2 時点において、本品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。
- pH4.0（50rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の 2 時点において、本品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。
- pH6.8（50rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の 2 時点において、本品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。
- 水（50rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の 2 時点において、本品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、本品の溶出挙動を標準製剤（ロキソニン錠 60 mg）と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=6)



<ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 9 年 12 月 22 日 医薬審発第 487 号別添）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

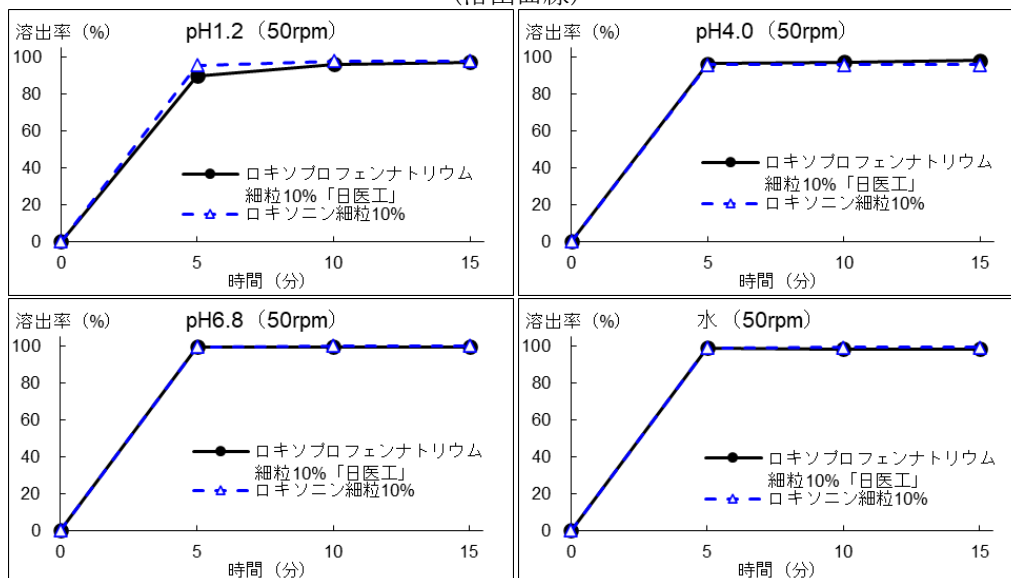
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）

[判定]

- ・ pH1.2（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH4.0（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ pH6.8（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。
- ・ 水（50rpm）では、標準製剤及び本品はともに 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤（ロキソニン細粒 10%）と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=6)

## 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

該当しない

### (2) 包装

#### 〈ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」〉

100 錠 [10 錠×10 ; PTP]

1000 錠 [10 錠×100 ; PTP]

1000 錠 [プラスチック袋 ; バラ]

#### 〈ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」〉

100g [プラスチック袋 ; バラ]

### (3) 予備容量

該当しない

### (4) 容器の材質

販売名	PTP 包装	バラ包装
ロキソプロフェン ナトリウム 錠 60mg「日医工」	PTP : ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔 ピロー : ポリエチレンテレフタレート・アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム	袋 : ポリエチレンテレフタレート・アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム
ロキソプロフェン ナトリウム 細粒 10%「日医工」		

## 11. 別途提供される資材類

該当資料なし

## 12. その他

該当記載事項なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 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

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。
手術後、外傷後並びに抜歯後の鎮痛・消 炎	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。
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

###### 17.1.1 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<sup>3)</sup>。

###### 〈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<sup>4)</sup>。

###### 〈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)、やや改善以上の割合は 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<sup>5)</sup>。

###### 〈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<sup>6)</sup>。

###### 〈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<sup>7)</sup>。

## 〈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<sup>8)</sup>。

## 〈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<sup>9)</sup>。

### (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<sup>10)</sup>。

### (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<sup>11)</sup>。

## 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 830 例の臨床成績の概要は次のとおりである<sup>8)、12) - 24)</sup>。

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		96/154 (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

非ステロイド性消炎鎮痛剤 (NSAIDs)

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・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<sup>25)、26)</sup>。

#### (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 ED<sub>50</sub> 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<sup>27)、28)</sup>。

**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 ID<sub>50</sub> 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<sup>27)、28)</sup>。

**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 ED<sub>50</sub> 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<sup>28)</sup>。

**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<sup>27)</sup>。

##### 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<sup>27)、28)</sup>。

##### 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<sup>28)</sup>。

#### (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

##### 16.1.1 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<sup>29)</sup>。

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 ( $\mu$ g/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)	AUC ( $\mu$ g · hr/mL)	吸収速度 定数 (hr <sup>-1</sup> )	消失速度 定数 (hr <sup>-1</sup> )
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	$\lambda_1 = 4.04 \pm$ 0.93
							$\lambda_2 = 0.59 \pm$ 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	$\lambda_1 = 0.99 \pm$ 0.07
							$\lambda_2 = 0.54 \pm$ 0.02

mean ± 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 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<sup>30)</sup>。

注) 本剤の承認最大用量は 180mg である。



### 16.1.3 生物学的同等性試験

#### (1) ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「日医工」

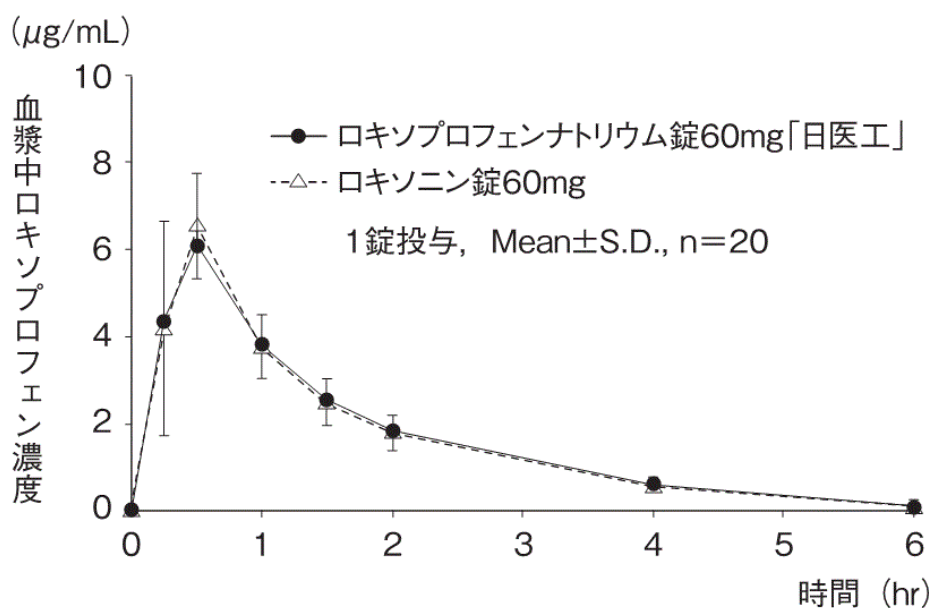
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成9年12月22日 医薬審第487号別添）

ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「日医工」及びロキソニン錠 60mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ロキソプロフェンナトリウム無水物として 60mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中ロキソプロフェン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>31)</sup>。

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→6</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr/mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g/mL}$ )	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「日医工」	10.15 ± 1.90	6.49 ± 1.74	0.49 ± 0.15	1.23 ± 0.16
ロキソニン錠 60mg	10.14 ± 1.82	6.84 ± 1.28	0.45 ± 0.10	1.24 ± 0.15

(1錠投与, Mean ± S.D., n=20)



血漿中薬物濃度推移

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) ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」

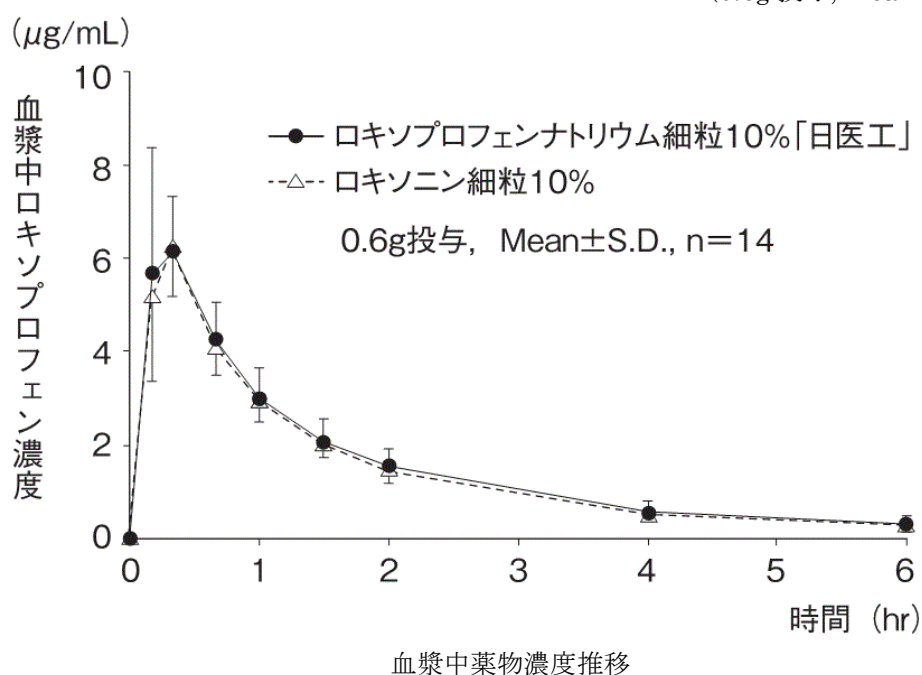
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成9年12月22日 医薬審第487号別添）

ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」及びロキソニン細粒 10%を、クロスオーバー法によりそれぞれ 0.6g（ロキソプロフェンナトリウム無水物として 60mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中ロキソプロフェン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>3,2)</sup>。

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-6</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ロキソプロフェンナトリウム 細粒 10%「日医工」	9.57±2.10	7.08±1.70	0.30±0.13	1.61±0.36
ロキソニン細粒 10%	9.23±1.38	6.51±1.35	0.31±0.06	1.65±0.38

(0.6g 投与, Mean±S.D., n=14)



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。

### (3) 中毒域

該当資料なし

### (4) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響

該当資料なし

2) 併用薬の影響

(「VIII. 7. 相互作用」の項参照)

## 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

該当資料なし

### (4) クリアランス

該当資料なし

### (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) 妊婦」の項参照）

### (3) 乳汁への移行性

（「VIII. 6. (6) 授乳婦」の項参照）

### (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

#### 16.3.1 血漿蛋白結合率

ロキソプロフェン、trans-OH 体の結合率はそれぞれ 97%、93%であった<sup>33)</sup>。

## 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

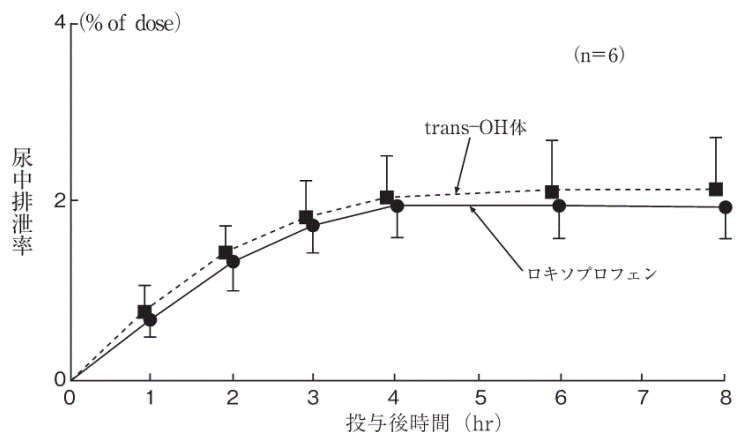
該当資料なし

#### 7. 排泄

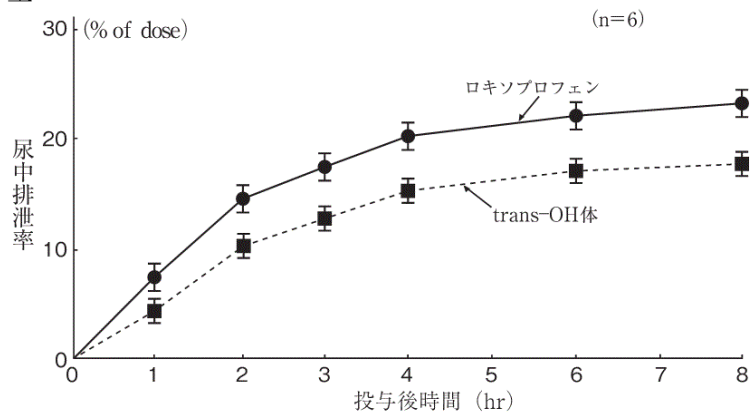
健康成人男性 6 例にロキソプロフェンナトリウム錠 60mg を単回経口投与したとき、尿中への排泄は速やかで、尿中に排泄された大部分がロキソプロフェン又は trans-OH 体のグルクロン酸抱合体であった<sup>29)</sup>。

ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 単回経口投与後の尿中排泄

遊離型



グルクロン酸抱合型



	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. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。）

### 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。

（解説）

8.4 本剤を特に歯痛に対して用いる場合には、原因が特定されないまま漫然と投与される可能性が否定できず、感染症を不顕性化したり、発熱をマスクしたりする恐れがあるため、注意を喚起することとした。

## 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 クローン病の患者

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。

(解説)

9.1.2 従来より、本剤では「消化性潰瘍のある患者」は投与禁忌として記載してきたが、抗 NSAID 潰瘍剤であるミソプロストールの電子添文の記載内容との整合性を図り、ミソプロストールとの併用に関する記載を追加し、注意を喚起することとした。

9.1.6、9.1.7

クローン病、潰瘍性大腸炎はともに炎症性腸疾患であり、NSAID 投与はプロスタグランジン合成を抑制し、粘膜防御機構を脆弱にすることにより病態を悪化させるおそれがあることから設定した。

### (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

### (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、適宜羊水量を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。

(解説)

9.5.2 公表論文の報告より、NSAIDs の妊婦への投与例で認められた胎児の腎機能障害及び尿量低下、それに伴う羊水過少症に関するリスクはシクロオキシゲナーゼ 2 阻害作用によるものと考えられるため、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に使用する際には、必要最小限の使用とし適宜羊水量を確認する旨を注意喚起することとした。

### (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。
スルホニル尿素系血糖降下剤 クロルプロパミド等	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）

###### 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 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。

###### 11.1.7 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。

###### 11.1.8 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。

###### 11.1.9 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。

###### 11.1.10 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、 $\gamma$ -GTP 上昇等）、劇症肝炎があらわれることがある。

###### 11.1.11 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。

###### 11.1.12 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。

###### 11.1.13 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 <sup>注)</sup>	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 <sup>注)</sup> 、小腸・大腸の潰瘍 <sup>注)</sup> 、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。

(解説)

他の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ことから、本項目を設定し、注意を喚起することとした。

(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」の項参照)

#### (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

該当資料なし

#### (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

製 剤	ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」 ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」	なし
有効成分	ロキソプロフェンナトリウム水和物	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

〈錠〉

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. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド：有

くすりのしおり：有

その他の患者向け資料：無

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分：ロキソニン錠 60mg、ロキソニン細粒 10%

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 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

〈ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「日医工」〉

履歴	販売名	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
販売 開始	ロルフェナミン錠	1997年 4月23日	20900AMZ00362000	1998年 7月10日	1998年 7月10日
販売名 変更	ロルフェナミン錠 60mg	2007年 8月31日	21900AMX01289000	2007年 12月21日	2007年 12月21日
販売名 変更	ロキソプロフェンナトリ ウム錠 60mg「日医工」	2012年 8月3日	22400AMX00908000	2012年 12月14日	2012年 12月14日

<ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」>※

履歴	販売名	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
販売 開始	ロルフェナミン細粒	1997年 4月23日	20900AMZ00368000	2000年 7月7日	2000年 7月7日
販売名 変更	ロルフェナミン細粒 10%	2008年 3月7日	22000AMX00533000	2008年 6月20日	2008年 6月20日
販売名 変更	ロキソプロフェンナトリ ウム細粒 10%「日医工」※	2012年 7月12日	22400AMX00753000	2012年 12月14日	2012年 12月14日

※：経過措置満了日：2024年3月31日（目安）

官報非告示品目であり、一定期間の後、本剤の医薬品コードの使用は出来なくなります。

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

<効能又は効果追加>

追加年月日：1998年9月16日

販売名：ロルフェナミン細粒

追加年月日：1998年12月22日

販売名：ロルフェナミン錠

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

（\_：追加・変更箇所）

< 効能又は効果追加 >

追加年月日：2005年12月22日

販売名：ロルフェナミン錠、ロルフェナミン細粒

	新	旧
効能 又は 効果	①下記疾患並びに症状の消炎・鎮痛 <u>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</u> ②手術後、外傷後並びに抜歯後の鎮痛・消炎 ③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）	①下記疾患並びに症状の消炎・鎮痛 慢性関節リウマチ、変形性関節症、腰痛症、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群 ②手術後、外傷後並びに抜歯後の鎮痛・消炎 ③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）
用法 及び 用量	効能又は効果①・②の場合： 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。 <u>また、空腹時の投与は避けさせることが望ましい。</u> 効能又は効果③の場合： 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。	効能又は効果①・②の場合： 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。 効能又は効果③の場合： 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。

(\_\_：追加・変更箇所)

## 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

< 品質再評価 >

結果公表年月日：1999年10月7日

販売名：ロルフェナミン錠、ロルフェナミン細粒

内容：両製剤は薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しない

## 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、投薬期間に関する制限は定められていない。

### 13. 各種コード

販売名	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 (9桁) 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 ンナトリウム 錠 60mg「日医工」	1149019F1595	1149019F1595	101009101	620100901
ロキソプロフェ ンナトリウム 細粒 10%「日医工」	1149019C1017	1149019C1165	112151301	621215101

※ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」

：経過措置満了日：2024 年 3 月 31 日（目安）

官報非告示品目であり、一定期間の後、本剤の医薬品コードの使用は出来なくなります。

### 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) 社内資料：安定性資料
- 2) 社内資料：溶出試験
- 3) 五十嵐三都男 他：リウマチ. 1985 ; 25 (1) : 61-72
- 4) 青木虎吉 他：医学のあゆみ. 1986 ; 136 (12) : 983-1001
- 5) 広畑和志 他：Prog. Med. 1985 ; 5 (5) : 1487-1505
- 6) 天児民和 他：臨牀と研究. 1985 ; 62 (9) : 2938-2953
- 7) 長屋郁郎 他：臨床医薬. 1985 ; 1 (1) : 69-89
- 8) 内田安信 他：歯科薬物療法. 1984 ; 3 (1) : 32-48
- 9) 藤森一平 他：Prog. Med. 1985 ; 5 (5) : 1469-1485
- 10) 勝正孝 他：臨床医薬. 1993 ; 9 (10) : 2299-2320
- 11) 勝正孝 他：臨床医薬. 1993 ; 9 (10) : 2321-2331
- 12) 塩川優一 他：Prog. Med. 1984 ; 4 (12) : 2561-2577
- 13) 菅原幸子 他：臨牀と研究. 1985 ; 62 (10) : 3395-3412
- 14) 青木虎吉 他：臨牀と研究. 1985 ; 62 (3) : 1015-1024
- 15) 内藤正俊 他：診療と新薬. 1984 ; 21 (12) : 2546-2552
- 16) 今井望：臨牀と研究. 1985 ; 62 (7) : 2257-2267
- 17) 小田裕胤 他：新薬と臨牀. 1985 ; 34 (2) : 188-194
- 18) 川上和夫：薬理と治療. 1985 ; 13 (1) : 287-299
- 19) 比嘉康宏 他：薬理と治療. 1983 ; 11 (8) : 3235-3248
- 20) 吉岡利孝：薬理と治療. 1984 ; 12 (2) : 807-819
- 21) 太田信夫 他：新薬と臨牀. 1984 ; 33 (11) : 1535-1546
- 22) 斉藤敏二：臨牀と研究. 1984 ; 61 (8) : 2734-2743
- 23) 原田容治 他：臨床医薬. 1992 ; 8 (5) : 1205-1218
- 24) 荻原俊男 他：臨床医薬. 1992 ; 8 (5) : 1219-1225
- 25) 松田啓一 他：炎症. 1982 ; 2 (3) : 263-266
- 26) 山口武 他：炎症. 1983 ; 3 (1) : 63-67
- 27) 三坂英一 他：応用薬理. 1981 ; 21 (5) : 753-771
- 28) 飯塚義夫 他：薬理と治療. 1986 ; 14 (8) : 5191-5209
- 29) 長沼英夫 他：臨床医薬. 1986 ; 2 (9) : 1219-1237
- 30) 阿部重人 他：炎症. 1985 ; 5 (1) : 67-79
- 31) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 60mg）
- 32) 社内資料：生物学的同等性試験（細粒 10%）
- 33) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店 2021 ; C6311-C6316

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

なし

### 2. 海外における臨床支援情報

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

##### 粉砕物の安定性試験

##### ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「日医工」

粉砕物の安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は開始時ごく薄い紅色の粉末で、0.5 ヶ月後一部固化した。含量は規格内であった。

試験実施日：2004/10/1～2005/1/20

#### ● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光、開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	0.5 ヶ月	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	FP1001	ごく薄い紅 色の粉末	一部固化	一部固化	一部固化	一部固化
含量 (%) ※ <93.0～107.0%>	FP1001	99.8	100.0	99.9	99.8	99.5
(参考値) 重量変化 (%)	FP1001	—	+4.2	+3.9	+3.3	+4.0

※：表示量に対する含有率 (%)

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

### ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「日医工」

#### 1) 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

温湯（約 55℃）20mL の入ったビーカーに、製剤 1 錠（1 回投与量）を入れてかき混ぜ、5～10 分間自然放置する。

##### [通過性試験]

十分に分散懸濁した液を、シリンジに入れ経管チューブに投与する。必要であれば、容器、シリンジ及び経管チューブ内に付着した残留物を少量の水で洗う。

試験実施期間：2005/10/20

ロット番号：FR2201

#### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「日医工」	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分で崩壊せず 10 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr. チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（(株) じほう）」を改変して実施しました。

## ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「日医工」

### 1) 試験方法

#### [崩壊懸濁試験]

検体 1g を容器にとり、約 55℃の温湯 20mL を加え、軽く攪拌し、ディスペンサー内に入れ、ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1g を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

#### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施期間：2019/1/30~2/7

ロット番号：D00400

### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
ロキソプロフェンナトリウム 細粒 10%「日医工」	5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

### 2. その他の関連資料

該当資料なし