

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 2013 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 [CH]

ロキソプロフェンナトリウム細粒10% [CH]
(ロキソプロフェンナトリウム水和物細粒)

剤形	錠 60mg：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 を含有 (無水物として 60mg) 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 を含有 (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・発売年月日	製造販売承認年月日：2008 年 2 月 28 日 (販売名変更による) 薬価基準収載年月日：2008 年 6 月 20 日 (販売名変更による) 発売年月日：1998 年 7 月 10 日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売元：日本ジェネリック株式会社 製造販売元：長生堂製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客様相談室 受付時間：9 時～18 時（土、日、祝日を除く） TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172 医療関係者向けホームページ： https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/

本 IF は 2022 年 10 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

IF 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、添付文書と略す)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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬と略す)学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、IF と略す)の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」(<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する PMDA ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体(図表は除く)で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別(内用剤, 注射剤, 外用剤)に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの, 製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」(以下, 「IF 記載要領 2013」と略す)により作成された IF は, 電子媒体での提供を基本とし, 必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は, 平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については, 「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂, 再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ, 記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては, PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は, 電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については, PMDA ホーム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薬剤師等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, 当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等, あるいは医薬品医療機器情報配信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 ホームページで確認する。

なお, 適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることがあり, その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし, 薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により, 製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて, 当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから, 記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は, IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり, インターネットでの公開等も踏まえ, 薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目次

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯……………6
2. 製品の治療学的・製剤学的特性……………6

II. 名称に関する項目

1. 販売名……………7
2. 一般名……………7
3. 構造式又は示性式……………7
4. 分子式及び分子量……………7
5. 化学名(命名法) ……8
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号……………8
7. CAS 登録番号……………8

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質……………9
2. 有効成分の各種条件下における安定性……………9
3. 有効成分の確認試験法……………9
4. 有効成分の定量法……………9

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形……………10
2. 製剤の組成……………10
3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意……………11
4. 製剤の各種条件下における安定性…11
5. 調製法及び溶解後の安定性……………14
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化) ……14
7. 溶出性……………14
8. 生物学的試験法……………18
9. 製剤中の有効成分の確認試験法…18
10. 製剤中の有効成分の定量法……………19
11. 力価……………19
12. 混入する可能性のある夾雑物……………19
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報……………19
14. その他……………19

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果……………20
2. 用法及び用量……………20
3. 臨床成績……………20

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……………22
2. 薬理作用……………22

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法……………23
2. 薬物速度論的パラメータ……………25
3. 吸収……………25
4. 分布……………25
5. 代謝……………26
6. 排泄……………26
7. トランスポーターに関する情報…26
8. 透析等による除去率……………26

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……………27
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)……………27
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由……………27
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由……………27
5. 慎重投与内容とその理由……………28
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法……………28
7. 相互作用……………29
8. 副作用……………30
9. 高齢者への投与……………33
10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与……………33
11. 小児等への投与……………33
12. 臨床検査結果に及ぼす影響……………33
13. 過量投与……………33
14. 適用上の注意……………33

15. その他の注意	34
16. その他	34

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	35
2. 毒性試験	35

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	36
2. 有効期間又は使用期限	36
3. 貯法・保存条件	36
4. 薬剤取扱い上の注意点	36
5. 承認条件等	36
6. 包装	36
7. 容器の材質	37
8. 同一成分・同効薬	37
9. 国際誕生年月日	37
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	37
11. 薬価基準収載年月日	37
12. 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	37
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	38
14. 再審査期間	38
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	38
16. 各種コード	38
17. 保険給付上の注意	38

X I. 文献

1. 引用文献	39
2. その他の参考文献	39

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	40
2. 海外における臨床支援情報	40

X III. 備考

その他の関連資料	41
----------	----

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。

長生堂製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬発第 698 号(昭和 55 年 5 月 30 日)に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、1997 年 5 月にロキフラン錠及びロキフラン細粒として承認を得て、1998 年 7 月発売に至った。

その後、1999 年 5 月に一部変更承認され、急性上気道炎(急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む)における解熱・鎮痛の効能・効果が追加された。

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 日研第 4 号、医薬審第 104 号)に基づき、2005 年 12 月に「歯痛」の効能・効果が追加された。

なお、本剤は販売名変更に伴う再承認を得て、販売名を 2008 年 2 月にロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「CH」及びロキソプロフェンナトリウム細粒 10% 「CH」に変更し、2008 年 6 月に変更銘柄名で薬価基準に収載された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、フェニルプロピオン酸系の非ステロイド性鎮痛・抗炎症・解熱剤である。
- (2) 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。なお、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、溶血性貧血、白血球減少、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、消化管出血、消化管穿孔、小腸・大腸の狭窄・閉塞、肝機能障害、黄疸、喘息発作、無菌性髄膜炎、横紋筋融解症があらわれることがある。また、類薬による重大な副作用として、再生不良性貧血があらわれることがある。([VIII.8. (2) 重大な副作用と初期症状]の項参照)

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 「CH」
ロキソプロフェンナトリウム細粒 10% 「CH」

(2) 洋名：

LOXOPROFEN SODIUM Tablets 60mg “CH”
LOXOPROFEN SODIUM Fine Granules 10% “CH”

(3) 名称の由来：

一般名＋剤形＋含量＋「CH」

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)

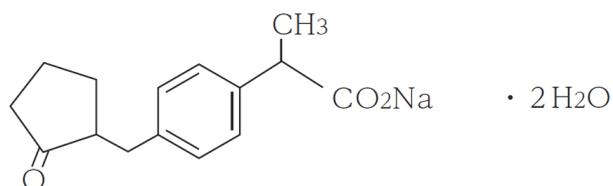
(2) 洋名(命名法)：

Loxoprofen Sodium Hydrate (JAN)
Loxoprofen (INN)

(3) ステム：

イブプロフェン系抗炎症薬：-profen

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)

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

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

別名: ロキソプロフェンナトリウム

7. CAS 登録番号

80382-23-6 (Loxoprofen Sodium Hydrate)

68767-14-6 (Loxoprofen)

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：

旋光性：水溶液(1→20)は旋光性を示さない。

pH：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

日局「ロキソプロフェンナトリウム水和物」の確認試験による。

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)

(3) ナトリウム塩の定性反応

4. 有効成分の定量法

日局「ロキソプロフェンナトリウム水和物」の定量法による。

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

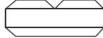
1. 剤形

(1) 剤形の区別, 外観及び性状 :

錠 60mg

剤形・性状 : 微紅色の片面 1/2 割線入り素錠

外形 :

表	裏	側面	直径	9.0 mm
			厚さ	3.3 mm
			重量	250 mg

細粒 10%

剤形・性状 : 微紅色の細粒剤

(2) 製剤の物性 :

該当資料なし

(3) 識別コード :

錠 60mg : なし / (本体表示) ロキソプロフェン 60 ch

細粒 10% : なし

(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等 :

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量 :

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 含有
(無水物として 60mg)

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 含有
(無水物として 100mg)

(2) 添加物 :

錠 60mg	細粒 10%
乳糖水和物, 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, 三二酸化鉄, ポリソルベート 40	乳糖水和物, 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, 含水二酸化ケイ素, 三二酸化鉄, ポリソルベート 40

(3) その他：

該当しない

3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験

錠 60mg¹⁾

加速試験(40℃, 相対湿度 75%, 6 ヶ月)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推測された。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
最終包装製品 (PTP 包装)	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	質量 偏差試験	適合	—	—	適合
	崩壊試験	適合	適合	適合	適合
	定量試験	100.6%	100.2%	100.5%	99.8%
	純度試験	適合	適合	適合	適合
	溶出試験	86.1%	86.3%	87.1%	84.9%
最終包装製品 (バラ包装)	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	質量 偏差試験	適合	—	—	適合
	崩壊試験	適合	適合	適合	適合
	定量試験	100.6%	100.5%	100.4%	99.5%
	純度試験	適合	適合	適合	適合
	溶出試験	86.1%	85.9%	86.1%	86.1%

細粒 10%²⁾

加速試験(40℃, 相対湿度 75%, 6 ヶ月)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推測された。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
最終包装製品 (バラ包装)	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	粒度試験	適合	—	—	適合
	定量試験	100.3%	100.0%	99.4%	100.0%
	純度試験	適合	適合	適合	適合

(2) 長期安定性試験

錠 60mg¹⁾

長期保存試験(室温保存, 3 年)の結果, 外観及び含量等は規格の範囲内であり, 室温保存における 3 年間の安定性が確認された。

保存形態	試験項目	開始時	3 年
最終包装製品 (PTP 包装)	性状	適合	適合
	確認試験	適合	適合
	質量偏差試験	適合	適合
	溶出試験	102.5%	103.9%
	定量試験	101.2%	102.6%

細粒 10%²⁾

長期保存試験(室温保存, 3 年)の結果, 外観及び含量等は規格の範囲内であり, 室温保存における 3 年間の安定性が確認された。

保存形態	試験項目	開始時	3 年
最終包装製品 (バラ包装)	性状	適合	適合
	確認試験	適合	適合
	粒度試験	適合	適合
	溶出試験	99.4%	98.8%
	定量試験	99.0%	96.5%

(3) 無包装状態での安定性試験

錠 60mg

保存条件

- ①温度：40℃，3 ヶ月〔遮光・気密容器〕
- ②湿度：30℃/75%RH，3 ヶ月〔遮光・開放〕
- ③光：120 万 lux・hr（1000lux/hr・50 日）〔気密容器〕

	外観	崩壊性	溶出性	含量	硬度	評価
①温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
②湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎
③光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	◎

細粒 10%

保存条件

- ①温度：40℃，3 ヶ月〔遮光・気密容器〕
- ②湿度：25℃/75%RH，3 ヶ月〔遮光・開放〕
- ③光：60 万 lux・hr（1000lux/hr・25 日）〔シャールにラップをし保存〕

	外観	溶出性	含量	評価
①温度	変化なし	変化なし	変化なし	◎
②湿度	変化なし	変化なし	変化なし	◎
③光	変化なし	変化なし	変化なし	◎

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成 11 年 8 月 20 日(社)日本病院薬剤師会学術第 5 小委員会)の評価分類基準(下記)に準じる。

◎：すべての測定項目において変化を認めなかった。

(外観：変化をほとんど認めない。崩壊性・溶出性：規格値内。含量：3%未満の低下。硬度：30%未満の変化。)

○：いずれかの測定項目で「規格内」の変化を認めた。

(外観：わずかな色調変化(退色等)等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている。含量：3%以上の低下で、規格値内。硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf 以上。)

△：いずれかの測定項目で「規格外」の変化を認めた。

(外観：形状変化や著しい色調変化等を認め、規格を逸脱している。崩壊性・溶出性：規格値外。含量：規格値外。硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf 未満。)

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

該当資料なし

7. 溶出性

(1) 溶出規格

錠 60mg

日本薬局方医薬品各条 ロキソプロフェンナトリウム錠溶出規格に適合する。

試験法：日局溶出試験法(パドル法)

条件：回転数 50rpm

試験液 水

結果：30 分間 85%以上

細粒 10%

日本薬局方外医薬品規格第 3 部 ロキソプロフェンナトリウム 10%細粒溶出規格に適合する。

試験法：日局溶出試験法(パドル法)

条件：回転数 50rpm

試験液 水

結果：15 分間 85%以上

(2) 品質再評価における溶出試験結果

錠 60mg³⁾

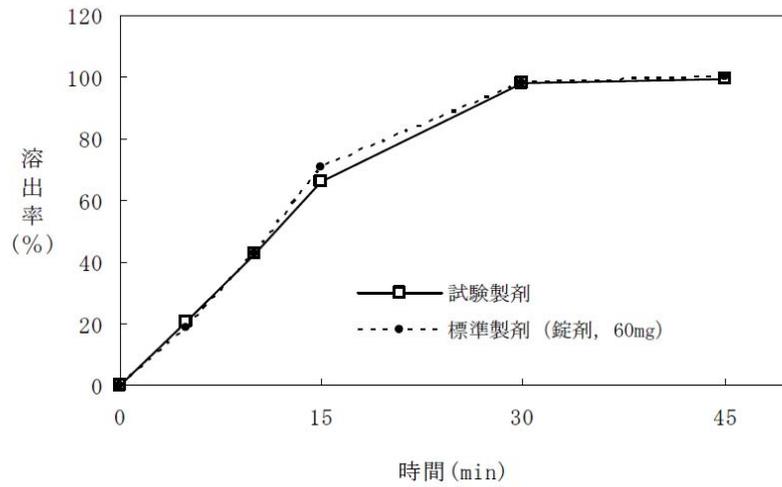
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 9 年 12 月 22 日 医薬審第 487 号)」に従い、標準製剤との溶出挙動の同等性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH4.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm

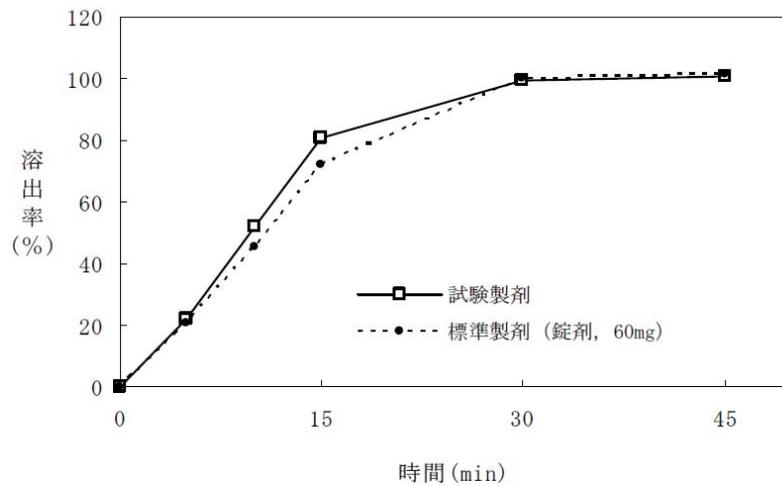
[判定基準]

①～④：標準製剤の平均溶出率が60%及び85%付近の適当な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%の範囲にある。

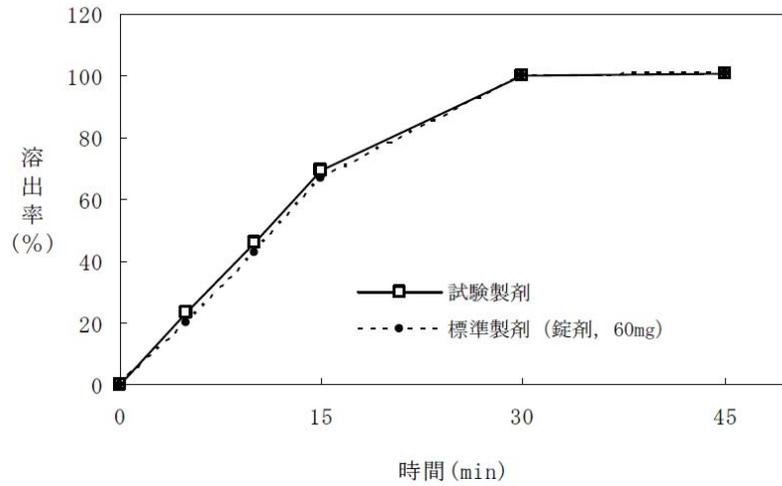
①pH1.2, 50rpm



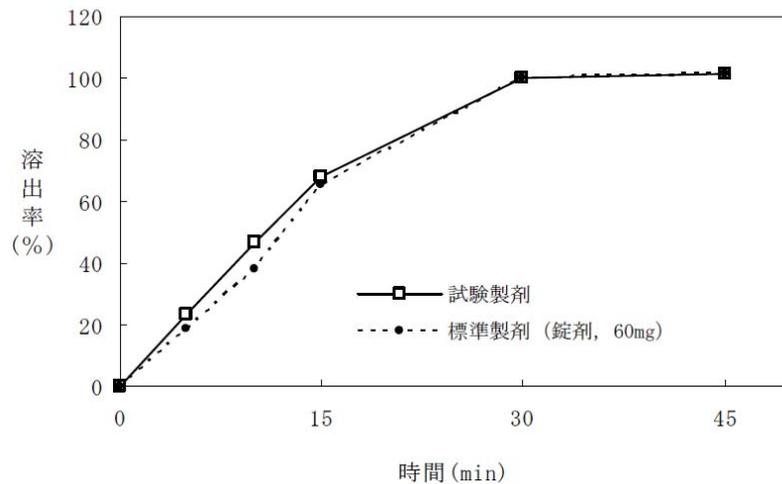
②pH4.0, 50rpm



③pH6.8, 50rpm



④水, 50rpm



細粒 10%⁴⁾

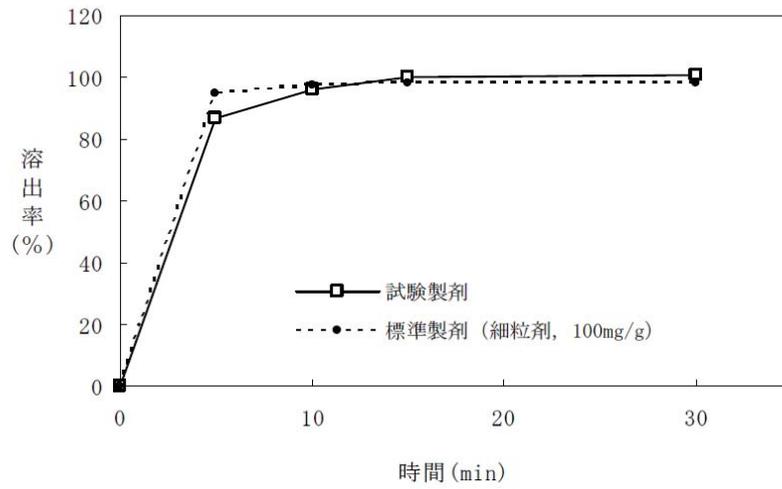
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日医薬審第487号)」に従い, 標準製剤との溶出挙動の同等性を判定した結果, 両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH4.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm

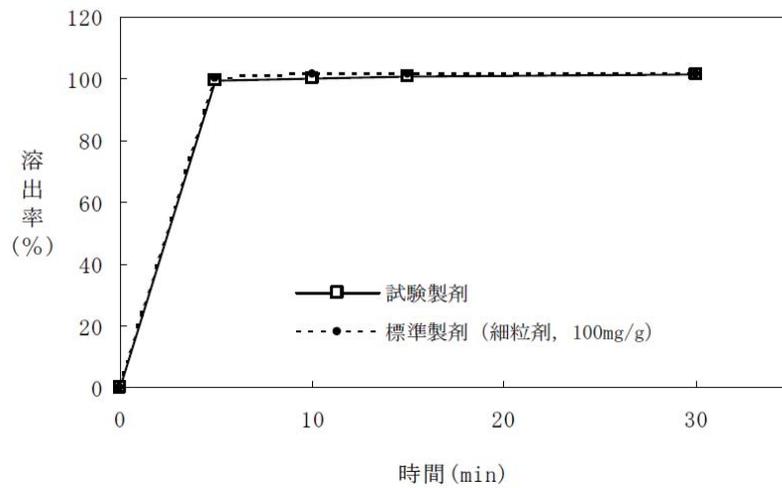
[判定基準]

①～④：試験製剤は15分以内に平均85%以上溶出する。又は、標準製剤の平均溶出率が85%付近の適当な時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にある。

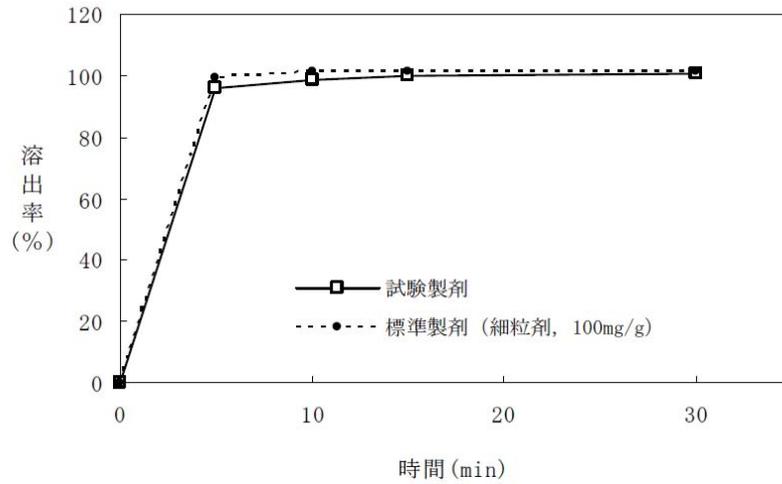
①pH1.2, 50rpm



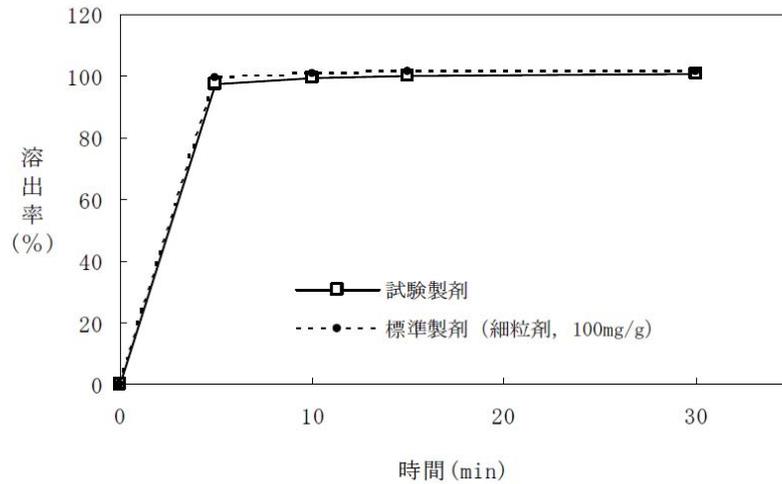
②pH4.0, 50rpm



③pH6.8, 50rpm



④水, 50rpm



8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

錠 60mg :

日局「ロキソプロフェンナトリウム錠」の確認試験による。

紫外可視吸光度測定法

細粒 10% :

(1) 4-ジメチルアミノベンズアルデヒドのエタノール溶液及び水酸化ナトリウム試液による呈色反応

加温するとき、液は黄色を呈する。

(2) 紫外可視吸光度測定法

極大吸収波長：221～225nm

(3) 薄層クロマトグラフィー

展開溶媒：1,2-ジクロロエタン・酢酸混液

薄層板：薄層クロマトグラフィー用シリカゲル(蛍光剤入り)

判定：紫外線(主波長 254nm)を照射するとき、試料溶液及び標準溶液から得たスポットは青紫色を呈し、それらの R_f 値は等しい。

10. 製剤中の有効成分の定量法

錠 60mg：

日局「ロキソプロフェンナトリウム錠」の定量法による。

液体クロマトグラフィー

細粒 10%：

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

- (1) 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
- (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)

2. 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。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(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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ :

該当しない

(2) 臨床効果 :

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験 :

該当資料なし

(4) 探索的試験 :

該当資料なし

(5) 検証的試験 :

1) 無作為化並行用量反応試験 :

該当資料なし

2) 比較試験：

該当資料なし

3) 安全性試験：

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験
(市販後臨床試験)：

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試験の概要：

該当しない

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

非ステロイド性抗炎症薬 (NSAIDs)

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序⁵⁾ :

プロドラッグであり、活性代謝物のトランス OH 体が酸性非ステロイド性抗炎症薬としての作用を示す。すなわち、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、抗炎症作用、解熱作用、鎮痛作用を現す。構成型 COX (COX-1) と誘導型 COX (COX-2) に対する選択性はない。

(2) 薬効を裏付ける試験成績 :

該当資料なし

(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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度：

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間：

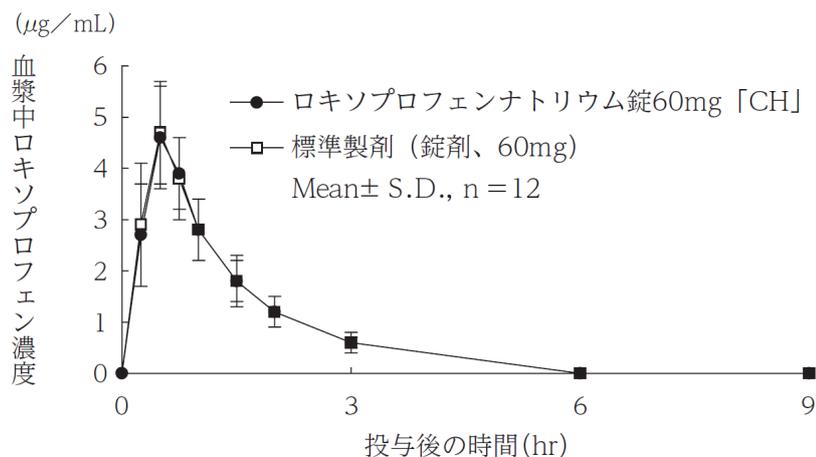
〔(3)臨床試験で確認された血中濃度〕の項参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度：

生物学的同等性試験

錠 60mg⁶⁾

ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「CH」と標準製剤を、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水和物 68.1mg (無水物として 60mg)含有)健康成人男子に空腹時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。



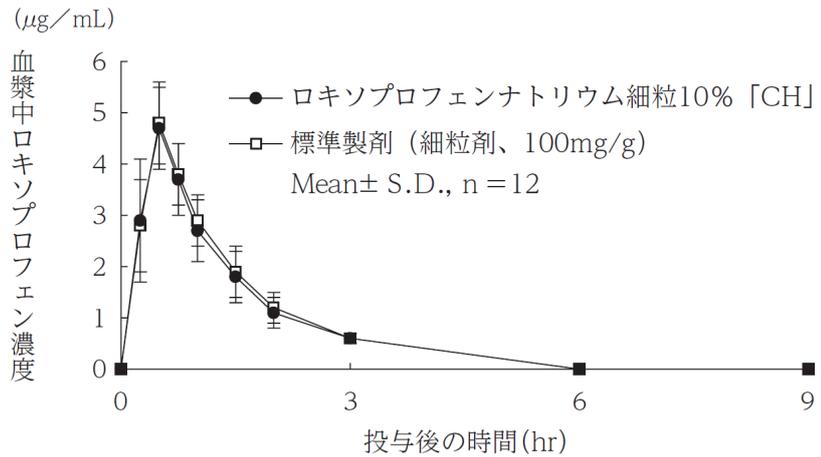
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₉ ($\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ロキソプロフェンナトリウム錠60mg「CH」	6.9±1.1	5.0±0.7	0.5±0.2	1.0±0.1
標準製剤 (錠剤、60mg)	6.9±1.0	5.0±0.8	0.5±0.1	0.9±0.1

(Mean±S.D., n=12)

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。

細粒 10%⁷⁾

ロキソプロフェンナトリウム細粒 10% 「CH」と標準製剤を、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水和物 68.1mg (無水物として 60mg) 含有)健康成人男子に空腹時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。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₉ (µg · hr/mL)	Cmax (µg/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ロキソプロフェンナトリウム細粒10% 「CH」	6.7 ± 1.0	4.9 ± 0.6	0.5 ± 0.1	0.9 ± 0.1
標準製剤 (細粒剤、100mg/g)	7.0 ± 1.1	4.9 ± 0.7	0.5 ± 0.1	0.9 ± 0.1

(Mean ± S.D., n=12)

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。

(4) 中毒域：

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響：

該当資料なし

(6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因：

該当資料なし

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) バイオアベイラビリティ：
該当資料なし
- (4) 消失速度定数：
該当資料なし
- (5) クリアランス：
該当資料なし
- (6) 分布容積：
該当資料なし
- (7) 血漿蛋白結合率：
該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 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：
該当資料なし
- (3) 乳汁への移行性：
〔Ⅷ.10.妊婦,産婦,授乳婦等への投与〕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

5. 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(CYP450 等)の分子種：
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比率：
該当資料なし
- (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ：
該当資料なし

6. 排泄

- (1) 排泄部位及び経路：
該当資料なし
- (2) 排泄率：
該当資料なし
- (3) 排泄速度：
該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

該当しない(現段階では定められていない)

2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- (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。](ただし, [5. 慎重投与内容とその理由]の項参照)
- (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。]
- (3) 重篤な肝障害のある患者[副作用として肝障害が報告されており, 悪化するおそれがある。]
- (4) 重篤な腎障害のある患者[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。]
- (5) 重篤な心機能不全のある患者[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。]
- (6) 本剤の成分に過敏症の既往歴のある患者
- (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。]
- (8) 妊娠末期の女性([10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与]の項参照)

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

- (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。]
- (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[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ので、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。]
- (3) 血液の異常又はその既往歴のある患者[溶血性貧血等の副作用が起こりやすくなる。]
- (4) 肝障害又はその既往歴のある患者[肝障害を悪化又は再発させることがある。]
- (5) 腎障害又はその既往歴のある患者[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。]
- (6) 心機能異常のある患者([2.禁忌内容とその理由]の項参照)
- (7) 過敏症の既往歴のある患者
- (8) 気管支喘息の患者[病態を悪化させることがある。]
- (9) 潰瘍性大腸炎の患者[病態を悪化させることがある。]
- (10) クロウン病の患者[病態を悪化させることがある。]
- (11) 高齢者([9.高齢者への投与]の項参照)

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (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。
- (2) 慢性疾患(関節リウマチ、変形性関節症)に対し本剤を用いる場合には、次の事項を考慮すること。
 - 1) 長期投与する場合には定期的に臨床検査(尿検査、血液検査及び肝機能検査等)を行うこと。また、異常が認められた場合には減量、休薬等の適切な措置を講ずること。
 - 2) 薬物療法以外の療法も考慮すること。
- (3) 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。
 - 1) 急性炎症、疼痛及び発熱の程度を考慮し、投与すること。
 - 2) 原則として同一の薬剤の長期投与を避けること。
 - 3) 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。
- (4) 患者の状態を十分観察し、副作用の発現に留意すること。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。

- (5) 感染症を不顕性化するおそれがあるので、感染による炎症に対して用いる場合には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。
- (6) 他の消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい。
- (7) 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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由：

該当しない(現段階では定められていない)

(2) 併用注意とその理由：

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)	その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、その薬剤の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	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 (トルブタミド等)	その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、その薬剤の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)	その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。本剤の併用によりその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、その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)	その利尿・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)	その降圧作用を減弱するおそれがある。	本剤のプロスタグランジンの生合成抑制作用により、これらの薬剤の降圧作用を減弱させる可能性がある。
	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、腎血流量が低下するためと考えられる。

8. 副作用

(1) 副作用の概要：

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。

(2) 重大な副作用と初期症状：

1) 重大な副作用(頻度不明)

- ① ショック, アナフィラキシー：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ので、観察を十分に行い、異常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。

- ② **無顆粒球症, 溶血性貧血, 白血球減少, 血小板減少** : 無顆粒球症, 溶血性貧血, 白血球減少, 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い, 異常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。
- ③ **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** : 中毒性表皮壊死融解症, 皮膚粘膜眼症候群, 多形紅斑, 急性汎発性発疹性膿疱症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直ちに投与を中止し, 適切な処置を行うこと。
- ④ **急性腎障害, ネフローゼ症候群, 間質性腎炎** : 急性腎障害, ネフローゼ症候群, 間質性腎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直ちに投与を中止し, 適切な処置を行うこと。また, 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。
- ⑤ **うっ血性心不全** : うっ血性心不全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直ちに投与を中止し, 適切な処置を行うこと。
- ⑥ **間質性肺炎** : 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。
- ⑦ **消化管出血** : 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, 観察を十分に行い, 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。
- ⑧ **消化管穿孔** : 消化管穿孔があらわれることがあるので, 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。
- ⑨ **小腸・大腸の狭窄・閉塞** : 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, 観察を十分に行い, 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。
- ⑩ **肝機能障害, 黄疸** : 肝機能障害(黄疸, AST (GOT) 上昇, ALT (GPT) 上昇, γ -GTP 上昇等), 劇症肝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中止するなど適切な処置を行うこと。
- ⑪ **喘息発作** : 喘息発作等の急性呼吸障害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, 本剤の投与を直ちに中止し, 適切な処置を行うこと。

⑫ 無菌性髄膜炎：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ので，観察を十分に行い，異常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。（特に SLE 又は MCTD の患者に発現しやすい。）

⑬ 横紋筋融解症：横紋筋融解症があらわれることがあるので，観察を十分に行い，筋肉痛，脱力感，CK（CPK）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) 重大な副作用（類薬）

再生不良性貧血：他の非ステロイド性消炎鎮痛剤で，再生不良性貧血があらわれるとの報告がある。

(3) その他の副作用：

	頻度不明
過 敏 症 ^{注)}	発疹，そう痒感，蕁麻疹，発熱
消 化 器	腹痛，胃部不快感，食欲不振，悪心・嘔吐，下痢，消化性潰瘍 ^{注)} ，便秘，胸やけ，口内炎，消化不良，口渇，腹部膨満，小腸・大腸の潰瘍 ^{注)}
循 環 器	動悸，血圧上昇
精神神経系	眠気，頭痛，しびれ，めまい
血 液	貧血，白血球減少，好酸球增多，血小板減少
肝 臓	AST（GOT）上昇，ALT（GPT）上昇，ALP 上昇
泌 尿 器	血尿，蛋白尿，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。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧：

該当資料なし

(5) 基礎疾患，合併症，重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度：

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法：

[2.禁忌内容とその理由]

[5.慎重投与内容とその理由]

[8.副作用]の項参照

9. 高齢者への投与

高齢者では、副作用があらわれやすいので、少量から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。〔6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法〕の項参照)

10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与

- (1) 妊婦(妊娠末期以外)又は妊娠している可能性のある女性には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。妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。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。
- (2) 妊娠末期の女性には投与しないこと。〔動物実験(ラット)で分娩遅延が報告されている。〕
- (3) 妊娠末期のラットに投与した実験で、胎児の動脈管収縮が報告されている。
- (4) 授乳中の女性に投与することを避け、やむをえず投与する場合には授乳を中止させること。〔動物実験(ラット)で乳汁中への移行が報告されている。〕

11. 小児等への投与

低出生体重児, 新生児, 乳児, 幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 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。)

15. その他の注意

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. その他

該当しない

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) 副次的薬理試験 :

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験 :

該当資料なし

(4) 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⁸⁾ :

LD₅₀ 値 (mg/kg)

動物	性別	経口	皮下注	腹腔内	静注
マウス	♂	3,030	1,070	1,130	740
ラット	♀	145	285	275	155

(2) 反復投与毒性試験 :

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験 :

該当資料なし

(4) 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

- (1) 製剤：該当しない
- (2) 有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年(安定性試験結果に基づく)

3. 貯法・保存条件

錠 60mg：室温保存, 気密容器
細粒 10%：室温保存

4. 薬剤取り扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について：

錠 60mg

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。

(2) 薬剤交付時の取り扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)：

[Ⅷ.14.適用上の注意]の項参照

患者向医薬品ガイド：有り, くすりのしおり：有り

(3) 調剤時の留意点について：

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

錠 60mg

PTP：100錠(10錠×10), 1000錠(10錠×100)

バラ：1000錠

細粒 10%

バラ：1kg

7. 容器の材質

錠 60mg

PTP：PTP（ポリ塩化ビニルフィルム, アルミニウム箔）, 紙箱

バラ：ポリエチレン製容器, ポリプロピレン製キャップ, 紙箱

細粒 10%

バラ：ポリエチレン製袋, ポリエチレン製容器, ポリプロピレン製キャップ,
紙箱

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ロキソニン®錠 60mg, ロキソニン®細粒 10%, ロキソニン®テープ
50mg, ロキソニン®テープ 100mg, ロキソニン®パップ 100mg, ロ
キソニン®ゲル 1%

同効薬：ケトプロフェン, アスピリン, プラノプロフェン等

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	承認年月日	承認番号
ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「CH」	2008年2月28日 (販売名変更による)	22000AMX00107000
ロキソプロフェンナトリウム細粒 10% 「CH」	2008年2月28日 (販売名変更による)	22000AMX00109000

11. 薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日	薬価基準経過措置期限
ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「CH」	2008年6月20日 (販売名変更による)	—
ロキソプロフェンナトリウム細粒 10% 「CH」	2008年6月20日 (販売名変更による)	—

12. 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・効果及び用法・用量追加承認年月日：1999年5月10日

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)」の効能・効果
及び用法・用量の追加

効能・効果及び用法・用量追加, 変更承認年月日: 2005年12月22日
内容: 「歯痛」の効能・効果の追加及び「また, 空腹時の投与は避けさせることが望ましい。」を用法・用量に追加

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は, 投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT (9桁) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算 コード
ロキソプロフェンナト リウム錠 60mg 「CH」	101003904	1149019F1498	620007152
ロキソプロフェンナト リウム細粒 10% 「CH」	100986603	1149019C1017	620007151

17. 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) 長生堂製薬株式会社 社内資料(安定性試験に関する資料)
- 2) 長生堂製薬株式会社 社内資料(安定性試験に関する資料)
- 3) 長生堂製薬株式会社 社内資料(溶出試験に関する資料)
- 4) 長生堂製薬株式会社 社内資料(溶出試験に関する資料)
- 5) 第十八改正日本薬局方解説書
- 6) 長生堂製薬株式会社 社内資料(生物学的同等性試験に関する資料)
- 7) 長生堂製薬株式会社 社内資料(生物学的同等性試験に関する資料)
- 8) 厚生省薬務局推薦：規制医薬品事典(第5版), 薬業時報社

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

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料

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) 粉碎：

錠 60mg

1.試験目的

ロキソプロフェンナトリウム錠60mg「CHJ」について、粉碎した検体を下記条件にて保存し、安定性を確認した。

2.保存条件

・温度に対する安定性試験：40±2°C/60±5%RH 30日〔遮光・気密容器〕

・湿度に対する安定性試験：25±2°C/75±5%RH 30日〔遮光・開放容器〕

・光に対する安定性試験：120万lux・hr〔密閉容器(シャーレ+ラップ)〕*

※ 25±2°C/60±5%RH 1000 lux/hr 50日

3.試験項目

性状、定量試験

4.試験結果

〈参考〉製剤の規格(粉碎前の状態)

性状	微紅色の片面 $\frac{1}{2}$ 割線入り素錠
含量	95.0～105.0%

保存条件	試験項目	試験開始時	15日	30日	
温度	性状	微紅色の粉末	変化なし	変化なし	
	定量試験	実測値	101.9%	102.5%	102.3%
		残存率	100.0%	100.6%	100.4%
湿度	性状	微紅色の粉末	変化なし	変化なし	
	定量試験	実測値	101.9%	102.3%	102.3%
		残存率	100.0%	100.4%	100.4%

保存条件	試験項目	試験開始時	30万lux・hr (12.5日)	60万lux・hr (25日)	120万lux・hr (50日)	
光	性状	微紅色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし	
	定量試験	実測値	101.9%	102.1%	101.9%	101.8%
		残存率	100.0%	100.2%	100.0%	99.9%

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性：

錠 60mg

1. 試験目的

ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「CH」について、崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性を確認するため試験を実施した。

2. 試験製剤

ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「CH」(素錠)

3. 試験方法

・崩壊懸濁試験：

ディスペンサー内に錠剤 1 個を入れ、約 55℃の温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、錠剤を破壊して上記と同様の操作を行う。

・通過性試験：

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管投与チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、チューブの通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。チューブサイズは 8Fr、12Fr、14Fr、16Fr、18Fr、と通過するまで変更する。

4. 試験結果

●崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「CH」	10 分以内に崩壊・懸濁しなかった。 錠剤を破壊した場合は、10 分以内に崩壊・懸濁した。

●通過性試験結果

品目名	通過性
ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg「CH」	8Fr のチューブを通過した。

細粒 10%

1.試験目的

ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「CH」について、崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性を確認するため試験を実施した。

2.試験製剤

ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「CH」(細粒剤)

3.試験方法

・崩壊懸濁試験:

ディスペンサー内に細粒剤を 0.6g 入れ、約 55°Cの温湯 20mL を吸い取り 10 分間自然放置する。10 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。

・通過性試験:

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管投与チューブの注入端より 2~3mL/秒の速度で注入し、チューブ(8Fr.)の通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。チューブサイズは 8Fr.、12Fr.、14Fr.、16Fr.、18Fr.、と通過するまで変更する。

4.試験結果

●崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「CH」	10 分以内に崩壊・懸濁した。 (ディスペンサー内に製剤の残存が認められた。)

●通過性試験結果

品目名	通過性
ロキソプロフェンナトリウム細粒 10%「CH」	8Fr.のチューブを通過した。