

# 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

持続性消炎・鎮痛剤

オキサプロジン製剤

劇薬 **アルボ錠<sup>®</sup> 100mg**

劇薬 **アルボ錠<sup>®</sup> 200mg**

**Alvo<sup>®</sup> tablets 100mg / tablets 200mg**

剤形	白色素錠
製剤の規制区分	劇薬
規格・含量	アルボ錠100mg：1錠中 日局オキサプロジン 100mg アルボ錠200mg：1錠中 日局オキサプロジン 200mg
一般名	和名：オキサプロジン（JAN） 洋名：oxaprozin（JAN、INN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2007年 3月22日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2007年 6月15日（販売名変更による） 販売開始年月日：1985年12月18日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売：大正製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	大正製薬株式会社 メディカルインフォメーションセンター TEL：0120-591-818 9:00～17:30（土・日・祝日、当社休日除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://medical.taisho.co.jp/">https://medical.taisho.co.jp/</a>

本IFは2024年10月改訂の電子化された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（<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、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「X II. 参考資料」、「X III. 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>	5. 混入する可能性のある夾雑物.....	6
1. 開発の経緯.....	1	6. 製剤の各種条件下における安定性.....	6
2. 製品の治療学的特性.....	1	7. 調製法及び溶解後の安定性.....	7
3. 製品の製剤学的特性.....	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	7
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	1	9. 溶出性.....	7
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	1	10. 容器・包装.....	7
(1) 承認条件.....	1	(1) 注意が必要な容器・包装、外観が	
(2) 流通・使用上の制限事項.....	1	特殊な容器・包装に関する情報.....	7
6. RMPの概要.....	1	(2) 包装.....	7
		(3) 予備容量.....	7
		(4) 容器の材質.....	7
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	11. 別途提供される資材類.....	7
1. 販売名.....	2	12. その他.....	7
(1) 和名.....	2		
(2) 洋名.....	2		
(3) 名称の由来.....	2		
2. 一般名.....	2	<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>8</b>
(1) 和名（命名法）.....	2	1. 効能又は効果.....	8
(2) 洋名（命名法）.....	2	2. 効能又は効果に関連する注意.....	8
(3) ステム（stem）.....	2	3. 用法及び用量.....	8
3. 構造式又は示性式.....	2	(1) 用法及び用量の解説.....	8
4. 分子式及び分子量.....	2	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠.....	8
5. 化学名（命名法）又は本質.....	2	4. 用法及び用量に関連する注意.....	8
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	2	5. 臨床成績.....	8
		(1) 臨床データパッケージ.....	8
		(2) 臨床薬理試験.....	8
		(3) 用量反応探索試験.....	9
		(4) 検証的試験.....	10
		(5) 患者・病態別試験.....	10
		(6) 治療的使用.....	11
		(7) その他.....	11
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>3</b>	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>12</b>
1. 物理化学的性質.....	3	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群.....	12
(1) 外観・性状.....	3	2. 薬理作用.....	12
(2) 溶解性.....	3	(1) 作用部位・作用機序.....	12
(3) 吸湿性.....	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績.....	12
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点.....	3	(3) 作用発現時間・持続時間.....	12
(5) 酸塩基解離定数.....	3		
(6) 分配係数.....	3	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>13</b>
(7) その他の主な示性値.....	3	1. 血中濃度の推移.....	13
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	3	(1) 治療上有効な血中濃度.....	13
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	4	(2) 臨床試験で確認された血中濃度.....	13
		(3) 中毒域.....	13
		(4) 食事・併用薬の影響.....	13
		2. 薬物速度論的パラメータ.....	14
		(1) 解析方法.....	14
		(2) 吸収速度定数.....	14
		(3) 消失速度定数.....	14
		(4) クリアランス.....	14
		(5) 分布容積.....	14
		(6) その他.....	14
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>		
1. 剤形.....	5		
(1) 剤形の区別.....	5		
(2) 製剤の外観及び性状.....	5		
(3) 識別コード.....	5		
(4) 製剤の物性.....	5		
(5) その他.....	5		
2. 製剤の組成.....	5		
(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤.....	5		
(2) 電解質等の濃度.....	5		
(3) 熱量.....	5		
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	6		
4. 力価.....	6		

# 目次

3. 母集団（ポピュレーション）解析	14	10. 過量投与	26
(1) 解析方法	14	11. 適用上の注意	26
(2) パラメータ変動要因	14	12. その他の注意	26
4. 吸収	14	(1) 臨床使用に基づく情報	26
5. 分布	15	(2) 非臨床試験に基づく情報	26
(1) 血液－脳関門通過性	15	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	<b>27</b>
(2) 血液－胎盤関門通過性	15	1. 薬理試験	27
(3) 乳汁への移行性	15	(1) 薬効薬理試験	27
(4) 髄液への移行性	15	(2) 安全性薬理試験	27
(5) その他の組織への移行性	15	(3) その他の薬理試験	27
(6) 血漿蛋白結合率	15	2. 毒性試験	27
6. 代謝	15	(1) 単回投与毒性試験	27
(1) 代謝部位及び代謝経路	15	(2) 反復投与毒性試験	27
(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、		(3) 遺伝毒性試験	28
寄与率	16	(4) がん原性試験	28
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	16	(5) 生殖発生毒性試験	28
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、		(6) 局所刺激性試験	28
存在比率	16	(7) その他の特殊毒性	28
7. 排泄	16	<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	<b>29</b>
8. トランスポーターに関する情報	16	1. 規制区分	29
9. 透析等による除去率	16	2. 有効期間	29
10. 特定の背景を有する患者	16	3. 包装状態での貯法	29
11. その他	16	4. 取扱い上の注意	29
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	<b>17</b>	5. 患者向け資材	29
1. 警告内容とその理由	17	6. 同一成分・同効薬	29
2. 禁忌内容とその理由	17	7. 国際誕生年月日	29
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	17	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、	
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	17	薬価基準収載年月日、販売開始年月日	29
5. 重要な基本的注意とその理由	17	9. 効能又は効果追加、用法及び	
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	18	用量変更追加等の年月日及びその内容	29
(1) 合併症・既往歴等のある患者	18	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及び	
(2) 腎機能障害患者	18	その内容	29
(3) 肝機能障害患者	19	11. 再審査期間	29
(4) 生殖能を有する者	19	12. 投薬期間制限に関する情報	29
(5) 妊婦	19	13. 各種コード	30
(6) 授乳婦	19	14. 保険給付上の注意	30
(7) 小児等	19	<b>XI. 文献</b>	<b>31</b>
(8) 高齢者	20	1. 引用文献	31
7. 相互作用	20	2. その他の参考文献	32
(1) 併用禁忌とその理由	20	<b>XII. 参考資料</b>	<b>33</b>
(2) 併用注意とその理由	20	1. 主な外国での発売状況	33
8. 副作用	21	2. 海外における臨床支援情報	33
(1) 重大な副作用と初期症状	21		
(2) その他の副作用	22		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	26		

# 目 次

---

<b>XIII. 備考</b> .....	<b>37</b>
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.....	37
(1) 粉碎.....	37
(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性.....	38
2. その他の関連資料.....	38

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

アルボの主成分であるオキサプロジン (oxaprozin) は、1968年Brownら (英国) により合成された既存の薬物にみられないジアリールオキサゾール骨格を有するプロピオン酸系の酸性非ステロイド性消炎鎮痛剤である。オキサプロジンは消化管からの吸収が良好で血中半減期が長く、しかも各種動物試験において優れた抗炎症・鎮痛・解熱作用が認められた。

以来、米国Wyeth社を中心に世界各国で開発が行われた。本邦においては1978年に大正製薬株式会社と日本ワイズ株式会社 (現: ファイザー株式会社) が共同で本剤の研究開発に着手し、大正製薬株式会社では1985年に「アルボ100」、「アルボ200」の承認を取得し発売に至った。2007年には厚生省医薬安全局長通知第935号「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り扱いについて」に基づき、販売名を「アルボ錠100mg」、「アルボ錠200mg」に変更した。

## 2. 製品の治療学的特性

- (1) アルボはオキサゾール骨格を有するプロピオン酸系の非ステロイド性消炎鎮痛剤である。  
(I-1. 開発の経緯 参照)
- (2) アルボは消化管からの吸収が良好であり<sup>1) ~3)</sup>、単回投与では血中半減期が約50時間と長時間持続するが、反復投与では血清中総オキサプロジン濃度の上昇に伴い、非結合型薬物の比率が増加し、その結果クリアランスが増大するという特徴を有する薬剤である<sup>4)</sup>。  
(VII-1. (2) 臨床試験で確認された血中濃度 参照)
- (3) 二重盲検比較試験において1日1回の投与で効果が得られる薬剤との評価を受けており<sup>5) ~8)</sup>、その有用性の高いことが認められた。  
(V-3. (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠、V-5. (3) 用量反応探索試験 参照)
- (4) 総症例数43,787例中、571例 (1.30%) 648件に副作用が認められた。その主な副作用は胃部不快感117件、胃痛112件、発疹62件、嘔気41件、浮腫31件であった。[再審査結果時]  
重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー (いずれも頻度不明)、消化性潰瘍 (頻度不明)、皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson症候群) (頻度不明)、急性腎障害 (頻度不明)、心筋梗塞、脳血管障害 (いずれも頻度不明) が報告されている。  
(VIII-8. 副作用 参照)

## 3. 製品の製剤学的特性

- (1) PTPシートは、製品名・含量の識別性を高める目的で、ピッチコントロール (1錠ごとの定位置表示) を行っている。
- (2) PTPシートの印字には、見やすく誤認しにくい「ユニバーサルデザインフォント」を採用している。

## 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、最適使用推進ガイドライン等	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

## 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

アルボ錠100mg

アルボ錠200mg

#### (2) 洋名

Alvo tablets 100mg

Alvo tablets 200mg

#### (3) 名称の由来

不明

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

オキサプロジン（JAN）

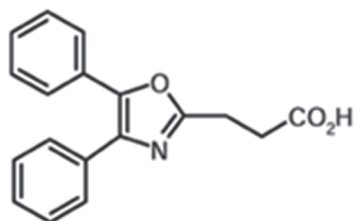
#### (2) 洋名（命名法）

oxaprozin（JAN、INN）

#### (3) ステム（stem）

不明

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>18</sub>H<sub>15</sub>NO<sub>3</sub>

分子量：293.32

### 5. 化学名（命名法）又は本質

3-(4,5-Diphenyloxazol-2-yl) propanoic acid

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

OSP、Wy-21743



### 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～帯黄白色の結晶性の粉末である。  
光によって徐々に変化する。

##### (2) 溶解性

メタノール又はエタノール (95) にやや溶けにくく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

##### (3) 吸湿性

なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：161～165°C

##### (5) 酸塩基解離定数

pKa<sub>1</sub>=1.00（溶解度法）

pKa<sub>2</sub>=4.23

##### (6) 分配係数

(37°C)

pH	溶媒		
	クロロホルム	イソアミルアルコール	ヘキサン
2	8.4	0.48	2.1
4	26.1	1.2	1.8
6	40.3	8.5	0.1
8	1.9	22.1	—
10	0.1	29.7	0.01

##### (7) その他の主な示性値

吸光度E<sub>1</sub><sup>1%</sup><sub>1cm</sub> (285nm) : 455～495（乾燥後、10mg、メタノール、1000mL）

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験	室温	39ヵ月	褐色ガラス瓶	規格内
加温保存試験	40°C	6ヵ月		規格内
	50°C	3ヵ月		規格内
加温・加湿保存試験	40°C・75%RH	6ヵ月		規格内
	40°C・90%RH	3ヵ月		規格内
光照射保存試験	室内散光	3ヵ月	無色ペトリ皿	2ヵ月目より、外観の淡黄色化、芳香臭の発生を認めた。
		3ヵ月	褐色ペトリ皿	規格内

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

---

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

日本薬局方「オキサプロジン」の確認試験法による。

定量法

日本薬局方「オキサプロジン」の定量法による。







## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

素錠

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	剤形	外形・サイズ等		
		上面	下面	側面
アルボ錠100mg	白色素錠			
		直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
		約7	約2.7	約115
		上面	下面	側面
アルボ錠200mg	白色素錠			
		直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
		約8	約4.1	約230
		上面	下面	側面

#### (3) 識別コード

販売名	表示部位	識別コード
アルボ錠100mg	本体及びPTP包装	T71
アルボ錠200mg	本体及びPTP包装	T72

#### (4) 製剤の物性

崩壊性：本品は、日本薬局方一般試験法、崩壊試験法により試験するとき、錠剤の試験に適合する。  
崩壊時間が早い。(2～9分)

#### (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	アルボ錠100mg	アルボ錠200mg
有効成分	1錠中 日局 オキサプロジン100mg	1錠中 日局 オキサプロジン200mg
添加剤	カルメロースカルシウム ヒプロメロース 結晶セルロース メタケイ酸アルミン酸マグネシウム ステアリン酸マグネシウム	

#### (2) 電解質等の濃度

該当しない

#### (3) 熱量

該当資料なし

## IV. 製剤に関する項目

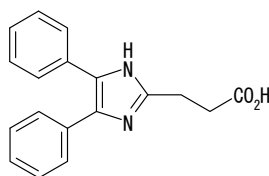
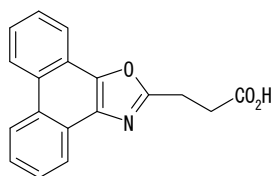
### 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

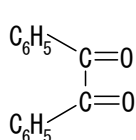
### 4. カ価

該当しない

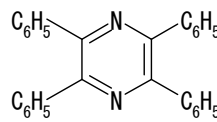
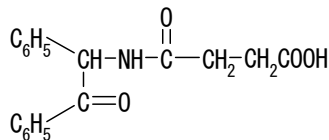
### 5. 混入する可能性のある夾雑物



4,5-ジフェニル-2-イミダゾールプロピオン酸



ベンジル



テトラフェニルピラジン

### 6. 製剤の各種条件下における安定性

製剤	試験	保存条件	保存期間	保存形態	結果
アルボ錠 100mg	長期保存試験	室温	5年	・PTP/ピロー/紙器包装 (遮光)	規格内
	加温保存試験	40°C	6ヵ月	・PTP包装 (遮光)	規格内
		50°C	3ヵ月	・カン包装 (密閉)	規格内
	加温・加湿保存試験	40°C・75%RH	6ヵ月	・PTP包装 (遮光) ・カン包装 (開放)	規格内
光照射保存試験	室内散光	3ヵ月	・PTP包装 (遮光) ・カン包装 (密閉)	規格内	
		3ヵ月	・PTP包装 (無色) ・無色ペトリ皿	1ヵ月目より芳香臭の発生を認めた。	
アルボ錠 200mg	長期保存試験	室温	5年	・PTP/ピロー/紙器包装 (遮光)	規格内
	加温保存試験	40°C	6ヵ月	・PTP包装 (遮光)	規格内
		50°C	3ヵ月	・カン包装 (密閉)	規格内
	加温・加湿保存試験	40°C・75%RH	6ヵ月	・PTP包装 (遮光) ・カン包装 (開放)	規格内
光照射保存試験	室内散光	3ヵ月	・PTP包装 (遮光) ・カン包装 (密閉)	規格内	
		3ヵ月	・PTP包装 (無色) ・無色ペトリ皿	1ヵ月目より芳香臭の発生を認めた。	

試験項目：性状、確認試験、崩壊試験、定量試験

## IV. 製剤に関する項目

PTPシートから外した状態での安定性試験結果

製剤	保存条件		保存期間	保存形態	結果
	温度				
アルボ錠100mg	温度	40°C	3ヵ月	褐色ガラス瓶密栓	規格内
	湿度	25°C・75%RH	3ヵ月	褐色ガラス瓶開栓	規格内
	光	D65ランプ3000Lux、60万Lux・hr		透明シャーレ開放	微黄白色に変化
アルボ錠200mg	温度	40°C	3ヵ月	褐色ガラス瓶密栓	規格内
	湿度	25°C・75%RH	3ヵ月	褐色ガラス瓶開栓	規格内
	光	D65ランプ3000Lux、60万Lux・hr		透明シャーレ開放	微黄白色に変化

試験項目：性状、含量、崩壊性、硬度

### 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）

該当資料なし

### 9. 溶出性

該当資料なし

### 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

〈アルボ錠100mg〉

PTP100錠 [10錠×10]

〈アルボ錠200mg〉

PTP100錠 [10錠×10]

#### (3) 予備容量

該当しない

#### (4) 容器の材質

PTP：ポリプロピレン（PP）、アルミニウム

ピロー：ポリプロピレン（PP）、ポリエチレン（PE）

### 11. 別途提供される資材類

該当資料なし

### 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、変形性脊椎症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、痛風発作

○外傷後及び手術後の消炎・鎮痛

### 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

通常、成人にはオキサプロジンとして1日量400mgを1～2回に分けて経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減するが、1日最高量は600mgとする。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

V-5. (3) 用量反応探索試験 参照

オキサプロジン (OX) 400mg/日、800mg/日の有用性をインドメタシンを対照とした二重盲検比較試験 (DBT) により検討した結果、関節リウマチに対して400mg/日で有用性を発揮することが認められた<sup>9)</sup>。

また、対照薬とのDBTにおいても、関節リウマチ、変形性関節症、腰痛症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、外傷後及び手術後の疼痛・炎症に対するOX400mg/日の有用性が確認された<sup>5~8)</sup>。

更に、一般臨床試験において1日200～1200mgの各用量で臨床検討を行った結果、OX400mg/日で適応疾患に対する有用性が裏付けられたことから1日用量が400mgと設定された。

また、連続投与の場合、1日量を1回投与しても2回分割投与しても体内動態には差がなく<sup>2)</sup>、一般試験及びDBTを通じて1日1回投与と2回分割投与との間に有効性、安全性に差がなかったこと、更に症例によっては2回分割の方が投与しやすいという医師の要望等もあることから、分1又は分2として医師の選択にゆだねる方がよいと判断した。

なお、一般試験及びDBTを通じて、症例によっては増量することにより、更に治療効果が増強される場合もあることが示唆されたことから、年齢、症状により適宜増減とした。

一方、用量別副作用発現率 (～400mg/日、600mg/日、800mg/日～) が800mg/日以上で増加する傾向が認められたことから、1日最高量を600mgとした。

### 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

他の非ステロイド性消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい。

(解説)

消炎鎮痛剤の第12次再評価 (1977年 (昭和52年) 7月6日) の結果による同種同効品の使用上の注意の記載を参考として、発売時より使用上の注意に記載し注意を喚起した。

### 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

## V. 治療に関する項目

### (3) 用量反応探索試験

関節リウマチ患者を対象とした用量比較試験<sup>9)</sup>

目的	日本人関節リウマチ患者（以下、RA）を対象として、オキサプロジン（以下、OXP）1日400mg（OXP400群）及び1日800mg（OXP800群）投与における臨床的有用性をインドメタシン（以下、IND）1日75mg（IND75群）を対照に検討した。																																							
試験デザイン	無作為化、二重盲検による用量比較試験																																							
対象	解析対象144例 （OXP400群：46例、OXP800群：47例、IND75群：51例）																																							
登録基準	アメリカ・リウマチ協会（ARA）の診断基準でclassical RA又はdefinite RAと診断された原則として17～75歳の患者の中から、発病後6ヵ月以上を経過し、1～2週間のイブプロフェン投与による観察期間終了時に、次の5項目のうち3項目以上の活動性症状を有するものを対象とした。 ① 朝のこわばりの持続時間：30分以上 ② 握力：140mmHg以下 ③ 赤沈：25mm以上（1時間値） ④ 疼痛関節数：6個以上（圧痛又は他動運動痛の認められるもの） ⑤ 腫脹関節数：3個以上																																							
除外基準	<ul style="list-style-type: none"> <li>・6ヵ月以内に金療法を受け維持量に達していないもの</li> <li>・6ヵ月以内に免疫抑制剤の投与を受け維持量に達していないもの</li> <li>・3ヵ月以内にD-ペニシラミン療法を受け維持量に達していないもの</li> <li>・ステロイド療法を受け維持量（プレドニゾロン換算量で5mg/day以下）に達していないもの</li> <li>・ステロイドの関節内注入を必要とするもの</li> <li>・消化管出血及び消化性潰瘍もしくはその既往歴のあるもの</li> <li>・心疾患、肝疾患、腎疾患、血液疾患、その他の重篤な合併症を有するもの</li> <li>・妊婦、妊娠する可能性のある女性</li> <li>・薬物過敏症の既往歴のあるもの</li> <li>・その他医師が試験対象として不適当として判断したもの</li> </ul>																																							
試験方法	<p>試験薬剤投与開始前1ないし2週間を観察期間とし、イブプロフェン1日量600mg（1回200mgを1日3回）をそれまで使用中の酸性非ステロイド系抗炎症薬に替えて投与した。観察期間終了後、OXP1回200mg、1日2回（OXP400群）及びOXP1回400mg、1日2回（OXP800群）は、朝食・夕食後に、IND1回75mg、1日3回（IND75群）は毎食後にそれぞれ6週間投与した。</p> <p style="text-align: center;">試験スケジュール</p> <table border="1" style="margin-left: auto; margin-right: auto;"> <thead> <tr> <th colspan="2"></th> <th colspan="2">観察期間</th> <th colspan="4">試験期間</th> </tr> <tr> <th colspan="2"></th> <th>-2週 or -1週</th> <th>0週</th> <th>2週</th> <th>4週</th> <th colspan="2">6週</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td rowspan="2">OXP400群</td> <td>イブプロフェン</td> <td colspan="2">1日600mg</td> <td colspan="4">OXP 1回200mg 1日2回</td> </tr> <tr> <td>IND75群</td> <td colspan="2">イブプロフェン 1日600mg</td> <td colspan="4">IND 1回25mg 1日3回</td> </tr> <tr> <td>OXP800群</td> <td>イブプロフェン</td> <td colspan="2">1日600mg</td> <td colspan="4">OXP 1回400mg 1日2回</td> </tr> </tbody> </table>			観察期間		試験期間						-2週 or -1週	0週	2週	4週	6週		OXP400群	イブプロフェン	1日600mg		OXP 1回200mg 1日2回				IND75群	イブプロフェン 1日600mg		IND 1回25mg 1日3回				OXP800群	イブプロフェン	1日600mg		OXP 1回400mg 1日2回			
		観察期間		試験期間																																				
		-2週 or -1週	0週	2週	4週	6週																																		
OXP400群	イブプロフェン	1日600mg		OXP 1回200mg 1日2回																																				
	IND75群	イブプロフェン 1日600mg		IND 1回25mg 1日3回																																				
OXP800群	イブプロフェン	1日600mg		OXP 1回400mg 1日2回																																				
評価項目	<p>[有効性]</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>・評価項目</li> </ul> <p>朝のこわばりの持続時間、握力、赤沈、ランスバリーの活動性関節点数とこれら4項目によるランスバリーの活動性指数、並びに疼痛関節数（圧痛又は他動運動痛の認められる関節数）、腫脹関節数、圧痛点数（日常動作に際し、痛くない：0、痛いほぼ普通にできる：1、痛くて困難：2、何もしないで安静にしているもうずく：3）を採用し、試験薬剤投与開始時、投与2週後、4週後、6週後に評価した。</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>・総合評価</li> </ul> <p>最終全般改善度は、試験終了時に試験薬剤投与開始後の全経過を投与開始時と比較して「著明改善」、「改善」、「不変」、「悪化」、「著明悪化」の5段階で判定した。有効性は、RAにおいては最終</p>																																							

## V. 治療に関する項目

	<p>全般改善度が「不変」と判定されても、試験前のほぼ安定した症状程度が維持されたと評価され、試験薬剤が「無効」ではなかったと判断される場合があるため、最終全般改善度とは別に「著効」、「有効」、「やや有効」、「無効」の4段階で判定した。</p> <p>[安全性] 副作用、臨床検査</p>
解析方法	<p>試験成績の解析には、データ尺度に応じて分割表<math>\chi^2</math>-検定、Kruskal WallisのH-検定、分散分析F-検定あるいは1標本t-検定を用いた。有意水準は比較あたりの値とした。</p>
結果	<p>[有効性] ・各評価項目 朝のこわばりの持続時間、握力、赤沈、ランスバリーの活動性関節点数及びこれら4項目から算出したランスバリーの活動性指数、並びに疼痛関節数、腫脹関節数、圧痛点数のいずれの評価項目においても3群間（OXP400群、OXP800群及びIND75群）に有意差を認めなかった。</p> <p>・総合評価 最終全般改善度では3群間に有意差は認められなかったが、「著明改善」と「改善」を合計した改善率はIND75群53.1%に対し、OXP400群は55.6%、OXP800群は60.0%であった。 有効性においても3群間に有意差は認められなかったが、「著効」及び「有効」を合計した有効率はIND75群の40.8%に対し、OXP400群は40.0%、OXP800群は42.2%であった。</p> <p>[安全性] 副作用の発現率は、OXP400群8.7%（4/46例）、OXP800群14.9%（7/47例）、IND75群15.7%（8/51例）であった。主な副作用は胃腸症状で、OXP400群8.7%（4/46例）、OXP800群12.8%（6/47例）、IND75群15.7%（8/51例）に認められた。 投与中止に至った副作用は、OXP800群に3例（浮腫2例、胃痛・胃膨満感1例）、IND75群に2例（フラフラ感・悪心・嘔吐1例、めまい、嘔気・嘔吐1例）に認められ、OXP400群には認められなかった。</p>

注）本剤の承認されている用法及び用量は、「通常、成人にはオキサプロジンとして1日量400mgを1～2回に分けて経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減するが、1日最高量は600mgとする。」である。

- (4) 検証的試験
  - 1) 有効性検証試験  
該当資料なし
  - 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



## V. 治療に関する項目

---

### (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

「新医薬品等の再審査の申請のために行う使用の成績等に関する調査の実施方法に関するガイドラインについて」（平成5年6月28日 薬安第54号）、「医療用医薬品の使用成績調査等の実施方法に関するガイドラインについて」（平成9年3月27日 薬安第34号）、GPSP省令に基づく調査・試験を実施していない。

#### 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

臨床効果<sup>5~17)</sup>

承認時に実施された二重盲検比較試験<sup>5~9)</sup>を含む臨床試験及び製造販売後の使用成績調査の成績は以下のとおりである。

疾患名	改善率(%)【改善以上】
関節リウマチ	52.1 ( 894/ 1715)
変形性関節症	67.8 ( 2172/ 3203)
腰痛症	84.6 (11065/13076)
変形性脊椎症	67.9 ( 2153/ 3170)
頸肩腕症候群	80.5 ( 2712/ 3369)
肩関節周囲炎	77.0 ( 2100/ 2727)
痛風発作	86.3 ( 176/ 204)
外傷後及び手術後の炎症・疼痛	84.0 ( 1549/ 1844)

## 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

イブプロフェン、ケトプロフェン、ナプロキセン、プラノプロフェン、ロキソプロフェンナトリウム水和物他  
(以上プロピオン酸系)

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子化された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

オキサプロジンは*in vitro*試験（ウシ精のう腺）において、プロスタグランジン生合成を抑制することが報告されており<sup>18)</sup>、シクロオキシゲナーゼ阻害による消炎・鎮痛効果を示すものと考えられる。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 抗炎症作用<sup>18)</sup>

ラットにおけるカラゲニン急性足浮腫法、綿球肉芽腫法、アジュバント関節炎法などの急性・慢性炎症に対する抑制作用はアスピリンと同程度であった。また、マウスにおけるカラゲニン急性足浮腫法による炎症に対しては、イブプロフェン、フェンブフェン、スリンダクより強い抑制作用を示し、酢酸惹起血管透過性亢進に対しても、フェニルブタゾン、アスピリン、イブプロフェンより強い抑制作用を示した。

##### 2) 鎮痛作用<sup>19)</sup>

ラットにおけるRandall-Selitto法、硝酸銀関節炎法、アジュバント関節炎法などの急性・慢性炎症性疼痛に対する抑制作用はアスピリンより若干強い程度であったが、マウスにおける酢酸・フェニルキノン・アセチルコリンwrithing法、イースト投与圧刺激法では、フェニルブタゾン、アスピリンよりはるかに強い抑制作用を示した。

また、イヌにおいてオキサプロジン投与20時間後に誘発した尿酸関節炎に対しても疼痛抑制作用が認められた。

#### (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

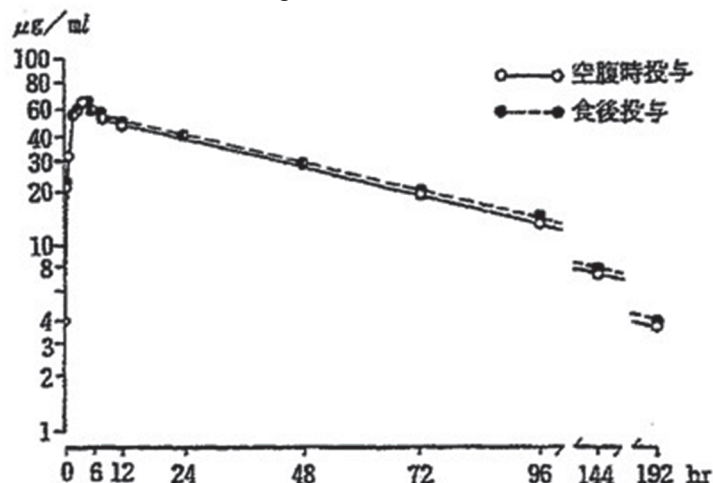
該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>2)</sup>

##### 1) 単回投与

健康成人にオキサプロジン400mgを空腹時単回投与した場合、血中濃度は約3.7時間後に最高に達し、その血中濃度は約67 $\mu\text{g}/\text{mL}$ で、その後約50時間の血清中濃度半減期で緩徐に減少した。

オキサプロジン（400mg）単回投与後の血清中濃度推移（ヒト）（n=6）



	$C_{\max}$ ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	$T_{\max}$ (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	AUC ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )
成人 (n=6)	66.9	3.7	49.5	4001.8

##### 2) 反復投与

健康成人にオキサプロジン400mgを1日1回又は2回に分割して10日間連続経口投与した場合の血中濃度は、いずれも4～6日間で定常状態に達し、その平均血中濃度はいずれの投与方法でもほぼ一定値（約100 $\mu\text{g}/\text{mL}$ ）を示した。

#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

健康成人にオキサプロジン400mgを空腹時又は食後に経口投与したところ、食後投与は、空腹時投与に比べて吸収速度に若干の遅れがみられたが、最高血中濃度到達時間（ $T_{\max}$ ）、最高血中濃度（ $C_{\max}$ ）及び最高血中濃度下面積（AUC）には有意差は認められなかった<sup>2)</sup>。

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

---

### 2. 薬物速度論的パラメータ

- (1) 解析方法<sup>4)</sup>  
2-コンパートメントモデル
- (2) 吸収速度定数<sup>4)</sup>  
 $0.604 \pm 0.127 \text{hr}^{-1}$  (ヒト400mg単回投与)
- (3) 消失速度定数<sup>4)</sup>  
 $0.0241 \pm 0.0059 \text{hr}^{-1}$  (ヒト400mg単回投与)
- (4) クリアランス<sup>4)</sup>  
 $113 \pm 4 \text{mL/hr}$
- (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

バイオアベイラビリティ<sup>3)</sup>

<sup>14</sup>C-オキサプロジンにヒトに投与後60%以上の放射活性が尿中から回収されることにより、本剤の吸収は良好である。同時に糞便中の放射活性はほとんどが48時間以降に排泄され、それらが代謝産物であることは、本剤の糞便排泄が胆汁中排泄によることを示唆している。したがって本剤の吸収はほぼ完全と考えられる。本剤を反復投与 (10日間) すると、定常状態における血漿クリアランスの上昇に伴い、オキサプロジンの血漿中濃度は単回投与試験で推定されたレベル (約500 $\mu\text{g/mL}$ ) の40%程度 (約200 $\mu\text{g/mL}$ ) となった。

吸収部位<sup>1)</sup>

(マウス、ラット、ウサギ、イヌ)

幽門結紮又は腸管結紮ラットを用いて<sup>14</sup>C-オキサプロジンの吸収部位を調べた結果、胃からの吸収もわずかに認められたが、主な吸収部位は腸管であった。

ラット、マウス、ウサギ及びイヌに<sup>14</sup>C-オキサプロジン50mg/kgを経口投与したのちの血中放射能濃度は、いずれの動物種においても比較的速やかに上昇し、血中からの消失半減期はウサギ、ラットが3~4時間、マウスが8.3時間、イヌは53.9時間と著明に長かった。

腸肝循環<sup>1)</sup>

(ラット)

ラットに<sup>14</sup>C-オキサプロジンに投与後採取した胆汁1mLを別の胆管カニューレを施したラットの十二指腸内に注入し、再度胆汁中に排泄される放射能を測定した結果、48時間までに約70%が回収され腸肝循環の存在が示された。

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

### 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<sup>20)</sup>

(ラット)

妊娠ラットに<sup>14</sup>C-オキサプロジンを経口投与し、胎児への移行性を全身オートラジオグラフィ及び組織中濃度の定量により検討した。妊娠12日目の全胎児中濃度は投与後2時間で母体の血漿の約1/10であり、胎児への移行が血液－胎盤関門により強く阻止されることが示された。妊娠19日目では胎児の肝、腎などに活性が検出されたが、母体血漿の約1/6と低濃度であった。なお、母体の分布パターンは雄ラットの場合と同様であった。

#### (3) 乳汁への移行性<sup>20)</sup>

(ラット)

分娩5日後のラットに<sup>14</sup>C-オキサプロジンを投与し、経時的に乳汁を採取して放射能濃度を測定した結果、母体の最高血中濃度とほぼ同じレベルの活性が検出された。また、乳汁を介しての乳児1匹当たりの総移行量は、投与後24時間までで投与量の0.12%にすぎなかった。

#### (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<sup>4)、21)、22)</sup>

(マウス、ラット、ウサギ)

マウス、ラット及びウサギに<sup>14</sup>C-オキサプロジンを経口投与したのちの組織中放射能濃度は、肝、腎に高い分布が認められ、他の組織は血漿レベルより低く中枢神経系への移行は極めて低かった。また特定臓器への残留性は認められなかった。

#### (6) 血漿蛋白結合率<sup>4)</sup>

総オキサプロジン濃度 50µg/mL 結合率 約99.8%

総オキサプロジン濃度 150µg/mL 結合率 約99.7%

ヒト血清中に種々の濃度で<sup>14</sup>C-オキサプロジン (0.8~300µg/mL) を添加し、総薬物濃度と非結合型薬物の比率との相関を予測した結果、血清中総オキサプロジン濃度の上昇に伴い、非結合型薬物の比率が増加した (*in vitro*)。

### 6. 代謝

#### (1) 代謝部位及び代謝経路<sup>2)</sup>

健康成人にオキサプロジン400mgを空腹時単回経口投与した場合、5日間で尿中には投与量の約32%が排泄された。尿中主代謝物はオキサプロジンのエステル型グルクロニドでありほかにフェニル基の水酸化体及びそれらのエーテルグルクロニドが検出された。

(マウス、ラット、ウサギ、イヌ)<sup>23)</sup>

イヌ及びマウスの血漿においては大部分が未変化体であり、代謝物は極めて少量であったのに対し、ウサギ、ラットでは多量の代謝物が検出された。

尿糞中代謝物を分析した結果、イヌは未変化体が大部分を占めたのに対して、マウス、ウサギはフェニル基の水酸化体である5-(4-ヒドロキシフェニル)-4-フェニル-2-オキサゾールプロピオン酸 (M-2)、4-(4-ヒドロキシフェニル)-5-フェニル-2-オキサゾールプロピオン酸 (M-3) あるいはそのグルクロニドが主要代謝物であった。ラットの場合にはこれらの他にフェニル基のメトキシ水酸化体あるいはデジオール体の生成も認められた。

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

---

(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<sup>24)</sup>

代謝物5-(4-ヒドロキシフェニル)-4-フェニル-2-オキサゾールプロピオン酸（M-2）、4-(4-ヒドロキシフェニル)-5-フェニル-2-オキサゾールプロピオン酸（M-3）、副生成物4, 5-ジフェニル-2-オキサゾールプロピオン酸アミド（Wy-22075）、4, 5-ジフェニル-2-イミダゾールプロピオン酸（Wy-23120B）の抗炎症、鎮痛作用を検討したが、これらはオキサプロジンの作用より弱いか、全く作用を示さなかった。

7. 排泄<sup>2)、3)</sup>

健康成人にオキサプロジン400mgを単回経口投与した場合、5日間で尿中には投与量の約32%が排泄された。

〈参考〉

海外において健康成人男子にオキサプロジン600mgを単回投与した場合、投与後15日間の尿中回収率は約60%であった。

（マウス、ラット、ウサギ、イヌ、サル）

ラット、マウス、ウサギの場合は投与量の多くが48時間までに尿糞中に回収されたが、イヌの排泄はより緩慢であり、体内動態に種差がみられた。

ウサギは尿中に、サル、イヌ、ラット、マウスは糞中に多く排泄された。

胆汁排泄は48時間までにラットが約60%、ウサギが約18%であった<sup>1)</sup>。

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

腎機能障害患者<sup>25)</sup>

海外において健康成人、クレアチニンクリアランスの低下した患者及び血液透析患者各5例にオキサプロジン600mgを単回経口投与し、体内動態を検討した。3群間には有意な半減期の差は認められなかったが、患者群の最高血中濃度及びAUCは健康成人群より低かった。患者群では血漿中のアルブミン含量が低いことから、健康成人群の場合よりオキサプロジンは薬理作用を示す蛋白非結合型として多く存在すると考えられた。したがって腎機能障害患者には、この点を配慮した投与が望まれる。

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〔消化性潰瘍を悪化させるおそれがある。〕〔11.1.2参照〕

2.2 重篤な肝機能障害のある患者〔9.3.1参照〕

2.3 重篤な腎機能障害のある患者〔9.2.1参照〕

2.4 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.5 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〔喘息発作を誘発させるおそれがある。〕〔9.1.3参照〕

2.6 妊婦又は妊娠している可能性のある女性〔9.5参照〕

（解説）

2.1-2.4、2.6

消炎鎮痛剤の第12次再評価（1977年（昭和52年）7月6日）の結果による同種同効品の使用上の注意の記載を参考として、発売時より使用上の注意に記載し注意を喚起した。

2.5

昭和53年10月12日薬安第63号に従って設定した。

### 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 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。

8.3 外傷後及び手術後に対し本剤を用いる場合には、次の事項を考慮すること。

- ・炎症及び疼痛の程度を考慮し投与すること。
- ・原則として長期投与を避けること。

（解説）

消炎鎮痛剤の第12次再評価（1977年（昭和52年）7月6日）の結果による同種同効品の使用上の注意の記載を参考として、発売時より使用上の注意に記載し注意を喚起した。

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 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

消化性潰瘍を再発させるおそれがある。[11.1.2参照]

##### 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。

##### 9.1.3 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）

喘息発作を誘発させるおそれがある。[2.5参照]

##### 9.1.4 血液の異常又はその既往歴のある患者

血液の異常を悪化又は再発させるおそれがある。

##### 9.1.5 潰瘍性大腸炎の患者

症状を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.6 クロウン病の患者

症状を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.7 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)

#### 9.1.1、9.1.4、9.1.7

消炎鎮痛剤の第12次再評価（1977年（昭和52年）7月6日）の結果による同種同効品の使用上の注意の記載を参考として、発売時より使用上の注意に記載し注意を喚起した。

#### 9.1.2

「非ステロイド性消炎鎮痛剤の長期投与にみられる胃潰瘍及び十二指腸潰瘍」を効能又は効果として有するミソプロストールと非ステロイド性消炎鎮痛剤間における使用上の注意の整合を図る平成10年2月3日付の厚生省（現厚生労働省）医薬安全局安全対策課事務連絡により設定した。

#### 9.1.3

昭和53年10月12日薬安第63号に従って設定した。

#### 9.1.5、9.1.6

潰瘍性大腸炎、クロウン病は炎症性腸疾患であり、非ステロイド性消炎鎮痛剤の投与はプロスタグランジンの生合成を抑制し、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。また、潰瘍性大腸炎やクロウン病の患者に非ステロイド性消炎鎮痛剤を投与した場合に、症状を悪化させることが報告されている。本剤をこれらの患者に投与し症状が悪化した症例の報告はないが、安全性を重視し、注意喚起することとした。

#### (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。腎血流量を低下させ腎機能障害を悪化させるおそれがある。[2.3、11.1.4参照]

##### 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）

腎血流量を低下させ腎機能障害を悪化又は再発させるおそれがある。[11.1.4参照]

(解説)

#### 9.2.1

重篤な腎機能障害のある患者に対しては、腎血流量を低下させ腎障害を悪化させるおそれがあるため投与は禁忌である。



## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 9.2.2

腎機能障害又はその既往歴のある患者に対しては、腎血流量を低下させ腎機能障害を悪化又は再発させることがあるため注意喚起した。

### (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いるため、肝機能障害を悪化させるおそれがある。

[2.2参照]

##### 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おそれがある。

(解説)

消炎鎮痛剤の第12次再評価（1977年（昭和52年）7月6日）の結果による同種同効品の使用上の注意の記載を参考として、発売時より使用上の注意に記載し注意を喚起した。

### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

### (5) 妊婦

#### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。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。[2.6参照]

(解説)

消炎鎮痛剤の第12次再評価（1977年（昭和52年）7月6日）の結果による同種同効品の使用上の注意の記載を参考として、発売時より使用上の注意に記載し注意を喚起した。また、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た（昭和59年3月21日薬安第21号通知）。

### (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。

(解説)

消炎鎮痛剤の第12次再評価（1977年（昭和52年）7月6日）の結果による同種同効品の使用上の注意の記載を参考として、発売時より使用上の注意に記載し注意を喚起した。（Ⅶ-5. (3) 乳汁への移行性 参照）

### (7) 小児等

#### 9.7 小児等

9.7.1 小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.7.2 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。

(解説)

昭和58年12月15日薬安第181号に従って設定した。

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### (8) 高齢者

#### 9.8 高齢者

副作用の発現に特に注意し、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。本剤は、主として腎臓から排泄され、また血漿アルブミンとの結合性が強い薬物であるので、腎機能の低下により高い血中濃度が持続したり、血漿アルブミンの減少により、遊離の薬物の血中濃度が高くなるおそれがある。

(解説)

消炎鎮痛剤の第12次再評価（1977年（昭和52年）7月6日）の結果による同種同効品の使用上の注意の記載を参考として、発売時より使用上の注意に記載し注意を喚起した。

## 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
経口抗凝血剤 〔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。	本剤は血漿アルブミンと高率に結合するので、血漿アルブミン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。
リチウム製剤 〔炭酸リチウム〕	血中濃度を上昇させ、リチウム中毒を起こすおそれがあるので、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。	本剤の腎におけるプロスタグランジン生合成阻害作用により、炭酸リチウムの腎排泄が減少するためと考えられている。
ニューキノロン系抗菌剤 〔シプロフロキサシン等〕	動物実験で痙攣があらわれたとの報告がある。	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。

(解説)

#### ・経口抗凝血薬

本邦における開発時、同一成分のDURAPROX（アメリカ、Wyeth社）の添付文書（案）において、「抗凝血剤のうち、クマリン系抗凝血剤とオキサプロジンの併用で凝固因子に新たに変化が生じることはなかったが、アスピリンとオキサプロジンの併用で蛋白結合率の低下によりオキサプロジンのクリアランスが亢進する」との記載があったこと、並びに同種同効品の使用上の注意等の記載を参考として、発売時より相互作用の項に記載し、併用する際の注意を喚起した。

#### ・リチウム製剤

他の非ステロイド性消炎鎮痛剤（フルルビプロフェン含有貼付剤）とリチウム製剤との併用でリチウム中毒を発現した症例が報告され<sup>26)</sup>、リチウム製剤の添付文書上に非ステロイド性消炎鎮痛剤との相互作用の記載が入った。機序として起こる可能性があるため、1994年9月に使用上の注意を自主改訂し、併用する際の注意を喚起した。

#### ・ニューキノロン系抗菌剤

他のプロピオン酸系非ステロイド性消炎鎮痛剤であるケトプロフェンとニューキノロン系抗菌剤の塩酸シプロフロキサシンとの併用において臨床における痙攣誘発の報告\*があり、アルボにおいては臨床報告はなかったものの動物実験で痙攣誘発が報告された<sup>27)</sup>ため、1995年11月に使用上の注意を自主改訂し、相互作用の併用注意の項に記載して併用する際の注意を喚起した。

※厚生省医薬品副作用情報 No. 98（1989年9月）

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 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、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

蕁麻疹、呼吸困難、血圧低下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。

##### 11.1.2 消化性潰瘍（頻度不明）

胃痛、嘔吐、吐血・下血等を伴う胃腸出血が認められた場合には必要に応じて減量、休薬、投与中止等の適切な処置を行うこと。[2.1、9.1.1参照]

##### 11.1.3 皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）（頻度不明）

##### 11.1.4 急性腎障害（頻度不明）

[9.2.1、9.2.2参照]

##### 11.1.5 心筋梗塞、脳血管障害（いずれも頻度不明）

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<sup>28)</sup>。

(解説)

##### 11.1.1～11.1.4

市販後、本剤による重篤な副作用症例が報告されている。

##### 11.1.5

米国<sup>29)</sup>及び欧州<sup>30)</sup>のNSAIDsの添付文書で心血管系イベント（急性冠症候群、脳梗塞及び脳出血）の発現リスクについて注意喚起されていることを踏まえ、PMDAにおいて厚生労働省保健局が保有する匿名医療保険等関連情報データベース（NDB）を用いたNSAIDsによる心血管系イベント発現のリスク評価を実施した結果、NSAIDs（アスピリンを除く）による心血管系イベント発現のリスク増加傾向が認められ<sup>28)</sup>注意喚起が必要と判断された（2024年10月8日付厚生労働省医薬局医薬安全対策課長通知）。

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### (2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明
精神神経系		眠気 めまい 頭痛	
消化器	胃部不快感 胃痛	嘔気 食欲不振 便秘 下痢 口内炎 胃炎 腹痛 腹部不快感 舌の荒れ 口渇 嘔吐	
血液			貧血 白血球減少
皮膚	発疹	かゆみ	
肝臓		AST上昇 ALT上昇 Al-P上昇	肝炎
その他		浮腫 倦怠感 胸部圧迫感 霞目 発汗 耳鳴り 尿沈渣異常	

発現頻度は承認時の臨床試験及び製造販売後の使用成績調査の合算に基づいている。

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### ◆ 副作用頻度一覧表等

#### 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

総症例43,787例中、571例（1.30%）648件に副作用が認められた。その主な副作用は胃部不快感117件、胃痛112件、発疹62件、嘔気41件、浮腫31件であった。[再審査結果時]

[再審査期間：昭和60年（1985年）8月22日～平成3年（1991年）8月21日]

	承認時迄の調査	使用成績調査	合計
解析対象例数	2,518	41,269	43,787
副作用発現症例数	181 (7.19%)	390 (0.95%)	571 (1.30%)
副作用発現件数	214 (8.50%)	434 (1.05%)	648 (1.48%)

内訳（件数）

消化器	胃・腹痛	42 (1.67%)	85 (0.20%)	127 (0.29%)
	胃・腹部不快感	38 (1.51%)	86 (0.21%)	124 (0.28%)
	嘔気・嘔吐	14 (0.56%)	30 (0.07%)	44 (0.10%)
	食欲不振	12 (0.48%)	20 (0.05%)	32 (0.07%)
	胃腸障害	2 (0.08%)	26 (0.06%)	28 (0.06%)
	便秘	9 (0.36%)	16 (0.04%)	25 (0.06%)
	下痢	3 (0.12%)	15 (0.04%)	18 (0.04%)
	胃炎	2 (0.08%)	14 (0.03%)	16 (0.04%)
	胃重感	6 (0.24%)	5 (0.01%)	11 (0.03%)
	胸やけ	3 (0.12%)	7 (0.02%)	10 (0.02%)
	胃・腹部膨満感	3 (0.12%)	4 (0.01%)	7 (0.02%)
	胃部灼熱感		1 (0.00%)	1 (0.00%)
	悪心		1 (0.00%)	1 (0.00%)
	むかつき		1 (0.00%)	1 (0.00%)
	小計	134 (5.32%)	313 (0.76%)	447 (1.02%)
過敏症	発疹	15 (0.60%)	47 (0.11%)	62 (0.14%)
	かゆみ	3 (0.12%)	3 (0.01%)	6 (0.01%)
	発赤	1 (0.04%)	3 (0.01%)	4 (0.01%)
	薬疹		2 (0.00%)	2 (0.00%)
	蕁麻疹		1 (0.00%)	1 (0.00%)
	皮膚炎	1 (0.04%)		1 (0.00%)
小計	20 (0.79%)	56 (0.14%)	76 (0.17%)	
精神神経系	眠気	7 (0.28%)	6 (0.01%)	13 (0.03%)
	めまい	3 (0.12%)	4 (0.01%)	7 (0.02%)
	頭痛	4 (0.16%)	2 (0.00%)	6 (0.01%)
	ふらふら感	1 (0.04%)	3 (0.01%)	4 (0.01%)
	不眠		1 (0.00%)	1 (0.00%)
	心悸亢進		1 (0.00%)	1 (0.00%)
小計	15 (0.60%)	17 (0.04%)	32 (0.07%)	
肝臓	ALTの上昇	7 (0.28%)	2 (0.00%)	9 (0.02%)
	ASTの上昇	4 (0.16%)	3 (0.01%)	7 (0.02%)
	AI-Pの上昇	1 (0.04%)		1 (0.00%)
	肝機能悪化		1 (0.00%)	1 (0.00%)
	小計	12 (0.48%)	6 (0.01%)	18 (0.04%)

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

		承認時迄の調査	使用成績調査	合計
その他	浮腫・腫脹	12 (0.48%)	20 (0.05%)	32 (0.07%)
	口内炎	9 (0.36%)	9 (0.02%)	18 (0.04%)
	舌の荒れ	2 (0.08%)	2 (0.00%)	4 (0.01%)
	口渇・口内乾燥	1 (0.04%)	3 (0.01%)	4 (0.01%)
	胸部圧迫感	1 (0.04%)	1 (0.00%)	2 (0.00%)
	霞目	1 (0.04%)	1 (0.00%)	2 (0.00%)
	倦怠感	1 (0.04%)	1 (0.00%)	2 (0.00%)
	発汗	1 (0.04%)		1 (0.00%)
	耳鳴り	1 (0.04%)		1 (0.00%)
	気分不快	1 (0.04%)		1 (0.00%)
	尿混濁	1 (0.04%)		1 (0.00%)
	頻尿		1 (0.00%)	1 (0.00%)
	咳		1 (0.00%)	1 (0.00%)
	結膜充血		1 (0.00%)	1 (0.00%)
	唾液増加		1 (0.00%)	1 (0.00%)
	顔面熱感		1 (0.00%)	1 (0.00%)
	尿沈渣	1 (0.04%)		1 (0.00%)
	白血球減少	1 (0.04%)		1 (0.00%)
	小計	33 (1.31%)	42 (0.10%)	75 (0.17%)

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別副作用発現頻度（使用成績調査集計）

項目		発現例数（発現頻度）	
年齢別	～29才	17/ 3271	(0.52%)
	～49才	80/10012	(0.80%)
	～69才	137/12702	(1.08%)
	70才～	56/ 4457	(1.26%)
	不明又は未記載	5/ 247	(2.02%)
合併症	あり	237/27904	(0.85%)
	なし	58/ 2784	(2.08%)
1日投与量	～200mg	5/ 656	(0.76%)
	201～399mg	1/ 381	(0.26%)
	400mg	216/23493	(0.92%)
	401～600mg	71/ 6110	(1.16%)
	600mg<	1/ 33	(3.03%)
	不明又は未記載	1/ 16	(6.25%)
投与方法	分 1	42/ 3515	(1.19%)
	分 2	182/20846	(0.87%)
	分 3	70/ 6254	(1.12%)
	分 4	0/ 5	(0.00%)
	その他	1/ 69	(1.45%)
併用薬	あり	37/ 9731	(0.38%)
	なし	258/20958	(1.23%)
使用理由	関節リウマチ	23/ 1532	(1.50%)
	変形性関節症	31/ 3024	(1.03%)
	腰痛症	101/13495	(0.75%)
	変形性脊椎症	62/ 3516	(1.76%)
	頸肩腕症候群	32/ 3331	(0.96%)
	肩関節周囲炎	21/ 2631	(0.80%)
	痛風発作	1/ 186	(0.54%)
	外傷後	15/ 1543	(0.97%)
	手術後	1/ 209	(0.48%)
	その他	31/ 2310	(1.34%)

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

---

### 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

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。

(解説)

日薬連発第240号（平成8年3月27日付）「PTPの誤飲対策について」の申し合わせ事項に基づいて記載した。

### 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、注意喚起した（平成13年4月25日付厚生労働省医薬局安全対策課事務連絡）。

#### (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

##### 1) 中枢神経系に対する作用<sup>31)</sup>

オキサプロジンは弱いながらも中枢神経系に対して抑制作用を示した。

##### 2) 自律神経系及び摘出平滑筋に対する作用<sup>32)</sup>

各種アゴニストによる摘出平滑筋（回腸、胃、輸精管、子宮、気管）の収縮をオキサプロジンは非競合的に抑制し、また子宮や回腸の自動運動も抑制するが、いずれも非常に弱い作用であった。炭末輸送能、生体位消化管運動抑制も極めて弱かった。

##### 3) 呼吸・循環系に対する作用<sup>32)</sup>

特に無し

##### 4) 泌尿器系・体性神経系及びその他に対する作用<sup>32)</sup>

オキサプロジンは表面・浸潤・伝達麻酔作用及び血液凝固系、溶血性に対する作用は認められず、尿排泄、胆汁排泄に対する作用はほとんど影響が認められなかった。

#### (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

急性毒性：LD<sub>50</sub>値 (mg/kg) <sup>33)</sup>

動物種・性	投与経路				
	経口	皮下	腹腔内	静脈内	
マウス (ddY系)	♂	1,530	893	385	93
	♀	1,210	556	376	102
ラット (SD系)	♂	4,470	4,580	541	85
	♀	>5,000	2,910	506	82

中毒症状はいずれの動物種、いずれの投与経路においても酸性抗炎症剤に共通してみられる鎮静、呼吸数減少などの中枢抑制症状並びに閉眼、間代性痙攣などが見られ、特異的なものはなかった。

#### (2) 反復投与毒性試験<sup>34~36)</sup>

亜急性毒性・慢性毒性

ラットに65, 160, 400及び1000mg/kg/日を1ヵ月間、また、25, 50, 100, 200及び400mg/kg/日を6ヵ月間経口投与した試験において、高投与量では体重増加抑制、消化管障害に伴う変化と考えられる軽度な貧血、薬物代謝酵素誘導に基づく肝細胞肥大が認められた。

しかし65mg/kg/日を30日間及び25mg/kg/日を6ヵ月間経口投与しても特記すべき変化は認められなかった。

ラットの場合亜急性毒性における最大無作用量は65mg/kg、慢性毒性における最大無作用量は25mg/kgであった。

また、イヌに6.4, 16, 40mg/kg/日を6ヵ月間経口投与した試験では、40mg/kg/日に貧血及び消化管障害が観察された。

イヌにおける最大無作用量は6.4mg/kgと推察された。

## IX. 非臨床試験に関する項目

### (3) 遺伝毒性試験<sup>37)</sup>

哺乳動物（ラット）肝臓由来の薬物代謝酵素系を組み込んだ細菌株復帰突然変異試験（Ames試験）並びに哺乳動物（マウス）を用いた染色体異常誘発試験同じくマウスを用いた小核形成試験のそれぞれにおいて陰性であった。

### (4) がん原性試験<sup>38)</sup>

ラットに216.0mg/kgを2年間投与群と非投与群発癌性試験において、オキサプロジンにがん原性を示唆する所見は認められなかった。

### (5) 生殖発生毒性試験<sup>39~42)</sup>

オキサプロジンの生殖に及ぼす影響を検討するため、妊娠前、妊娠初期（ラット）、器官形成期（ラット、ウサギ）並びに周産期・授乳期（ラット）の各投与試験を行った。

20~300mg/kg/日をラットの妊娠前及び妊娠初期に経口投与した試験では、300mg/kg/日においても生殖能に対する有害作用は認められなかった。

20~500mg/kg/日をラットの、また、3~30mg/kg/日をウサギの胎児の器官形成期に経口投与した試験では、催奇形性作用は認められず、産児の発育、生殖能にも異常は認められなかった。20~400mg/kg/日をラットの周産期・授乳期に経口投与した試験では400mg/kg/日で母体及び産児の体重に増加抑制が認められた以外には産児の行動、学習能及び生殖能に影響は認められなかった。

### (6) 局所刺激性試験<sup>43)</sup>

オキサプロジンの皮膚一次刺激性及び眼粘膜刺激性を検討した結果、0.05%オキサプロジン溶液を適用した皮膚及び眼に変化は認められなかった（ウサギ）。

### (7) その他の特殊毒性

#### 1) 溶血性組織障害<sup>32)</sup>

溶血性については、イヌ赤血球*in vitro* でオキサプロジンは $2 \times 10^{-3}$ Mの濃度まで溶血性は認められなかった。

#### 2) 身体依存性<sup>44)</sup>

ラットにオキサプロジンを反復投与しても抗炎症及び鎮痛作用に対する耐性は形成されず、MOR (morphine hydrochloride)、PHB (phenobarbital) 型の身体依存性はないものと考えられる。

#### 3) 抗原性<sup>45)</sup>

モルモットを用いた全身性アナフィラキシー反応及び遅延型皮膚反応、ウサギを用いた受身血球凝集 (PHA) 反応、モルモット受身皮膚アナフィラキシー (PCA) 反応及びアルサス反応、マウスを用いたラット受身皮膚アナフィラキシー (PCA) 反応により抗原性を観察したが、いずれの試験においても抗原性は認められなかった。

#### 4) 感覚器に対する作用<sup>46)</sup>

網膜機能に及ぼす影響、視覚系に及ぼす影響及び臓器に対する作用を検討した結果、致死量以下の用量では影響は認められなかった（ラット）。

#### 5) 肝臓に対する作用<sup>47)</sup>

オキサプロジンは肝臓に対し薬物代謝酵素誘導、BSP排泄促進等の機能亢進作用を有するが、障害作用はないと判断した（ラット）。

#### 6) 腎臓に対する作用<sup>48)</sup>

オキサプロジン200, 400mg/kgのラット経口投与により、尿量増加、尿比重の減少、腎重量の増加が認められた。しかし、腎機能検査、尿検査及び腎の病理組織学検査において、対照として用いたピューロマイシン、ゲンタマイシン、フェニルアントラニル酸で観察されたような腎障害を示唆する所見は認められなかった。

#### 7) 胎児動脈管に対する作用<sup>49)</sup>

オキサプロジンはラットに対し、他の非ステロイド性消炎鎮痛剤にみられるのと同様な胎児動脈管収縮作用を示したが、その程度はアスピリンよりやや高く、インドメタシン、イブプロフェンより弱かった。

#### 8) 胃粘膜に対する作用<sup>18)</sup>

ラットでの胃粘膜障害作用はフェニルブタゾン及びアスピリンより弱く、イブプロフェンと同程度であった。

## X. 管理的事項に関する項目

---

### 1. 規制区分

製 剤：アルボ錠100mg、アルボ錠200mg 劇薬  
有効成分：オキサプロジン 劇薬

### 2. 有効期間

有効期間：5年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

該当しない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし  
くすりのしおり：あり

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

### 7. 国際誕生年月日

1968年7月13日（英国）

### 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

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
アルボ錠100mg	2007年3月22日	21900AMX00675000	2007年6月15日	1985年12月18日
アルボ錠200mg	2007年3月22日	21900AMX00676000	2007年6月15日	1985年12月18日

旧販売名：アルボ100

承認年月日：1985年8月22日、承認番号：60AM-4126、薬価基準収載年月日：1985年12月17日

旧販売名：アルボ200

承認年月日：1985年8月22日、承認番号：60AM-4127、薬価基準収載年月日：1985年12月17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

該当しない

### 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再審査結果通知年月日：1992年12月2日

### 11. 再審査期間

6年間（1985年8月22日～1991年8月21日：終了）

### 12. 投薬期間制限に関する情報

該当しない

## X. 管理的事項に関する項目

---

### 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
アルボ錠100mg	1149026F1056	1149026F1056	101035001	620004916
アルボ錠200mg	1149026F2206	1149026F2206	101038101	620004917

### 14. 保険給付上の注意

該当しない

## X I . 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) 諏訪俊男ほか：応用薬理. 1984 ; 27 (1) : 133-139
- 2) 東威ほか：臨床薬理. 1984 ; 15 (4) : 555-565
- 3) Janssen, F.W., et al : Clin.Pharmacol.Ther. 1980 ; 27 (3) : 352-362 (PMID : 7357792)
- 4) 諏訪俊男ほか：薬学雑誌. 1987 ; 107 (6) : 440-448
- 5) 塩川優一ほか：医学のあゆみ. 1984 ; 130 (5) : 386-403
- 6) 広畑和志ほか：医学のあゆみ. 1984 ; 130 (2) : 164-178
- 7) 津山直一ほか：臨床評価. 1984 ; 12 (3) : 729-764
- 8) 鈴木勝己ほか：Prog. Med. 1984 ; 4 (4) : 975-994
- 9) 塩川優一ほか：炎症. 1984 ; 4 (2) : 131-149
- 10) 津山直一ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (3) : 1021-1036
- 11) 菅原幸子ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (4) : 1135-1146
- 12) 室田景久ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (3) : 1037-1045
- 13) 岡田孝三ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (4) : 1249-1253
- 14) 花井謙次ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (4) : 1254-1262
- 15) 猪又義男：基礎と臨床. 1984 ; 18 (4) : 1297-1302
- 16) 山中寿ほか：臨床成人病. 1984 ; 14 (6) : 849-857
- 17) 青木虎吉ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (4) : 1337-1341
- 18) 樋口昭平ほか：日薬理誌. 1984 ; 83 (5) : 383-394
- 19) 天沼二三雄ほか：日薬理誌. 1984 ; 83 (4) : 345-354
- 20) 諏訪俊男ほか：応用薬理. 1984 ; 27 (1) : 157-163
- 21) 諏訪俊男ほか：応用薬理. 1984 ; 27 (1) : 141-146
- 22) Janssen, F.W., et al. : Current Ther. Res. 1984 ; 35 (3) : 363-376
- 23) 諏訪俊男ほか：応用薬理. 1984 ; 27 (1) : 147-155
- 24) 承認時資料：オキサプロジンの代謝物及び不純物の抗炎症、鎮痛作用ならびに一般薬理作用
- 25) Chiang, S.T., et al : Clin.Pharmacol.Ther. 1982 ; 31 (4) : 509-515 (PMID : 7060332)
- 26) 宗岡克政ほか：九州神経精神医学. 1991 ; 37 (3-4) : 252-254
- 27) 河野健一ほか：応用薬理. 1994 ; 48 (4) : 289-296
- 28) 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>
- 29) Food and Drug Administration (2015年7月9日/FDA) (<https://www.fda.gov/media/92768/download>)
- 30) European Medicines Agency (2012年6月14日/EMA) ([https://www.ema.europa.eu/en/documents/press-release/prac-recommends-same-cardiovascular-precautions-diclofenac-selective-cox-2-inhibitors\\_en.pdf](https://www.ema.europa.eu/en/documents/press-release/prac-recommends-same-cardiovascular-precautions-diclofenac-selective-cox-2-inhibitors_en.pdf))
- 31) 天沼二三雄ほか：応用薬理. 1984 ; 27 (2) : 315-328
- 32) 土田勝晴ほか：応用薬理. 1984 ; 27 (2) : 329-344
- 33) 阿部訓志ほか：医薬品研究. 1984 ; 15 (3) : 359-370
- 34) 木村正明ほか：医薬品研究. 1984 ; 15 (3) : 371-390
- 35) 樽本保男ほか：医薬品研究. 1984 ; 15 (3) : 391-405
- 36) 樽本保男ほか：医薬品研究. 1984 ; 15 (3) : 406-418
- 37) 安井一ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (2) : 461-467
- 38) 承認時資料：ラットにおける2年間慢性毒性試験
- 39) 山田隆ほか：医薬品研究. 1984 ; 15 (2) : 207-224
- 40) 山田隆ほか：医薬品研究. 1984 ; 15 (2) : 225-249
- 41) 山田隆ほか：医薬品研究. 1984 ; 15 (2) : 250-264
- 42) 山田隆ほか：医薬品研究. 1984 ; 15 (2) : 265-292
- 43) 承認時資料：オキサプロジンの毒性研究 局所刺激性試験
- 44) 阿部訓志ほか：応用薬理. 1984 ; 27 (2) : 345-352

## X I . 文献

---

- 45) 阿部訓志ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (2) : 453-460
- 46) 阿部訓志ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (2) : 468-486
- 47) 阿部訓志ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (2) : 489-495
- 48) 阿部訓志ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (2) : 496-510
- 49) 山田隆ほか：基礎と臨床. 1984 ; 18 (2) : 528-532

### 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

本剤は、米国での発売を確認している。(2024年8月時点)

※確認した国：米国、カナダ、EU、英国、オーストラリア

米国の添付文書 (2024年8月時点)

国名	米国 (1992年承認)								
会社名	Pfizer Labs Division of Pfizer Inc.								
販売名	DAYPRO								
販売開始年月日	1992年10月29日								
剤形・規格	oxaprozin caplets, film coated 600mg								
効能又は効果	<ul style="list-style-type: none"> <li>• For relief of the signs and symptoms of osteoarthritis</li> <li>• For relief of the signs and symptoms of rheumatoid arthritis</li> <li>• For relief of the signs and symptoms of juvenile rheumatoid arthritis</li> </ul>								
用法及び用量	<ul style="list-style-type: none"> <li>• Osteoarthritis For OA, the dosage is 1200 mg (two 600 mg caplets) given orally once a day.</li> <li>• Rheumatoid Arthritis For RA, the dosage is 1200 mg (two 600 mg caplets) given orally once a day.</li> <li>• Juvenile Rheumatoid Arthritis For JRA, in patients 6 to 16 years of age, the recommended dosage given orally once per day should be based on body weight of the patient as given in Table 1.</li> </ul> <p>Table 1. Recommended Daily Dose of DAYPRO by Body Weight in Pediatric Patients</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th>Body Weight Range (kg)</th> <th>Dose (mg)</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td>22-31</td> <td>600</td> </tr> <tr> <td>32-54</td> <td>900</td> </tr> <tr> <td>≥ 55</td> <td>1200</td> </tr> </tbody> </table>	Body Weight Range (kg)	Dose (mg)	22-31	600	32-54	900	≥ 55	1200
Body Weight Range (kg)	Dose (mg)								
22-31	600								
32-54	900								
≥ 55	1200								

Drugs@FDA [DAYPRO® (Pfizer Labs Division of Pfizer Inc.), 2022年11月改訂

<[https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda\\_docs/label/2022/018841s034lbl.pdf](https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2022/018841s034lbl.pdf)> (2024年8月20日アクセス)] より

### 2. 海外における臨床支援情報

#### (1) 妊婦に関する海外情報

本邦における「9.5 妊婦」「9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、米国の添付文書とは異なる。

本邦における使用上の注意

#### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。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。[2.6参照]

#### 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。

出典	記載内容
米国の添付文書 (2022年11月)	<p><b>8.1 Pregnancy</b> <u>Risk Summary</u></p> <p>Use of NSAIDs, including DAYPRO, can cause premature closure of the fetal ductus arteriosus and fetal renal dysfunction leading to oligohydramnios and, in some cases, neonatal renal impairment. Because of these risks, limit dose and duration of DAYPRO use between about 20 and 30 weeks of gestation, and avoid DAYPRO use at about 30 weeks of gestation and later in pregnancy ( see Clinical Considerations, Data).</p>

## X II . 参考資料

### *Premature Closure of Fetal Ductus Arteriosus*

Use of NSAIDs, including DAYPRO, at about 30 weeks gestation or later in pregnancy increases the risk of premature closure of the fetal ductus arteriosus.

### *Oligohydramnios/Neonatal Renal Impairment*

Use of NSAIDs at about 20 weeks gestation or later in pregnancy has been associated with cases of fetal renal dysfunction leading to oligohydramnios, and in some cases, neonatal renal impairment.

Data from observational studies regarding other potential embryofetal risks of NSAID use in women in the first or second trimesters of pregnancy are inconclusive. In animal reproduction studies, oral administration of oxaprozin to pregnant rabbits at doses 0.1-times the maximum daily human dose (based on body surface area) resulted in evidence of teratogenicity; however, oral administration of oxaprozin to pregnant mice and rats during organogenesis at doses equivalent to the maximum recommended human dose revealed no evidence of teratogenicity or embryotoxicity. In rat reproduction studies in which oxaprozin was administered through late gestation failure to deliver and a reduction in live birth index was observed at doses equivalent to the maximum recommended human dose. Based on animal data, prostaglandins have been shown to have an important role in endometrial vascular permeability, blastocyst implantation, and decidualization. In animal studies, administration of prostaglandin synthesis inhibitors such as oxaprozin, resulted in increased pre- and post-implantation loss. Prostaglandins also have been shown to have an important role in fetal kidney development. In published animal studies, prostaglandin synthesis inhibitors have been reported to impair kidney development when administered at clinically relevant doses.

The estimated background risk of major birth defects and miscarriage for the indicated population(s) is unknown. All pregnancies have a background risk of birth defect, loss, or other adverse outcomes. In the U.S. general population, the estimated background risk of major birth defects and miscarriage in clinically recognized pregnancies is 2% to 4% and 15% to 20%, respectively.

### Clinical Considerations

#### *Fetal/Neonatal Adverse Reactions*

##### *Premature Closure of Fetal Ductus Arteriosus:*

Avoid use of NSAIDs in women at about 30 weeks gestation and later in pregnancy, because NSAIDs, including DAYPRO, can cause premature closure of the fetal ductus arteriosus ( see Data).

##### *Oligohydramnios/Neonatal Renal Impairment:*

If an NSAID is necessary at about 20 weeks gestation or later in pregnancy, limit the use to the lowest effective dose and shortest duration possible. If DAYPRO treatment extends beyond 48 hours, consider monitoring with ultrasound for oligohydramnios. If oligohydramnios occurs, discontinue DAYPRO and follow up according to clinical practice ( see Data).

#### *Labor or Delivery*

There are no studies on the effects of DAYPRO during labor or delivery. In animal studies, NSAIDs, including oxaprozin, inhibit prostaglandin synthesis, cause delayed parturition, and increase the incidence of stillbirth.

### Data

#### *Human Data*

##### *Premature Closure of Fetal Ductus Arteriosus:*

Published literature reports that the use of NSAIDs at about 30 weeks of gestation and later in pregnancy may cause premature closure of the fetal ductus arteriosus.

##### *Oligohydramnios/Neonatal Renal Impairment:*

Published studies and postmarketing reports describe maternal NSAID use at about 20 weeks gestation or later in pregnancy associated with fetal renal dysfunction leading to oligohydramnios, and in some cases, neonatal renal impairment. These adverse outcomes are seen, on average, after days to weeks of treatment, although oligohydramnios has been infrequently reported as soon as 48 hours after NSAID initiation. In many cases, but not all, the decrease in amniotic fluid was transient and reversible with cessation of the drug. There have been a limited number of case reports of maternal NSAID use and neonatal renal dysfunction without oligohydramnios, some of which were irreversible. Some cases of neonatal renal dysfunction required treatment with invasive procedures, such as exchange transfusion or dialysis.



## X II . 参考資料

Methodological limitations of these postmarketing studies and reports include lack of a control group; limited information regarding dose, duration, and timing of drug exposure; and concomitant use of other medications. These limitations preclude establishing a reliable estimate of the risk of adverse fetal and neonatal outcomes with maternal NSAID use. Because the published safety data on neonatal outcomes involved mostly preterm infants, the generalizability of certain reported risks to the full-term infant exposed to NSAIDs through maternal use is uncertain.

### *Animal data*

Teratology studies with oxaprozin were performed in mice, rats, and rabbits in pregnant animals administered oral doses up to 200 mg/kg/day, 200 mg/kg/day, and 30 mg/kg/day, respectively, during the period of organogenesis. In rabbits, malformations were observed at doses greater than or equal to 7.5 mg/kg/day of oxaprozin (0.1 times the maximum recommended human daily dose [MRHD] of 1800 mg based on body surface area). However, in mice and rats, no drug-related developmental abnormalities or embryo-fetal toxicity were observed at doses up to 50 and 200 mg/kg/day of oxaprozin, respectively (0.1 times and 1.1 times the maximum recommended human daily dose of 1800 mg based on a body surface area comparison, respectively).

In fertility/reproductive studies in rats, 200 mg/kg/day oxaprozin was orally administered to female rats for 14 days prior to mating through lactation day (LD) 2, or from gestation day (GD) 15 through LD 2 and the females were mated with males treated with 200 mg/kg/day oxaprozin for 60 days prior to mating. Oxaprozin administration resulted in failure to deliver and a reduction in live birth index at 200 mg/kg/day (1.1-times the maximum recommended human daily dose of 1800 mg based on a body surface area comparison).

### **8.2 Lactation**

#### Risk Summary

Lactation studies have not been conducted with DAYPRO. It is not known whether DAYPRO is excreted in human milk. DAYPRO should be administered to lactating women only if clearly indicated.

The developmental and health benefits of breastfeeding should be considered along with the mother's clinical need for DAYPRO and any potential adverse effects on the breastfed infant from the DAYPRO or from the underlying maternal condition.

### **8.3 Females and Males of Reproductive Potential**

#### Infertility

##### *Females*

Based on the mechanism of action, the use of prostaglandin-mediated NSAIDs, including DAYPRO, may delay or prevent rupture of ovarian follicles, which has been associated with reversible infertility in some women. Published animal studies have shown that administration of prostaglandin synthesis inhibitors has the potential to disrupt prostaglandin-mediated follicular rupture required for ovulation.

Small studies in women treated with NSAIDs have also shown a reversible delay in ovulation. Consider withdrawal of NSAIDs, including DAYPRO, in women who have difficulties conceiving or who are undergoing investigation of infertility.

##### *Males*

Testicular degeneration was observed in beagle dogs treated with 37.5 mg/kg/day (0.7-times the maximum recommended human daily dose based on body surface area) of oxaprozin for 42 days or 6 months.

Drugs@FDA [DAYPRO® (Pfizer Labs Division of Pfizer Inc.), 2022年11月改訂

<[https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda\\_docs/label/2022/018841s034lbl.pdf](https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2022/018841s034lbl.pdf)> (2024年8月20日アクセス)] より

## X II . 参考資料

### (2) 小児等に関する海外情報

本邦における「9.7 小児等」の項の記載は以下のとおりであり、米国の添付文書とは異なる。

本邦における使用上の注意

#### 9.7 小児等

9.7.1 小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.7.2 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。

出典	記載内容
米国の添付文書 (2022年11月)	<p><b>8.4 Pediatric Use</b></p> <p>Safety and effectiveness of DAYPRO in pediatric patients below the age of 6 years of age have not been established. The effectiveness of DAYPRO for the treatment of the signs and symptoms of juvenile rheumatoid arthritis (JRA) in pediatric patients aged 6 to 16 years is supported by evidence from adequate and well controlled studies in adult rheumatoid arthritis patients, and is based on an extrapolation of the demonstrated efficacy of DAYPRO in adults with rheumatoid arthritis and the similarity in the course of the disease and the drug's mechanism of effect between these two patient populations. Use of DAYPRO in JRA patients 6 to 16 years of age is also supported by the following pediatric studies.</p> <p>The pharmacokinetic profile and tolerability of oxaprozin were assessed in JRA patients relative to adult rheumatoid arthritis patients in a 14 day multiple dose pharmacokinetic study. Apparent clearance of unbound oxaprozin in JRA patients was reduced compared to adult rheumatoid arthritis patients, but this reduction could be accounted for by differences in body weight. No pharmacokinetic data are available for pediatric patients under 6 years. Adverse events were reported by approximately 45% of JRA patients versus an approximate 30% incidence of adverse events in the adult rheumatoid arthritis patient cohort. Most of the adverse events were related to the gastrointestinal tract and were mild to moderate.</p> <p>In a 3 month open label study, 10 to 20 mg/kg/day of oxaprozin were administered to 59 JRA patients. Adverse events were reported by 58% of JRA patients. Most of those reported were generally mild to moderate, tolerated by the patients, and did not interfere with continuing treatment. Gastrointestinal symptoms were the most frequently reported adverse effects and occurred at a higher incidence than those historically seen in controlled studies in adults. Fifty-two patients completed 3 months of treatment with a mean daily dose of 20 mg/kg. Of 30 patients who continued treatment (19 to 48 week range total treatment duration), nine (30%) experienced rash on sun-exposed areas of the skin and 5 of those discontinued treatment. Controlled clinical trials with oxaprozin in pediatric patients have not been conducted.</p>

Drugs@FDA [DAYPRO® (Pfizer Labs Division of Pfizer Inc.), 2022年11月改訂

<[https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda\\_docs/label/2022/018841s034lbl.pdf](https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2022/018841s034lbl.pdf)> (2024年8月20日アクセス)] より

## 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。

掲載根拠：「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するQ&Aについて（その3）」  
（令和元年9月6日付厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課事務連絡）

アルボ錠を粉砕して経口投与、又は粉砕法・簡易懸濁法により経管投与することは適応外の用法である。また、これらの方法で投与した場合の、有効性・安全性・体内動態を検討したデータはないため、原則として粉砕もしくは簡易懸濁法を適用して投与することは推奨できない。

#### (1) 粉砕

アルボ錠200mgの粉砕後の安定性試験を、下記条件につき実施した。

アルボ錠200mg粉砕後の安定性試験結果

保存条件		試験項目	包装	保存期間			
				直後	1週間	2週間	4週間
加温	40°C	外観	瓶（開放）	*1	—	変化なし	—
		定量（%）*2		100.0	—	99.8	—
		重量変化（%）		—	—	-0.16	—
加湿	25°C 60%RH	外観	瓶（開放）	*1	—	変化なし	変化なし
			ポリセロ		—	変化なし	変化なし
		定量（%）*2	瓶（開放）	100.0	—	99.2	99.6
			ポリセロ		—	99.2	98.1
		重量変化（%）	瓶（開放）	—	—	+0.17	+0.26
			ポリセロ		—	-0.32	-0.22
	25°C 75%RH	外観	瓶（開放）	*1	—	変化なし	変化なし
			ポリセロ		—	変化なし	変化なし
		定量（%）*2	瓶（開放）	100.0	—	—	—
			ポリセロ		—	—	—
		重量変化（%）	瓶（開放）	—	—	+0.56	+0.64
			ポリセロ		—	+0.24	+0.07
25°C 90%RH	外観	瓶（開放）	*1	—	変化なし	変化なし	
		ポリセロ		—	変化なし	変化なし	
	定量（%）*2	瓶（開放）	100.0	—	100.5	100.6	
		ポリセロ		—	99.8	100.0	
	重量変化（%）	瓶（開放）	—	—	+1.93	+2.47	
		ポリセロ		—	+1.46	+2.32	
光照射	蛍光灯 1000Lux	外観	ポリセロ	*1	変化なし	変化なし	変化なし
		定量（%）*2		100.0	100.0	99.9	99.1
		重量変化（%）		—	+0.09	-0.45	-0.44

\*1：白色の粉末で、におい、味はなかった。なお、2週間で降はにおいと味の試験は行わなかった。

\*2：数字は重量補正を行い、対直後%で示した。

—：測定せず

## XIII. 備考

### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

アルボ錠100mg及びアルボ錠200mgの簡易懸濁法適用時の安定性試験を、下記条件につき実施した。

#### 試験方法

アルボ錠100mg (1錠中オキサプロジン100mg含有) 1錠及びアルボ錠200mg (1錠中オキサプロジン200mg含有) 1錠にそれぞれ約55°Cの水20mLを加え、照度800Lux条件の下、室温で10分間静置した液を被験液とし、主薬の含量を定量した。また、遮光条件下 (アルミホイルにて被覆) においても検討した。

簡易懸濁法適用時の安定性試験結果

販売名	条件	残存率 (%)
アルボ錠100mg	室温、照度800Lux	101.63
	室温、遮光	99.37
アルボ錠200mg	室温、照度800Lux	102.68
	室温、遮光	101.82

残存率：被験液につき液体クロマトグラフィー法にて主薬の含量を測定し、主薬の表示量を100%とした場合の残存率 (%) を求めた。

### 2. その他の関連資料

該当資料なし



**大正製薬株式会社**

〒170-8633東京都豊島区高田3-24-1

<https://www.taisho.co.jp/>

2024年10月改訂