

劇薬
指定医薬品**オキシアシドン[®]錠**
OXYACIDON[®] Tab.

(オキサプロジン製剤)

貯 法：遮光保存
使用期限：外装容器に表示

承認番号	20500AMZ00665
薬価収載	1994年7月
販売開始	1994年8月

【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〔ただし、「慎重投与」の項参照〕副作用として消化性潰瘍が報告されているため、消化性潰瘍を悪化させるおそれがある。〕
- (2)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いるため、肝障害を悪化させるおそれがある。〕
- (3)重篤な腎障害のある患者〔腎血流量を低下させ腎障害を悪化させるおそれがある。〕
- (4)本剤の成分に対し過敏症の患者
- (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。〕
- (6)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人〔「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照〕

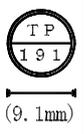
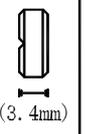
- (3)血液の異常又はその既往歴のある患者〔血液の異常を悪化又は再発させるおそれがある。〕
- (4)肝障害又はその既往歴のある患者〔肝障害を悪化又は再発させるおそれがある。〕
- (5)腎障害又はその既往歴のある患者〔腎血流量を低下させ腎障害を悪化又は再発させるおそれがある。〕
- (6)過敏症の既往歴のある患者
- (7)気管支喘息の患者〔喘息発作を誘発させるおそれがある。〕
- (8)潰瘍性大腸炎の患者〔症状を悪化させるおそれがある。〕
- (9)クローン病の患者〔症状を悪化させるおそれがある。〕
- (10)高齢者〔「重要な基本的注意」、「高齢者への投与」の項参照〕
- (11)小児〔「重要な基本的注意」の項参照〕

【組成・性状】

1. 組成

1錠中、日局オキサプロジン 200mgを含有する。
添加物として、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカ
ルメロースNa、タルク、ステアリン酸Mgを含有する。

2. 製剤の性状

外 形			重量 (mg)	色調 剤形	識 別 コ ー ド	
上面	下面	側面			本 体	T P
			235	白色 円板形 錠剤	TP	TP
(9.1mm)	(9.1mm)	(3.4mm)			P T P	TP-191

【効能・効果】

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、変形性
脊椎症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎、痛風発作
2. 外傷後及び手術後の消炎・鎮痛

【用法・用量】

通常、成人にはオキサプロジンとして1日量400mg(2錠)
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(3錠)とする。

【使用上の注意】

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)
 - (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。〕
 - (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。〕

2. 重要な基本的注意

- (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(慢性関節リウマチ、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。
 - 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)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。
 - 1)炎症及び疼痛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。
- (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。
- (5)感染症を不顕性化するおそれがあるので、感染症を合併している患者に対し用いる場合には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。
- (7)高齢者及び小児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。

3. 相互作用

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	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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
リチウム製剤	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	動物実験で痙攣があらわれたとの報告があるので注意すること。	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。

4. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用（頻度不明）

- 1) ショック、アナフィラキシー様症状：ショック、アナフィラキシー様症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常（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。
- 2) 消化性潰瘍：消化性潰瘍があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常（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。
- 3) 皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）
急性腎不全：皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）急性腎不全が報告されているので、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。

(2) その他の副作用

	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	肝炎、AST (GOT) の上昇、ALT (GPT) の上昇、Al-Pの上昇
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

5. 高齢者への投与

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（「相互作用」の項参照）薬物であるので、少量から投与を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。[高齢者では、一般に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。]

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。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ている。]

(2) 授乳婦への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は授乳を避けること。[動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。]

7. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。[使用経験が少ない。]

8. 適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

9. 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。

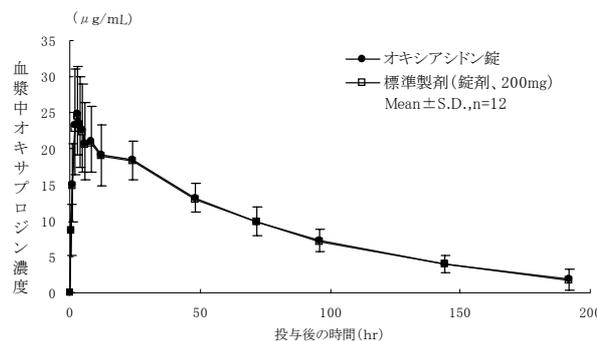
【薬物動態】

生物学的同等性試験¹⁾

オキサシドン錠と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（オキサプロジンとして200mg）健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、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 (0-192) ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	t 1/2 (hr)
オキサシドン錠	1,735.11 ± 350.20	25.66 ± 6.69	3.6 ± 3.0	57.9 ± 7.1
標準製剤（錠剤、200mg）	1,721.29 ± 333.56	25.27 ± 5.23	3.6 ± 3.0	58.4 ± 7.4

(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。

溶出挙動²⁾

オキサシドン錠は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたオキサプロジン錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：オキサプロジン(Oxaprozin) (JAN)

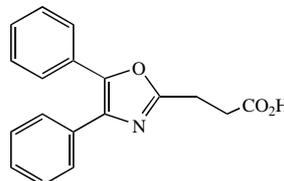
化学名：3-(4,5-Diphenyloxazol-2-yl) propanoic acid

分子式：C₁₈H₁₅NO₃

分子量：293.32

融点：161 ~ 165

構造式：



性状：白色～帯黄白色の結晶性の粉末である。
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。
光によって徐々に変化する。

【取扱い上の注意】

安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、オキシアシドン錠は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。

【包装】

1,000錠(PTP包装)

【主要文献】

- 1) ニプロジェネファ(株)社内資料：生物学的同等性試験(1991)
- 2) ニプロジェネファ(株)社内資料：溶出性試験(2003)
- 3) ニプロジェネファ(株)社内資料：安定性試験(1991)

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

ニプロジェネファ株式会社 学術情報室

〒344-0057 埼玉県春日部市南栄町7番地5

電話 048-754-8712 FAX 048-754-8776



販売元
三井製薬株式会社
東京都練馬区豊玉北2-3-1



製造販売元
ニプロジェネファ株式会社
埼玉県春日部市南栄町7番地5