

医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）

2023.07.05 初版

有効成分	ロキソプロフェンナトリウム水和物		
	1	ロキソプロフェン錠60mg「EMEC」	エルメッド
	2	ロキソプロフェンナトリウム錠60mg「CH」	長生堂製薬
	3	ロキソプロフェンナトリウム錠60mg「クニヒロ」	皇漢堂製薬
	4	ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」	メディサ新薬
	5	ロキソプロフェンナトリウム錠60mg「日医工」	日医工
	6	ロキソプロフェンNa錠60mg「YD」	陽進堂
	7	ロキソプロフェンNa錠60mg「三和」	三和化学研究所
	8	ロキソプロフェンNa錠60mg「トーワ」	東和薬品
	9	ロキソプロフェンNa錠60mg「ツルハラ」	鶴原製薬
	10	ロキソプロフェンNa錠60mg「KN」	小林化工
	11	ロキソプロフェンNa錠60mg「アメル」	共和薬品工業
	12	ロキソプロフェンNa錠60mg「日新」	日新製薬（山形）
	13	ロキソプロフェンNa錠60mg「NPI」	日本薬品工業
	14	ロキソプロフェンNa錠60mg「TCK」	辰巳化学
	15	ロキソプロフェンNa錠60mg「OHA」	大原薬品工業
	16	ロキソプロフェンNa錠60mg「あすか」	あすか製薬
	17	ロキソプロフェンNa錠60mg「武田テバ」	武田テバファーマ
	18	ロキソプロフェンNa錠60mg「三恵」	三恵薬品
	19	ロキソプロフェンNa錠60mg「KO」	寿製薬
	20	ロキソプロフェンナトリウム内服液60mg「日医工」	日医工
品目名（製造販売業者） 【先発医薬品】	①	ロキソニン錠60mg	第一三共
効能・効果	https://www.bbdb.jp		
用法・用量	https://www.bbdb.jp		
添加物	https://www.bbdb.jp		
解離定数 ¹⁾	pKa : 4.20		
溶解度 ¹⁾	第一液 : 1.5mg/mL pH4.0 : 1000mg/mL 以上 pH6.8 : 1000mg/mL 以上 水 : 1000mg/mL 以上		
原薬の安定性 ¹⁾	水	なし	
	液性(pH)	酸性～中性は安定。pH13 でやや不安定。	
	光	なし	
	その他	なし	
膜透過性	なし		
BCS・Biowaiver option	なし		

藥効分類	114 解熱鎮痛消炎剤
規格単位	60mg 1錠 0.6% 1mL

【記載データ一覧】

	品目名	製造販売業者	BE	品質 再評価	溶出/ 純度	検査
1	ロキソプロフェン錠60mg「EMEC」	エルメッド	○		①No.7	○
2	ロキソプロフェンナトリウム錠60mg「CH」	長生堂製薬	○	○*	①No.15	○
3	ロキソプロフェンナトリウム錠60mg「クニヒロ」	皇漢堂製薬	○		①No.19*	○*
4	ロキソプロフェンNa錠60mg「サワイ」	メディサ新薬	○	○*	①No.9*	○*
5	ロキソプロフェンナトリウム錠60mg「日医工」	日医工	○	○*	①No.24*	○*
6	ロキソプロフェンNa錠60mg「YD」	陽進堂	○	○*	①No.5*	○*
7	ロキソプロフェンNa錠60mg「三和」	三和化学研究所	○	○*	①No.10*	○*
8	ロキソプロフェンNa錠60mg「トーフ」	東和薬品	○	○*	①No.12*	○*
9	ロキソプロフェンNa錠60mg「ツルハラ」	鶴原製薬	○	○*	①No.18*	○*
10	ロキソプロフェンNa錠60mg「KN」	小林化工	○	○*	①No.17*	○*
11	ロキソプロフェンNa錠60mg「アメル」	共和薬品工業	○	○*	①No.23*	○*
12	ロキソプロフェンNa錠60mg「日新」	日新製薬（山形）	○	○*	①No.14*	○*
13	ロキソプロフェンNa錠60mg「NPI」	日本薬品工業	○	○*	①No.11*	○*
14	ロキソプロフェンNa錠60mg「TCK」	辰巳化学	○	○*	①No.16* ②No.3*	○*
15	ロキソプロフェンNa錠60mg「OHA」	大原薬品工業	○	○*	①No.13*	○*
16	ロキソプロフェンNa錠60mg「あすか」	あすか製薬	○	○*	①No.2*	○*
17	ロキソプロフェンNa錠60mg「武田テバ」	武田テバファーマ	○	○*	①No.20*	○*
18	ロキソプロフェンNa錠60mg「三恵」	三恵薬品	○	○*	①No.4*	○*
19	ロキソプロフェンNa錠60mg「KO」	寿製薬	○	○*	①No.8*	○*
20	ロキソプロフェンナトリウム内服液60mg「日医工」	日医工	○	記載 対象外		

注)「BE」は、生物学的同等性(BE)試験結果を示し、○印がついているものは本情報集にデータを掲載している。【5~9ページ】

注)「品質再評価」の項目に○印がついているものは、品質再評価結果通知²⁾が発出されている品目である。空欄となっているものは、品質再評価指定以降に承認された品目等である。なお、参考として、品質再評価の際の先発医薬品の溶出曲線測定例を本情報集に掲載している。また、品質再評価は、内用固形製剤の溶出性を溶出試験で確認したものであり、内用液剤は検討対象外である。【10ページ】

注)「溶出」及び「純度」は、ジェネリック医薬品品質情報検討会での溶出試験結果及び純度試験結果を示し、上記表中に番号の記載があるものは、試験を実施した品目である(上記表中の番号は、本情報集に掲載された溶出試験及び純度試験結果中の番号と対応している。)全品目で空欄となっている場合は、溶出試験あるいは純度試験未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該試験実施以降に承認された品目等である。【11~15ページ】

注)「検査」は、後発医薬品品質確保対策事業検査結果を示し、上記表中に○印がついているものは検査を実施

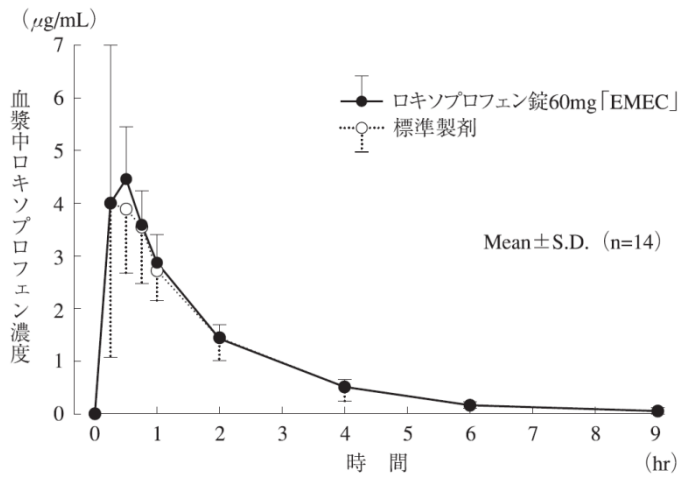
した品目である。全品目で空欄となっている場合は、検査未実施である。一部が空欄となっている場合は、当該検査実施以降に承認された品目等である。【16 ページ】

注) サンノーバ及び龍角散の製剤は、承認時において他社と共同開発されたものである（医薬品審査管理課調査による）。

*：旧販売名で記載

【生物学的同等性 (BE) 試験結果】

1

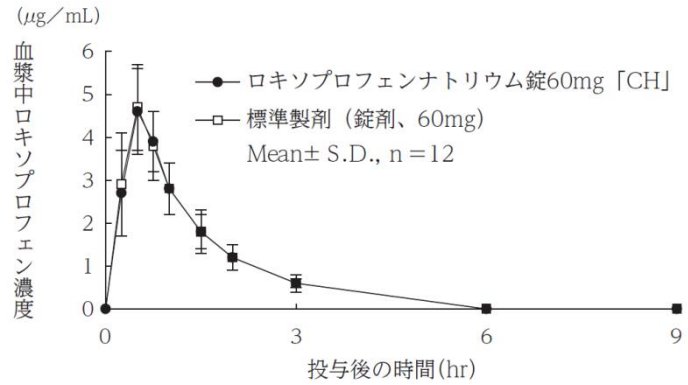


1錠投与時の平均血漿中薬物濃度推移

標準製剤：錠剤

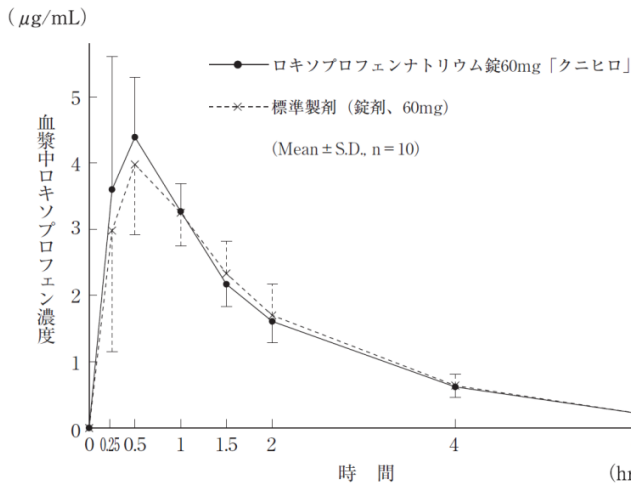
2

1錠投与



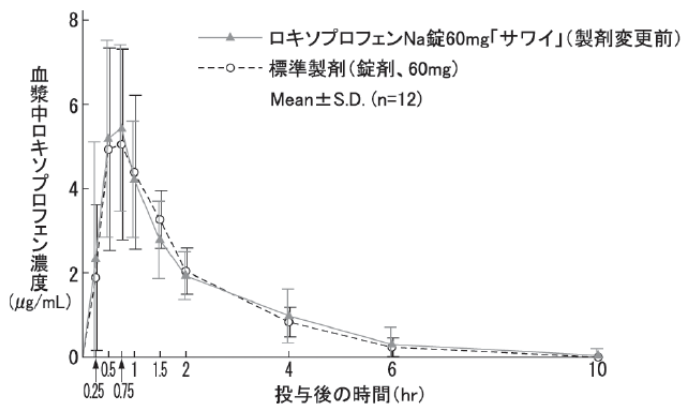
3

1錠投与



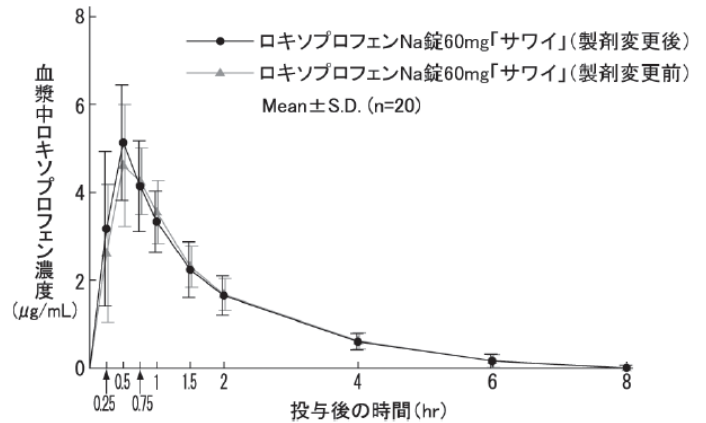
4

1錠投与



(インタビューフォームより)

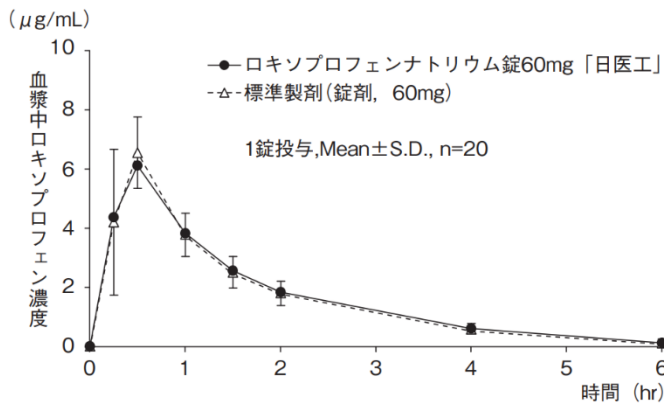
1錠投与



(インタビューフォームより)

5

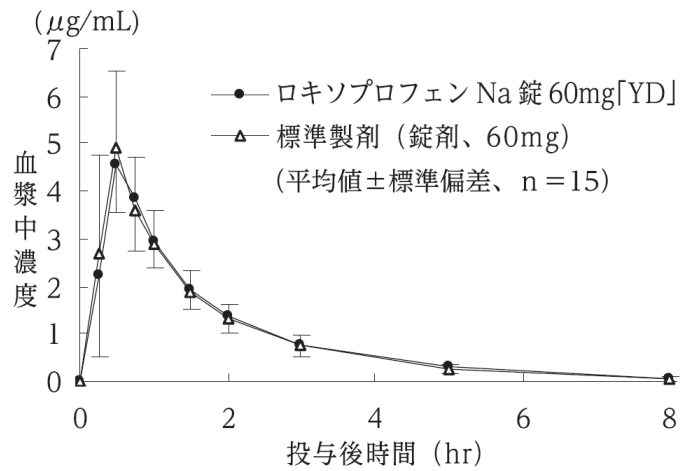
1錠投与



6

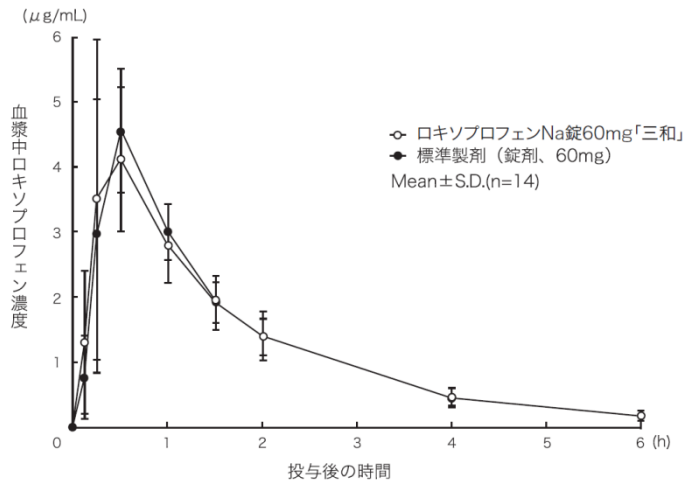
1錠投与

血漿中未変化体濃度を測定



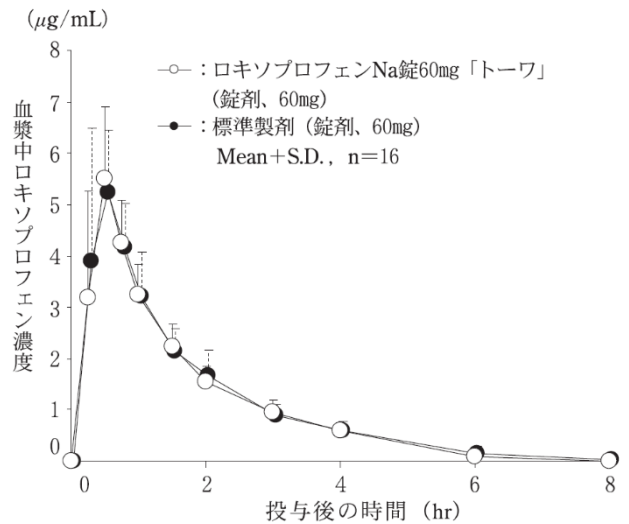
7

1錠投与



8

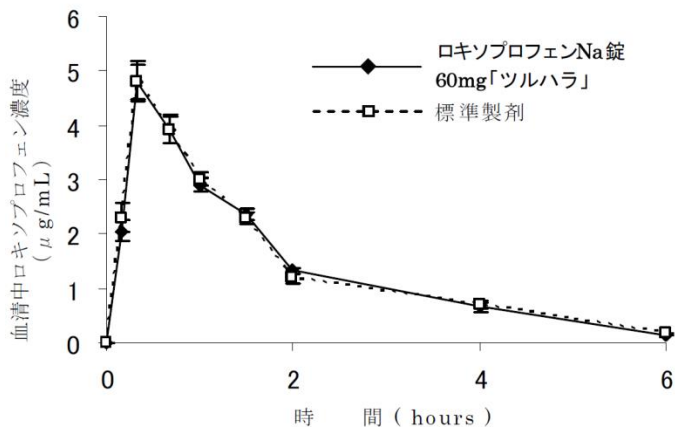
1錠投与



9

1錠投与

(n=12、Mean±S.E.)



標準製剤：錠剤

10

1錠投与

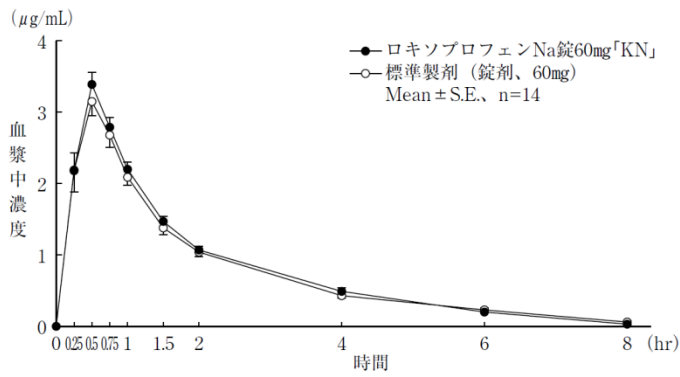


図1 ロキソプロフェンの血漿中濃度推移

1錠投与

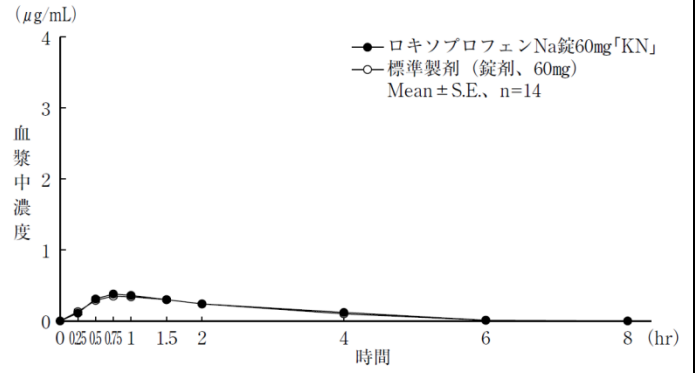
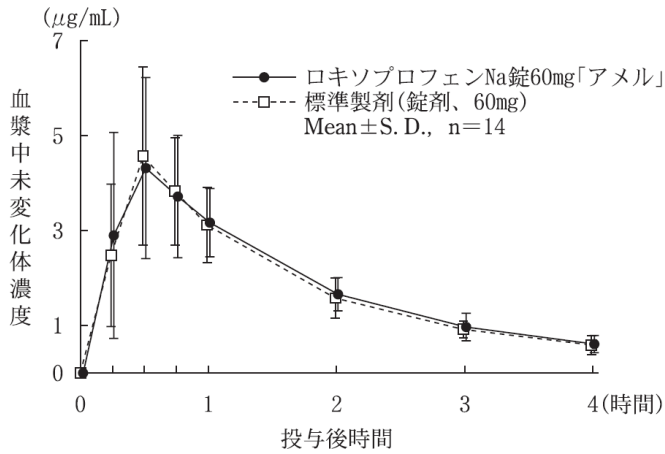


図2 活性代謝物 *trans*-OH体の血漿中濃度推移

11

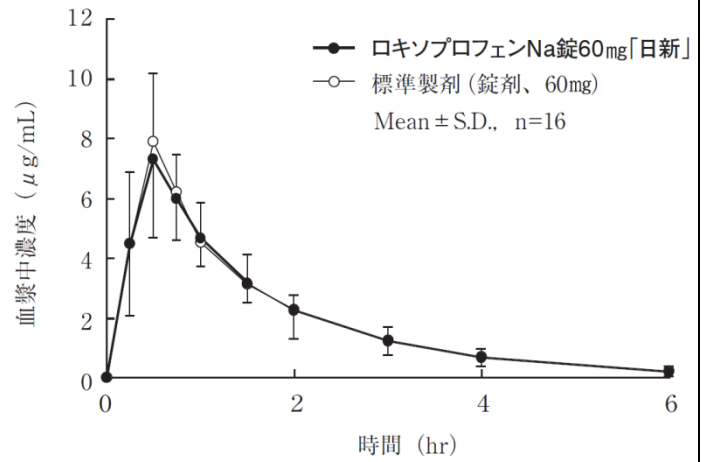
1錠投与



12

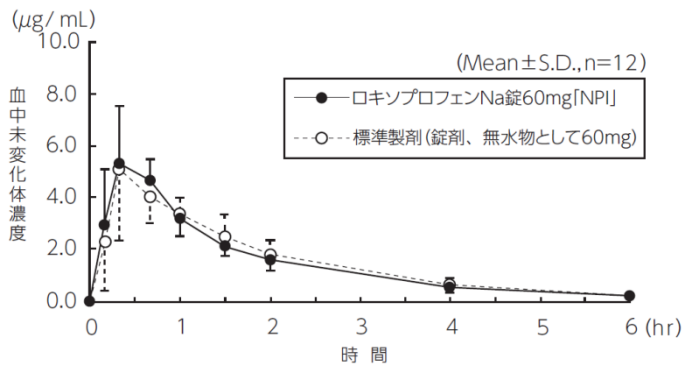
1錠投与

血漿中未変化体濃度を測定



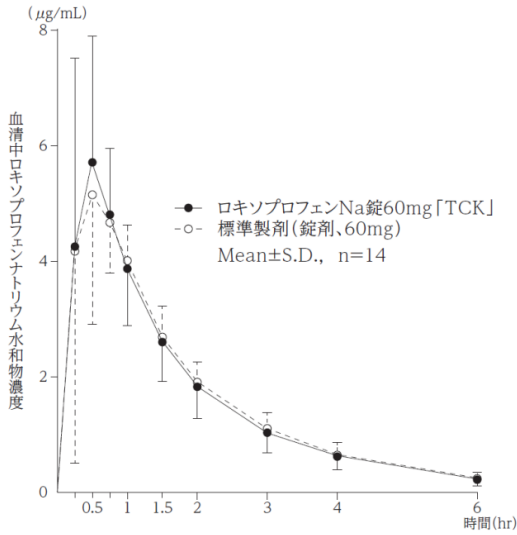
13

1錠投与

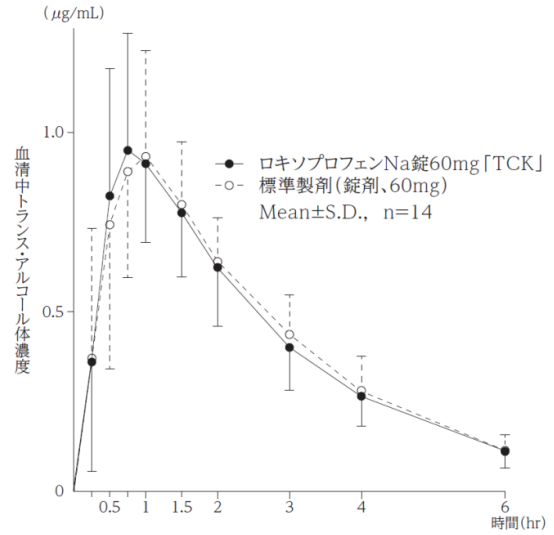


14

1錠投与

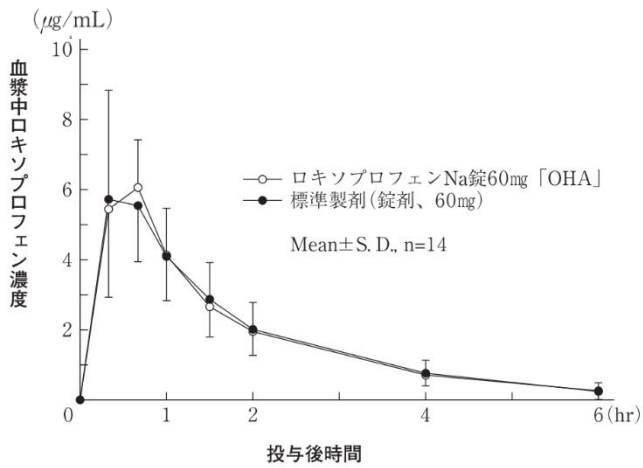


1錠投与



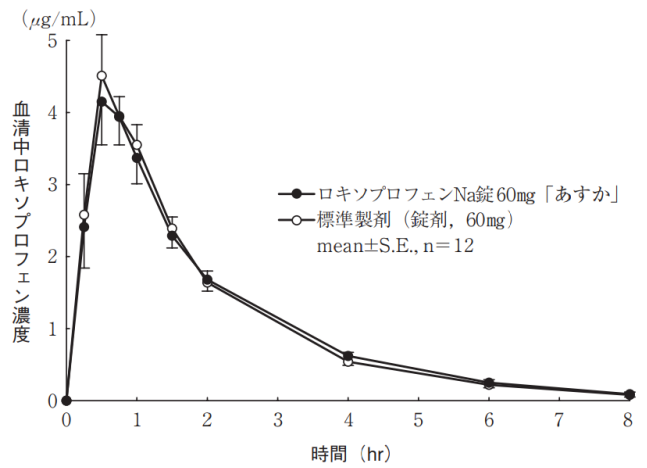
15

1錠投与



16

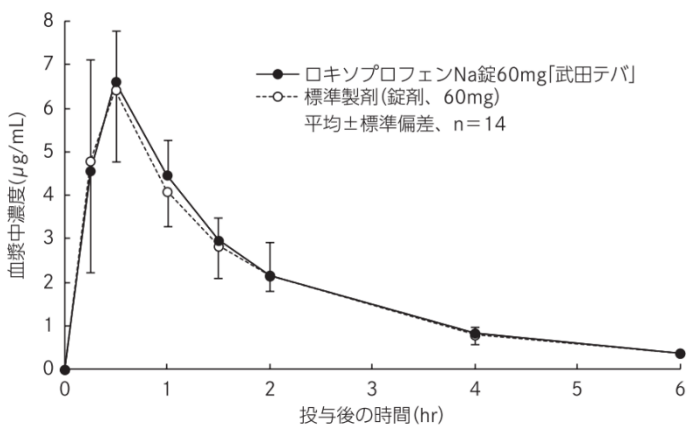
1錠投与



17

1錠投与

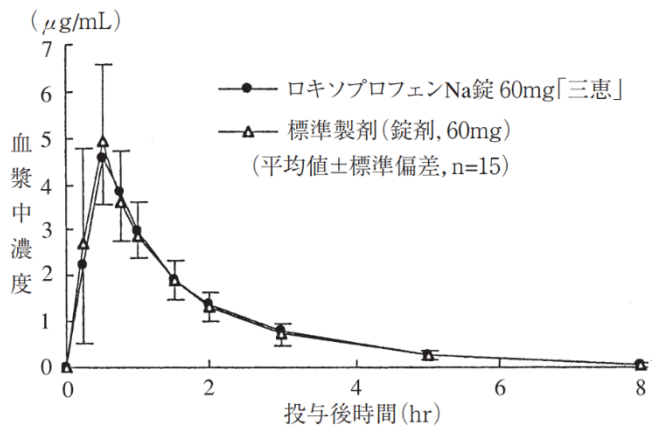
血漿中未変化体濃度を測定



18

1錠投与

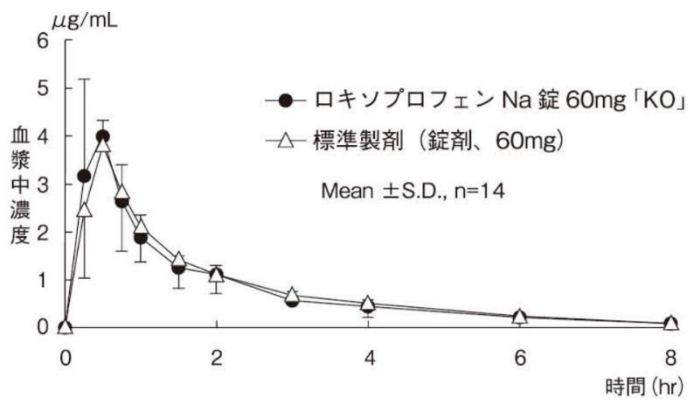
血漿中未変化体濃度を測定



19

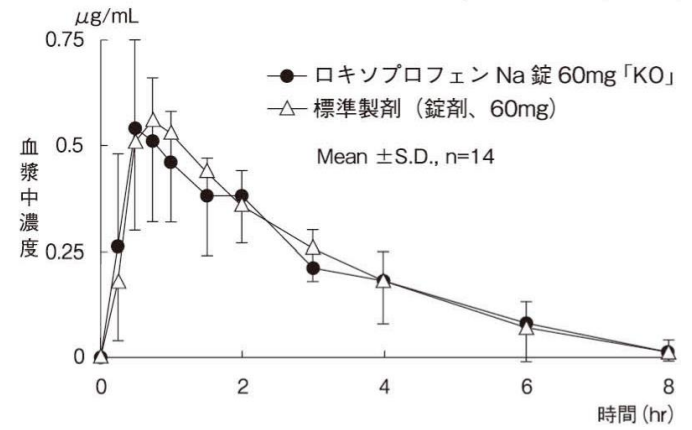
1錠投与

血漿中未変化体（ロキソプロフェン）濃度を測定



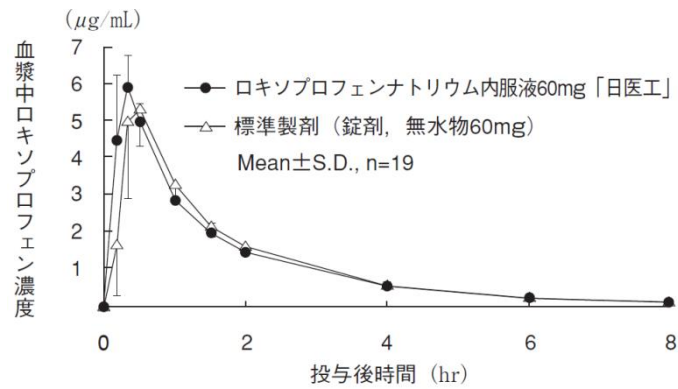
1錠投与

活性代謝物（trans-OH体）濃度を測定



20

ロキソプロフェンナトリウム無水物として 60mg 投与



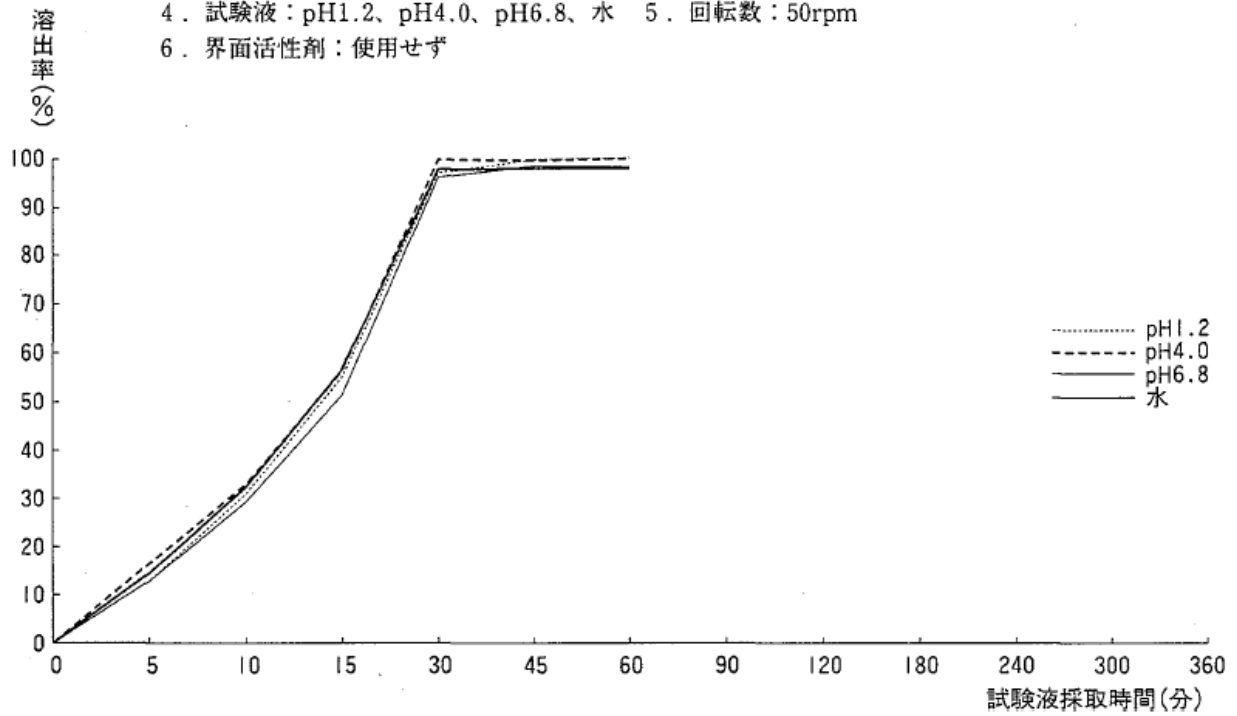
【品質再評価（医療用医薬品品質情報（オレンジブック））】¹⁾

※先発医薬品の溶出曲線測定例を示す。

溶出曲線測定例

ロキソプロフェンナトリウム錠60mg

- 1. 有効成分名：ロキソプロフェンナトリウム
- 2. 剤形：錠剤
- 3. 含量：60mg
- 4. 試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水
- 5. 回転数：50rpm
- 6. 界面活性剤：使用せず



【溶出試験結果①（ジェネリック医薬品品質情報検討会）】³⁾

製剤 No	製品名	製造販売元	ロット番号	使用期限	備考
No. 1	ロキソニン錠	第一三共(株)	THA2548	2012. 06	先発医薬品
No. 2	スリノフェン錠	あすか製薬(株)	8D020	2011. 03	製品名変更
No. 3	ウナスチン錠 60mg	マイラン製薬(株)	M004BP6	2011. 06	製品名変更、承認 整理済み
No. 4	サンロキソ錠	(株)三恵薬品	20H8	2011. 08	製品名変更
No. 5	リンゲリーズ錠	(株)陽進堂	YCF-7	2011. 05	製品名変更
No. 6	ノブフェン錠 60mg	サンド(株)	L0001	2011. 02	承認整理済み
No. 7	ロキソプロフェン錠 60mg 「EMEC」	サンノーバ(株)	87A79S	2011. 06	承継し、製造販売 元変更
No. 8	ロキプロナル錠 60mg	寿製薬(株)	H04L	2011. 07	製品名変更
No. 9	ケンタン錠 60mg	メディサ新薬(株)	08501	2011. 05	製品名変更
No. 10	レトラック錠 60mg	(株)三和化学研究所	HD010K	2011. 04	製品名変更
No. 11	オキミナス錠 60mg	日本薬品工業(株)	28805	2011. 06	製品名変更
No. 12	カンファタニン錠 60mg	東和薬品(株)	A356	2011. 05	製品名変更
No. 13	ロブ錠	大原薬品工業(株)	LG25	2011. 05	製品名変更
No. 14	ロキソート錠	日新製薬(株)	822081	2011. 01	製品名変更
No. 15	ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「CH」	長生堂製薬(株)	TD042	2011. 04	
No. 16	ロゼオール錠 60mg	辰巳化学(株)	THDC	2011. 08	製品名変更
No. 17	コバロキニン錠 60mg	小林化工(株)	T8DC05	2011. 06	製品名変更
No. 18	ツルメリン錠 60mg	鶴原製薬(株)	8022	2011. 02	製品名変更
No. 19	ロキソプロフェンナトリウム錠「ク ニヒロ」 60mg	皇漢堂製薬(株)	ZHM497	2011. 11	製品名変更
No. 20	ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg 「タイヨー」	大洋薬品工業(株)	707203	2010. 09	製品名及び製造 販売元変更
No. 21	ロキソマリン錠 60mg	大正薬品工業(株)	8K12	2011. 04	承認整理済み
No. 22	ロキフェン錠 60mg	(株)龍角散	LG837	2011. 07	承認整理済み
No. 23	ロキペイン錠 60mg	共和薬品工業(株)	8008	2011. 07	製品名変更
No. 24	ロルフェナミン錠 60mg	日医工(株)	BU2001	2011. 03	製品名変更

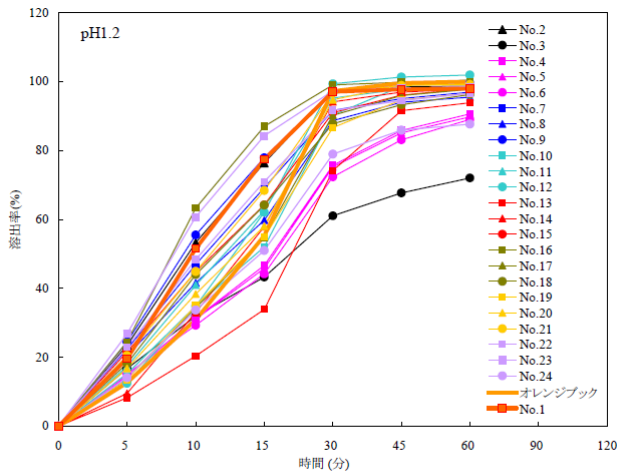


図 26 ロキソプロフェンナトリウム錠の pH1.2 における溶出挙動

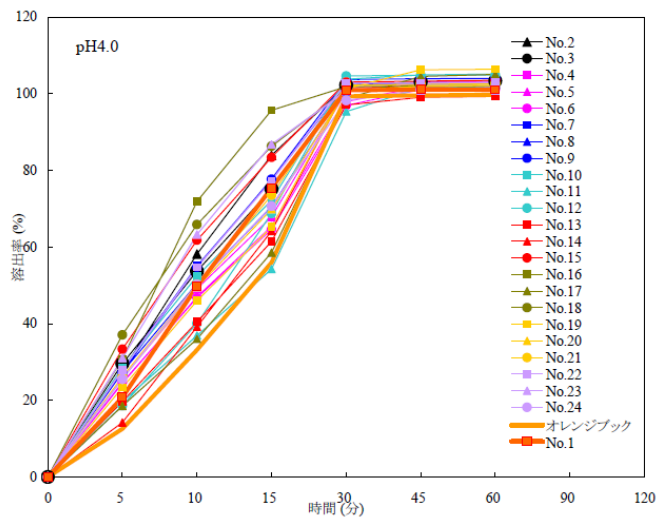


図 27 ロキソプロフェンナトリウム錠の pH4.0 における溶出挙動

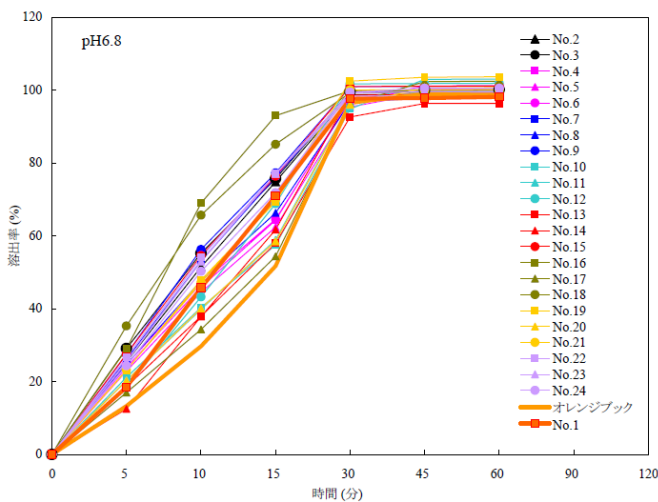


図 28 ロキソプロフェンナトリウム錠の pH6.8 における溶出挙動

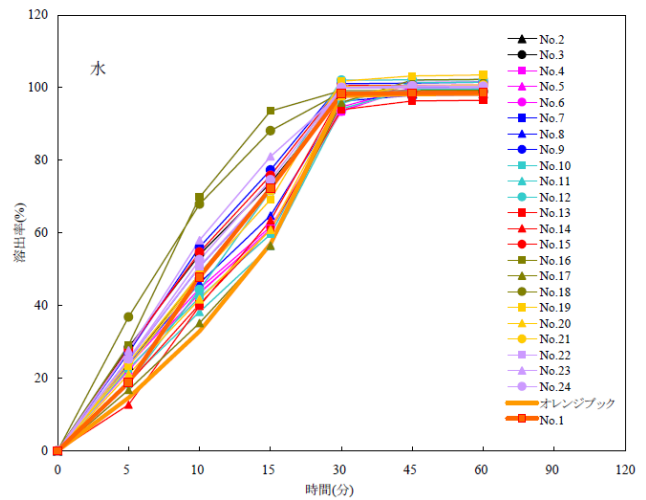


図 29 ロキソプロフェンナトリウム錠の水における溶出挙動

各試験液における溶出曲線を図 26～29 に示した。

ロキソプロフェンナトリウム 60mg 錠の公的溶出規格は、水を試験液として、毎分 50 回転で試験を行うとき、30 分後に 85%以上であり、すべての製剤が規格に適合した。

先発製剤 No. 1 とオレンジブックの溶出挙動を比較すると、4 試験液すべてにおいて、溶出が速い傾向が認められたが、類似の範囲内であった。

ジェネリック製剤とオレンジブックの溶出挙動を比較すると、類似の許容範囲と判断できなかったものは、pH1.2 では製剤 No. 3、pH4.0、pH6.8 および水では製剤 No. 16 であった。その他の製剤はすべて類似の許容範囲内であった。

類似性が疑わしい製剤 No. 3 はすでにメーカーが製法の検討を終了し、No. 16 も製法を確認予定となっている。

※改善後の製剤については、ジェネリック医薬品品質情報検討会で溶出試験が行われた（次ページ、【溶出試験結果②（ジェネリック医薬品品質情報検討会）】参照）。

【溶出試験結果②（ジェネリック医薬品品質情報検討会）】⁴⁾

製剤 No	製品名	製造販売元	ロット番号	使用期限	備考
No. 1	ロキソニン錠	第一三共(株)	THA6076	2018. 10	先発医薬品
No. 2	ウナスチン錠 60mg	マイラン製薬(株)	J42727	2017. 03	製品名変更、承認 整理済み
No. 3	ロゼオール錠 60mg	辰巳化学(株)	ZJDK	2017. 10	製品名変更

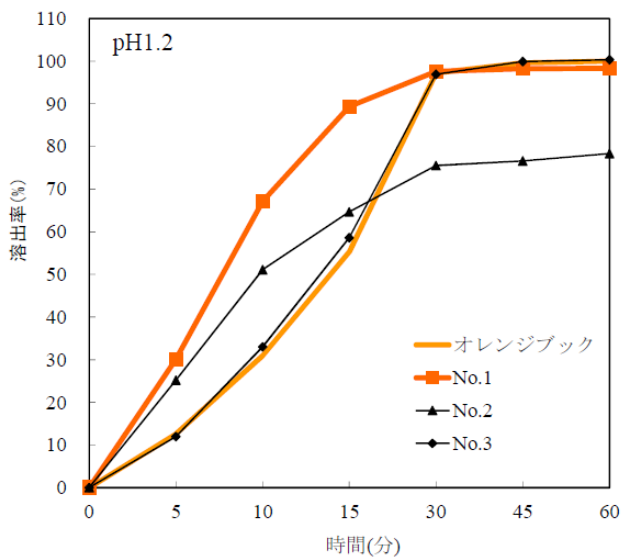


図1 ロキソプロフェンナトリウム錠の pH1.2 における溶出挙動

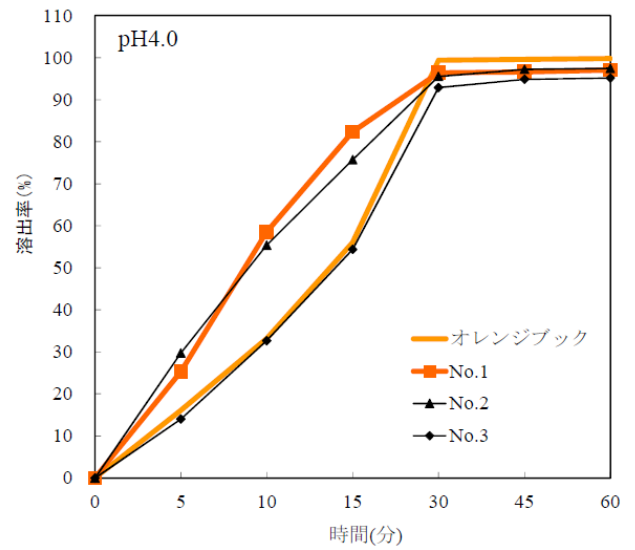


図2 ロキソプロフェンナトリウム錠の pH4.0 における溶出挙動

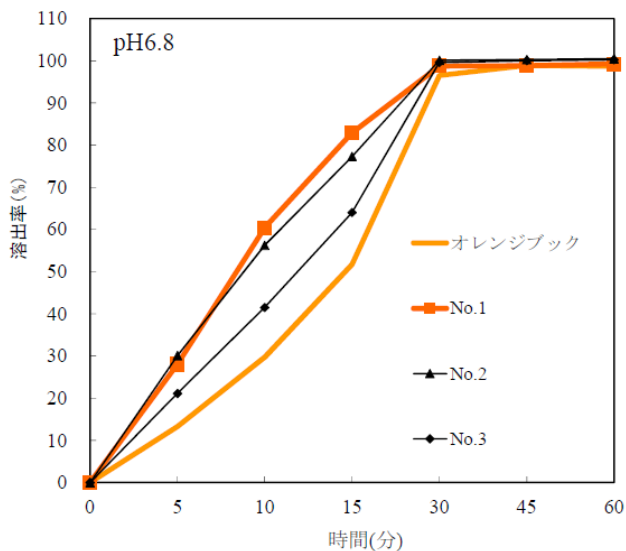


図3 ロキソプロフェンナトリウム錠の pH6.8 における溶出挙動

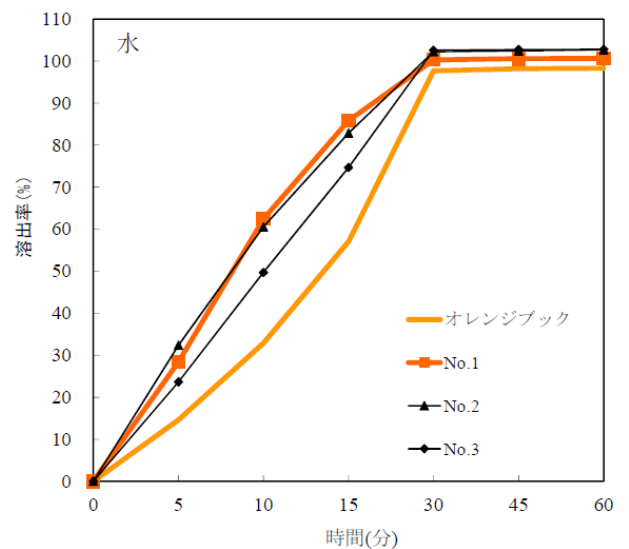


図4 ロキソプロフェンナトリウム錠の水における溶出挙動

各試験液における溶出曲線を図 1~4 に示す。以後の全ての図中で同様であるが、No. 1 は類似性の比較対照となる先発品、オレンジブックと記しているのは、品質再評価時の標準製剤の溶出プロファイルを示している。

ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg の公的溶出規格は、水を試験液として毎分 50 回転で試験を行なうとき、30 分間の溶出率が 85%以上であり、全ての製剤が規格に適合していた（図 4）。

pH1.2 を試験液としたとき、製剤 No. 2 においてベッセル底部に固形の残留物が認められ、溶出が遅延する傾向にあったが、オレンジブック曲線とは類似の範囲内であった。

その他、いずれの後発品も先発品またはオレンジブック溶出曲線と類似の範囲にあり、溶出性の改善がなされていることが確認された。

【純度試験結果（ジェネリック医薬品品質情報検討会）】

なし

【後発医薬品品質確保対策事業検査結果】⁵⁾

平成 20 年度（溶出試験） 適

ロキソプロフェンナトリウム錠

Loxoprofen Sodium Tablets

溶出性 〈6.10〉 試験液に水 900mL を用い、パドル法により、毎分 50 回転で試験を行うとき、本品の 30 分間の溶出率は 85% 以上である。

本品 1 個をとり、試験を開始し、規定された時間に溶出液 20mL 以上をとり、孔径 0.8 μ m 以下のメンブランフィルターでろ過する。初めのろ液 10mL 以上を除き、次のろ液 1mL を正確に量り、1mL 中にロキソプロフェンナトリウム (C₁₅H₁₇NaO₃) 約 13 μ g を含む液となるように溶出試験第 2 液を加えて正確に V' mL とし、試料溶液とする。別にロキソプロフェン標準品を 60°C で 3 時間減圧乾燥し、その約 31mg を精密に量り、エタノール(99.5) 5mL に溶かし、水を加えて正確に 250mL とする。この液 5mL を正確に量り、溶出試験第 2 液を加えて正確に 50mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液につき、水を対照とし、紫外可視吸光度測定法 〈2.24〉 により試験を行い、波長 223nm における吸光度 A_T 及び A_S を測定する。

ロキソプロフェンナトリウム (C₁₅H₁₇NaO₃) の表示量に対する溶出率 (%)

$$= M_s \times A_T / A_S \times V' / V \times 1 / C \times 36 \times 1.089$$

M_s: ロキソプロフェン標準品の秤取量 (mg)

C: 1 錠中のロキソプロフェンナトリウム (C₁₅H₁₇NaO₃) の表示量 (mg)

【分析法（純度試験）】

なし

【関連情報】

なし

【引用情報】

- 1) 医療用医薬品品質情報集（オレンジブック）（平成 11 年 10 月版、厚生省医薬安全局審査管理課）
- 2) 医療用医薬品再評価結果 平成 11 年度（その 3）について（平成 11 年 10 月 7 日付け医薬発第 1179 号、厚生省医薬安全局長）
- 3) 第 4 回ジェネリック医薬品品質情報検討会 資料 4-1-1
- 4) 第 16 回ジェネリック医薬品品質情報検討会 資料 16-1
- 5) 平成 20 年度「後発医薬品品質確保対策事業」検査結果報告書（平成 21 年 8 月、厚生労働省医薬食品局監視指導・麻薬対策課）
- 6) 第十八改正日本薬局方（令和 3 年 6 月 7 日厚生労働省告示第 220 号）