meloxicam (JAN)

メロキシカム

非ステロイド性消炎鎮痛剤

114

【基本電子添文】 モービック錠2024年10月改訂

【製品】 規制等: [劇] 《モービック錠5・10mg 2004.09.10承認》

メロキシカム 錠5・10mg(共和薬品 皇漢堂 沢井 高田 東和薬品 日医工 ニプロ 日本ケミファー共創未来 日本薬品工業)

メロキシカム [経] 錠5・10mg (ダイト—エルメッド, 日医 工)

モービック Mobic 錠5・10mg (日本ベーリンガー)

【組成】 〔錠剤〕:1錠中5mg, 10mg

【効能・効果】 次の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

【用法・用量】 メロキシカムとして1日1回10mg食後経口投与 (増減)。1日最高用量15mg

用法関連注意 ①国内において1日15mgを超える用量での安全性は確立していない[使用経験が少ない] ②他の消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい ③高齢者では、少量(1回5mg1日1回)から開始するなど慎重に投与する(特定背景関連注意⑦参照)

【禁忌】 ●消化性潰瘍のある患者「プロスタグランジン合成 阻害作用により,胃粘膜防御能が低下し,消化性潰瘍を悪化 させるおそれがある] (特定背景関連注意**●** b 参照) 篤な血液の異常がある患者(特定背景関連注意●ⓒ参照) 3重篤な肝機能障害のある患者(特定背景関連注意30参 ◆重篤な腎機能障害のある患者(特定背景関連注意 昭) 2 (3)参照) ●重篤な心機能不全のある患者(特定背景関連 注意❶@参照) 6重篤な高血圧症の患者(特定背景関連注 意❶@参照) ◆本剤の成分,サリチル酸塩(アスピリン) 等) 又は他の非ステロイド性消炎鎮痛剤に対して過敏症の既 往歴のある患者 ③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 [重症喘息発作を誘発するおそれがある] (特定背景関連注 意❶①参照) **9**妊婦又は妊娠している可能性のある女性 (特定背景関連注意◆参照)

【重要な基本的注意】 ●本剤はin vitro試験において、シクロオキシゲナーゼ(COX)-1に対してよりもCOX-2をより強く阻害することが確認されているが、日本人を対象とした臨床試験ではCOX-2に対してより選択性の低い非ステロイド性消炎鎮痛剤と比較して、本剤の安全性がより高いことは検証されていない。特に、消化管障害発生のリスクファクターの高い患者(消化性潰瘍の既往歴のある患者等)への投与に際しては副作用の発現に留意し、十分な観察を行う(臨床成績③③、薬効薬理⑤参照) ②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。また、薬物療法以外の療法も考慮する

❸長期投与する場合には、定期的かつ必要に応じて尿検査、血 液検査, 肝機能検査及び便潜血検査等を行う 4感染症を不顕 性化するおそれがあるので、観察を十分に行い、慎重に投与す る ⑤眼の調節障害、眠気等の精神神経系症状が現れることが あるので、投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の 操作に従事させないよう十分注意する 【特定背景関連注意】 ●合併症・既往歴等のある患者 ②消化性潰瘍の既往歴のある 患者:プロスタグランジン合成阻害作用により、胃粘膜防御能 が低下し、消化性潰瘍を再発させるおそれがある(重大な副作 用②参照) ⑥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。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(禁忌❶参照) ⓒ血液の異常又は その既往歴のある患者(重篤な血液の異常がある患者を除く): 血液の異常を悪化又は再発させるおそれがある (禁忌②参照) d心機能障害のある患者(重篤な心機能不全のある患者を除 く):プロスタグランジン合成阻害作用により、腎血流量低下及 び水、ナトリウムの貯留が起こり、心機能障害を悪化させるお それがある(禁忌 6参照) (空高血圧症の患者 (重篤な高血圧症 の患者を除く):プロスタグランジン合成阻害作用により、腎血 流量低下及び水、ナトリウムの貯留が起こり、血圧を上昇させ るおそれがある(禁忌6参照) ① 気管支喘息のある患者(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 するおそれがある(禁忌❸参照) ⑧体液喪失を伴う大手術直後 の患者:循環体液量が減少している状態にある患者では、プロ スタグランジン合成阻害作用により、腎血流の低下、腎機能障 害が惹起されるおそれがある ⑥出血傾向のある患者:血小板 機能異常が起こることがあるため、出血傾向を助長するおそれ がある (i)炎症性腸疾患 (クローン病あるいは潰瘍性大腸炎) の患者:症状が悪化するおそれがある ②腎機能障害患者 ② 重篤な腎機能障害のある患者:投与しない。プロスタグランジ ン合成阻害作用により、腎血流量低下及び水、ナトリウムの貯 留が起こり、腎機能障害を悪化させるおそれがある(禁忌⁴参 害のある患者を除く):プロスタグランジン合成阻害作用によ り、腎血流量低下及び水、ナトリウムの貯留が起こり、腎機能 障害を悪化又は再発させるおそれがある ③肝機能障害患者 ②重篤な肝機能障害のある患者:投与しない。肝機能障害を悪 化させるおそれがある(禁忌3参照) ⑤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 4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。動物実験(ラッ ト及びウサギ)において、次のことが認められている(禁忌9 参照) @ラットの妊娠前及び妊娠初期投与試験において, 黄体 数、着床数及び生存胎児数が減少し、着床率の低下と着床後死 亡率の増加がみられた
⑤ラットの器官形成期投与試験におい て妊娠期間の延長及び死産児数の増加がみられた ⓒウサギの 器官形成期投与試験において着床後死亡率の増加がみられた (d)ラット周産期及び授乳期投与試験において、妊娠期間の延長 及び分娩時間の遷延,死産児数及び生後4日までの死亡児数の

増加がみられた 5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。動物実験(ラット)で乳汁中へ移行することが認められている ⑥小児等:小児等を対象とした臨床試験は実施していない ⑦高齢者:観察を十分行い(消化管障害、特に胃腸出血に注意する)、異常が認められた場合には、中止し、適切な処置を行う。一般に高齢者においては胃腸出血、潰瘍、穿孔はより重篤な転帰をたどり、極めてまれにではあるが致死性の消化管障害も報告されている。これらの事象は治療のどの時点でも発現し、重篤な消化管障害の既往の有無にかかわらず発現する可能性がある(用法関連注意③参照)

【相互作用】併用注意

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ACE阻害薬	糸球体ろ過量がより減少	プロスタグランジン合成
アンギオテンシンⅡ受容	し, 腎機能障害のある患	阻害作用により、腎血
体拮抗剤	者では急性腎障害を引き	流量が低下するためと
	起こす可能性がある	考えられる
選択的セロトニン再取り	出血傾向が増強するおそ	選択的セロトニン再取
込み阻害剤	れがある	り込み阻害剤は血小板
		凝集抑制作用を有する
		ためと考えられる
	消化性潰瘍及び胃腸出血	両剤ともプロスタグラン
阻害剤	のリスクを高める可能性	ジン合成阻害作用を有
・糖質コルチコイド・他の非ステロイド性消	がある	するためと考えられる
炎鎮痛剤		
・サリチル酸塩(アスピ		
リンを含む)		
抗凝固剤	出血傾向が増強するおそ	これら薬剤は抗凝固作
・トロンビン阻害剤(ダ	れがあるので、併用が避	用を有するためと考え
ビガトランエテキシラー	けられない場合は、血液	られる。また、CYP2C9
ト等)	凝固に関する検査を行う	による代謝において,
・クマリン系抗凝血剤	など、これら薬剤の効果	本剤とワルファリンと
(ワルファリン等)	を十分観察する	の薬物相互作用が起こ
・ヘパリン		るおそれがある
抗血小板剤	出血傾向を増強するおそ	抗血小板剤は血小板凝
・チクロピジン	れがある	集抑制作用を有するた
		めと考えられる
血栓溶解剤		これら薬剤は血栓溶解
		作用を有するためと考
		えられる
コレスチラミン	本剤の作用が減弱する	コレスチラミンの薬物
		吸着作用により、本剤
		の消失が速まると考え られる
经中面特度工到	ナ刻の佐田 お焼砂よりむ	
経口血糖降下剤	本剤の作用が増強するお それがある	機序は十分に解明され ていないが、グリベンク
	(40N-00) S	ラミドが本剤の代謝を
		阻害した (in vitro試験)
		との報告がある
キニジン	本剤の作用が減弱するお	
	それがある	ていないが, キニジン
		が本剤の代謝を亢進さ
		せた(<i>in vitro</i> 試験)と
		の報告がある
リチウム	血中リチウム濃度が上昇	プロスタグランジン合成
	する。他の非ステロイド	阻害作用により,リチ
	性消炎鎮痛剤で、リチウ	ウムの腎排泄が遅延する
	ム中毒を呈したとの報告	ためと考えられている
	があるので、本剤の治療	
	開始、用量の変更及び中	
	止時には、血中リチウム 濃度を測定するなど留意	
	涙及を測定するなど留息 する	
J 1 1 1 2 2 1		プロフカガニいバン人中
メトトレキサート (重士な可佐田②参昭)	メトトレキサートの血液	プロスタグランジン合成
(重大な副作用@参照)	障害を悪化させるおそれ があるので、血液検査を	阻害作用により、メト トレキサートの尿細管
		II レカッ・ピソカKWIII 巳
	十分行う	The state of the s

		分泌を抑制するためと 考えられている
利尿剤	利尿剤を使用中の患者に おいては、非ステロイド 性消炎鎮痛剤で急性腎障 害を起こすおそれがある ので、腎機能に十分留意 し、本剤の併用を開始す る	プロスタグランジン合成 阻害作用により、腎血 流量低下及び水、ナト リウムの貯留が起こるた めと考えられている
降圧薬 ・β-受容体遮断薬 ・ACE阻害薬 ・血管拡張薬 ・利尿剤等	他の非ステロイド性消炎 鎮痛剤で、降圧薬の効果 を減弱させることが報告 されている	血管拡張作用を有する プロスタグランジンの合 成が阻害されるため、 降圧薬の血圧低下作用 を減弱させると考えら れている
シクロスポリン	シクロスポリンの腎毒性 が非ステロイド性消炎鎮 痛剤により増強されるお それがあるので、腎機能 に十分留意する	プロスタグランジン合成 阻害作用により腎血流 量が減少するためと考 えられている

【副作用】 次の副作用が現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

●重大な副作用 ②消化性潰瘍 (1%以下) (穿孔を伴うことがある), 吐血 (頻度不明), 下血等の胃腸出血 (1%以下), 大腸炎 (0.1%未満): (特定背景関連注意●②参照) ⑤喘息 (0.1%未満) ②急性腎障害 (頻度不明) ④無顆粒球症 (頻度不明), 血小板減少 (1%以下): (相互作用参照) ④中毒性表皮壊死融解症 (Toxic Epidermal Necrolysis: TEN) (頻度不明), 皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson症候群) (頻度不明), 水疱 (頻度不明), 多形紅斑 (頻度不明) ①ショック (頻度不明), アナフィラキシー (0.1%未満), 血管浮腫 (0.1%未満) ⑧肝炎 (頻度不明), 重篤な肝機能障害 (1%以下) ⑥再生不良性貧血, 骨髄機能抑制 (いずれも頻度不明) ①ネフローゼ症候群 (頻度不明) ①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 (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現れることがある

2その他の副作用

	5%以上	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
循環器		血圧上昇	低血圧, 動悸	
消化器	腹痛	口内炎, 口内 乾燥, 口角 炎, 日角 炎, 軽点 、悪気, 胃炎心・ 嘔気, 胃潰, 消化不良, 消化不屁, 下角, 便潜 あ, 便潜 なび, でがある。	腹部膨満感, 便秘	胃炎
精神神経系		頭痛,味覚障害	知覚異常,眠 気,眩暈	錯乱,失見 当識,抑う つ
過敏症		発疹,皮膚瘙痒,蕁麻疹	接触性皮膚 炎,光線過敏 性反応	
感覚器			眼異物感,眼 球強膜充血, 耳鳴	結膜炎,視 覚障害,霧 視
肝臓		AST, ALT, LDH, Al-Pの 上昇等の肝機 能障害, ウロ		

	•		•	
		ビリノーゲン		
		の上昇,総ビ		
		リルビン値の		
		上昇		
腎臓		BUN, クレア	尿量減少	
		チニン、尿酸値		
		の上昇,総蛋		
		白,アルブミン		
		の低下, 尿蛋		
		白, 尿糖		
血液		白血球の増		
		加,赤血球,		
		白血球, へモ		
		グロビン, ヘマ		
		トクリット		
		値,リンパ球		
		の減少,好中		
		球,好酸球,		
		好塩基球,単		
		球の増加,貧		
		щ		
その他		浮腫,倦怠	咳嗽、腋窩・	排尿障害
		感,気分不	乳房の痛み,	(尿閉を含
		快,尿沈渣の	悪寒, 潮紅・	む)
		増加,尿潜	ほてり,発	
		血, 血清鉄の	熱, 下肢脱力	
		減少,カリウム		
		の上昇		
			1. dat = 100 d. a	

【過量投与】処置:コレスチラミンが本剤の消失を速めるとの報告がある 【その他の注意】 臨床使用に基づく情報 ①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 ②他の非ステロイド性消炎鎮痛剤で、子宮内避妊器具の避妊効果を減弱させることが報告されている 【取扱い上の注意】 品質保証上、防湿包装にしているので、開封後の保管及び投薬調剤の場合は、吸湿に注意する 【保存等】 室温保存(取扱い上の注意参照)。有効期間:3年

【薬物動態】(#: 承認用法・用量は1日1回10mg食後経口投 与) **①**血中濃度 **②**単回投与 **⑦健康成人に5**, 10, 20mg[#]を カプセル剤として空腹時投与時、最高血中濃度は約7時間後に得 られ, 血中濃度のピークは二峰性を示し, これは腸肝循環及び 腸管内へ排泄後、腸から再吸収される腸から腸への再循環 (enteroenteric circulation) によると考えられる。 C_{max}及び AUCは用量に比例 ④健康成人男子に10mgを錠剤及びカプセ ル剤として空腹時投与し、薬物動態パラメータを比較した結 果,両製剤が生物学的に同等であることを確認 ⑥反復投与: 健康成人男子25例に10mgをカプセル剤として食後7日間反復投 与時の薬物動態パラメータは、 $C_{\mathrm{m~a~x}}$ 1.842 ± 0.428 μ g/mL, AUC $_{0}$ $_{\tau}$ 30.21 \pm 7.88 μ g \cdot hr/mL, C $_{\tau}$ 0.875 \pm $0.300\,\mu\,\mathrm{g/mL}$,MRT 29.95 \pm 7.40時間, $\mathrm{t_{\,1\,/\,2}}$ 18.68 \pm 5.20時 間、 t_{max} 5.160 ± 1.599時間 **②**吸収 ④健康成人に¹⁴C-標 識体30mg#を経口投与時の吸収率は約100%と推定(外国人デ ータ) ⑥食事の影響については、健康成人12例に10mgを空腹 時及び食後投与時の薬物動態パラメータを比較した結果、C_{ma} x は食後投与時で高かったが、AUCに差は認められず、本剤の 吸収に対する食事の影響は少ないと考えられた

				$AUC_{0_{-}7}$
薬物動態	$C_{m \ a \ x}$	t _{max}	t _{1/2}	2
パラメータ	$(\mu \mathrm{g/mL})$	(hr)	(hr)	(μg·
				hr/mL)

	空腹時	0.741 ± 0.101	8.0 ± 8.0	28.7 ± 5.6	26.6 ± 5.0
ſ	食後	0.851 ± 0.139	5.0 ± 1.0	23.7 ± 5.3	26.9 ± 5.1

3分布 a^{14} C-標識体1mg/kgを経口投与時,消化管の他に血 液、肝臓、腎臓、肺、甲状腺で高濃度で、脳にはほとんど分布 しなかった (ラット) ⑥健康成人に¹⁴C-標識体30mg[#]を経口投 与時, in vivoでの血清蛋白との結合率は99%以上(外国人デー タ) ©ヒト血漿蛋白とのin vitroでの結合率は99%以上で、主 結合蛋白はアルブミンと考えられた ●代謝:健康成人に¹⁴C-標識体30mg#を経口投与時,血漿中ではほとんどが未変化体 で、代謝物はほとんど認められなかった(外国人データ)。尿中 には未変化体は認められず、主な代謝物は5′-ヒドロキシメチ ル体、5′-カルボキシ体及びチアジン環の酸化的開裂によって 生じるオキサム酸化合物等 (外国人データ)。本剤の代謝には主 に肝臓のチトクロームP-450のCYP2C9が、また、部分的に CYP3A4が関与することを示唆 **⑤**排泄 ②授乳中に移行(ラ ット) ⑥健康成人に¹⁴C-標識体30mg[#]を経口投与時,未変化体 及び代謝物の総量のうち、投与後168時間までに尿中に約 43%、180時間までに糞中に約47%排泄(外国人データ) 床成績】有効性及び安全性に関する試験〔カプセル剤の成績。 *: 承認用量10mg以外(5, 15又は20mg)を含む〕 **●**国内前期 第Ⅱ相試験 ②慢性関節リウマチ患者を対象に本剤をオープン 法(漸増法)により、5、10、15及び20mgを1日1回4~21週間 投与した臨床試験の結果,本剤10mgの最終全般改善度では,有 効率(中等度改善以上)は44.4%(4/9例) ⑤副作用発現率 は、10mg群で10.7%(3/28例)で、本剤群 * の主な副作用は口 内炎7.5% (3/40例),皮膚瘙痒5.0% (2/40例), ALT上昇 5.0% (2/40例) ②国内後期第Ⅱ相試験 ②慢性関節リウマチ 患者を対象に本剤を二重盲検群間比較法により、5、10及び 15mgを1日1回6週間投与した用量・用法検討試験及び用量反応 性検討試験の結果,本剤10mgの最終全般改善度では,有効率 (中等度改善以上) は29.6% (40/135例) ⑥副作用発現頻度 は、10mg群で12.9% (22/171例) で、主な副作用は皮疹・発 疹・薬疹2.9% (5/171例), 胃部不快感1.8% (3/171例), 瘙痒 感・かゆみ1.8% (3/171例), 浮腫1.8% (3/171例)。臨床検査 値異常変動の発現頻度は16.4%(28/171例)で、主な臨床検査 値異常変動はBUNの上昇2.3% (4/171例), 尿潜血 2.3% (4/171例) 3国内第Ⅲ相比較試験 ②慢性関節リウマチ 患者を対象に本剤10mg(1日1回投与)又はピロキシカムカプセ ル20mg (1日1回投与) を6週間投与した二重盲検比較試験の結 果,本剤10mgの最終全般改善度では,有効率(中等度改善以 上) は31.3%(26/83例)で、本剤の概括安全度は対照薬との 間に有意差を認めなかった ⑤副作用発現頻度は,本剤10mg群 で12.5% (13/104例) で、主な副作用は皮疹・発疹・瘙痒疹 2.9% (3/104例), 胃部不快感1.9% (2/104例), 胃痛 1.9% (2/104例)。臨床検査値異常変動の発現頻度は 7.7% (8/104例) で、主な臨床検査値異常変動は尿蛋白 2.9% (3/104例), 尿沈渣の増加2.9% (3/104例) (重要な基本 的注意❶参照) ❹国内長期投与試験 ②慢性関節リウマチ患者 を対象に本剤10mgを中心に1日1回最長73週間投与した長期投 与試験の結果,本剤10mgの最終全般改善度では,有効率(中等 度改善以上) は40.5% (32/79例) ⑤副作用発現頻度は、本剤 群*で17.5%(20/114例)で、主な副作用は胃部痛・胃痛 4.4% (5/114例), 発疹3.5% (4/114例), 胃部不快感 1.8% (2/114例)。臨床検査値異常変動の発現頻度は

12.3% (14/114例) で、主な臨床検査値異常変動はBUNの上昇 3.5% (4/114例), ASTの上昇3.5% (4/114例), ALTの上昇 3.5%(4/114例) **⑤**国内前期第 II 相試験 ②変形性膝関節症患 者を対象に本剤をオープン法により、5、10及び15mgを1日1回 4週間投与した臨床試験の結果,本剤10mgの最終全般改善度で は,有効率(中等度改善以上)は76.2%(16/21例) ⑤副作用 発現頻度は、10mg群で13.0% (3/23例)で、本剤群*の主な副 作用は胃部不快感5.3% (3/57例), 胃痛3.5% (2/57例), 発疹 3.5% (2/57例)。主な臨床検査値異常変動は、AST・ALT上昇 3.5% (2/57例), LDH上昇1.8% (1/57例) **⑥**国内後期第Ⅱ相 試験 ②変形性膝関節症患者を対象に本剤を二重盲検群間比較 法により、5, 10及び15mgを1日1回4週間投与した臨床試験の 結果,本剤10mgの最終全般改善度では,有効率(中等度改善以 上) は75.0% (42/56例) ⑤副作用発現頻度は、10mg群で 7.6% (5/66例) で、本剤群*の主な副作用は胃部不快感 4.0% (8/202例), 胃痛1.5% (3/202例), 皮疹・発疹 1.0% (2/202例), 血圧上昇1.0% (2/202例)。主な臨床検査値 異常変動は、BUNの上昇2.0% (4/202例)、赤血球数の減少 者を対象に本剤10mg (1日1回投与) 又はジクロフェナク錠 25mg(1日3回投与)を4週間投与した二重盲検比較試験の結 果,本剤10mgの最終全般改善度では,有効率(中等度改善以 上) は69.7% (62/89例)で、本剤の概括安全度は対照薬に比 し優位に優れていた ⑥副作用発現頻度は、本剤10mg群で 18.0% (16/89例) で、主な副作用は胃部不快・異和感・上腹 部不快感5.6% (5/89例), 胃・上腹部痛4.5% (4/89例), 悪 心・嘔気・胸やけ3.4% (3/89例)。主な臨床検査値異常変動 は、白血球数の減少2.2%(2/89例) ❸国内第Ⅲ相比較試験 ②腰痛症・肩関節周囲炎・頸肩腕症候群患者を対象に本剤10mg (1日1回投与) 又はインドメタシンカプセル25mg (1日3回投 与) を4週間投与した二重盲検比較試験の結果,本剤10mgの最 終全般改善度では,有効率(中等度改善以上)は 77.7% (87/112例)で、本剤の概括安全度は対照薬との間に有 意差を認めなかった ⑥副作用発現頻度は、本剤10mg群で 28.1% (27/96例) で、主な副作用は胃部不快感8.3% (8/96

例), 胃痛5.2% (5/96例), 腹痛2.1% (2/96例), 口角炎 2.1% (2/96例)。主な臨床検査値異常変動は、好酸球の増加 1.1% (1/95例), BUNの上昇1.1% (1/95例) (重要な基本的注 意❶参照) ❷国内一般臨床試験 ②腰痛症・肩関節周囲炎・頸 肩腕症候群患者を対象に本剤をオープン法により、10及び15mg を1日1回投与した一般臨床試験の結果,本剤10mgの最終全般 改善度では、有効率(中等度改善以上)は76.9%(40/52例) ⑤副作用発現頻度は、本剤群*で14.0%(8/57例)で、消化器系 の副作用が75% (6/8例)。臨床検査値異常変動は尿糖 1.8% (1/57例), カリウムの上昇1.8% (1/57例), BUNの上昇 1.8% (1/57例) 【薬効薬理】 ●作用機序:シクロオキシゲナ ーゼ (COX) の活性を抑制して (in vitro), 炎症局所でのプロ スタグランジン生合成を阻害し (ラット, マウス), 消炎・鎮痛 作用を示すと考えられる ②抗炎症作用 (ラット):カオリン足 蹠浮腫で、インドメタシンとほぼ同等の抗炎症作用を示した。 アジュバント関節炎では、インドメタシン、ピロキシカム及び ジクロフェナクナトリウムに比べ、数倍強力な作用を示した。 カラゲニン足蹠浮腫、綿球法による肉芽形成、カラゲニン胸膜 炎でも抗炎症作用を示した 3鎮痛作用:足蹠浮腫の炎症性疼 痛 (ラット: Randall-Selitto法), アジュバント関節炎痛 (ラッ ト), 酢酸writhing (マウス) で, インドメタシン及びピロキシ カムとほぼ同程度の鎮痛作用を示した 4消化管に対する作用 (ラット): 胃粘膜障害作用及び小腸潰瘍惹起作用は、ピロキシ カム及びインドメタシンよりも弱かった。塩酸による胃粘膜障 害に対し、抗炎症用量でピロキシカムは有意に増悪作用を示し たが、本剤は増悪作用を示さなかった 5シクロオキシゲナー ゼ (COX) -1及びCOX-2に対する阻害活性 (重要な基本的注意 ●参照):酵素実験及び細胞を用いた実験で、COX-1よりも COX-2に対して強い阻害活性。in vitro試験でのCOX-1, COX-2 に対する阻害活性比〔IC₅₀ (COX-2/COX-1)〕は、酵素実験 0.0825, 細胞実験0.33

【性状】メロキシカムは淡黄色の粉末である。ギ酸に溶けやすく、メタノール又はエタノール (95) に極めて溶けにくく、水又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。融点:241℃(分解)