

lornoxicam (JAN)
ロルノキシカム
オキシカム系消炎鎮痛剤

114

【基本電子添文】 ロルカム錠2024年10月改訂

【製品】 規制等：〔劇〕《ロルカム錠2・4mg 2000.12.22承認》
ロルカム Lorcam 錠2・4mg（大正）
ロルノキシカム 錠2・4mg（寿）

【組成】 〔錠剤〕：1錠中2mg, 4mg

【効能・効果】 ①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、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎
②手術後、外傷後及び抜歯後の消炎・鎮痛

【用法・用量】 ①関節リウマチ、変形性関節症、腰痛症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎の消炎・鎮痛：1回4mg, 1日3回食後経口投与（増減）。1日18mgを限度とする ②手術後、外傷後及び抜歯後の消炎・鎮痛：1回8mgを頓用。ただし、1回量は8mgまで、1日量は24mgまで、投与期間は3日までを限度とする。空腹時の投与は避けることが望ましい

用法関連注意 ①手術後、外傷後及び抜歯後の消炎・鎮痛に用いる場合、1回8mg, 1日24mg及び3日間を超えて、投与された経験はなく、安全性は確立されていないので、用法・用量を遵守する ②他の消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい

【禁忌】 ①消化性潰瘍のある患者〔消化性潰瘍を悪化させることがある〕（重大な副作用①参照） ②重篤な血液の異常のある患者（特定背景関連注意①③, 重大な副作用③参照） ③重篤な肝機能障害のある患者（特定背景関連注意③④, 重大な副作用④参照） ④重篤な腎機能障害のある患者（特定背景関連注意②④, 重大な副作用⑤参照） ⑤重篤な心機能不全のある患者（特定背景関連注意①⑥参照） ⑥重篤な高血圧症のある患者（特定背景関連注意①⑥参照） ⑦本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者 ⑧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〔重篤な喘息発作を誘発するおそれがある〕（特定背景関連注意①⑦参照） ⑨妊娠後期の女性（特定背景関連注意④⑧参照）

【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 ②慢性疾患（関節リウマチ、変形性関節症等）に対し用いる場合には、次の事項を考慮する ③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（重大な副作用③参照） ④薬物療法以外の療法も考慮する ⑤急性疾患に対し用いる場合には、次の事項を考慮する ⑥急性炎症及び疼痛の程度を考慮し、投与する ⑦原則として長期投与を避ける ⑧原因療法があればこれを行う 【特定背景関連注意】 ①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：消化性潰瘍を再発させることがある（重大な副作用①参照） ③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 ④血液の異常又はその既往歴のある患者（重篤な血液の異常のある患者を除く）：血液の異常を悪化あるいは再発させるおそれがある（禁忌②, 重大な副作用③参照） ⑤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）：心機能障害を悪化させるおそれがある（禁忌⑤参照） ⑥高血圧症のある患者（重篤な高血圧症のある患者を除く）：血圧を更に上昇させるおそれがある。血圧上昇が報告されている（禁忌⑥参照） ⑦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（禁忌⑧参照） 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。感染症を不顕性化するおそれがある ⑪腎機能障害患者 ⑫重篤な腎機能障害のある患者：投与しない。腎機能障害を悪化させるおそれがある（禁忌④, 重大な副作用⑤参照） ⑬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）：腎機能障害を悪化あるいは再発させることがある（重大な副作用⑤参照） ⑭肝機能障害患者 ⑮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, 重大な副作用④参照） ⑯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）：肝機能障害を悪化あるいは再発させることがある（重大な副作用④参照） ⑰妊婦 ⑱妊娠後期の女性：投与しない。動物実験（ラット）で胎児の動脈管収縮、分娩遅延、妊娠期間の延長が報告されている（禁忌⑨参照） ⑲妊婦又は妊娠している可能性のある女性（妊娠後期の女性を除く）：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。投与する際には、必要最小限にとどめ、羊水量、胎児の動脈管収縮を疑う所見を妊娠週数や投与日数を考慮して適宜確認するなど慎重に投与する。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。シクロオキシゲナーゼ阻害剤（全身作用を期待する製剤）を妊娠中期の妊婦に使用し、胎児の動脈管収縮が起きたとの報告がある ⑳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）で乳汁への移行が報告されている ㉑小児等 ㉒小児等を対象とした臨床試験は実施していない ㉓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 ㉔高齢者：副作用の発現に特に注意し、少量から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。本剤は肝臓で代謝される薬剤であり、一般に高齢者では肝機能をはじめとする生理機能が低下していることが多い。なお、本剤における消化性潰瘍は、高齢者でより多く報告されており、自覚症状のないまま重篤化（突然の吐血等）することがある。また、これらの事象は消化性潰瘍の既往の有無や投与期間の長さにかかわらず発現する可能性がある（重大な副作用①参照）

【相互作用】 主としてCYP2C9で代謝される（薬物動態③参照）
併用注意

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ジゴキシン	併用時、ジゴキシンのクリアランスが14%程度低下することが報告されている（外国人データ）。ジゴキシンの強心作用を増強させるおそれがあるので注意し、必要があれば減量する	機序は不明だが、両薬剤の併用によりジゴキシンのクリアランスの低下が認められる
クマリン系抗凝血剤 ・ワルファリンカリウム等	併用後、本剤のみを休業したところ、ワルファリンの血清中濃度は16%低下し、プロトロンビン時間は19%低下したことが報告されている（外国人データ）。併用により抗凝血作用を増強させるおそれがあるので注意し、必要があれば減量する	CYP2C9に対する競合によるためと考えられる
抗血小板剤 ・アスピリン ・チクロピジン塩酸塩等	消化管からの出血が助長されるおそれがある	抗血小板剤による血小板凝集抑制作用のためと考えられる
スルホニル尿素系血糖降下剤 ・トルブタミド等	血糖降下作用を増強させるおそれがあるので注意し、必要があれば減量する。また、グリベンクラミドと併用した場合、グリベンクラミドの体内動態に影響を及ぼすことはなかったが、血漿インスリン濃度（AUC）は増加し、血漿グルコース濃度（AUC）は低下したことが報告されている（外国人データ）	スルホニル尿素系血糖降下剤は、主にCYP2C9により代謝されることから、競合によるためと考えられる
リチウム製剤 ・炭酸リチウム	併用時、リチウムのC _{m a x} が約20%増加したことが報告されている（外国人データ）。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	本剤の腎におけるプロスタグランジン合成阻害により、二次的に再吸収が促進され、リチウムの腎排泄が減少するためと考えられている
メトトレキサート製剤 ・メトトレキサート	併用時、メトトレキサートの血清中濃度（AUC）は21.9%上昇したことが報告されている（外国人データ）。メトトレキサートの血中濃度を上昇させるおそれがある	メトトレキサートの腎尿細管分泌を競合的に阻害することにより腎排泄が遅延するためと考えられる
ループ利尿剤 ・フロセミド等	フロセミドの利尿作用が減弱したとの報告がある	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、水、ナトリウムの排泄が減少するためと考えられている
チアジド系利尿剤 ・ヒドロクロロチアジド等	他の非ステロイド性消炎鎮痛剤との併用により、利尿作用が減弱したとの報告がある	
アンギオテンシン変換酵素阻害剤 ・エナラプリルマレイン酸塩等	他の非ステロイド性消炎鎮痛剤との併用により、アンギオテンシン変換酵素阻害剤の効果が減弱したとの報告がある	本剤のプロスタグランジンの合成阻害作用により、アンギオテンシン変換酵素阻害剤のプロスタグランジン合成による血圧低下作用を減弱させ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

①**重大な副作用** ①**消化性潰瘍**（0.4%）、**小腸・大腸潰瘍**（頻度不明）：出血、穿孔を伴うことがある。腹痛、嘔吐、吐血・下血等を伴う胃腸出血が認められた場合には、中止し、適切な処置を行う（禁忌①、特定背景関連注意①a⑦参照） ②**ショック、アナフィラキシー**（いずれも頻度不明）：蕁麻疹、潮紅、浮腫、呼吸困難、血圧低下等が認められた場合には、中止し、適切な処置を行う ③**再生不良性貧血、無顆粒球症、血小板減少**（いずれも頻度不明）：（禁忌②、重要な基本的注意②、特定背景関連注意①c参照） ④**皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）、中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis : TEN）**（いずれも頻度不明） ⑤**急性腎障害、ネフローゼ症候群**（いずれも頻度不明）：浮腫、乏尿、血尿、尿蛋白、BUN・血中クレアチニン上昇、低アルブミン血症等が認められた場合には、中止し、適切な処置を行う（禁忌④、特定背景関連注意②a⑥参照） ⑥**劇症肝炎、肝機能障害、黄疸**（いずれも頻度不明）：劇症肝炎等の重篤な肝炎、AST、ALT、 γ -GTP、Al-P上昇等を伴う肝機能障害、黄疸が現れることがある（禁忌③、特定背景関連注意③a⑥参照） ⑦**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栓性事象が現れることがある

②その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	発疹、痒痒感	蕁麻疹、口唇腫脹、アレルギー性紫斑病	
精神神経系	頭痛、めまい	眠気、しびれ（感）、傾眠	
感覚器		視力異常、耳鳴り	
消化器	腹痛、腹部不快感、嘔気、嘔吐、消化不良、下痢、食欲不振、口内炎、腹部膨満、便秘	口渇、便潜血陽性、血便、おくび、苦味、口角炎、食道炎、胃炎	しゃっくり、舌炎
血液	ヘモグロビン減少	赤血球減少、ヘマトクリット値減少、血小板減少、好酸球増多、好中球増多、白血球減少	
肝臓	ALT上昇、AST上昇、Al-P上昇	ウロビリノーゲン陽性	
腎臓	尿中NAG上昇、BUN上昇、尿蛋白陽性	高尿素窒素血症、蛋白尿増加、クレアチニン上昇	
その他	浮腫、倦怠感、季肋部疼痛、悪寒	浮遊感、血尿、高尿酸血症、咽頭炎、関節痛、眼球充血、胸痛、高血圧、体重減少、動悸、尿閉、熱感、鼻炎、頻尿、夜間頻尿	発熱

【その他の注意】 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 【取扱い上の注意】 吸湿性を有するので、PTPシートの状態で保存する 【保存等】 室温保存。有効期間：3年

【薬物動態】①血中濃度：健康成人男性（6例）に空腹時単回経口投与（4mg）時、未変化体の平均血漿中濃度は 0.63 ± 0.09 時間で最高値 414 ± 30 ng/mLに達した後、半減期 2.30 ± 0.14 時間で消失。AUC_{0-∞}は $1,248 \pm 132$ ng・hr/mL。未変化体のC_{max}及びAUCは用量に比例して上昇。反復投与によるC_{max}、T_{1/2}及びAUCの有意な変動は認められなかった ②分布 ③蛋白結合率（*in vitro*）：ヒト血清中における蛋白結合率は $0.1 \sim 10 \mu\text{g/mL}$ の範囲で99.30～99.35%と高率で、本剤の結合部位はアルブミンのワルファリンサイト ④組織中濃度：ラットに¹⁴C-標識体を単回経口投与1時間後、肝臓、腎臓、血漿の順に高く分布、その他の組織ではいずれも血漿と同程度かそれ以下で、脳、眼球及び精巣への分布は低かった。その後、大部分の組織の濃度は時間とともに減少し、血漿とほぼ平行に消失。反復経口投与後、組織中濃度は多くの組織で14回投与までにほぼ一定となり、21回投与後168時間では皮膚をはじめとして肝臓、腎臓、血液、血漿、心臓、肺、脾臓、筋肉、褐色脂肪、精巣上体及び大腸で検出 ⑤代謝（*in vitro*）：本剤の代謝には主としてCYP2C9が関与することが示された（相互作用参照） ⑥排泄：健康成人男性に経口投与後24時間までの尿中に、未変化体の5'位水酸化体が4.9%、そのグルクロン酸抱合体が5.8%、5-chloro-3-（N-methyl sulfamoyl）-2-thiophenecarboxylic acidが0.7%排泄。尿中に未変化体は検出されなかった 【臨床成績】有効性及び安全性に関する試験 ①関節リウマチ ②国内後期第Ⅱ相試験：関節リウマチ患者（220例）を対象としたプラセボ対照二重盲検比較試験において、本剤4、6mg又はプラセボをそれぞれ1日3回4週間食後に経口投与 ③改善率（最終全般改善度 改善以上）はプラセボ群10.0%（5/50）、本剤4mg群34.0%（17/50）、本剤6mg群31.5%（17/54） ④副作用発現割合は4mg群で26.6%（17/64例）、6mg群で12.5%（9/72例）。主な副作用は4mg群で腹痛、悪心・嘔吐各7.8%（5/64例）、腹部不快感、痒感各4.7%（3/64例）、発疹3.1%（2/64例）であり、6mg群で悪心・嘔吐5.6%（4/72例）、腹痛4.2%（3/72例） ⑤国内第Ⅲ相試験：関節リウマチ患者（189例）を対象としたインドメタシン対照二重盲検比較試験において、本剤4mg又はインドメタシン25mgをそれぞれ1日3回6週間食後に経口投与 ⑥本剤群の改善率（最終全般改善度 改善以上）は29.2%（26/89例） ⑦本剤群の副作用発現割合は20.2%（18/89例）で、主な副作用は腹痛6.7%（6/89例）、AST上昇3.4%（3/89例） ⑧変形性関節症 ⑨国内後期第Ⅱ相試験：変形性関節症患者（250例）を対象とした用量設定二重盲検比較試験において、2、4、6mgをそれぞれ1日3回4週間食後に経口投与 ⑩4mg群、6mg群の改善率（最終全般改善度 改善以上）は、それぞれ84.1%（58/69例）、81.5%（53/65例） ⑪副作用発現割合は4mg群で13.6%（11/81例）、6mg群で30.1%（25/83例）。主な副作用は4mg群で腹部不快感4.9%（4/81例）、腹痛2.5%（2/81例）であり、6mg群で腹痛13.3%（11/83例）、腹部不快感8.4%（7/83例）、悪心6.0%（5/83例） ⑫国内第Ⅲ相試験：変形性関節症患者（225例）を対象としたジクロフェナクナトリウム対照二重盲検比較試験において、本剤4mg又はジクロフェナクナトリウム25mgをそれぞれ1日3回4週間食後に経口投与 ⑬本剤群の改善率（最終全般改善度 改善以上）は72.3%（68/94例） ⑭本剤群の副作用発現割合は25.2%（27/107例）で、主な副作用は腹痛14.0%（15/107例）、悪心・嘔吐5.6%（6/107例） ⑮腰痛症、頸肩腕症候群、肩関節周囲炎 ⑯国内第Ⅱ相試験：腰痛症患者

（58例）、頸肩腕症候群患者（43例）、肩関節周囲炎患者（42例）を対象とした用量設定オープン試験において、2、4、6mgをそれぞれ1日3回2週間食後に経口投与 ⑰4mg群、6mg群の改善率（最終全般改善度 改善以上）は、それぞれ63.9%（23/36例）、60.5%（23/38例） ⑱副作用発現割合は4mg群で7.1%（3/42例）、6mg群で17.4%（8/46例）。主な副作用は4mg群で食欲不振、発疹・皮疹、頭重感、全身倦怠感各2.4%（1/42例）であり、6mg群で腹痛6.5%（3/46例）、腹部不快感、頭痛各4.3%（2/46例） ⑲国内第Ⅲ相試験：腰痛症患者（122例）、頸肩腕症候群患者（110例）、肩関節周囲炎患者（99例）を対象としたジクロフェナクナトリウム対照二重盲検比較試験において、本剤4mg又はジクロフェナクナトリウム25mgをそれぞれ1日3回2週間食後に経口投与 ⑳本剤群の改善率（最終全般改善度 改善以上）は60.8%（76/125例） ㉑本剤群の副作用発現割合は21.6%（32/148例）で、主な副作用は腹痛6.8%（10/148例）、悪心・嘔吐4.7%（7/148例）、腹部不快感3.4%（5/148例） ㉒手術後疼痛、外傷後疼痛 ㉓国内第Ⅱ相試験：手術後疼痛患者（48例）、外傷後疼痛患者（47例）を対象とした用量設定オープン試験において、4、6、8mgをそれぞれ1日3回3日間食後に経口投与 ㉔8mg群の改善率（最終全般改善度 改善以上）は手術後疼痛100%（14/14）、外傷後疼痛100%（10/10） ㉕副作用発現割合は手術後疼痛患者8mg群で0%（0/15例）、外傷後疼痛患者8mg群で0%（0/12例） ㉖国内第Ⅲ相試験：手術後疼痛患者（158例）、外傷後疼痛患者（127例）を対象としたロキソプロフェンナトリウム対照二重盲検比較試験において、本剤8mg又はロキソプロフェンナトリウム60mgをそれぞれ1日3回3日間食後に経口投与 ㉗本剤群の改善率（最終全般改善度 改善以上）は手術後疼痛87.9%（51/58）、外傷後疼痛76.4%（42/55） ㉘本剤群の副作用発現割合は手術後疼痛患者8mg群で11.3%（8/71例）、主な副作用は腹部不快感4.2%（3/71例）、ALT上昇2.8%（2/71例）であり、外傷後疼痛患者8mg群で13.1%（8/61例）、主な副作用は腹痛4.9%（3/61例） ㉙抜歯後疼痛 ㉚国内後期第Ⅱ相試験：抜歯後疼痛患者（316例）を対象とした用量設定二重盲検比較試験において、4、6、8mgをそれぞれ1回経口投与 ㉛8mg群の改善率（疼痛全般改善度 改善以上）は85.7%（72/84例） ㉜副作用発現割合は8mg群で0%（0/85例） ㉝国内第Ⅲ相試験：抜歯後疼痛患者（270例）を対象としたメフェナム酸対照二重盲検比較試験において、本剤8mg又はメフェナム酸500mgをそれぞれ1回経口投与 ㉞本剤群の改善率（疼痛全般改善度 改善以上）は78.4%（87/111例） ㉟本剤群の副作用発現割合は2.6%（3/114例）で、発現した副作用は悪寒1.8%（2/114例）、頭痛、胸部痛各0.9%（1/114例） 【薬効薬理】①作用機序：*in vitro*、*in vivo*（ラット）の試験で、アラキドン酸代謝におけるシクロオキシゲナーゼ活性阻害によりプロスタグランジン合成を抑制することが明らかにされており、主としてこの作用により消炎・鎮痛効果を示すと考えられる ②抗炎症作用：急性炎症であるラットカラゲニン足浮腫法及び慢性炎症であるラットアジュバント関節炎法で、テノキシカム、ロキソプロフェンナトリウム、ジクロフェナクナトリウム、インドメタシン、メフェナム酸より強い抗炎症作用 ③鎮痛作用：ラットイースト足浮腫法（ランダル-セリット法）、ラットアジュバント関節炎法（屈曲伸展法）及びマウス酢酸ライジング法で、テノキシカム、ロキソプロフェンナトリウム、ジクロフェナクナトリウム、インドメタシン、メフェナム酸より強い鎮痛作用。ラット

イースト足浮腫法（ランダル-セリット法）で、本剤は非炎症足の疼痛閾値を上昇させなかったことから、本剤の鎮痛作用は末梢性と考えられた

【性状】 ロルノキシカムは黄色の結晶性の粉末で、ギ酸に溶けやすく、ジメチルスルホキシドに溶けにくく、アセトニトリル又は酢酸（100）に極めて溶けにくく、水、メタノール、エタノール（95）又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。融点：約207℃（分解）