

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

がん疼痛治療用注射剤
劇薬、麻薬、処方箋医薬品
オキシコドン塩酸塩水和物注射液

オキシコドン注射液10mg「第一三共」 オキシコドン注射液50mg「第一三共」

OXYCODONE INJECTION “DAIICHI SANKYO”

剤形	注射剤
製剤の規制区分	劇薬、麻薬、処方箋医薬品（注意—医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	オキシコドン注射液 10mg 「第一三共」： 1 アンプル中にオキシコドン塩酸塩水和物（日局）11.54mg/1mL （オキシコドン塩酸塩（無水物）として 10mg/1mL）を含有 オキシコドン注射液 50mg 「第一三共」： 1 アンプル中にオキシコドン塩酸塩水和物（日局）57.68mg/5mL （オキシコドン塩酸塩（無水物）として 50mg/5mL）を含有
一般名	和名：オキシコドン塩酸塩水和物（JAN） 洋名：Oxycodone Hydrochloride Hydrate（JAN）
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：2019年2月15日 薬価基準収載年月日：2019年6月14日 販売開始年月日：2019年6月14日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：第一三共プロファーマ株式会社 販売元：第一三共株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	第一三共株式会社 製品情報センター TEL：0120-065-132（がん・医療用麻薬専用） FAX：03-6225-1922 医療関係者向けホームページ https://www.medicalcommunity.jp

本 IF は 2024 年 5 月改訂（第 2 版）の電子添文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。
専用アプリ「添文ナビ」で GS1 バーコードを読み取ることで、最新の電子添文等を閲覧できます。



(01)14987081522009

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「XII.参考資料」、「XIII.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・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、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を利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

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

(4) クリアランス	14	(1) 臨床使用に基づく情報	22
(5) 分布容積	14	(2) 非臨床試験に基づく情報	22
(6) その他	14		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	14	IX. 非臨床試験に関する項目	23
(1) 解析方法	14	1. 薬理試験	23
(2) パラメータ変動要因	14	(1) 薬効薬理試験	23
4. 吸収	14	(2) 安全性薬理試験	23
5. 分布	14	(3) その他の薬理試験	23
(1) 血液－脳関門通過性	14	2. 毒性試験	23
(2) 血液－胎盤関門通過性	14	(1) 単回投与毒性試験	23
(3) 乳汁への移行性	14	(2) 反復投与毒性試験	23
(4) 髄液への移行性	14	(3) 遺伝毒性試験	23
(5) その他の組織への移行性	14	(4) がん原性試験	23
(6) 血漿蛋白結合率	14	(5) 生殖発生毒性試験	23
6. 代謝	15	(6) 局所刺激性試験	23
(1) 代謝部位及び代謝経路	15	(7) その他の特殊毒性	23
(2) 代謝に関与する酵素（CYP等） の分子種、寄与率	15	X. 管理的事項に関する項目	24
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	15	1. 規制区分	24
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	15	2. 有効期間	24
7. 排泄	15	3. 包装状態での貯法	24
8. トランスポーターに関する情報	15	4. 取扱い上の注意	24
9. 透析等による除去率	15	5. 患者向け資材	24
10. 特定の背景を有する患者	16	6. 同一成分・同効薬	24
11. その他	16	7. 国際誕生年月日	24
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	17	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	24
1. 警告内容とその理由	17	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	24
2. 禁忌内容とその理由	17	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	24
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	17	11. 再審査期間	24
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	17	12. 投薬期間制限に関する情報	25
5. 重要な基本的注意とその理由	17	13. 各種コード	25
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	18	14. 保険給付上の注意	25
(1) 合併症・既往歴等のある患者	18	XI. 文 献	26
(2) 腎機能障害患者	19	1. 引用文献	26
(3) 肝機能障害患者	19	2. その他の参考文献	26
(4) 生殖能を有する者	19	XII. 参考資料	27
(5) 妊婦	19	1. 主な外国での発売状況	27
(6) 授乳婦	19	2. 海外における臨床支援情報	30
(7) 小児等	19	XIII. 備 考	32
(8) 高齢者	19	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	32
7. 相互作用	20	(1) 粉碎	32
(1) 併用禁忌とその理由	20	(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの 通過性	32
(2) 併用注意とその理由	20	2. その他の関連資料	32
8. 副作用	20		
(1) 重大な副作用と初期症状	21		
(2) その他の副作用	21		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	21		
10. 過量投与	22		
11. 適用上の注意	22		
12. その他の注意	22		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オキシコドンは、アヘンから抽出されるテバインを原料として合成されるオピオイド受容体作動薬の一つであり、 μ オピオイド受容体作動性の強オピオイド鎮痛薬に分類される。1916年に M. Freund と E. Speyer によって合成されて以来、鎮痛薬として欧米で広く使われている。国内では、オキシコドン塩酸塩水和物を有効成分とした製剤が「中等度から高度の疼痛を伴う各種癌における鎮痛」の効能又は効果で使用されている。

がん患者のうち、治療や病態の悪化のために経口投与が困難となったり、急速に痛みが増強し経口剤や貼付剤では鎮痛がコントロールできない場合に、非経口投与で迅速に効果が得られる注射剤は有効な治療選択肢となる。経口剤や貼付剤から注射剤への切り替えでは、先行するオピオイド鎮痛薬の効果や安全性に問題なければ、同一成分の注射剤への切り替えが好ましいとされている^{1,2,3}。

注射剤であるオキシコドン注射液 10mg「第一三共」・注射液 50mg「第一三共」は、後発医薬品として第一三共プロファーマ株式会社と第一三共株式会社の2社で共同開発した。平成26年11月21日薬食発1121第2号に基づき安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、第一三共プロファーマ株式会社が製造販売承認申請を行い2019年2月に承認を取得した。

2. 製品の治療学的特性

(1) 中等度から高度の疼痛を伴う各種癌における鎮痛に用いる μ オピオイド受容体作動薬である。

(「VI.薬効薬理に関する項目」参照)

(2) 本剤をレスキュー薬として使用する場合は、1日量の1/24量(1時間量相当分)を目安に早送りによる投与又は追加の静脈内投与を行う。

(「V.治療に関する項目」参照)

(3) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、依存性、呼吸抑制、錯乱、譫妄、無気肺、気管支痙攣、喉頭浮腫、麻痺性イレウス、中毒性巨大結腸、肝機能障害があらわれることがある。

(「VIII.安全性(使用上の注意等)に関する項目」参照)

3. 製品の製剤学的特性

本剤は臨時追加投与(レスキュー薬)としても使用するオキシコドン塩酸塩水和物の注射剤である。

(「IV.製剤に関する項目」、「V.治療に関する項目」参照)

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料、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先等
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	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	有	在宅療養指導管理料の点数の取扱いについて(平成24年4月17日付 保医発0417第2号) 使用薬剤の薬価(薬価基準)の一部改正等について(令和元年6月13日付 保医発0613第1号) (「X.14.保険給付上の注意」参照)

I. 概要に関する項目

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

オキシコドン注射液 10mg 「第一三共」

オキシコドン注射液 50mg 「第一三共」

(2)洋名

OXYCODONE INJECTION 10mg “DAIICHI SANKYO”

OXYCODONE INJECTION 50mg “DAIICHI SANKYO”

(3)名称の由来

有効成分に係る一般名+剤形+含量+会社名（屋号）に基づく

2. 一般名

(1)和名（命名法）

オキシコドン塩酸塩水和物（JAN）

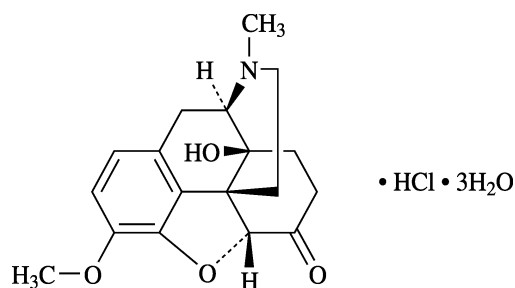
(2)洋名（命名法）

Oxycodone Hydrochloride Hydrate（JAN）

(3)ステム

不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₈H₂₁NO₄ • HCl • 3H₂O

分子量：405.87

5. 化学名（命名法）又は本質

(5*R*)-4,5-Epoxy-14-hydroxy-3-methoxy-17-methylmorphinan-6-one monohydrochloride trihydrate

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

DS-5058b

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。光によって変化する。

(2) 溶解性

水、メタノール又は酢酸（100）に溶けやすく、エタノール（95）にやや溶けにくく、無水酢酸に溶けにくい。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

約 251℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

1.0g を水 10mL に溶かした液の pH は 3.8～5.8 である。

旋光度 $[\alpha]_D^{20} = -140 \sim -149^\circ$

（脱水物に換算したもの 0.5g、水、25mL、100mm）

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	25℃/60%RH	60 ヶ月	ポリエチレン袋二重 /金属缶	変化なし
加速試験	40℃/75%RH	6 ヶ月		変化なし

試験項目：性状、類縁物質、含量等

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法：日局「オキシコドン塩酸塩水和物」による

定量法：日局「オキシコドン塩酸塩水和物」による

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

注射剤

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	性状
オキシコドン注射液 10mg「第一三共」	無色澄明の液
オキシコドン注射液 50mg「第一三共」	

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

販売名	pH	浸透圧比 (生理食塩液対比)
オキシコドン注射液 10mg「第一三共」	4.5～5.5	約1
オキシコドン注射液 50mg「第一三共」		

(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	有効成分	添加剤
オキシコドン注射液 10mg「第一三共」	1 アンプル中 オキシコドン塩酸塩水和物（日局） 11.54mg/1mL (オキシコドン塩酸塩（無水物）として 10mg/1mL)	クエン酸ナトリウム水和物、 クエン酸水和物、等張化剤、 pH 調節剤
オキシコドン注射液 50mg「第一三共」	1 アンプル中 オキシコドン塩酸塩水和物（日局） 57.68mg/5mL (オキシコドン塩酸塩（無水物）として 50mg/5mL)	

(2) 電解質等の濃度

オキシコドン注射液 10mg「第一三共」：1 アンプル（1 mL 中）Na⁺ 0.13 mEq、Cl⁻ 0.15 mEqオキシコドン注射液 50mg「第一三共」：1 アンプル（5 mL 中）Na⁺ 0.64 mEq、Cl⁻ 0.74 mEq

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

IV. 製剤に関する項目

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当しない

6. 製剤の各種条件下における安定性

試験	保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	25°C/60%RH	無色ガラス製アンプル/紙箱	36 ヶ月	変化なし
加速試験	40°C/75%RH		6 ヶ月	変化なし

試験項目：性状、浸透圧比、pH、類縁物質、不溶性異物、不溶性微粒子、含量

オキシコドン注 10mg の希釈後の安定性試験

希釈液	保存条件	保存形態	保存期間	結果
生理食塩液 ^{a)}	室内散光 (1000lx、 白色蛍光灯)、 25°C/60%RH	ソフトバッグ	48 時間	変化なし
ブドウ糖注射液 ^{b)}	室内散光 (1000lx、 白色蛍光灯)、 25°C/60%RH	ソフトバッグ	48 時間	変化なし
ブドウ糖-電解質液 (維持液) ^{c)}	室内散光 (1000lx、 白色蛍光灯)、 25°C/60%RH	ソフトバッグ	48 時間	変化なし

試験項目：性状、pH、含量等

希釈倍率：約 500 倍

a) 大塚生食注 500mL (株式会社大塚製薬工場) b) 大塚糖液 5% 500mL (株式会社大塚製薬工場)

c) ソルデム 3 輸液 500mL (テルモ株式会社)

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

オキシコドン注 10mg の希釈後の安定性は上記「IV.6.製剤の各種条件下における安定性」参照

8. 他剤との配合変化 (物理化学的変化)

「XIII.2.その他の関連資料 オキシコドン注射液 10mg・50mg 「第一三共」 配合変化試験」参照

9. 溶出性

該当しない

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

〈オキシコドン注射液 10mg 「第一三共」〉

1mL 10 アンプル

〈オキシコドン注射液 50mg 「第一三共」〉

5mL 5 アンプル

(3)予備容量

該当しない

(4)容器の材質

アンプル：ガラス（無色）

11.別途提供される資材類

該当しない

12.その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

中等度から高度の疼痛を伴う各種癌における鎮痛

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

通常、成人にはオキシコドン塩酸塩（無水物）として1日7.5～250mgを持続静脈内又は持続皮下投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

(2)用法及び用量の設定経緯・根拠

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法・用量に関連する注意

〈持続投与時〉

7.1 初回投与

本剤の投与開始前のオピオイド鎮痛薬による治療の有無を考慮して初回投与量を設定することとし、既に治療されている場合にはその投与量及び鎮痛効果の持続を考慮して副作用の発現に注意しながら適宜投与量を調節すること。

7.1.1 オピオイド鎮痛薬を使用していない患者には、疼痛の程度に応じてオキシコドン塩酸塩として7.5～12.5mgを1日投与量とすることが望ましい。

7.1.2 モルヒネ注射剤の持続静脈内投与を本剤に変更する場合には、モルヒネ注射剤1日投与量の1.25倍量を1日投与量の目安とすることが望ましい。

7.1.3 経口オキシコドン製剤から本剤へ変更する場合には、オキシコドン製剤1日投与量の0.75倍量を1日投与量の目安とすることが望ましい。

7.1.4 経皮フェンタニル貼付剤から本剤へ変更する場合には、経皮フェンタニル貼付剤剥離後にフェンタニルの血中濃度が50%に減少するまで17時間以上かかることから、剥離直後の本剤の使用は避け、本剤の使用を開始するまでに、フェンタニルの血中濃度が適切な濃度に低下するまでの時間をあけるとともに、本剤の低用量から投与することを考慮すること。

7.2 増量

本剤投与開始後は患者の状態を観察し、適切な鎮痛効果が得られ副作用が最小となるよう用量調整を行うこと。鎮痛効果が不十分な場合は、レスキュー薬の投与量を考慮して前日の1日投与量の25～50%増を目安として増量を行うこと。 [8.4 参照]

7.3 減量

連用中における急激な減量は、退薬症候があらわれることがあるので行わないこと。副作用等により減量する場合は、患者の状態を観察しながら慎重に行うこと。 [7.4、11.1.2 参照]

7.4 投与の中止

本剤の投与を必要としなくなった場合には、退薬症候の発現を防ぐために徐々に減量すること。 [7.3、11.1.2 参照]

〈臨時追加投与（レスキュー薬の投与）として本剤を使用する場合〉

7.5 疼痛が増強した場合や鎮痛効果が得られている患者で突発性の疼痛が発現した場合は、本剤の1日投与量の1/24量（1時間量相当分）を目安に早送りによる投与又は追加の静脈内投与を行い、鎮痛を図ること。ただし、レスキュー薬としての投与を連続して行う場合は、呼吸抑制等の副作用の発現に注意すること。

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

(3)用量反応探索試験

該当資料なし

(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

(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**

該当資料なし

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

該当資料なし

(7)その他

オキシコドン塩酸塩水和物の承認時における一般臨床試験での中等度から高度のがん疼痛を有する患者に対する臨床試験成績の概要を以下に示す。

国内第Ⅲ相試験（オープンラベル試験）⁴⁾

①疼痛コントロール達成率

オピオイド系鎮痛剤による先行治療のない群及び先行治療のある群の、オキシコドン塩酸塩水和物投与による疼痛コントロール達成率は次の表のとおりであった。

疼痛コントロール達成率

投与開始前の疼痛治療	静脈内投与		皮下投与	
	達成例数/ 評価対象例数	達成率 (%)	達成例数/ 評価対象例数	達成率 (%)
オピオイド系鎮痛剤非使用例	10/12	83.3	1/2	—
オピオイド系鎮痛剤からの切替え例	47/58	81.0	13/17	76.5
合計	57/70	81.4	14/19	73.7

達成率 (%) = 疼痛コントロール達成例数/評価対象例数 × 100

②疼痛強度改善率

オキシコドン塩酸塩水和物投与開始前及び投与終了時の疼痛強度が「なし」又は「軽度」であった例数の評価対象例数に対する割合は、次の表のとおりであった。

疼痛強度改善率

観測時期	静脈内投与		皮下投与	
	改善例数/ 評価対象例数	改善率 (%)	改善例数/ 評価対象例数	改善率 (%)
投与開始前	31/70 <34/75>	44.3 <45.3>	10/19 <14/23>	52.6 <60.9>
投与終了時	61/68 <57/65>	89.7 <87.7>	15/19 <17/20>	78.9 <85.0>

改善率 (%) = (疼痛強度が「なし」 + 「軽度」の例数) / 評価対象例数 × 100

< > : 継続投与試験を含めた成績

③臨時追加投与（レスキュードーズ）前後の疼痛強度改善率

オキシコドン塩酸塩水和物のレスキュードーズ前後の疼痛強度が「なし」又は「軽度」であった件数の評価対象件数に対する割合は、次の表のとおりであった。

レスキュードーズ前後の疼痛強度改善率

観測時期	静脈内投与		皮下投与	
	改善件数/ 評価対象件数	改善率 (%)	改善件数/ 評価対象件数	改善率 (%)
レスキュードーズ前	69/383	18.0	21/105	20.0
レスキュードーズ後	288/382	75.4	73/105	69.5

改善率 (%) = (疼痛強度が「なし」 + 「軽度」の件数) / 評価対象件数 × 100

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

モルヒネ塩酸塩水和物、モルヒネ硫酸塩水和物、フェンタニルクエン酸塩

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1)作用部位・作用機序

モルヒネと同様に μ オピオイド受容体を介して鎮痛作用を示すものと考えられる。

(2)薬効を裏付ける試験成績

鎮痛作用

鎮痛作用についてモルヒネ硫酸塩を対照薬として検討した。マウスの Hot plate 法、Tail pressure 法、酢酸ライジング法及びラットの Tail flick 法（いずれも経口投与）を用いて検討した結果、オキシコドン塩酸塩はモルヒネ硫酸塩より ED₅₀ 値で 3～6 倍、効力比で 3～5 倍強い鎮痛作用を示した⁵⁾。

試験法	動物種	ED ₅₀ (95%信頼限界) mg/kg	
		オキシコドン塩酸塩	モルヒネ硫酸塩
Hot plate 法	マウス	3.2 (0.9-5.3)	15.6 (8.6-21.9)
Tail pressure 法	マウス	3.5 (2.7-4.5)	8.9 (4.8-12.7)
酢酸ライジング法	マウス	2.3 (1.6-4.0)	7.0 (4.6-15.6)
Tail flick 法	ラット	3.8 (1.8-5.5)	21.6 (19.2-24.2)

(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

1) 急速単回静脈内投与時

日本人がん疼痛患者7例にオキシコドン塩酸塩注射液2mgを急速静脈内投与したときのオキシコドン及びノルオキシコドンの薬物動態パラメータを次の表に示す。オキシコドンに対するオキシモルフォンのC_{max}及びAUC_{0-last}の平均値の比はそれぞれ1%未満であった⁶⁾。

急速静脈内投与時のオキシコドン及びノルオキシコドンの薬物動態パラメータ

投与量	例数		C _{max} (ng/mL)	AUC _{0-6hr} (ng・hr/mL)	AUC _{0-inf} (ng・hr/mL)	t _{1/2} (hr)
2mg	7 ^{a)}	オキシコドン	18.5 ±4.11	37.11 ±10.65	54.38 ±25.19	3.26 ±0.774
		ノルオキシコドン	1.69 ±0.528	8.928 ±2.772	33.02 ±18.47	12.1 ±5.81

a) ノルオキシコドンのAUC_{0-inf}、t_{1/2}のみ4例

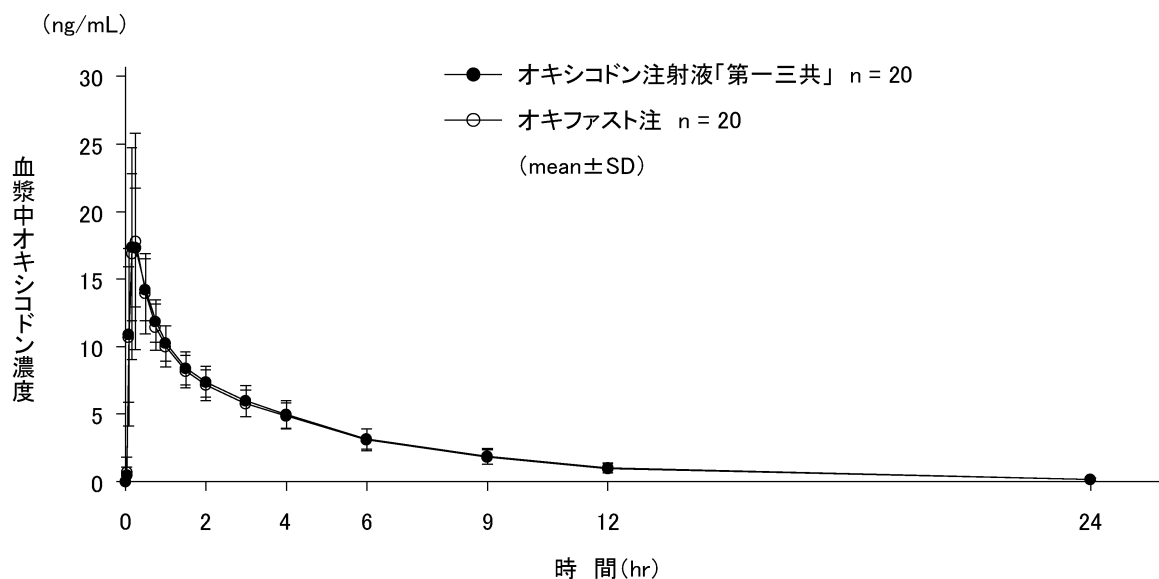
(測定法：LC/MS/MS) (mean±SD)

注) 本剤の承認用法は、持続静脈内投与又は持続皮下投与である。

2) 生物学的同等性試験

オキシコドン注射液「第一三共」とオキファスト注（それぞれオキシコドン塩酸塩として2.5mg）を、クロスオーバー法により健康成人男性20例に単回急速皮下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、C_{max}）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された⁷⁾。

単回急速皮下投与時の血漿中オキシコドン濃度推移



オキシコドンの薬物動態パラメータ

	n	AUC _{0-24hr} (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} ^{a)} (hr)	t _{1/2} (hr)
オキシコドン注射液「第一三共」 2.5mg	20	60.7±12.2	19.6±4.05	0.17 (0.08~0.50)	4.12±0.578
オキファスト注 2.5mg	20	59.3±11.9	19.7±7.11	0.25 (0.17~0.75)	4.06±0.507

(mean±SD)

a) 中央値（最小値～最大値）

血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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。

AUC_{0-24hr}：投与後 24 時間までの血漿中濃度-時間曲線下面積、C_{max}：最高血漿中濃度、

T_{max}：最高血漿中濃度到達時間、t_{1/2}：終末相の消失半減期

注) 本剤の承認用法及び用量は、1 日 7.5~250mg を持続静脈内又は持続皮下投与である。

(3)中毒域

該当資料なし

(4)食事・併用薬の影響

「Ⅷ.7.(2)併用注意とその理由」参照

国内におけるオキシコドン注射剤の臨床試験において、ボリコナゾール（100~200mg/日、経口投与）とオキシコドン塩酸塩（24~48mg/日、持続皮下投与）を 4 日間併用した症例（1 例）の定常状態時におけるオキシコドンの血漿中濃度は、測定した全症例の平均の 3.57 倍であった⁴⁾。

<外国人データ>

リファンピシン（600mg/日）の経口投与中にオキシコドン塩酸塩を単回静脈内投与（0.1mg/kg）した場合で AUC が 1/2.2 に、単回経口投与（15mg）した場合で AUC が 1/7.1 に減少したとの報告がある⁸⁾。

<参考：外国人データ（経口投与）>

- 1) ボリコナゾール〔400mg/日（2 日目のみ 600mg/日）〕の経口投与中にオキシコドン塩酸塩（10mg）を単回経口投与した場合、オキシコドンの C_{max} が 1.72 倍、AUC が 3.61 倍上昇したとの報告がある⁹⁾。
- 2) リトナビル（600mg/日）の経口投与中にオキシコドン塩酸塩（10mg）を単回経口投与した場合、オキシコドンの C_{max} が 1.74 倍、AUC が 2.95 倍上昇したとの報告がある¹⁰⁾。
- 3) クラリスロマイシン（1,000mg/日：承認外用量）の経口投与中にオキシコドン塩酸塩（10mg）を単回経口投与した場合、若年者群（19~25 歳）のオキシコドンの C_{max} が 1.45 倍、AUC が 2.02 倍上昇し、また、高齢者群（70~77 歳）のオキシコドンの C_{max} が 1.68 倍、AUC が 2.31 倍上昇したとの報告がある¹¹⁾。

注) 本剤の承認用法及び用量は、1 日 7.5~250mg を持続静脈内又は持続皮下投与である。

2. 薬物速度論的パラメータ

(1)解析方法

該当資料なし

(2)吸収速度定数

該当資料なし

(3)消失速度定数

0.172±0.0265 hr⁻¹

(4)クリアランス

該当資料なし

(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

該当資料なし

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

該当資料なし

(3)乳汁への移行性

＜外国人データ（経口投与）＞

授乳婦が帝王切開後にオキシコドン塩酸塩を服用した際、血漿及び母乳中オキシコドン濃度を測定したところ、両者の間に正の相関を認め、血漿中濃度に対する母乳中濃度の比は中央値で3.2であった¹²⁾。

また、オキシコドン塩酸塩とアセトアミノフェンの合剤を授乳婦6例に経口投与したとき、母乳への移行が認められ、そのときの投与0.25～12時間後におけるオキシコドン塩酸塩濃度の乳汁/血漿中濃度の平均比率は3.4であった¹³⁾。

(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

該当資料なし

(6)血漿蛋白結合率

限外ろ過法を用いて測定したオキシコドン濃度20～100ng/mLの*in vitro*でのヒト血清蛋白結合率（pH7.4、37℃）は45.0～45.8%であり、主としてアルブミンと結合する¹⁴⁾。

6. 代謝

(1)代謝部位及び代謝経路

<外国人データ>¹⁵⁾

代謝部位：肝臓

代謝経路：O-脱メチル化反応によりオキシモルフォン、N-脱メチル化反応によりノルオキシコドンへ代謝される。

(2)代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

オキシコドンの代謝について、CYP発現系ヒトリンパ芽球ミクロソームを用いて検討した結果、ノルオキシコドンへの代謝にはCYP3A4によるN-脱メチル化反応が、オキシモルフォンへの代謝にはCYP2D6によるO-脱メチル化反応がそれぞれ主に関与していた。オキシコドンの主代謝経路はN-脱メチル化反応であった（*in vitro*）¹⁵⁾。

(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

<外国人データ及び動物データ（ラット）>¹⁶⁾

オキシコドンより *in vitro* での活性が強い代謝物としてオキシモルフォンとノルオキシモルフォンが報告されているが、瞳孔径を指標とした薬効と血漿中代謝物の関連性を検討した臨床試験の結果と、ラットにオキシコドン経口投与後の代謝物の脳内濃度・血漿中濃度比を検討した結果からは、オキシコドンの主要なオピオイド作用は親化合物であるオキシコドンによるもので血漿中代謝物は関与していないと考えられる。

7. 排泄

排泄部位及び経路

<外国人データ（経口投与）>

健康成人9例にオキシコドン塩酸塩 0.28mg/kg を経口投与したとき、投与後24時間までの尿中に投与量の $5.5 \pm 2.5\%$ （平均値±標準偏差）が未変化体として、また、 $2.3 \pm 5.5\%$ がオキシコドンの抱合体として排泄された。また、尿中にはノルオキシコドンとオキシモルフォン抱合体も排泄された¹⁷⁾。

健康成人にオキシコドン 15mg を経口投与したとき、投与後48時間までの尿中に投与量の $8.9 \pm 2.6\%$ が排泄され、大部分が非抱合体であった。また、ノルオキシコドンも非抱合体として $22.1 \pm 9.0\%$ が、オキシモルフォンはほぼ抱合化されて $10.7 \pm 5.5\%$ が尿中に排泄された。なお、未変化体及び代謝物（抱合体を含む）は投与48時間後までの尿中に投与量の $72 \pm 19\%$ が排泄された¹⁶⁾。

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

(1) 腎機能障害患者

＜外国人データ（経口投与）＞

腎機能障害患者 12 例（クレアチニンクリアランス：60mL/min 未満）にオキシコドン塩酸塩徐放錠 20mg を空腹時単回経口投与したとき、AUC 並びに C_{max} はそれぞれ健康成人の約 1.6 倍及び 1.4 倍であった。腎機能障害患者の鎮静作用は健康成人に比べて増加傾向を示した¹⁸⁾。

(2) 肝機能障害患者

＜外国人データ（経口投与）＞

肝機能障害患者 12 例にオキシコドン塩酸塩徐放錠 20mg を空腹時単回経口投与したとき、AUC 並びに C_{max} はそれぞれ健康成人の約 2 倍及び約 1.5 倍と有意に高く、薬力学的評価項目を増強させる傾向がみられた¹⁹⁾。

(3) 高齢者

＜外国人データ（経口投与）＞

健康高齢者（65～79 歳）、健康非高齢者（21～45 歳）各 14 例にオキシコドン塩酸塩徐放錠 20mg を空腹時単回経口投与したとき、薬物動態に関しては高齢者と非高齢者との間に差は認められなかった²⁰⁾。

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 重篤な呼吸抑制のある患者、重篤な慢性閉塞性肺疾患の患者 [呼吸抑制を増強する。] [11.1.3 参照]
- 2.2 気管支喘息発作中の患者 [呼吸を抑制し、気道分泌を妨げる。]
- 2.3 慢性肺疾患に続発する心不全の患者 [呼吸抑制や循環不全を増強する。] [9.1.2 参照]
- 2.4 痙攣状態（てんかん重積症、破傷風、ストリキニーネ中毒）にある患者 [脊髄の刺激効果があらわれる。] [9.1.14 参照]
- 2.5 麻痺性イレウスの患者 [消化管運動を抑制する。] [11.1.6 参照]
- 2.6 急性アルコール中毒の患者 [呼吸抑制を増強する。]
- 2.7 アヘンアルカロイドに対し過敏症の患者
- 2.8 出血性大腸炎の患者 [腸管出血性大腸菌（O157 等）や赤痢菌等の重篤な細菌性下痢のある患者では、症状の悪化、治療期間の延長を来すおそれがある。] [9.1.1 参照]
- 2.9 ナルメフェン塩酸塩水合物を投与中又は投与中止後 1 週間以内の患者 [10.1 参照]

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」参照

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 連用により薬物依存を生じることがあるので、観察を十分に行い、慎重に投与すること。 [11.1.2 参照]
- 8.2 眠気、眩暈が起こることがあるので、本剤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に注意すること。
- 8.3 本剤を投与する場合には、便秘に対する対策として緩下剤、嘔気・嘔吐に対する対策として制吐剤の併用を、また、鎮痛効果が得られている患者で通常とは異なる強い眠気がある場合には、過量投与の可能性を念頭において本剤の減量を考慮するなど、本剤投与時の副作用に十分注意すること。 [13.1、13.2 参照]
- 8.4 本剤を増量する場合には、副作用に十分注意すること。 [7.2 参照]
- 8.5 本剤の医療目的外使用を防止するため、適切な処方を行い、保管に留意するとともに、患者等に対して適切な指導を行うこと。 [14.2.1、14.2.2 参照]

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 細菌性下痢のある患者

治療上やむを得ないと判断される場合を除き、投与しないこと。治療期間の延長を来すおそれがある。
[2.8 参照]

9.1.2 心機能障害あるいは低血圧のある患者

循環不全を増強するおそれがある。 [2.3 参照]

9.1.3 呼吸機能障害のある患者

呼吸抑制を増強するおそれがある。 [11.1.3 参照]

9.1.4 脳に器質的障害のある患者

呼吸抑制や頭蓋内圧の上昇を起こすおそれがある。

9.1.5 ショック状態にある患者

循環不全や呼吸抑制を増強するおそれがある。 [11.1.1 参照]

9.1.6 代謝性アシドーシスのある患者

呼吸抑制を起こしたときアシドーシスを増悪させるおそれがある。

9.1.7 甲状腺機能低下症（粘液水腫等）の患者

呼吸抑制や昏睡を起こすおそれがある。

9.1.8 副腎皮質機能低下症（アジソン病等）の患者

呼吸抑制作用に対し、感受性が高くなっている。

9.1.9 薬物・アルコール依存又はその既往歴のある患者

依存性を生じやすい。 [9.1.10 参照]

9.1.10 薬物、アルコール等による精神障害のある患者

症状が増悪するおそれがある。 [9.1.9 参照]

9.1.11 衰弱者

呼吸抑制作用に対し、感受性が高くなっている。

9.1.12 前立腺肥大による排尿障害、尿道狭窄、尿路手術術後の患者

排尿障害を増悪することがある。

9.1.13 器質的幽門狭窄又は最近消化管手術を行った患者

消化管運動を抑制する。

9.1.14 痙攣の既往歴のある患者

痙攣を誘発するおそれがある。 [2.4 参照]

9.1.15 胆嚢障害、胆石症又は膵炎の患者

オッジ筋を収縮させ症状が増悪することがある。

9.1.16 重篤な炎症性腸疾患のある患者

連用した場合、巨大結腸症を起こすおそれがある。

(2)腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

排泄が遅延し副作用があらわれるおそれがある。 [16.6.1 参照]

解説：

9.2 「VII.10.(1)腎機能障害患者」参照

(3)肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

代謝が遅延し副作用があらわれるおそれがある。 [16.6.2 参照]

解説：

9.3 「VII.10.(2)肝機能障害患者」参照

(4)生殖能を有する者

設定されていない

(5)妊婦

9.5 妊婦

9.5.1 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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こと。オキシコドンでは催奇形作用は認められていないが、類薬のモルヒネの動物試験（マウス、ラット）で催奇形作用が報告されている。

9.5.2 分娩前に投与した場合、出産後新生児に退薬症候（多動、神経過敏、不眠、振戦等）があらわれることがある。

9.5.3 分娩時の投与により、新生児に呼吸抑制があらわれることがある。

(6)授乳婦

9.6 授乳婦

本剤投与中は授乳を避けさせること。ヒト母乳中へ移行することが報告されている。

(7)小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8)高齢者

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら、慎重に投与すること。一般に生理機能が低下しており、特に呼吸抑制の感受性が高い。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

7. 相互作用

10. 相互作用

本剤は、主として薬物代謝酵素 CYP3A4 及び一部 CYP2D6 で代謝される。 [16.4 参照]

(1)併用禁忌とその理由

10.1 併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ナルメフェン塩酸塩水和物 セリンクロ [2.9 参照]	本剤の鎮痛作用を減弱させることがある。また、退薬症候を起こすことがある。	μ オピオイド受容体拮抗作用により、本剤の作用が競合的に阻害される。

(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
中枢神経抑制剤 フェノチアジン誘導体、バルビツール酸誘導体等 吸入麻酔剤 MAO 阻害剤 三環系抗うつ剤 β 遮断剤 アルコール	臨床症状：呼吸抑制、低血圧及び顕著な鎮静又は昏睡が起こることがある。 措置方法：減量するなど慎重に投与すること。	相加的に中枢神経抑制作用を増強させる。
クマリン系抗凝血剤 ワルファリンカリウム	クマリン系抗凝血剤の作用が増強されることがあるので投与量を調節するなど慎重に投与すること。	機序は不明である。
抗コリン作用を有する薬剤 フェノチアジン系薬剤、三環系抗うつ剤等	臨床症状：麻痺性イレウスに至る重篤な便秘又は尿貯留が起こることがある。	相加的に抗コリン作用を増強させる。
ブプレノルフィン、ペンタゾシン等	本剤の鎮痛作用を減弱させることがある。また、退薬症候を起こすことがある。	ブプレノルフィン、ペンタゾシン等は本剤の作用する μ 受容体の部分アゴニストである。
CYP3A4 阻害作用を有する薬剤 ボリコナゾール、イトラコナゾール、フルコナゾール、リトナビル、クラリスロマイシン等 [16.7.1-16.7.3 参照]	本剤の血中濃度が上昇し、副作用が発現するおそれがあるので、観察を十分に行い、慎重に投与すること。	CYP3A4 を介する本剤の代謝が阻害される。
CYP3A4 誘導作用を有する薬剤 リファンピシン、カルバマゼピン、フェニトイン等 [16.7.4 参照]	本剤の血中濃度が低下し、作用が減弱する可能性がある。なお、これらの薬剤の中止後に、本剤の血中濃度が上昇し、副作用が発現するおそれがあるので、観察を十分に行い、慎重に投与すること。	CYP3A4 を介する本剤の代謝が促進される。

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）

顔面蒼白、血圧低下、呼吸困難、頻脈、全身発赤、血管浮腫、蕁麻疹等の症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。[9.1.5 参照]

11.1.2 依存性（頻度不明）

連用により薬物依存を生じることがある。また、連用中における投与量の急激な減少ないし投与の中止により、あくび、くしゃみ、流涙、発汗、悪心、嘔吐、下痢、腹痛、散瞳、頭痛、不眠、不安、譫妄、痙攣、振戦、全身の筋肉・関節痛、呼吸促迫、動悸等の退薬症候があらわれることがあるので、投与を中止する場合には、1日用量を徐々に減量するなど、患者の状態を観察しながら行うこと。[7.3、7.4、8.1 参照]

11.1.3 呼吸抑制（3%未満）

息切れ、呼吸緩慢、不規則な呼吸、呼吸異常等があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

なお、本剤による呼吸抑制には、麻薬拮抗剤（ナロキソン、レバロルフアン等）が拮抗する。[2.1、9.1.3、13.2 参照]

11.1.4 錯乱（1%未満）、譫妄（3%未満）

11.1.5 無気肺、気管支痙攣、喉頭浮腫（いずれも頻度不明）

11.1.6 麻痺性イレウス、中毒性巨大結腸（いずれも頻度不明）

炎症性腸疾患の患者に投与した場合、中毒性巨大結腸があらわれるとの報告がある。[2.5 参照]

11.1.7 肝機能障害（5%未満）

AST、ALT、Al-P等の著しい上昇を伴う肝機能障害があらわれることがある。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

種類\頻度	5%以上	5%未満	頻度不明
過敏症		発疹	蕁麻疹
循環器		低血圧、血圧変動	不整脈、起立性低血圧、失神
精神神経系	眠気・傾眠（23.8%）	眩暈、頭痛・頭重感、不眠、悪夢、筋れん縮、発汗、焦燥	幻覚、意識障害、しびれ、不安、異夢、興奮、視調節障害、縮瞳、神経過敏、感覚異常、痙攣、振戦、筋緊張亢進、健忘、抑うつ、感情不安定、多幸感、思考異常、構語障害、痛覚過敏 ^{注)} 、アロディニア
消化器	便秘（23.8%）、嘔気（22.8%）、嘔吐（19.8%）	下痢、食欲不振、腹痛	胃不快感、おくび、鼓腸、味覚異常、嚥下障害、口渇
投与部位	発赤	腫脹、硬結、疼痛、そう痒感等の注射部位反応	
その他		そう痒感、呼吸困難、倦怠感、脱水	発熱、悪寒、頭蓋内圧の亢進、脱力感、胸部圧迫感、排尿障害、尿閉、無月経、性欲減退、勃起障害、浮腫、皮膚乾燥、血管拡張（顔面潮紅、熱感）

注) 増量により痛みが増悪する。

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

13. 過量投与

13.1 症状

呼吸抑制、意識不明、痙攣、錯乱、血圧低下、重篤な脱力感、重篤な眩暈、嗜眠、心拍数の減少、神経過敏、不安、縮瞳、皮膚冷感等を起こすことがある。 [8.3、14.1.2 参照]

13.2 処置

麻薬拮抗剤投与を行い、患者に退薬症候又は麻薬拮抗剤の副作用が発現しないよう慎重に投与する。なお、麻薬拮抗剤の作用持続時間はオキシコドンのそれより短いので、患者のモニタリングを行うか又は患者の反応に応じて初回投与後は注入速度を調節しながら持続静注する。 [8.3、11.1.3 参照]

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

14.1.1 オピオイド製剤のがん疼痛における臨床使用方法としては、経口投与又は直腸内投与が不可能なとき、初めて注射を用いる。

14.1.2 静注する場合には緩徐に行うことが望ましい。急速静注により、アナフィラキシー、重篤な呼吸抑制、低血圧、末梢循環虚脱、心停止が起こるおそれがある。 [13.1 参照]

14.2 薬剤交付時の注意

14.2.1 具体的な投与方法、投与時の注意点、保管方法等を十分に説明し、本剤の目的以外への使用あるいは他人への譲渡をしないよう指導するとともに、本剤を子供の手の届かないところに保管するよう指導すること。 [8.5 参照]

14.2.2 本剤が不要となった場合には、病院又は薬局へ返納するなどの処置について適切に指導すること。 [8.5 参照]

解説：

14.2.1 薬物乱用及び誤用を防止するために設定した。

14.2.2 オピオイド製剤に共通の注意事項である。薬物乱用及び誤用を防止するために設定した。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(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

該当資料なし

(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

該当資料なし

(2)反復投与毒性試験

該当資料なし

(3)遺伝毒性試験

該当資料なし

(4)がん原性試験

該当資料なし

(5)生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6)局所刺激性試験

該当資料なし

(7)その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：劇薬、麻薬、処方箋医薬品：注意—医師等の処方箋により使用すること
有効成分：毒薬、麻薬

2. 有効期間

3年（安定性試験結果に基づく）

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

外箱開封後は遮光して保存すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無し くすりのしおり：有り

6. 同一成分・同効薬

先発医薬品：オキファスト注

7. 国際誕生年月日

不明

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

製造販売承認年月日：2019年2月15日

承認番号：オキシコドン注射液 10mg「第一三共」：23100AMX00174

オキシコドン注射液 50mg「第一三共」：23100AMX00175

薬価基準収載年月日：2019年6月14日

販売開始年月日：2019年6月14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

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は厚生労働省告示第 107 号（平成 18 年 3 月 6 日付）に基づき、1 回 14 日分を限度として投与する。

13. 各種コード

販売名	HOT（13 桁）番号	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）	レセプト電算処理 システム用コード
オキシコドン注射液 10mg「第一三共」	1268577010201	8119400A1033	8119400A1033	622685701
オキシコドン注射液 50mg「第一三共」	1268584010201	8119400A2030	8119400A2030	622685801

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

本製剤はオキシコドン製剤であり、本製剤を投与した場合は、医科点数表区分番号「C108」在宅悪性腫瘍等患者指導管理料又は「C108-2」在宅悪性腫瘍患者共同指導管理料を算定できるものであること。

（令和元年 6 月 13 日付 保医発 0613 第 1 号）

以下の条件を満たすバルーン式ディスポーザブルタイプの連続注入器等に必要な応じて生理食塩水等で希釈の上充填して交付した場合に限る。

ア 薬液が取り出せない構造であること

イ 患者等が注入速度を変えることができないものであること

（平成 24 年 4 月 17 日付 保医発 0417 第 2 号）抜粋

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) 大坂巖：月刊薬事 2015;57(4):75-80
- 2) 富安志郎ほか：がん患者と対症療法 2012;23(1):15-20
- 3) 的場元弘：がん患者と対症療法 2012;23(1):6-7
- 4) 国内第Ⅲ相試験、有効性及び安全性の概要（オキファスト注：2012年1月18日承認、CTD 2.5.4.3、2.5.4.4、2.5.5.5）
- 5) マウス、ラットにおける鎮痛作用（オキシコンチン錠：2003年4月16日承認、申請資料概要ホ.1.(1)）
- 6) 国内第Ⅲ相試験、静脈内及び皮下投与時の薬物動態（オキファスト注：2012年1月18日承認、CTD2.7.2.2）
- 7) 社内資料：健康成人を対象としたオキシコドン注射液「第一三共」10mgと標準製剤の生物学的同等性試験
- 8) Nieminen TH, et al. : Anesthesiology 2009;110(6):1371-1378 (PMID : 19417618)
- 9) Hagelberg NM, et al. : Eur J Clin Pharmacol 2009;65(3):263-271 (PMID : 18836708)
- 10) Nieminen TH, et al. : Eur J Clin Pharmacol 2010;66(10):977-985 (PMID : 20697700)
- 11) Liukas A, et al. : J Clin Psychopharmacol 2011;31(3):302-308 (PMID : 21508859)
- 12) Seaton S, et al. : Aust N Z J Obstet Gynaecol 2007;47(3):181-185 (PMID : 17550483)
- 13) Marx CM, et al. : Drug Intell Clin Pharm 1986;20:474
- 14) Leow KP, et al. : Ther Drug Monit 1993;15(5):440-447 (PMID : 8249052)
- 15) Lalovic B, et al. : Drug Metab Dispos 2004;32(4):447-454 (PMID : 15039299)
- 16) Lalovic B, et al. : Clin Pharmacol Ther 2006;79(5):461-479 (PMID : 16678548)
- 17) Pöyhiä R, et al. : Br J Clin Pharmacol 1992;33(6):617-621 (PMID : 1389934)
- 18) 腎機能障害者における薬物動態（オキシコンチン錠：2003年4月16日承認、申請資料概要へ.3.(1)6）
- 19) 肝機能障害者における薬物動態（オキシコンチン錠：2003年4月16日承認、申請資料概要へ.3.(1)7）
- 20) 高齢者における薬物動態（オキシコンチン錠：2003年4月16日承認、申請資料概要へ.3.(1)5）

2. その他の参考文献

第十八改正日本薬局方解説書 2021, 廣川書店

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

オキシコドン製剤の主な販売国又は地域を以下のとおり示す。

米国、英国、オーストラリア、カナダ、フランス、ドイツ、イタリア、オランダ、ロシア、スペイン、スイス等
(Martindale 40th ed. 2020)

英国での効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりである。

出典	記載内容
英国の SPC (OxyNorm 10mg/ml solution for injection or infusion, Napp Pharmaceuticals Ltd., 2024 年 3 月)	<p>4. Clinical particulars</p> <p>4.1 Therapeutic indications</p> <p>For the treatment of moderate to severe pain in patients with cancer and post-operative pain.</p> <p>For the treatment of severe pain requiring the use of a strong opioid.</p> <p>4.2 Posology and method of administration</p> <p><i>Posology</i></p> <p>The dose should be adjusted according to the severity of pain, the total condition of the patient and previous or concurrent medication. The patient's previous history of analgesic requirements should be taken into account when determining the dose.</p> <p>Generally, the lowest effective dose for analgesia should be selected. A gradual increase in dose may be required if analgesia is inadequate or if pain severity increases.</p> <p>Prior to starting treatment with opioids, a discussion should be held with patients to put in place a strategy for ending treatment with oxycodone in order to minimise the risk of addiction and drug withdrawal syndrome (see section 4.4).</p> <p><i>Adults over 18 years</i></p> <p>The following starting doses are recommended.</p> <p>i.v. (Bolus): Dilute to 1 mg/ml in 0.9% saline, 5% dextrose or water for injections. Administer a bolus dose of 1 to 10 mg slowly over 1-2 minutes.</p> <p>Doses should not be administered more frequently than every 4 hours.</p> <p>i.v. (Infusion): Dilute to 1 mg/ml in 0.9% saline, 5% dextrose or water for injections. A starting dose of 2 mg/hour is recommended.</p> <p>i.v. (PCA): Dilute to 1 mg/ml in 0.9% saline, 5% dextrose or water for injections. Bolus doses of 0.03 mg/kg should be administered with a minimum lock-out time of 5 minutes.</p> <p>s.c. (Bolus): Use as 10 mg/ml concentration. A starting dose of 5 mg is recommended, repeated at 4-hourly intervals as required.</p> <p>s.c. (Infusion): Dilute to 1 mg/ml in 0.9% saline, 5% dextrose or water for injections. A starting dose of 7.5 mg/day is recommended in opioid naïve</p>

patients, titrating gradually according to symptom control. Cancer patients transferring from oral oxycodone may require higher doses (see below).

Conversion from morphine

Patients switching from parenteral morphine to parenteral oxycodone therapy should do so on the basis of a one to one dose ratio. It must be emphasised that this is a guide to the dose of **OxyNorm** injection required. Inter-patient variability requires that each patient is carefully titrated to the appropriate dose.

Transferring patients between oral and parenteral oxycodone

The dose should be based on the following ratio: 2 mg of oral oxycodone is equivalent to 1 mg of parenteral oxycodone. It must be emphasised that this is a guide to the dose required. Inter-patient variability requires that each patient is carefully titrated to the appropriate dose.

Elderly patients

Elderly patients should be treated with caution. The lowest dose should be administered with careful titration to pain control.

Paediatric population

There are no data on the use of **OxyNorm** injection in patients under 18 years of age.

Patients with renal and hepatic impairment

The dose initiation should follow a conservative approach in these patients. The recommended adult starting dose should be reduced by 50% (for example a total daily dose of 10 mg orally in opioid naïve patients), and each patient should be titrated to adequate pain control according to their clinical situation.

Use in non-malignant pain

Opioids are not first-line therapy for chronic non-malignant pain, nor are they recommended as the only treatment. Types of chronic pain which have been shown to be alleviated by strong opioids include chronic osteoarthritic pain and intervertebral disc disease.

Method of administration

Subcutaneous injection or infusion.

Intravenous injection or infusion.

Treatment goals and discontinuation

Before initiating treatment with **OxyNorm** injection, a treatment strategy including treatment duration and treatment goals, and a plan for end of the treatment, should be agreed together with the patient, in accordance with pain management guidelines. During treatment, there should be frequent contact between the physician and the patient to evaluate the need for continued treatment, consider discontinuation and to adjust dosages if needed. When a patient no longer requires therapy with oxycodone, it may be advisable to taper the dose gradually to prevent symptoms of withdrawal. In absence of adequate pain control, the possibility of hyperalgesia, tolerance and progression of underlying disease should be considered (see section 4.4).

	<p><i>Duration of treatment</i></p> <p>Oxycodone should not be used for longer than necessary.</p>
--	--

本邦における本剤の効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりである。国内の承認内容の範囲で本剤を使用すること。

4. 効能・効果

中等度から高度の疼痛を伴う各種癌における鎮痛

6. 用法・用量

通常、成人にはオキシコドン塩酸塩（無水物）として1日7.5～250mgを持続静脈内又は持続皮下投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。

7. 用法・用量に関連する注意

〈持続投与時〉

7.1 初回投与

本剤の投与開始前のオピオイド鎮痛薬による治療の有無を考慮して初回投与量を設定することとし、既に治療されている場合にはその投与量及び鎮痛効果の持続を考慮して副作用の発現に注意しながら適宜投与量を調節すること。

7.1.1 オピオイド鎮痛薬を使用していない患者には、疼痛の程度に応じてオキシコドン塩酸塩として7.5～12.5mgを1日投与量とすることが望ましい。

7.1.2 モルヒネ注射剤の持続静脈内投与を本剤に変更する場合には、モルヒネ注射剤1日投与量の1.25倍量を1日投与量の目安とすることが望ましい。

7.1.3 経口オキシコドン製剤から本剤へ変更する場合には、オキシコドン製剤1日投与量の0.75倍量を1日投与量の目安とすることが望ましい。

7.1.4 経皮フェンタニル貼付剤から本剤へ変更する場合には、経皮フェンタニル貼付剤剥離後にフェンタニルの血中濃度が50%に減少するまで17時間以上かかることから、剥離直後の本剤の使用は避け、本剤の使用を開始するまでに、フェンタニルの血中濃度が適切な濃度に低下するまでの時間をあけるとともに、本剤の低用量から投与することを考慮すること。

7.2 増量

本剤投与開始後は患者の状態を観察し、適切な鎮痛効果が得られ副作用が最小となるよう用量調整を行うこと。鎮痛効果が不十分な場合は、レスキュー薬の投与量を考慮して前日の1日投与量の25～50%増を目安として増量を行うこと。[8.4 参照]

7.3 減量

連用中における急激な減量は、退薬症候があらわれることがあるので行わないこと。副作用等により減量する場合は、患者の状態を観察しながら慎重に行うこと。[7.4、11.1.2 参照]

7.4 投与の中止

本剤の投与を必要としなくなった場合には、退薬症候の発現を防ぐために徐々に減量すること。[7.3、11.1.2 参照]

〈臨時追加投与（レスキュー薬の投与）として本剤を使用する場合〉

7.5 疼痛が増強した場合や鎮痛効果が得られている患者で突発性の疼痛が発現した場合は、本剤の1日投与量の1/24量（1時間量相当分）を目安に早送りによる投与又は追加の静脈内投与を行い、鎮痛を図ること。ただし、レスキュー薬としての投与を連続して行う場合は、呼吸抑制等の副作用の発現に注意すること。

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

	分類	参考：分類の概要
オーストラリア分類基準	C (OXYNORM(OXYCODONE HYDROCHLORIDE) SOLUTION FOR INJECTION OR INFUSION, Mundipharma Pty Limited, 2023年7月)	Drugs which, owing to their pharmacological effects, have caused or may be suspected of causing, harmful effects on the human fetus or neonate without causing malformations. These effects may be reversible. Accompanying texts should be consulted for further details.

妊婦、授乳婦等に関する記載

出典	記載内容
英国の SPC (OxyNorm 10mg/ml solution for injection or infusion, Napp Pharmaceuticals Ltd., 2024年3月)	<p>4. Clinical particulars</p> <p>4.6 Fertility, pregnancy and lactation</p> <p>Pregnancy</p> <p>There are limited data from the use of oxycodone in pregnant women. Regular use in pregnancy may cause drug dependence in the foetus, leading to withdrawal symptoms in the neonate. If opioid use is required for a prolonged period in pregnant women, advise the patient of the risk of neonatal opioid withdrawal syndrome and ensure that appropriate treatment will be available.</p> <p>Administration during labour may depress respiration in the neonate and an antidote for the child should be readily available.</p> <p>Breastfeeding</p> <p>Administration to nursing women is not recommended as oxycodone may be secreted in breast milk and may cause respiratory depression in the infant.</p> <p>Fertility</p> <p>No human data on the effect of oxycodone on fertility are available. In rats there was no effect on mating or fertility with oxycodone treatment (see section 5.3).</p>

本邦における本剤の使用上の注意「9.5 妊婦」及び「9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりである。

<p>9.5 妊婦</p> <p>9.5.1 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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こと。オキシコドンでは催奇形作用は認められていないが、類薬のモルヒネの動物試験（マウス、ラット）で催奇形作用が報告されている。</p> <p>9.5.2 分娩前に投与した場合、出産後新生児に退薬症候（多動、神経過敏、不眠、振戦等）があらわれることがある。</p> <p>9.5.3 分娩時の投与により、新生児に呼吸抑制があらわれることがある。</p> <p>9.6 授乳婦</p> <p>本剤投与中は授乳を避けさせること。ヒト母乳中へ移行することが報告されている。</p>

小児等に関する記載

出典	記載内容
<p>英国の SPC (OxyNorm 10mg/ml solution for injection or infusion, Napp Pharmaceuticals Ltd., 2024 年 3 月)</p>	<p>4. Clinical particulars</p> <p>4.2 Posology and method of administration</p> <p><i>Paediatric population</i></p> <p>There are no data on the use of <i>OxyNorm</i> injection in patients under 18 years of age.</p>

本邦における本剤の使用上の注意「9.7 小児等」の項の記載は以下のとおりである。

<p>9.7 小児等</p> <p>小児等を対象とした臨床試験は実施していない。</p>

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

(1)粉砕

該当しない

(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

オキシコドン注射液 10mg・50mg「第一三共」 配合変化試験

配合方法：

- ① 配合薬剤 1 管又は 1 バイアルの表示量相当の容量、オキシコドン注射液（10mg/1mL）1mL、及び生理食塩液 50mL 1 本分を混合する。
- ② 配合薬剤 1 袋及びオキシコドン注射液（10mg/1mL）1mL を混合する。
- ③ 配合薬剤 1 管、1 瓶、又は 1 バイアルの内容物を、生理食塩液 50mL のプラスチックボトルから採取した生理食塩液（適量）により溶解し、その液全量、オキシコドン注射液（10mg/1mL）1mL、及び残りの生理食塩液を混合する。
- ④ 配合薬剤 2 管分の表示量相当の容量、オキシコドン注射液（10mg/1mL）2mL、及び生理食塩液 500mL 1 本分を混合する。
- ⑤ 配合薬剤 1 バイアルの内容物を、添付の注射用水により溶解し、その液全量、オキシコドン注射液（10mg/1mL）1mL、及び生理食塩液 50mL 1 本分を混合する。
- ⑥ 配合薬剤 1 本及びオキシコドン注射液（50mg/5mL）10mL を混合する。
- ⑦ 配合薬剤 1 本及びオキシコドン注射液（50mg/5mL）5mL を混合する。

保存条件：

室内散光（白色蛍光灯 1000lx）、25℃/60%RH

室内散光条件下で実施したが、保存中に明確な品質の変化が確認された場合には、必要に応じて遮光条件下（25℃/60%RH）での配合変化試験も実施した。

測定項目：性状（外観）、pH、含量

配合変化試験の結果：表 1～6

実施期間：2018 年 4 月～2019 年 1 月

（記載されている配合薬剤名及び会社名は各試験実施当時のものである。）

表 1 配合変化試験の結果：神経系及び感覚器用医薬品

分類	薬剤名		配合方法	保存条件	試験項目	保存期間			
	販売名 [会社名]	配合量				開始時	6 時間	24 時間	48 時間
神経系及び感覚器用医薬品	ケタラル静注用 200mg [第一三共プロファーマ]	1 Va	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.65	4.65	4.65	4.66
					残存率 (%)	100.0	98.9	98.5	98.3
	ドルミカム注射液 10mg [アステラス製薬]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.20	4.18	4.25	4.20
					残存率 (%)	100.0	100.0	100.1	100.0
	ロヒプノール静注用 2mg [エーザイ]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.83	4.79	4.85	4.80
					残存率 (%)	100.0	99.7	99.4	98.8
	ロピオン静注 50mg [科研製薬]	1 管	①	室内散光	性状	白色の乳濁液	白色の乳濁液	白色の乳濁液	白色の乳濁液
					pH	5.13	5.14	5.16	5.14
					残存率 (%)	100.0	99.6	99.0	98.5
	アセリオ静注液 1000mg バッグ [テルモ]	1 袋	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	5.22	5.22	5.22	5.21
					残存率 (%)	100.0	100.1	99.4	99.5
	アタラックス-P 注射液 (50mg/ml) [ファイザー]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
pH					4.75	4.75	4.76	4.80	
残存率 (%)					100.0	99.9	99.9	99.9	
セレネース注 5mg [大日本住友製薬]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	4.01	4.01	4.04	4.06	
				残存率 (%)	100.0	99.9	99.4	98.7	
ハロペリドール注 5mg 「ヨシトミ」 [田辺三菱製薬]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	4.00	4.01	4.01	4.05	
				残存率 (%)	100.0	100.3	99.7	98.9	
ノバミン筋注 5mg [塩野義製薬]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	5.47	5.40	5.20	5.01	
				残存率 (%)	100.0	99.5	99.8	100.7	
ハイスコ皮下注 0.5mg [杏林製薬]	1 管	①	室内散光	表示含量 (%)	83.6	83.2	83.4	84.2	
				性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	4.93	4.93	4.93	4.93	
ブスコパン注 20mg [サノフィ]	1 管	①	室内散光	残存率 (%)	100.0	100.2	100.0	100.0	
				性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	4.76	4.87	4.87	4.87	
トラベルミン注 [エーザイ]	1 管	①	室内散光	残存率 (%)	100.0	99.8	99.7	99.6	
				性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	4.92	4.94	4.92	4.96	
				残存率 (%)	100.0	99.8	99.8	99.8	

残存率 (%)：オキシコドンの配合直後（開始時）の含量に対する比率

表示含量 (%)：オキシコドンの配合直後の含量が 90.0%未満のものについて記載

a：バイアル

XIII. 備 考

表 2 配合変化試験の結果：個々の器官系用医薬品

分類	薬剤名		配合方法	保存条件	試験項目	保存期間			
	販売名 [会社名]	配合量				開始時	6 時間	24 時間	48 時間
個々の器官系用医薬品	ネオフィリン注点滴用バッグ 250mg [エーザイ]	1 袋	②	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	8.83	8.77	8.82	8.82
					残存率 (%)	100.0	100.1	99.6	98.8
	イノバン注 100mg [協和発酵キリン]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.89	4.83	4.72	4.60
					残存率 (%)	100.0	100.4	101.6	103.3
	ドブトレックス注射液 100mg [塩野義製薬]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.18	4.19	4.17	4.15
					残存率 (%)	100.0	99.9	100.3	101.0
	静注用キシロカイン 2% [アスペンジャパン]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	5.94	6.07	6.05	6.08
					残存率 (%)	100.0	99.9	99.8	99.4
	ソルダクトン静注用 100mg [ファイザー]	1 管	③	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	8.41	8.39	8.38	8.39
					残存率 (%)	100.0	100.0	99.7	99.7
	ラシックス注 20mg [日医工]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	5.74	5.71	5.65	5.55
					残存率 (%)	100.0	99.8	99.6	99.8
	イミグラン注 3 [グラクソ・スミスクライン]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.67	4.74	4.78	4.76
					残存率 (%)	100.0	99.9	99.9	99.8
	ハンブ注射用 1000 [第一三共]	1 Va	③	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.82	4.87	4.89	4.91
					残存率 (%)	100.0	100.1	100.1	100.1
	ガスター注射液 20mg [アステラス製薬]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	5.86	5.79	5.78	5.83
					残存率 (%)	100.0	99.9	99.8	99.3
	ザンタック注射液 50mg [グラクソ・スミスクライン]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
pH					6.69	6.68	6.66	6.65	
残存率 (%)					100.0	100.1	100.2	100.0	
タガメット注射液 200mg [大日本住友製薬]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	5.73	5.73	5.70	5.68	
				残存率 (%)	100.0	100.2	100.2	100.2	
オメプラール注用 20 [アストラゼネカ]	1 Va	③	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	
				pH	9.01	9.00	8.99	8.91	
				残存率 (%)	100.0	98.9	97.0	95.9	
タケブロン静注用 30mg [武田薬品工業]	1 Va	③	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	
				pH	9.69	9.65	9.64	9.62	
				残存率 (%)	100.0	98.8	97.0	94.2	
プリンペラン注射液 10mg [アステラス製薬]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	4.60	4.56	4.52	4.53	
				残存率 (%)	100.0	99.6	100.2	101.0	
デカドロン注射液 1.65mg [アスペンジャパン]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	6.47	6.47	6.42	6.43	
				残存率 (%)	100.0	100.1	100.1	100.3	
リンデロン注 4mg (0.4%) [塩野義製薬]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	7.09	7.06	7.02	6.98	
				残存率 (%)	100.0	100.1	100.4	100.8	
水溶性プレドニン 50mg [塩野義製薬]	1 管	③	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	6.59	6.60	6.55	6.52	
				残存率 (%)	100.0	100.2	100.0	100.0	
ノルアドリナリン注 1mg [第一三共]	1 管	④	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	5.23	5.20	5.18	5.17	
				残存率 (%)	100.0	100.4	100.2	100.2	
ボスミン注 1mg [第一三共]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	4.71	4.72	4.72	4.71	
				残存率 (%)	100.0	100.0	100.1	100.2	

分類	薬剤名		配合方法	保存条件	試験項目	保存期間			
	販売名 [会社名]	配合量				開始時	6 時間	24 時間	48 時間
個々の器官系用医薬品	ソル・メドロール静注用 125mg [ファイザー]	1 Va	⑤	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	7.29	7.25	7.10	6.99
					残存率 (%)	100.0	100.0	99.8	99.4
	サンドスタチン皮下注用 100µg [ノバルティス ファーマ]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.34	4.35	4.35	4.37
					残存率 (%)	100.0	100.1	100.2	100.1
	ソマバート皮下注用 10mg [ファイザー]	1 Va	⑤	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	6.07	6.08	6.10	6.10
					残存率 (%)	100.0	100.0	100.0	100.3

残存率 (%) : オキシコドンの配合直後 (開始時) の含量に対する比率

表示含量 (%) : オキシコドンの配合直後の含量が 90.0%未満のものについて記載

a : バイアル

表 3 配合変化試験の結果 : 代謝性医薬品 (1)

分類	薬剤名		配合方法	保存条件	試験項目	保存期間			
	販売名 [会社名]	配合量				開始時	6 時間	24 時間	48 時間
代謝性医薬品	マルタミン注射用 [エイワイファーマ]	1 Va	③	室内散光	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液
					pH	4.76	4.98	4.81	4.37
					残存率 (%)	100.0	97.4	93.8	87.6
				遮光	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液
					pH	4.78	4.79	4.88	4.83
					残存率 (%)	100.0	99.6	97.3	94.3
	ビタメジン静注用 [第一三共]	1 Va	③	室内散光	性状	淡赤色澄明の液	淡赤色澄明の液	淡赤色澄明の液	淡赤色澄明の液
					pH	4.51	4.51	4.51	4.50
					残存率 (%)	100.0	99.7	99.8	99.9
	ネオラミン・マルチ V 注射用 [日本化薬]	1 Va	③	室内散光	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄褐色澄明の液	黄褐色澄明の液
					pH	4.99	5.18	4.98	4.62
					残存率 (%)	100.0	98.2	94.3	88.1
	アミカリック輸液 [テルモ]	1 袋	②	室内散光	性状	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液
					pH	5.04	5.04	5.03	5.02
					残存率 (%)	100.0	99.3	100.0	100.3
	アミノフリード輸液 [大塚製薬工場]	1 袋	②	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	6.60	6.58	6.51	6.51
					残存率 (%)	100.0	97.0	98.3	99.1
	エルネオバ NF1 号輸液 [大塚製薬工場]	1 袋	②	遮光	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液
					pH	5.15	5.17	5.16	5.16
					残存率 (%)	100.0	99.7	100.0	99.1
	エルネオバ NF2 号輸液 [大塚製薬工場]	1 袋	②	遮光	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液
					pH	5.33	5.34	5.34	5.34
					残存率 (%)	100.0	99.9	100.3	99.2
ネオパレン 1 号輸液 [大塚製薬工場]	1 袋	②	遮光	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液	
				pH	5.59	5.56	5.59	5.60	
				残存率 (%)	100.0	99.7	99.0	99.1	
ネオパレン 2 号輸液 [大塚製薬工場]	1 袋	②	遮光	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液	
				pH	5.37	5.34	5.39	5.38	
				残存率 (%)	100.0	99.9	99.7	99.5	
ピーエヌツイン-1 号輸液 [エイワイファーマ]	1 袋	②	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	4.97	4.97	4.94	4.96	
				残存率 (%)	100.0	99.9	99.1	98.6	
ピーエヌツイン-2 号輸液 [エイワイファーマ]	1 袋	②	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	5.08	5.06	5.04	5.05	
				残存率 (%)	100.0	100.3	99.8	97.3	
ピーエヌツイン-3 号輸液 [エイワイファーマ]	1 袋	②	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	5.16	5.14	5.11	5.13	
				残存率 (%)	100.0	97.7	97.3	96.8	
ビーフリード輸液 [大塚製薬工場]	1 袋	②	遮光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	6.70	6.64	6.70	6.70	
				残存率 (%)	100.0	99.8	99.8	100.1	

XIII. 備 考

分類	薬剤名		配合方法	保存条件	試験項目	保存期間			
	販売名 [会社名]	配合量				開始時	6 時間	24 時間	48 時間
代謝性医薬品	フルカリック 1号輸液 (903mL 袋) [テルモ]	1 袋	②	遮光	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液
					pH	5.04	5.05	5.03	5.01
					残存率 (%)	100.0	99.4	99.1	98.9
	フルカリック 2号輸液 (1003mL 袋) [テルモ]	1 袋	②	遮光	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液
					pH	5.27	5.27	5.24	5.22
					残存率 (%)	100.0	98.0	99.7	99.4
	フルカリック 3号輸液 (1103mL 袋) [テルモ]	1 袋	②	遮光	性状	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液	黄色澄明の液
					pH	5.45	5.44	5.40	5.37
					残存率 (%)	100.0	99.8	99.9	99.9
	イントラリポス輸液 20% [大塚製薬工場]	1 袋	②	室内散光	性状	白色の乳濁液	白色の乳濁液	白色の乳濁液	白色の乳濁液
					pH	7.10	6.98	6.97	6.92
	ソルデム 3 輸液 [テルモ]	1 袋	②	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	6.06	6.06	6.04	6.06
	トランサミン注 10% [第一三共]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	6.79	6.77	6.72	6.70
	ヘパリンナトリウム注 1万単位/10mL「ニプロ」 [ニプロ]	1 Va	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	5.53	5.55	5.54	5.56
	メイロン静注 7% (250mL 袋) [大塚製薬工場]	1 袋	②	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
pH					8.12	8.09	8.20	8.21	
ゾメタ点滴静注 4mg/5mL [ノバルティス ファーマ]	1 Va	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	5.91	5.90	5.91	5.90	
ハイカリック RF 輸液 [テルモ]	1 袋	②	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	4.44	4.45	4.45	4.44	
ハイカリック液-3号 [テルモ]	1 袋	②	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	
				pH	3.98	3.98	3.99	3.96	
				残存率 (%)	100.0	99.9	99.9	99.6	

残存率 (%) : オキシコドンの配合直後 (開始時) の含量に対する比率
 表示含量 (%) : オキシコドンの配合直後の含量が 90.0%未満のものについて記載
 a : バイアル

表 4 配合変化試験の結果 : 代謝性医薬品 (2)

分類	薬剤名		配合方法	保存条件	試験項目	保存期間						
	販売名 [会社名]	配合量				開始時	6 時間	24 時間	48 時間	7 日	14 日	30 日
代謝性医薬品	大塚糖液 5% [大塚製薬工場]	1 袋	②	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.81	4.83	4.80	4.79	4.79	4.77	4.72
					残存率 (%)	100.0	100.4	99.7	99.8	100.2	99.9	99.5
	大塚生食注 [大塚製薬工場] 100mL	1 本	⑥	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.69	4.73	4.73	4.74	4.72	4.73	4.77
					残存率 (%)	100.0	99.9	100.2	100.0	100.4	100.5	100.1
	大塚生食注 [大塚製薬工場] 500mL	1 袋	②	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	5.82	5.84	5.87	5.91	5.91	5.90	5.99
					残存率 (%)	100.0	101.9	102.4	102.2	102.4	102.3	102.2

残存率 (%) : オキシコドンの配合直後 (開始時) の含量に対する比率

表 5 配合変化試験の結果：組織細胞機能用医薬品・病原生物に対する医薬品

分類	薬剤名		配合方法	保存条件	試験項目	保存期間			
	販売名 [会社名]	配合量				開始時	6 時間	24 時間	48 時間
組織細胞機能用医薬品	ヒベルナ注 25mg [田辺三菱製薬]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	5.50	5.51	5.45	4.29
					残存率 (%)	100.0	100.4	101.1	110.8
					表示含量 (%)	84.1	84.4	85.0	93.2
					性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	5.55	5.54	5.51	5.48
病原生物に対する医薬品	塩酸バンコマイシン点滴静注用 0.5g [塩野義製薬]	1 瓶	③	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	3.69	3.69	3.71	3.75
					残存率 (%)	100.0	100.0	100.0	100.0
	フルマリン静注用 1g [塩野義製薬]	1 瓶	③	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液
					pH	4.91	5.04	5.20	5.48
					残存率 (%)	100.0	100.0	100.0	99.8
メロペン点滴用バイアル 0.5g [大日本住友製薬]	1 Va	③	室内散光	性状	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	微黄色澄明の液	
				pH	7.77	7.78	7.73	7.66	
				残存率 (%)	100.0	99.7	99.6	99.0	

残存率 (%)：オキシコドンの配合直後（開始時）の含量に対する比率

表示含量 (%)：オキシコドンの配合直後の含量が 90.0%未満のものについて記載

a：バイアル

表 6 配合変化試験の結果：治療を主目的としない医薬品・麻薬

分類	薬剤名		配合方法	保存条件	試験項目	保存期間			
	販売名 [会社名]	配合量				開始時	6 時間	24 時間	48 時間
ない 治療を 目的とし ない 医薬品	大塚蒸留水 (100mL) [大塚製薬工場]	1 本	⑦	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	5.09	5.09	5.13	5.13
					残存率 (%)	100.0	99.3	99.9	99.9
麻薬	ナルベイン注 2mg [第一三共プロファーマ]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.33	4.34	4.34	4.34
					残存率 (%)	100.0	99.9	99.9	100.2
	ナルベイン注 20mg [第一三共プロファーマ]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.22	4.23	4.23	4.21
					残存率 (%)	100.0	100.0	100.2	100.1
	モルヒネ塩酸塩注射液 50mg「第一三共」 [第一三共プロファーマ]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.18	4.17	4.22	4.20
					残存率 (%)	100.0	100.1	100.0	100.1
	フェンタニル注射液 0.25mg「第一三共」 [第一三共プロファーマ]	1 管	①	室内散光	性状	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液	無色澄明の液
					pH	4.83	4.84	4.87	4.85
					残存率 (%)	100.0	100.1	100.0	100.3

残存率 (%)：オキシコドンの配合直後（開始時）の含量に対する比率

〔文献請求先及び問い合わせ先〕

第一三共株式会社 製品情報センター

〒103-8426 東京都中央区日本橋本町 3-5-1

TEL:0120-065-132 (がん・医療用麻薬専用)