スイッチ OTC 医薬品の候補成分の成分情報等シート

１．候補成分に関連する事項

候補成分の情報	成分名 （一般名）	セレコキシブ
	スイッチ OTC とした際の効能・効果	各種鎮痛
	OTC としてのニーズ	ロキソプロフェンより消化管潰瘍を起こしにくいから。 1 日 2 回の服用で良いから
	OTC 化された際の使われ方	—
候補成分に対する医療用医薬品の情報	販売名	セレコックス錠 100mg、セレコックス錠 200mg （投与経路：経口） （剤形：錠剤（素錠））
	効能・効果	○下記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、腱・腱鞘炎 ○手術後、外傷後並びに抜歯後の消炎・鎮痛
	用法・用量	＜関節リウマチ＞ 通常、成人にはセレコキシブとして 1 回 100～200mg を 1 日 2 回、朝・夕食後に経口投与する。 ＜変形性関節症、腰痛症、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群、腱・腱鞘炎＞ 通常、成人にはセレコキシブとして 1 回 100mg を 1 日 2 回、朝・夕食後に経口投与する。 ＜手術後、外傷後並びに抜歯後の消炎・鎮痛＞ 通常、成人にはセレコキシブとして初回のみ 400mg、2 回目以降は 1 回 200mg として 1 日 2 回経口投与する。なお、投与間隔は 6 時間以上あけること。 頓用の場合は、初回のみ 400mg、必要に応じて以降は 200mg を 6 時間以上あけて経口投与する。ただし、1 日 2 回までとする。
	会社名	ヴィアトリス製薬合同会社

２．スイッチ OTC 化の妥当性評価にあたっての必要情報

医療用医薬品の特徴・概要	承認年月日	2007 年 1 月 26 日（関節リウマチ、変形性関節症） 2009 年 6 月 17 日（腰痛症、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群、腱・腱鞘炎の効能追加） 2011 年 12 月 22 日（手術後、外傷後並びに抜歯後の消炎・鎮痛の効能追加）
	再審査期間	関節リウマチ、変形性関節症： 2007 年 1 月 26 日～2015 年 1 月 25 日（8 年間） 腰痛症、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群、腱・腱鞘炎： 2009 年 6 月 17 日～2015 年 1 月 25 日 手術後、外傷後並びに抜歯後： 2011 年 12 月 22 日～2015 年 1 月 25 日
	再審査結果通知日	2020 年 3 月 18 日
	再審査結果	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第 14 条第 2 項第 3 号（承認拒否事由）イからハまでのいずれにも該当しない。
	開発の経緯（インタビューフォーム[1)]等より）	セレコキシブは、1992 年に米国サール社（現米国ファイザー社）で合成された、世界初のコキシブ系の非ステロイド性消炎・鎮痛剤（NSAIDs）である。 1991 年、シクロオキシゲナーゼ（COX）は、体内のほとんどの正常組織に広く存在する COX-1（構成酵素）と、炎症時に主に炎症組織で誘導される COX-2（誘導酵素）の 2 種類が存在することが明らかになった。そこで、COX-2 を選択的に阻害することで既存の NSAIDs と同様の消炎・鎮痛効果を有しつつ、消化管障害等の副作用が既存の NSAIDs よりも少ない薬剤の開発が期待されてきた。 セレコキシブは、この COX-2 をターゲットとした分子設計に基づくドラッグデザインにより初めて創薬され、COX-1 よりも COX-2 への阻害活性が高いことが示された（*in vitro*、ヒト組換え酵素）。また、既存の NSAIDs と同等の消炎・鎮痛作用を示す一方、消化管及び血小板に対する影響は既存の NSAIDs よりも少ないことが確認された（ラット）。 本邦においては、1995 年 10 月より第 I 相試験が開始され、1996 年 4 月から山之内製薬（現アステラス製薬）と日本モンサント（現ファイザー）が共同開発を実施し、関節リウマチ、変形性関節症に対する臨床的有用性が認められたことから、2007 年 1 月に承認された。また、2009 年 6 月には腰痛症、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群、腱・腱鞘炎、さ

		らに 2011 年 12 月には、手術後、外傷後並びに抜歯後の消炎・鎮痛の効能・効果が追加承認された。米国では変形性関節症・関節リウマチ・若年性関節リウマチ・強直性脊椎炎の徴候及び症状の軽減、急性疼痛管理、原発性月経困難症、欧州連合諸国では変形性関節症、関節リウマチにおける症状軽減の承認を取得している。
	治療学的・製剤学的特性（インタビューフォーム[1]等より）	＜治療学的特性＞ COX-2 をターゲットにドラッグデザインした、世界初のコキシブ系 NSAIDs である。 (1)炎症時に誘導される COX-2 を選択的に阻害する（ラット）。 (2)下記の消炎・鎮痛に優れた有効性を示す。 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、腱・腱鞘炎、手術後、外傷後並びに抜歯後の消炎・鎮痛 (3)健康成人対象の国内製造販売後臨床試験（プラセボ対照無作為化二重盲検比較試験）の結果、投与 2 週後の胃・十二指腸潰瘍発現率（内視鏡所見）はセレコキシブ 100mg 1 日 2 回投与で 1.4%（1/74 例）、対照薬で 27.6%（21/76 例）、プラセボで 2.7%（1/37 例）であった。 また、関節リウマチ患者の海外臨床試験では、投与 12 週後の内視鏡下における胃・十二指腸潰瘍発現率は、100mg 1 日 2 回投与群で 6%（9/148 例）、200mg 1 日 2 回投与群で 4%（6/145 例）であった。 (4)国内臨床試験では、安全性評価症例における臨床検査値異常を含む副作用発現率は以下のとおりであった。 ・関節リウマチ及び変形性関節症患者：24.6%（426/1,734 例）（承認時：2007 年 1 月） ・腰痛症、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群及び腱・腱鞘炎患者：34.6%（451/1,304 例）（効能・効果追加時：2009 年 6 月） ・手術後患者、外傷後患者及び抜歯後患者：13.1%（113/861 例）（効能・効果追加時：2011 年 12 月）
	臨床での使われ方[2),3)]	慢性疼痛治療において、運動器疼痛に対し使用することを強く推奨されている。変形性膝関節症の管理において内服薬による薬物療法として NSAIDs の使用を推奨されているが、膝以外にも変形性関節症を認め、軽度合併症のある場合には特に COX-2 選択性の高い NSAIDs が推奨される。 また、併存疾患がない場合、高齢者の変形性膝関節症の薬

<table>
<tr><td></td><td></td><td>物療法の第一選択として、アセトアミノフェン、NSAIDs 外用薬、非選択的 NSAIDs 内服薬、ヒアルロン酸関節内注射とともに COX-2 選択的阻害薬が推奨される。</td></tr>
<tr><td></td><td>安全性に関する情報（添付文書[4]より）</td><td>＜副作用＞
<table>
<tr><th>重大な副作用</th><th>高頻度（5%以上）の副作用</th></tr>
<tr><td>ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）
消化性潰瘍（0.2%）、消化管出血（0.1%未満）、消化管穿孔（頻度不明）
心筋梗塞、脳卒中（いずれも頻度不明）
心不全、うっ血性心不全（いずれも頻度不明）
肝不全、肝炎（いずれも頻度不明）、肝機能障害（0.1%未満）、黄疸（頻度不明）
再生不良性貧血、汎血球減少症、無顆粒球症（いずれも頻度不明）
急性腎障害、間質性腎炎（いずれも頻度不明）
中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis : TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）、多形紅斑、急性汎発性発疹性膿疱症、剥脱性皮膚炎（いずれも頻度不明）
間質性肺炎（頻度不明）</td><td>β_2-マイクログロブリン増加</td></tr>
</table></td></tr>
<tr><td></td><td>禁忌・注意事項（添付文書[4]より）</td><td>＜警告＞
外国において、COX-2 選択的阻害剤等の投与により、心筋梗塞、脳卒中等の重篤で場合によっては致命的な心血管系血栓塞栓性事象のリスクを増大させる可能性があり、これらのリスクは使用期間とともに増大する可能性があると報告されている。
＜禁忌＞
1.　本剤の成分又はスルホンアミドに対し過敏症の既往歴</td></tr>
</table>

		のある患者 2. 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。］ 3. 消化性潰瘍のある患者［消化性潰瘍を悪化させるおそれがある。］ 4. 重篤な肝障害のある患者 5. 重篤な腎障害のある患者 6. 重篤な心機能不全のある患者［プロスタグランジン合成阻害作用に基づくナトリウム・水分貯留傾向があるため心機能を悪化させるおそれがある。］ 7. 冠動脈バイパス再建術の周術期患者［外国において、類薬で心筋梗塞及び脳卒中の発現が増加するとの報告がある。］ 8. 妊娠末期の女性 ＜重要な基本的注意＞ 1. 本剤を使用する場合は、有効最小量を可能な限り短期間投与することに留め、長期にわたり漫然と投与しないこと。 2. 本剤の投与により、心筋梗塞、脳卒中等の重篤で場合によっては致命的な心血管系血栓塞栓性事象が発現するおそれがあるので、観察を十分に行い、これらの徴候及び症状の発現には十分に注意すること。 3. 本剤には血小板に対する作用がないので、心血管系疾患予防の目的でアスピリンの代替薬として使用しないこと。抗血小板療法を行っている患者については、本剤投与に伴い、その治療を中止してはならない。 4. 国内で患者を対象に実施した臨床試験ではCOX-2に対して選択性の高い本剤と選択性の低い非ステロイド性消炎・鎮痛剤による消化管の副作用発現率に差は認められなかった。特に、消化管障害発生のリスクファクターの高い患者への投与に際しては副作用の発現に十分な観察を行うこと。 5. 肝不全、肝炎、AST、ALT、ビリルビン等の上昇、黄疸の発現が報告されているので、定期的に肝機能検査を行うなど観察を十分に行うこと。 6. 急性腎障害、間質性腎炎等の重篤な腎障害の発現が報告されているので、定期的に腎機能検査を行うなど観察を十分に行うこと。

		7.　本剤の投与により、TEN、Stevens-Johnson 症候群等の重篤で場合によっては致命的な皮膚症状が発現するおそれがあり、多くの場合、これらの事象は投与開始後 1 カ月以内に発現しているので、治療初期には特に注意すること。 8.　慢性疾患（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。 ・定期的あるいは必要に応じて臨床検査（尿検査、血液検査、腎機能検査、肝機能検査、心電図検査及び便潜血検査等）を行うこと。 ・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。また、薬物療法以外の療法も考慮すること。 9.　急性疾患（手術後、外傷後並びに抜歯後の消炎・鎮痛）に対し本剤を用いる場合には、次の事項を考慮すること。 ・急性炎症及び疼痛の程度を考慮し、投与すること。 ・原則として長期投与を避けること。 ・原因療法があればこれを行い、本剤を漫然と投与しないこと。 ・初回の投与量が 2 回目以降と異なることに留意し、患者に対し服用方法について十分説明すること。 10.　本剤で報告されている薬理作用により、感染症を不顕性化するおそれがあるので、感染症の発現に十分に注意し慎重に投与すること。 11.　浮動性めまい、回転性めまい、傾眠等が起こることがあるので、自動車の運転等危険を伴う作業に従事する場合には注意させること。 ＜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 1.1　心血管系疾患又はその既往歴のある患者（冠動脈バイパス再建術の周術期患者を除く） 1.2　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） 水、ナトリウムの貯留が起こる可能性があり、心機能障害を悪化させるおそれがある。 1.3　高血圧症のある患者 水、ナトリウムの貯留が起こる可能性があり、血圧を上昇させるおそれがある。

		1.4　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。 1.5　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、慎重に投与すること。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又は効果としているが、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。 1.6　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。 2.　腎機能障害患者 2.1　重篤な腎障害のある患者 投与しないこと。腎障害を悪化させるおそれがある。 2.2　腎障害又はその既往歴のある患者（重篤な腎障害のある患者を除く） 腎血流量低下及び水、ナトリウムの貯留が起こる可能性があり、腎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 3.1　重篤な肝障害のある患者 投与しないこと。肝障害を悪化させるおそれがある。 3.2　肝障害又はその既往歴のある患者（重篤な肝障害のある患者を除く） 用量を減らすなど慎重に投与すること。血中濃度が高くなるとの報告がある。 5.　妊婦 5.1　妊娠末期の女性 投与しないこと。妊娠末期のマウス及びヒツジへの投与において、胎児の動脈管収縮が報告されている。 5.2　妊婦（妊娠末期を除く）又は妊娠している可能性のある女性 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。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こと。COX 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。COX 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。培養細胞を用いた染色体異常試験において、細胞毒性が認められる濃度で染色体の数的異常（核内倍加細胞の増加）が、生殖発生毒性試験で着床後死亡数や死産の増加、横隔膜ヘルニア、胎児体重減少等が認められている。またラットにおいて本剤が胎児に移行することが報告されている。 6. 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こと。ヒト母乳中への移行が報告されている。 7. 小児等 小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。 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いる。 ＜相互作用＞ 本剤は、主として薬物代謝酵素 CYP2C9 で代謝される。また、本剤は CYP2D6 の基質ではないが、CYP2D6 の阻害作用を有する。
	習慣性、依存性について	該当なし
	毒薬、劇薬等への該当性について	劇薬
推定使用者数等	変形性膝関節症は約 800 万人が疼痛を有しており、X 線学的な関節症変化は約 2,500 万人に存在し、40 歳以上での有病率が約 55%、有症状者が 1,800 万人に達するといわれている [4)]。 腰痛：2,800 万人 [5)]、肩こり：2,500 万人 [6)]	
同種同効薬・類薬のスイッチ OTC 化の状況について	経口投与する COX-2 選択性の高い NSAIDs の「メロキシン」（一般名：メロキシカム）のスイッチ OTC 化が 2025 年に承認された。その効能・効果は、「関節痛・腰痛・肩こり痛の鎮痛」である。	
関連するガイドライン等	変形性膝関節症診療ガイドライン 2023（日本整形外科学会） 慢性疼痛治療ガイドライン（「慢性の痛み診療・教育の基盤となるシステム構築に関する研究」研究班）	
その他		

３．候補成分の欧米等での承認状況

<table>
<tr><td>欧米等6か国での承認状況</td><td>一般用医薬品としての承認状況
☐英国　☐仏国　☐独国　☐米国　☐加国　☑豪州
〔欧米等 6 か国での承認内容〕
<table>
<tr><td></td><td colspan="2">欧米各国での承認内容</td></tr>
<tr><td rowspan="4">英国</td><td>販売名（企業名）</td><td>承認なし</td></tr>
<tr><td>効能・効果</td><td></td></tr>
<tr><td>用法・用量</td><td></td></tr>
<tr><td>備考</td><td></td></tr>
<tr><td rowspan="4">仏国</td><td>販売名（企業名）</td><td>承認なし</td></tr>
<tr><td>効能・効果</td><td></td></tr>
<tr><td>用法・用量</td><td></td></tr>
<tr><td>備考</td><td></td></tr>
<tr><td rowspan="4">独国</td><td>販売名（企業名）</td><td>承認なし</td></tr>
<tr><td>効能・効果</td><td></td></tr>
<tr><td>用法・用量</td><td></td></tr>
<tr><td>備考</td><td></td></tr>
<tr><td rowspan="4">米国</td><td>販売名（企業名）</td><td>承認なし</td></tr>
<tr><td>効能・効果</td><td></td></tr>
<tr><td>用法・用量</td><td></td></tr>
<tr><td>備考</td><td></td></tr>
<tr><td rowspan="4">加国</td><td>販売名（企業名）</td><td>承認なし</td></tr>
<tr><td>効能・効果</td><td></td></tr>
<tr><td>用法・用量</td><td></td></tr>
<tr><td>備考</td><td></td></tr>
<tr><td rowspan="3">豪州</td><td>販売名（企業名）</td><td>CELEBREX RELIEF（Viatris Pty Ltd）[7)]</td></tr>
<tr><td>効能・効果</td><td>1.　腰痛や足首の捻挫などの筋肉や関節の損傷
2.　月経痛</td></tr>
<tr><td>用法・用量</td><td>1.　初日は 1 回 2 カプセルを服用し、その後は必要に応じて 1 日 1～2 回、1 カプセルを服用。
2.　初日は 1 回 2 カプセル、または分割して服用し、その後は 1 日 1 回 1 カプセルを服用。必要に応じて、1 カプセルを追加服用する。
※いずれの効能・効果においても最大 5 日までの服用。</td></tr>
</table></td></tr>
</table>

	備考	（S3）Pharmacist Only Medicine

医療用医薬品としての承認状況

☑ 英国　☑ 仏国　☑ 独国　☑ 米国　☑ 加国　☑ 豪州

〔備考〕

食品、サプリメント等としての販売状況

☐ 英国　☐ 仏国　☐ 独国　☐ 米国　☐ 加国　☐ 豪州

〔備考〕

参考資料一覧

1） セレコックス錠 100mg／セレコックス錠 200mg　インタビューフォーム 2024 年 10 月改訂(第 4 版)
2） 慢性疼痛治療ガイドライン（「慢性の痛み診療・教育の基盤となるシステム構築に関する研究」研究班）
3） 変形性膝関節症診療ガイドライン 2023（日本整形外科学会）
4） セレコックス錠 100mg／セレコックス錠 200mg　添付文書 2025 年 7 月改訂（第 6 版）
5） 厚労省研究班：主任研究者 吉村典子・東大病院,2013
6） 厚生労働省　平成 22 年　国民生活基礎調査
7） TGA. “ARTG　ID : 463627　Concumer Medicines Infrmation https://www.ebs.tga.gov.au/ebs/picmi/picmirepository.nsf/pdf?OpenAgent&id=CP-2024-CMI-03020-1&d=202104131016933,（参照 2025-7-8）