

## 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

経皮吸収型鎮痛・抗炎症剤

ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤

**ロキソプロフェンNa パップ 100mg「テイコク」**  
**Loxoprofen Na Paps 100mg「TEIKOKU」**

|                                 |   |
|---------------------------------|---|
| 剤形                              | パップ剤  |
| 製剤の規制区分                         | 該当しない   |
| 規格・含量                           | 1枚 10cm×14cm（膏体質量 10g）中<br>日局 ロキソプロフェンナトリウム水和物 113.4mg（無水物として 100mg）含有  |
| 一般名                             | 和名：ロキソプロフェンナトリウム水和物（JAN）<br>洋名：Loxoprofen Sodium Hydrate（JAN）   |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載・<br>販売開始年月日 | 製造販売承認年月日：2013年2月15日<br>薬価基準収載年月日：2016年6月17日<br>販売開始年月日：2016年9月16日  |
| 製造販売（輸入）・<br>提携・販売会社名           | 製造販売元：帝國製薬株式会社  |
| 医薬情報担当者連絡先                      |   |
| 問い合わせ窓口                         | 帝國製薬株式会社 医薬営業部 製品情報室<br>TEL：0120-189-567<br>受付時間：9時～17時30分（土、日、祝日、会社休業日を除く）<br>医療関係者向けホームページ<br><a href="https://www.teikoku.co.jp/medical/">https://www.teikoku.co.jp/medical/</a> |

本 IF は 2024 年 1 月改訂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。

# 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て、「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、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に記載する項目及び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利用者自らが整備するとともに、最新の添付文書をPMDAの医療用医薬品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」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

|                              |           |  |           |
|------------------------------|-----------|--|-----------|
| <b>I. 概要に関する項目</b> .....     | <b>1</b>  | <b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....                 | <b>11</b> |
| 1. 開発の経緯 .....               | 1         | 1. 血中濃度の推移 .....                             | 11        |
| 2. 製品の治療学的特性 .....           | 1         | 2. 薬物速度論的パラメータ .....                         | 11        |
| 3. 製品の製剤学的特性 .....           | 1         | 3. 母集団（ポピュレーション）解析 .....                     | 12        |
| 4. 適正使用に関して周知すべき特性 .....     | 1         | 4. 吸収 .....                                  | 12        |
| 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 .....   | 1         | 5. 分布 .....                                  | 12        |
| 6. RMP の概要 .....             | 1         | 6. 代謝 .....                                  | 12        |
| <b>II. 名称に関する項目</b> .....    | <b>2</b>  | 7. 排泄 .....                                  | 13        |
| 1. 販売名 .....                 | 2         | 8. トランスポーターに関する情報 .....                      | 13        |
| 2. 一般名 .....                 | 2         | 9. 透析等による除去率 .....                           | 13        |
| 3. 構造式又は示性式 .....            | 2         | 10. 特定の背景を有する患者 .....                        | 13        |
| 4. 分子式及び分子量 .....            | 2         | 11. その他 .....                                | 13        |
| 5. 化学名（命名法）又は本質 .....        | 2         | <b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .            | <b>15</b> |
| 6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....      | 2         | 1. 警告内容とその理由 .....                           | 15        |
| <b>III. 有効成分に関する項目</b> ..... | <b>3</b>  | 2. 禁忌内容とその理由 .....                           | 15        |
| 1. 物理化学的性質 .....             | 3         | 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 .....                  | 15        |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....   | 3         | 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 .....                  | 15        |
| 3. 有効成分の確認試験法、定量法 .....      | 3         | 5. 重要な基本的注意とその理由 .....                       | 15        |
| <b>IV. 製剤に関する項目</b> .....    | <b>4</b>  | 6. 特定の背景を有する患者に関する注意 .....                   | 15        |
| 1. 剤形 .....                  | 4         | 7. 相互作用 .....                                | 16        |
| 2. 製剤の組成 .....               | 4         | 8. 副作用 .....                                 | 17        |
| 3. 添付溶解液の組成及び容量 .....        | 5         | 9. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....                        | 17        |
| 4. 力価 .....                  | 5         | 10. 過量投与 .....                               | 17        |
| 5. 混入する可能性のある夾雑物 .....       | 5         | 11. 適用上の注意 .....                             | 17        |
| 6. 製剤の各種条件下における安定性 .....     | 5         | 12. その他の注意 .....                             | 17        |
| 7. 調製法及び溶解後の安定性 .....        | 5         | <b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....                 | <b>18</b> |
| 8. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....   | 5         | 1. 薬理試験 .....                                | 18        |
| 9. 溶出性 .....                 | 6         | 2. 毒性試験 .....                                | 18        |
| 10. 容器・包装 .....              | 6         | <b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....                  | <b>19</b> |
| 11. 別途提供される資材類 .....         | 6         | 1. 規制区分 .....                                | 19        |
| 12. その他 .....                | 6         | 2. 有効期間 .....                                | 19        |
| <b>V. 治療に関する項目</b> .....     | <b>7</b>  | 3. 包装状態での貯法 .....                            | 19        |
| 1. 効能又は効果 .....              | 7         | 4. 取扱い上の注意 .....                             | 19        |
| 2. 効能又は効果に関連する注意 .....       | 7         | 5. 患者向け資材 .....                              | 19        |
| 3. 用法及び用量 .....              | 7         | 6. 同一成分・同効薬 .....                            | 19        |
| 4. 用法及び用量に関連する注意 .....       | 7         | 7. 国際誕生年月日 .....                             | 19        |
| 5. 臨床成績 .....                | 7         | 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、<br>薬価基準収載年月日、販売開始年月日 ... | 19        |
| <b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....  | <b>10</b> | 9. 効能又は効果追加、用法及び用量<br>変更追加等の年月日及びその内容 .....  | 19        |
| 1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 .....  | 10        | 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日<br>及びその内容 .....         | 19        |
| 2. 薬理作用 .....                | 10        | 11. 再審査期間 .....                              | 20        |
|                              |           | 12. 投薬期間制限に関する情報 .....                       | 20        |
|                              |           | 13. 各種コード .....                              | 20        |
|                              |           | 14. 保険給付上の注意 .....                           | 20        |

|   |           |
|---|-----------|
| <b>XI. 文献</b> .....                       | <b>21</b> |
| 1. 引用文献 .....                             | 21        |
| 2. その他の参考文献 .....                         | 21        |
| <b>XII. 参考資料</b> .....                    | <b>22</b> |
| 1. 主な外国での発売状況 .....                       | 22        |
| 2. 海外における臨床支援情報 .....                     | 22        |
| <b>XIII. 備考</b> .....                     | <b>23</b> |
| 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を<br>行うにあたっての参考情報 ..... | 23        |
| 2. その他の関連資料 .....                         | 23        |

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

ロキソプロフェンナトリウム水和物は、フェニルプロピオン酸系の非ステロイド性消炎鎮痛薬で、生体内で活性代謝物 *trans*-OH 体に変換され、抗炎症作用、解熱作用、鎮痛作用を示す<sup>1)</sup>。

ロキソプロフェン Na パップ 100mg 「テイコク」は、帝國製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（2005 年 3 月 31 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、生物学的同等性試験、安定性試験を実施し、2013 年 2 月に承認を取得、2016 年 9 月に販売を開始した。

## 2. 製品の治療学的特性

(1) 本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していないが、ロキソプロフェンナトリウム水和物貼付剤の副作用として、そう痒、紅斑、接触性皮膚炎等の皮膚症状、胃不快感等の消化管症状、ALT 上昇、AST 上昇等の臨床検査値異常等が報告されている。

(「VIII. 8. (2) その他の副作用」の項参照)

(2) 重大な副作用としてショック、アナフィラキシー（血圧低下、蕁麻疹、喉頭浮腫、呼吸困難等）があらわれることがある。（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

## 3. 製品の製剤学的特性

(1) 本剤は、ロキソプロフェンナトリウム水和物含有のパップ剤であり、1 日 1 回、患部に貼付する経皮吸収型鎮痛・抗炎症剤である。（「IV. 治療に関する項目」の項参照）

(2) 本剤は、水を含む基剤を用いた外用貼付剤である。

(「IV. 1. (1) 剤形の区別、(2) 外観及び性状」の項参照)

(3) 誤投与・貼り違い防止のための認識性向上の取り組みとして、薬袋の裏面にライナー（フィルム）の剥がし方と使用・保管の注意事項の説明を表示している。

## 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材、最適使用推進ガイドライン等 | 有無 |
| RMP                      | 無  |
| 追加のリスク最小化活動として作成されている資材  | 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             | 無  |

## 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

ロキソプロフェン Na パップ 100mg 「テイコク」

#### (2) 洋名

Loxoprofen Na Paps 100mg 「TEIKOKU」

#### (3) 名称の由来

「有効成分名」 + 「剤形」 + 「屋号」 より命名

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

ロキソプロフェンナトリウム水和物（JAN）

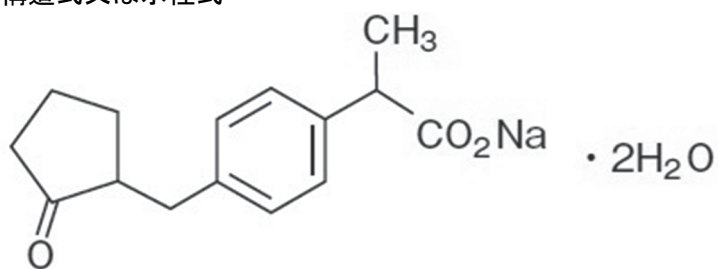
#### (2) 洋名（命名法）

Loxoprofen Sodium Hydrate（JAN）

#### (3) ステム

-profen：イブプロフェン誘導体

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>15</sub>H<sub>17</sub>NaO<sub>3</sub> · 2H<sub>2</sub>O

分子量：304.31

### 5. 化学名（命名法）又は本質

Monosodium 2-{4-[(2-oxocyclopentyl)methyl]phenyl}propanoate dihydrate (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

---

### 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～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

水又はメタノールに極めて溶けやすく、エタノール（95）に溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

##### (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

水溶液（1→20）は旋光性を示さない。

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

日局「ロキソプロフェンナトリウム水和物」の確認試験法による<sup>1)</sup>

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）
- (3) ナトリウム塩の定性反応

日局「ロキソプロフェンナトリウム水和物」の定量法による<sup>1)</sup>

液体クロマトグラフィー



## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

貼付剤（パップ剤）

#### (2) 製剤の外観及び性状

|        |  |
|--------|--|
| 販売名    | ロキソプロフェン Na パップ 100mg 「テイコク」                       |
| 1枚の大きさ | 10cm×14cm  |
| 性状     | 白色～淡黄色でハッカ油の芳香を有する膏体を支持体上に均一に展延し、膏体表面をライナーで被覆した貼付剤 |

#### (3) 識別コード

該当しない

#### (4) 製剤の物性

粘着力試験：医薬品製造販売指針（2010）の粘着力試験を行うとき、スチールボール（直径7.9mm）は粘着面で5秒以上停止する。

#### (5) その他

該当資料なし

### 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  | ロキソプロフェン Na パップ 100mg 「テイコク」   |
| 有効成分 | 1枚（膏体質量10g）中 日局 ロキソプロフェンナトリウム水和物 113.4mg<br>（無水物として100mg）  |
| 添加剤  | パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、プロピレングリコール、グリセリン、D-ソルビトール、ハッカ油、アクリル酸メチル・アクリル酸-2-エチルヘキシルコポリマー、ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリアクリル酸、ポリアクリル酸ナトリウム、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、カルメロースナトリウム、エデト酸ナトリウム水和物、酒石酸、酸化チタン、カオリン、その他2成分 |

#### (2) 電解質等の濃度

該当しない

#### (3) 熱量

該当しない

### 3. 添付溶解液の組成及び容量

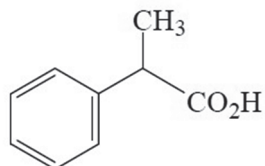
該当しない

### 4. 力価

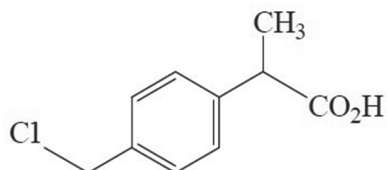
該当しない

### 5. 混入する可能性のある夾雑物<sup>1)</sup>

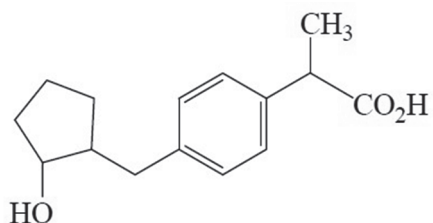
(1)



(2)



(3)



### 6. 製剤の各種条件下における安定性

<長期保存試験>

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、30 ヶ月）の結果、ロキソプロフェン Na パップ 100mg「テイコク」は通常の市場流通下において 2 年 6 ヶ月規格内であることが確認された<sup>2)</sup>。

| 製品名                            | 保存条件             | 保存形態                                    | 保存期間  | 結果               |
|--------------------------------|------------------|---|-------|------------------|
| ロキソプロフェン Na<br>パップ 100mg「テイコク」 | 25±2℃<br>60±5%RH | 遮光・気密容器<br>(紙/アルミニウム箔/ポリエチレン<br>積層フィルム) | 30 ヶ月 | 規格内 <sup>※</sup> |

※：性状、確認試験、純度試験（類縁物質）、形状試験、質量試験、粘着力試験、放出性、含量試験

### 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

### 8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

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

70 枚 (7 枚×10)

350 枚 (7 枚×50)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

内袋：紙・アルミニウム箔・ポリエチレン積層フィルム

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当資料なし

---

## V. 治療に関する項目

---

### 1. 効能又は効果

下記疾患並びに症状の消炎・鎮痛

変形性関節症、筋肉痛、外傷後の腫脹・疼痛

### 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

1日1回、患部に貼付する。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当しない

#### (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

〈変形性関節症〉

国内第Ⅱ相試験

変形性膝関節症患者を対象とした一般臨床試験において、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg を1日1回又は2回（いずれも1回1枚）、2週間投与した結果、最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は、1日1回群 80.0%（44/55例）、1日2回群 79.7%（47/59例）であった。副作用は1日1回群で 4.7%（3/64例）、1日2回群で 6.1%（4/66例）であり、1日1回群の副作用は、紅斑、そう痒症、丘疹、発疹が各 1.6%（1/64例）、1日2回群の主な副作用は、紅斑、そう痒症が各 3.0%（2/66例）であった<sup>3)</sup>。

### 国内第Ⅲ相試験

- (1) 変形性膝関節症患者を対象とした二重盲検試験において、ロキソプロフェンナトリウム錠 180mg/日を対照薬として、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg/日を 4 週間投与した結果、パップ剤 100mg 群の最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 77.9%（67/86 例）であった。副作用はパップ剤 100mg 群で 18.8%（16/85 例）に認められ、主な副作用は、腹部不快感 5.9%（5/85 例）、下痢・軟便、そう痒症が各 3.5%（3/85 例）であった<sup>4)</sup>。
- (2) 変形性膝関節症患者を対象とした非盲検・無作為割付試験において、ケトプロフェンナトリウム貼付剤 60mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg/日を 4 週間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群での最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 72.8%（107/147 例）であった。副作用はロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群で 10.0%（15/150 例）に認められ、主な副作用は、接触皮膚炎、 $\gamma$ -GTP 増加が各 2.7%（4/150 例）、ALT 増加 2.0%（3/150 例）であった<sup>5)</sup>。
- (3) 変形性膝関節症患者を対象とした一般臨床試験において、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg/日を 12~24 週間投与した結果、最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は、73.3%（22/30 例）であった。副作用は 10.0%（3/30 例）に認められ、発現した副作用は、接触皮膚炎、紅斑、皮下出血、そう痒症、発疹が各 3.3%（1/30 例）であった<sup>6)</sup>。

### 〈筋肉痛〉

#### 国内第Ⅲ相試験

- (1) 筋肉痛患者を対象とした二重盲検試験において、ロキソプロフェンナトリウム錠 180mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg/日を 2 週間投与した結果、パップ剤 100mg 群での最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 75.2%（82/109 例）であった。副作用はパップ剤 100mg 群で 9.4%（10/106 例）に認められ、主な副作用は、そう痒症 3.8%（4/106 例）、上腹部痛 2.8%（3/106 例）であった<sup>7)</sup>。
- (2) 筋肉痛患者を対象とした非盲検・無作為割付試験において、インドメタシン貼付剤 140mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg/日を 2 週間投与した結果、ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群での最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 85.7%（102/119 例）であった。副作用はロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 群で 5.0%（6/120 例）に認められ、主な副作用は、そう痒症 1.7%（2/120 例）であった<sup>8)</sup>。

### 〈外傷後の腫脹・疼痛〉

#### 国内第Ⅲ相試験

外傷後の腫脹・疼痛患者を対象とした二重盲検試験において、ロキソプロフェンナトリウム錠 180mg/日を対照薬としてロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg/日を 7 日間投与した結果、パップ剤 100mg 群での最終全般改善度の改善率（「改善」以上の比率）は 98.1%（101/103 例）であった。副作用はパップ剤 100mg 群で 7.8%（8/102 例）に認められ、主な副作用は、そう痒症 2.9%（3/102 例）であった<sup>9)</sup>。

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

該当しない

(7) その他

---

## 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

非ステロイド性消炎鎮痛剤

注意：関連のある化合物の効能・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

##### 作用機序

ロキソプロフェンナトリウム水和物はプロドラッグであり、活性代謝物の *trans*-OH 体が酸性非ステロイド性抗炎症薬としての作用を示す。すなわち、プロスタグランジン生合成の律速酵素であるシクロオキシゲナーゼ (COX) を阻害し、プロスタグランジンの産生を抑制することにより、抗炎症作用、解熱作用、鎮痛作用を現す。構成型 COX (COX-1) と誘導型 COX (COX-2) に対する選択性はない<sup>1)</sup>。

##### 抗炎症作用

ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤をラットに貼付したとき、カラゲニン浮腫（急性炎症モデル）、アジュバント関節炎（慢性炎症モデル）のいずれに対しても有意な抗炎症作用を示した<sup>10)</sup>。

##### 鎮痛作用

ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤をラットに貼付したとき、Randall-Selitto 法（炎症足加圧法）において、鎮痛作用を示した<sup>10)</sup>。また、ラットのアジュバント慢性関節炎疼痛に鎮痛作用を示した<sup>11)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (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

##### 血漿中濃度

健康な成人男子 14 例の背部にロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg (2 枚) を 1 日 1 回、5 日間反復投与したところ、ロキソプロフェン及び *trans*-OH 体 (活性代謝物) は投与開始後速やかに血漿中に検出され、投与期間とともに緩やかに増加し、投与開始後 4~5 日目に経口剤投与時と比較し低い濃度で定常状態となり、投与終了後は定量下限未満へと速やかに消失した<sup>12)</sup>。

##### ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg (2 枚) の 5 日間反復投与時の血漿中濃度

|                            | C <sub>ss</sub> (ng/mL) | AUC <sub>0~∞</sub> (ng・hr/mL) | MRT (hr) |
|----------------------------|-------------------------|-------------------------------|----------|
| ロキソプロフェン                   | 54.9±19.3               | 5,281±1,704                   | 72.2±4.8 |
| <i>trans</i> -OH 体 (活性代謝物) | 23.5±9.5                | 2,278±863                     | 73.1±4.9 |

n=14、Mean±SD

#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

### 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

該当資料なし

#### (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  
該当資料なし

- (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

ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 3.5cm<sup>2</sup> (<sup>14</sup>C-ロキソプロフェンを含む) をラット背部皮膚に 24 時間貼付したとき、投与部位直下の骨格筋中放射能濃度は非投与部骨格筋濃度の 3.6~24 倍高く、*trans*-OH 体（活性代謝物）の生成が確認された<sup>13)</sup>。

- (6) 血漿蛋白結合率  
血漿中での未変化体及び *trans*-OH 体のたん白結合率はそれぞれ 97%、93%である<sup>1)</sup>。

### 6. 代謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路  
該当資料なし
- (2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率  
該当資料なし

(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

活性代謝物：*trans*-OH 体<sup>1)</sup>

7. 排泄

尿中排泄

健康な成人男子 14 例の背部にロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg (2 枚) を 1 日 1 回、5 日間反復投与したところ、ロキソプロフェン、*trans*-OH 体 (活性代謝物) 及び *cis*-OH 体の 1 日尿中排泄量は投与開始 24 時間以降ほぼ一定で、投与開始から投与終了後 48 時間までの総累積排泄率は 2.67%であった<sup>12)</sup>。

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

該当資料なし

11. その他

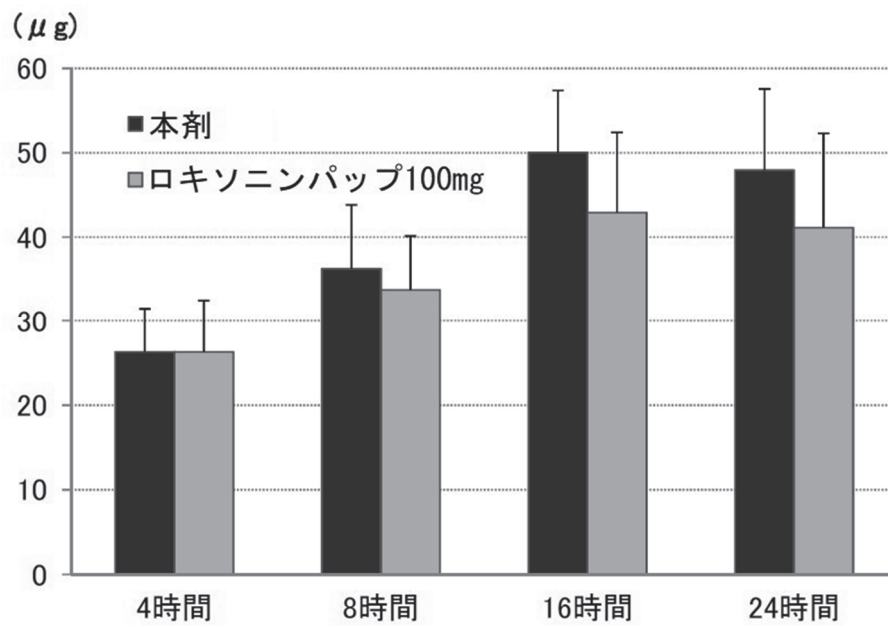
生物学的同等性試験

「局所皮膚適用製剤の後発医薬品のための生物学的同等性試験ガイドライン」(平成 15 年 7 月 7 日付薬食審査発第 0707001 号。平成 18 年 11 月 24 日付薬食審査発第 1124004 号により、一部改正)

(以下、「BE 試験 GL」という) に示されている皮膚薬物動態学的試験の手法に従って、ロキソプロフェン Na パップ 100mg 「テイコク」(以下、本剤) とロキソニンパップ 100mg を単回貼付・除去した後の角層に存在する薬物量を定量することにより生物学的同等性を評価した。

被験者 12 例について各被験者の背部皮膚を 6 つの部位に分け、本剤及びロキソニンパップ 100mg (各製剤 2.5cm×2.5cm に裁断したもの) をそれぞれ 3 部位に、1 部位につき各 4 枚ずつ割付表に従って貼付した。貼付 4、8、16 及び 24 時間後に各部位から 1 枚ずつ薬剤を除去した後に角層を剥離 (採取) し、高速液体クロマトグラフィーにより角層内ロキソプロフェンナトリウム量を測定した。各時点の角質内ロキソプロフェンナトリウム量から、両製剤ともに貼付後 16 時間で定常状態に達したと考えられたことから、生物学的同等性を評価するための治験薬適用時間は 16 時間及び 24 時間が適当であると判断し、「BE 試験 GL」に従い、上記 2 時点のデータを生物学的同等性の検証に用いることにした。

対数変数値における本剤とロキソニンパップ 100mg の平均値の差の 90%信頼区間は 16 時間貼付、24 時間貼ともに生物学的同等性の判定基準 ( $\log(0.70) \sim \log(1.43)$ ) の範囲内であったことから、両製剤は生物学的に同等であると判定された<sup>14)</sup>。



平均角層内ロキソプロフェンナトリウム量 (平均値±標準偏差、n=12)

## 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 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 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 [喘息発作を誘発することがある。] [9.1.1 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

設定されていない

### 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 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。

8.2 慢性疾患（変形性関節症等）に対し本剤を用いる場合には薬物療法以外の療法も考慮すること。

### 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 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）  
病態を悪化させることがある。 [2.2 参照]

##### 9.1.2 皮膚感染症のある患者

感染による炎症に対して用いる場合には適切な抗菌剤又は抗真菌剤を併用し、観察を十分行い慎重に使用すること。皮膚の感染症を不顕性化するおそれがある。

#### (2) 腎機能障害患者

設定されていない

#### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

#### (4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

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使用すること。他の非ステロイド性消炎鎮痛剤の外皮用剤を妊娠後期の女性に使用し、胎児動脈管収縮が起きたとの報告がある。また、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。

(6) 授乳婦

設定されていない

(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

65 歳以上の高齢者に使用する場合は、貼付部の皮膚の状態に注意すること。ロキソプロフェンナトリウム水和物パップ剤 100mg 及びテープ剤 50mg・100mg の製造販売後調査の結果、65 歳以上の高齢者での副作用の発現率（3.7%、1,738 例中 65 例）は、65 歳未満（1.7%、1,300 例中 22 例）と比較して有意に高く、主な副作用が貼付部の皮膚症状であった。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

## 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使用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（頻度不明）、アナフィラキシー（頻度不明）

ショック、アナフィラキシー（血圧低下、蕁麻疹、喉頭浮腫、呼吸困難等）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

|     | 1～3%未満           | 0.5～1%未満                     | 0.5%未満     | 頻度不明                 |
|-----|------------------|------------------------------|------------|----------------------|
| 皮膚  | そう痒、紅斑、接触性皮膚炎、皮疹 |                              |            | 皮下出血、皮膚刺激、色素沈着、水疱、腫脹 |
| 消化器 |                  | 胃不快感                         | 上腹部痛、下痢・軟便 |                      |
| 肝臓  |                  | AST上昇、ALT上昇、 $\gamma$ -GTP上昇 |            |                      |
| その他 |                  |                              |            | 浮腫                   |

## 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

設定されていない

## 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 損傷皮膚及び粘膜に使用しないこと。
- 14.1.2 湿疹又は発疹の部位に使用しないこと。

## 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」の項参照

(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

皮膚一次刺激性試験

本剤、本剤の基材及びロキソニンパップ 100mg (各製剤 直径 20mm) を、日本白色種雄性ウサギの両腹側部に設けた健常皮膚と損傷皮膚の投与部位にそれぞれ密閉貼付し、24 時間後に除去後、刺激性を評価した。その結果、いずれも弱い刺激物に分類され、本剤はロキソニンパップ 100mg と同程度の皮膚刺激性を有していると考えられた<sup>15)</sup>。

(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：該当しない

有効成分：劇薬

2. 有効期間

2年6ヵ月

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

内袋開封後はチャックを閉めて保存すること。

5. 患者向け資材

くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ロキソニン錠 60mg、ロキソニン細粒 10%、ロキソニンパップ 100mg、  
ロキソニンテープ 50mg・100mg、ロキソニンゲル 1% 等

同 効 薬：ケトプロフェン貼付剤、インドメタシン貼付剤、フェルビナク貼付剤、  
フルルビプロフェン貼付剤 等

7. 国際誕生年月日

1986年3月1日

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

| 販売名                                | 製造販売承認年月日  | 承認番号             | 薬価基準収載年月日  | 販売開始年月日    |
|------------------------------------|------------|------------------|------------|------------|
| ロキソプロフェン Na<br>パップ 100mg<br>「テイコク」 | 2013年2月15日 | 22500AMX00103000 | 2016年6月17日 | 2016年9月16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

該当しない

13. 各種コード

| 販売名                                | 厚生労働省薬価基準<br>収載医薬品コード | 個別医薬品コード<br>(YJコード) | HOT (13桁) 番号                            | レセプト電算処理<br>システム用コード |
|------------------------------------|-----------------------|---------------------|---|----------------------|
| ロキソプロフェン Na<br>パップ 100mg<br>「テイコク」 | 2649735S1150          | 2649735S1150        | 70枚 1250763010101<br>350枚 1250763010102 | 622507601            |

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。

---

## XI. 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) 第十八改正 日本薬局方解説書. 廣川書店 ; 2021 : C-6311-6316
- 2) 帝國製薬株式会社 社内資料 (安定性)
- 3) 菅原幸子ほか : 臨床医薬. 2006 ; 22 (4) : 311-326
- 4) 菅原幸子ほか : 臨床医薬. 2006 ; 22 (5) : 393-409
- 5) 菅原幸子ほか : 臨床医薬. 2007 ; 23 (1) : 55-71
- 6) 変形性膝関節症に対する一般臨床試験 (ロキソニンパップ : 2006年1月23日承認、申請資料概要ト 1-4-6)
- 7) 菅原幸子ほか : 臨床医薬. 2006 ; 22 (5) : 411-426
- 8) 菅原幸子ほか : 臨床医薬. 2007 ; 23 (2) : 127-141
- 9) 菅原幸子ほか : 臨床医薬. 2006 ; 22 (5) : 427-442
- 10) 浜本哲和ほか : 臨床医薬. 2006 ; 22 (3) : 179-186
- 11) ラットにおける鎮痛効果に関する検討 (ロキソニンパップ : 2006年1月23日承認、申請資料概要ホ 2-2)
- 12) 菅原幸子ほか : 臨床医薬. 2006 ; 22 (4) : 279-292
- 13) 松澤孝泰ほか : 臨床医薬. 2006 ; 22 (3) : 187-203
- 14) 帝國製薬株式会社 社内資料 (生物学的同等性)
- 15) 帝國製薬株式会社 社内資料 (皮膚一時刺激性)

### 2. その他の参考文献

特になし

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

---

## 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) 粉碎

該当資料なし

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

### 2. その他の関連資料

ロキソプロフェン Na パップ 100mg 「テイコク」の上手な貼り方

[https://www.teikoku.co.jp/med\\_database/fileviewer/fileview?file\\_class=13&file\\_name=13\\_28\\_dl.pdf](https://www.teikoku.co.jp/med_database/fileviewer/fileview?file_class=13&file_name=13_28_dl.pdf)

製造販売元



帝國製薬株式会社

香川県東かがわ市三本松567番地

2024年2月改訂