

貯法	室温保存 遮光した気密容器に保存
使用期限	包装に表示の使用期限内に 使用すること。

日本標準商品分類番号	872649
------------	--------

承認番号	21800AMZ10004
薬価収載	2006年4月
販売開始	2006年5月
再審査結果	2014年9月

経皮吸収型鎮痛・抗炎症剤

ロキソニン[®]パップ[®]100mg

LOXONIN[®] PAP

ロキソプロフェンナトリウム水和物貼付剤

【禁忌】(次の患者には使用しないこと)

1. 本剤の成分に過敏症の既往歴のある患者
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〔喘息発作を誘発することがある。〕

【組成・性状】

1. 組成

1枚（膏体質量10g）中に次の成分を含有

販売名	有効成分	添加物
ロキソニン パップ100mg	ロキソプロフェン ナトリウム水和物 （日局） 113.4mg （無水物として100mg）	ハッカ油、ポリソルベート80、 酸化チタン、酒石酸、エドト酸 ナトリウム水和物、グリセリン、 カルメロースナトリウム、タルク、 乾燥水酸化アルミニウムゲル、 クロタミトン、ポリアクリ ル酸部分中和物、その他2成分

2. 製剤の性状

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である。

販売名	大きさ	色	におい
ロキソニンパップ100mg	10cm×14cm	白色～淡黄色 （膏体面）	ハッカ油の 芳香

【効能・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

【用法・用量】

1日1回、患部に貼付する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与（次の患者には慎重に使用すること）

気管支喘息の患者〔病態を悪化させることがある。〕

2. 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こと。
- (2) 皮膚の感染症を不顕性化するおそれがあるので、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、観察を十分に行い慎重に使用すること。
- (3) 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。また、患者の状態を十分に観察し、副作用の発現に留意すること。

3. 副作用

安全性評価対象例1,075例中副作用（自他覚症状及び臨床検査値異常）の報告されたものは91例（8.5%）であった。その主なものは、そう痒（2.1%）、紅斑（1.5%）、接触性皮膚炎（1.4%）等の皮膚症状、胃不快感（0.6%）等の消化管症状、ALT（GPT）上昇（0.6%）、AST（GOT）上昇（0.5%）等の臨床検査値異常であった。〔承認時〕

ロキソニンパップ100mg及びロキソニンテープ50mg・100mgにおいて製造販売後調査3,038例中87例（2.9%）に副作用が報告され、主なものは、接触性皮膚炎（1.4%）、そう痒（0.5%）、紅斑（0.4%）等の皮膚症状であった。〔再審査終了時〕

(1) 重大な副作用（頻度不明[※]）

ショック、アナフィラキシー：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ので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には直ちに使用を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて使用を中止するなど適切な処置を行うこと。

	0.5～3%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(GOT)上昇、 ALT(GPT)上昇、 γ-GTP上昇	
その他		浮腫	

〔ロキソニンパップ100mg及びロキソニンテープ50mg・100mgの集計〕

注）自発報告において認められている副作用のため頻度不明。

4. 高齢者への使用

ロキソニンパップ100mg及びロキソニンテープ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かった。主な副作用が貼付部の皮膚症状であったことから、特に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。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への使用

- (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使用する。〔妊娠中の使用に関する安全性は確立していない。〕
 - (2) 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。
- ** (3) 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. 小児等への使用

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない（使用経験が少ない）。

7. 適用上の注意

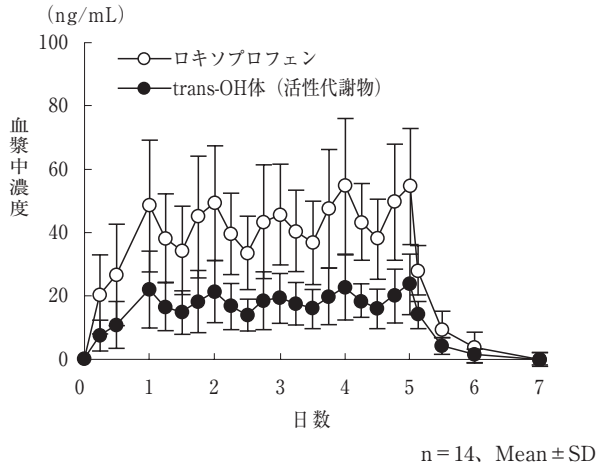
使用部位：

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

【薬物動態】

1. 血漿中濃度¹⁾

健康な成人男子14例の背部に本剤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、投与後4日～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、投与終了後は定量限界未満へと速やかに消失した。



ロキソニンパップ100mg (2枚) 5日間反復投与時の血漿中濃度

項目	C _{ss} (ng/mL)	AUC _{0-∞} (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
trans-OH体 (活性代謝物)	23.5 ± 9.5	2,278 ± 863	73.1 ± 4.9

n = 14, Mean ± SD

2. 尿中排泄¹⁾

健康な成人男子14例の背部に本剤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。

3. 組織移行性²⁾

本剤3.5cm² (¹⁴C-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。

4. 薬物代謝酵素³⁾

ロキソプロフェンナトリウム水和物はヒト肝ミクロソームを用いたin vitro代謝阻害試験において、1日1枚投与時の最高血漿中濃度の1,000倍以上の濃度 (200 μM) でもチトクロームP450各分子種 (CYP1A1/2, 2A6, 2B6, 2C8/9, 2C19, 2D6, 2E1及び3A4) の基質となる種々薬物の代謝に対して影響を与えなかった。

【臨床成績】⁴⁻¹⁰⁾

国内で実施された二重盲検比較試験を含む臨床試験成績の概要は次のとおり。

疾患名	改善率 (改善以上例数/評価例数)
変形性関節症	75.5% (240/318)
筋肉痛	80.7% (184/228)
外傷後の腫脹・疼痛	98.1% (101/103)

【薬効薬理】

ロキソプロフェンナトリウム水和物は急性炎症・慢性炎症、疼痛に対して、優れた抗炎症・鎮痛作用を示す。本剤は皮膚から吸収された後、活性代謝物trans-OH体に変換されて作用する。

1. 抗炎症作用¹¹⁾

急性炎症モデルであるカラゲニン浮腫（ラット）、慢性炎症モデルであるアジュバント関節炎（ラット）のいずれに対しても有意な抗炎症作用を示した。

2. 鎮痛作用^{11, 12)}

ランダルセリット法（ラット）において、鎮痛作用を示した。また、アジュバント慢性関節炎疼痛（ラット）に対しても鎮痛作用を示した。

【有効成分に関する理化学的知見】

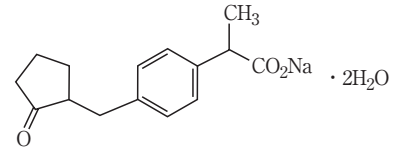
一般名：ロキソプロフェンナトリウム水和物 (Loxoprofen Sodium Hydrate)

化学名：Monosodium 2-[4-[(2-oxocyclopentyl)methyl]phenyl]propanoate dihydrate

分子式：C₁₅H₁₇NaO₃ · 2H₂O

分子量：304.31

構造式：



性状：白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。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。水溶液（1→20）は旋光性を示さない。

分配係数

有機溶媒	水相のpH	分配係数K
1-オクタノール	日局、第1液 (pH1.2)	190
	日局、第2液 (pH6.8)	0.82
クロロホルム	日局、第1液 (pH1.2)	87
	日局、第2液 (pH6.8)	0.95

【取り扱い上の注意】

開封後はチャックを軽く押えて閉じること。

【包装】

ロキソニンパップ100mg 70枚 (7枚/1袋 × 10袋)
350枚 (7枚/1袋 × 50袋)
700枚 (7枚/1袋 × 100袋)

【主要文献】

- 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22（4）：279-292
- 松澤孝泰ほか：臨床医薬 2006；22（3）：187-203
- 社内資料：チトクロームP450に及ぼす影響
- 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22（4）：311-326
- 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22（5）：393-409
- 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22（5）：411-426
- 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22（5）：427-442
- 菅原幸子ほか：臨床医薬 2007；23（1）：55-71
- 菅原幸子ほか：臨床医薬 2007；23（2）：127-141
- 社内資料：変形性膝関節症に対する一般臨床試験
- 浜本哲和ほか：臨床医薬 2006；22（3）：179-186
- 社内資料：ラットにおける鎮痛効果に関する検討

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。
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：0120-189-132

製造販売元
* **リードケミカル株式会社**
富山県富山市日俣77-3
販売元
第一三共株式会社
Daichi-Sankyo 東京都中央区日本橋本町3-5-1