

経皮鎮痛消炎剤 ケトプロフェン外用剤

ケトプロフェンパップ30mg「三和」

KETOPROFEN Pap “SANWA”



2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- 2.1 本剤又は本剤の成分に対して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おそれがある。][9.1.1、11.1.2参照]
- 2.3 チアプロフェン酸、スプロフェン、フェノフィブラート並びにオキシベンゾン及びオクトクリレンを含有する製品(サンスクリーン、香水等)に対して過敏症の既往歴のある患者[これらの成分に対して過敏症の既往歴のある患者では、本剤に対しても過敏症を示すおそれがある。]
- 2.4 光線過敏症の既往歴のある患者[5、8.1、11.1.4参照]
- 2.5 妊娠後期の女性[9.5.1参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	ケトプロフェンパップ30mg「三和」
有効成分	1枚(膏体10g)中 「日局」ケトプロフェン 30mg
添加剤	ヒマシ油、ゼラチン、トメントール、メタリン酸ナトリウム、1,3-ブチレングリコール、アクリル酸デンプン、ポリアクリル酸部分中和物、D-ソルビトール、pH調節剤、水酸化アルミナマグネシウム、オレイン酸ソルビタン、ポリソルベート80

3.2 製剤の性状

販売名	ケトプロフェンパップ30mg「三和」
性状	無色透明～微黄色半透明の膏体を支持体に展延したもので、膏体面をライナーで被覆した貼付剤であり、わずかに芳香がある。
大きさ	10cm×14cm
識別コード	Sc265(薬袋に記載)

4. 効能又は効果

下記疾患並びに症状の鎮痛・消炎

変形性関節症、肩関節周囲炎、腱・腱鞘炎、腱周囲炎、上腕骨上顆炎(テニス肘等)、筋肉痛、外傷後の腫脹・疼痛

5. 効能又は効果に関連する注意

本剤の使用により重篤な接触皮膚炎、光線過敏症が発現することがあり、中には重度の全身性発疹に進展する例が報告されているので、疾病の治療上の必要性を十分に検討の上、治療上の有益性が危険性を上回る場合にのみ使用すること。[2.4、8.1、9.8、11.1.3、11.1.4参照]

6. 用法及び用量

1日2回、患部に貼付する。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 接触皮膚炎又は光線過敏症を発現することがあり、中には重度の全身性発疹に至った症例も報告されているので、使用前に患者に対し次の指導を十分に行うこと。[2.4、5、9.8、11.1.3、11.1.4参照]
 - ・紫外線曝露の有無にかかわらず、接触皮膚炎を発現することがあるので、発疹・発赤、そう痒感、刺激感等の皮膚症状が認められた場合には、直ちに使用を中止し、患部を遮光し、受診すること。なお、使用後数日を経過して発現する場合は、同様に注意すること。
 - ・光線過敏症を発現することがあるので、使用中は天候にかかわらず、戸外の活動を避けるとともに、日常の外出時も、貼付部を衣服、サポーター等で遮光すること。なお、白い生地や薄手の服は紫外線を透過させるおそれがあるので、紫外線を透過させにくい色物の衣服などを着用すること。また、使用後数日から数カ月を経過して発現することもあるので、使用後も当分の間、同様に注意すること。異常が

認められた場合には直ちに使用を中止し、患部を遮光し、適切な処置を行うこと。

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

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 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)

アスピリン喘息でないことを十分に確認すること。気管支喘息の患者の中にはアスピリン喘息患者が潜在していることが考えられており、それらの患者では喘息発作を誘発するおそれがある。[2.2、11.1.2参照]

9.1.2 皮膚感染症のある患者

感染を伴う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。皮膚の感染症を不顕性化するおそれがある。

9.5 妊婦

9.5.1 妊娠後期の女性

使用しないこと。ケトプロフェンの外皮用剤を妊娠後期の女性に使用した場合、胎児動脈管収縮が起きることがある。[2.5参照]

- *9.5.2 妊婦(妊娠後期を除く)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使用すること。必要最小限の使用にとどめるなど慎重に使用すること。ケトプロフェンの外皮用剤を妊娠中期の女性に使用し、羊水過少症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。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、胎児動脈管収縮が起きたとの報告がある。

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。

9.8 高齢者

貼付部の皮膚の状態に注意しながら慎重に使用すること。市販後の使用成績調査の結果、65歳以上の高齢者の接触皮膚炎の発現率(2.14%：2,006例中43例)は、65歳未満(1.06%：3,118例中33例)と比較して有意に高かった。[5、8.1、11.1.3参照]

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。

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(0.1%未満)

ショック、アナフィラキシー(蕁麻疹、呼吸困難、顔面浮腫等)があらわれることがある。

11.1.2 喘息発作の誘発(アスピリン喘息)(0.1%未満)

乾性ラ音、喘鳴、呼吸困難感等の初期症状が発現した場合は使用を中止すること。なお、本剤による喘息発作の誘発は、貼付後数時間で発現している。[2.2、9.1.1参照]

11.1.3 接触皮膚炎(5%未満、重篤例は頻度不明)

貼付部に発現した発疹・発赤、そう痒感、刺激感、紅斑等が悪化し、腫脹、浮腫、水疱・びらん等の重度の皮膚炎症状や色素沈着、色素脱失が発現し、さらに全身に皮膚炎症

状が拡大し重篤化することがある。なお、使用後数日を経過してから発現することもある。[5.、8.1、9.8参照]

11.1.4 光線過敏症(頻度不明)

貼付部を紫外線に曝露することにより、強いそう痒を伴う紅斑、発疹、刺激感、腫脹、浮腫、水疱・びらん等の重度の皮膚炎症状や色素沈着、色素脱失が発現し、さらに全身に皮膚炎症状が拡大し重篤化することがある。なお、使用後数日から数カ月を経過してから発現することもある。[2.4、5.、8.1参照]

11.2 その他の副作用

頻度	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
皮膚	局所の発疹、発赤、腫脹、そう痒感、刺激感、水疱・びらん、色素沈着	皮下出血	
過敏症			蕁麻疹、眼瞼浮腫、顔面浮腫

注) 発現頻度には使用成績調査の結果を含む。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤使用時の注意

使用部位の皮膚刺激をまねくことがあるので、損傷皮膚、粘膜、湿疹又は発疹の部位には使用しないこと。

16. 薬物動態

16.2 吸収

16.2.1 単回投与

ケトプロフェン貼付剤7cm²(ケトプロフェンとして1.5mg)をモルモットに24時間貼付した実験で、正常皮膚では投与量の26.7%が吸収されたのに対し、角質層を除去した損傷皮膚では97.4%が吸収された²⁾。

16.3 分布

16.3.1 変形性膝関節症などの患者に単回又は反復投与したとき、適用部直下の皮膚、皮下脂肪、筋肉及び滑膜中の濃度は、いずれも血清中濃度より高く、深部に入るほど濃度勾配的に減少した³⁾。

16.3.2 モルモットにケトプロフェン貼付剤7cm²(ケトプロフェンとして1.5mg)を24時間投与した実験で、正常皮膚では4時間後に血中濃度が最高に達し、6時間後に投与部直下の筋膜及び筋肉内濃度が最高に達したが、損傷皮膚では2時間後に血中及びすべての臓器で最高に達した²⁾。

16.5 排泄

モルモットの正常皮膚に貼付した場合、120時間までに適用量の24.4%が尿中に、0.5%が糞中に排泄されたのに対し、損傷皮膚では96.7%の尿中排泄率を示した²⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

プロスタグランジン合成抑制作用、血管透過性亢進抑制作用、白血球遊走阻止作用、蛋白熱変性抑制作用、細胞膜安定化作用及びブラジキニン遊離抑制作用などが考えられている⁴⁾。

18.2 抗炎症作用

ラットのcarrageenin足浮腫、打撲足浮腫などの急性炎症モデル、ラットのcotton pellet肉芽増殖、adjuvant関節炎などの慢性炎症モデルのいずれに対しても有意な抑制作用を示した⁴⁾。

18.3 鎮痛作用

ラットのkaolin-carrageenin炎症足疼痛及び硝酸銀関節痛に対して有意な鎮痛作用を示した⁴⁾。

18.4 生物学的同等性試験

18.4.1 鎮痛作用

ラットの炎症性疼痛抑制試験(Randall-Selitto法)において、鎮痛作用が認められた。また、ケトプロフェンパップ30mg「三和」とモーラスパップ30mgとにおいて、鎮痛作用に有意な差は認められなかった⁵⁾。

18.4.2 抗炎症作用

ラットのカラゲニン足腫浮腫抑制試験及びアジュバント関節炎抑制試験において、抗炎症作用が認められた。また、ケトプロフェンパップ30mg「三和」とモーラスパップ30mgとにおいて、抗炎症作用に有意な差は認められなかった⁶⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：ケトプロフェン(Ketoprofen)

化学名：(2*R*S)-2-(3-Benzoylphenyl)propanoic acid

分子式：C₁₆H₁₄O₃

分子量：254.28

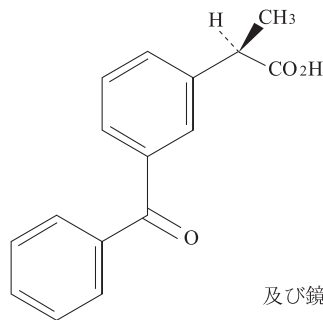
性状：本品は白色の結晶性の粉末である。

本品はメタノールに極めて溶けやすく、エタノール(95)又はアセトンに溶けやすく、水にほとんど溶けない。

本品のエタノール(99.5)溶液(1→100)は旋光性を示さない。

本品は光によって微黄色になる。

構造式：



融点：94～97℃

22. 包装

140枚[7枚/1袋×20袋]、700枚[7枚/1袋×100袋]

23. 主要文献

- 1) Veyrac G, et al. : *Thérapie*. 2002 ; 57(1) : 55-64
- 2) 矢野忠則 他 : *応用薬理*. 1986 ; 32(6) : 1181-1189
- 3) 菅原幸子 他 : *薬理と治療*. 1986 ; 14(10) : 6631-6637
- 4) 斉田勝 他 : *医薬品研究*. 1986 ; 17(6) : 1133-1143
- 5) 社内資料：鎮痛作用比較試験
- 6) 社内資料：抗炎症比較試験

24. 文献請求先及び問い合わせ先

株式会社三和化学研究所 コンタクトセンター
〒461-8631 名古屋市東区東外堀町35番地
TEL 0120-19-8130
FAX 052-950-1305

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

救急薬品工業株式会社

富山県射水市戸破32-7 〒939-0351

26.2 販売元

 **株式会社 三和化学研究所**
SKK 名古屋市東区東外堀町35番地 〒461-8631