

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2013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Naテープ50mg「EE」

ロキソプロフェンNaテープ100mg「EE」

Loxoprofen Na tape 50mg「EE」

Loxoprofen Na tape 100mg「EE」

＜ロキソプロフェンナトリウム水和物添付剤＞

剤形	テープ剤	
製剤の規制区分	該当しない	
規格・含量	テープ 50mg	1枚（7×10cm）中にロキソプロフェンナトリウム水和物56.7mg（無水物として50mg）含有
	テープ 100mg	1枚（10×14cm）中に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） 洋名：Loxoprofen Sodium Hydrate（JAN）	
製造販売承認年月日	製造販売承認年月日：2013年2月15日	
薬価基準収載 ・発売年月日	薬価基準収載年月日：2013年6月21日 発売年月日：2013年6月21日	
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売会社：エルメッド エーザイ株式会社 販売提携：エーザイ株式会社	
医薬情報担当者 の連絡先		
問い合わせ窓口	エーザイ hhc ホットライン フリーダイヤル 0120-223-698 エルメッド エーザイ株式会社 FAX 03-3980-6634 医療関係者向けホームページ http://www.emec.co.jp/member/index.html	

本IFは2017年7月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）^{注1）} から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法^{注2)}・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式】

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

【IF の作成】

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。

- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

〔IF の発行〕

- ①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページ^{注1)}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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分に留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法^{注2)}や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法^{注2)}上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

注 1) 現 (独) 医薬品医療機器総合機構ホームページ (<http://www.pmda.go.jp/>)

注 2) 現 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

目 次

I. 概要に関する項目	
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	
1. 販売名	2
(1) 和名	2
(2) 洋名	2
(3) 名称の由来	2
2. 一般名	2
(1) 和名(命名法)	2
(2) 洋名(命名法)	2
(3) ステム(stem)	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名(命名法)	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2
7. CAS登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	
1. 物理化学的性質	3
(1) 外観・性状	3
(2) 溶解性	3
(3) 吸湿性	3
(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点	3
(5) 酸塩基解離定数	3
(6) 分配係数	3
(7) その他の主な示性値	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法	3
4. 有効成分の定量法	3
IV. 製剤に関する項目	
1. 剤形	4
(1) 投与経路	4
(2) 剤形の区別、外観及び性状	4
(3) 製剤の物性	4
(4) 識別コード	5
(5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH域等	5
(6) 無菌の有無	5
2. 製剤の組成	5
(1) 有効成分(活性成分)の含量	5
(2) 添加物	5
(3) 添付溶解液の組成及び容量	5
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	5
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5
5. 製剤の各種条件下における安定性	6
6. 溶解後の安定性	7
7. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	7
8. 溶出性	7
9. 生物学的試験法	7
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	8
11. 製剤中の有効成分の定量法	8
12. 力価	8
13. 混入する可能性のある夾雑物	8
14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する 情報	8
15. 刺激性	8
16. その他	8
V. 治療に関する項目	
1. 効能又は効果	9
2. 用法及び用量	9
3. 臨床成績	9
(1) 臨床データパッケージ	9
(2) 臨床効果	9
(3) 臨床薬理試験	9
(4) 探索的試験	9
(5) 検証的試験	9
(6) 治療の使用	9
VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10
2. 薬理作用	10
(1) 作用部位・作用機序	10
(2) 薬効を裏付ける試験成績	10
(3) 作用発現時間・持続時間	10
VII. 薬物動態に関する項目	
1. 血中濃度の推移・測定法	11
(1) 治療上有効な血中濃度	11
(2) 最高血中濃度到達時間	11
(3) 臨床試験で確認された血中濃度	11
(4) 中毒域	11
(5) 食事・併用薬の影響	11
(6) 母集団(ポピュレーション)解析により 判明した薬物体内動態変動要因	11
2. 薬物速度論的パラメータ	11
(1) 解析方法	11
(2) 吸収速度定数	11
(3) バイオアベイラビリティ	11
(4) 消失速度定数	11
(5) クリアランス	11
(6) 分布容積	11
(7) 血漿蛋白結合率	11
3. 吸収	11
4. 分布	11
(1) 血液-脳関門通過性	11
(2) 血液-胎盤関門通過性	12

(3) 乳汁への移行性	12	2. 毒性試験	17
(4) 髄液への移行性	12	(1) 単回投与毒性試験	17
(5) その他の組織への移行性	12	(2) 反復投与毒性試験	17
5. 代謝	12	(3) 生殖発生毒性試験	17
(1) 代謝部位及び代謝経路	12	(4) その他の特殊毒性	17
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の 分子種	12	X. 管理的事項に関する項目	
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	13	1. 規制区分	18
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	13	2. 有効期間又は使用期限	18
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	13	3. 貯法・保存条件	18
6. 排泄	13	4. 薬剤取扱い上の注意点	18
(1) 排泄部位及び経路	13	(1) 薬局での取扱い上の留意点について	18
(2) 排泄率	13	(2) 薬剤交付時の取扱いについて (患者等に留意すべき必須事項等)	18
(3) 排泄速度	13	(3) 調剤時の留意点について	18
7. トランスポーターに関する情報	13	5. 承認条件等	18
8. 透析等による除去率	13	6. 包装	18
VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目		7. 容器の材質	18
1. 警告内容とその理由	14	8. 同一成分・同効薬	19
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	14	9. 国際誕生年月日	19
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意と その理由	14	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	19
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意と その理由	14	11. 薬価基準収載年月日	19
5. 慎重投与内容とその理由	14	12. 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	19
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	14	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及び その内容	19
7. 相互作用	14	14. 再審査期間	19
(1) 併用禁忌とその理由	14	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	19
(2) 併用注意とその理由	14	16. 各種コード	19
8. 副作用	14	17. 保険給付上の注意	19
(1) 副作用の概要	14	XI. 文献	
(2) 重大な副作用と初期症状	15	1. 引用文献	20
(3) その他の副作用	15	2. その他の参考文献	20
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値 異常一覧	15	XII. 参考資料	
(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の 有無等背景別の副作用発現頻度	15	1. 主な外国での発売状況	21
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	15	2. 海外における臨床支援情報	21
9. 高齢者への投与	15	XIII. 備考	
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	15	その他の関連資料	22
11. 小児等への投与	15		
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16		
13. 過量投与	16		
14. 適用上の注意	16		
15. その他の注意	16		
16. その他	16		
IX. 非臨床試験に関する項目			
1. 薬理試験	17		
(1) 薬効薬理試験 (「VI. 薬効薬理に関する項目」 参照)	17		
(2) 副次的薬理試験	17		
(3) 安全性薬理試験	17		
(4) その他の薬理試験	17		

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剤である。
エルメッド エーザイ株式会社は、ロキソプロフェン Na テープ 50mg「EE」及びロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」を後発医薬品として薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験及び生物学的同等性試験を実施し、2013 年 2 月に承認を得て、2013 年 6 月に発売に至った。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) 治療学的特性

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、活性代謝物のトランス 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。 (①)

(2) 製剤学的特性

50mg テープ、100mg テープともに無色透明～微黄色半透明の膏体を支持体に展延し、膏体表面をライナーで被覆したテープ剤である。

(3) 重大な副作用

ショック、アナフィラキシーが報告されている（頻度不明）。

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 テープ 50mg「EE」
ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」

(2) 洋名

Loxoprofen Na tape 50mg「EE」
Loxoprofen Na tape 100mg「EE」

(3) 名称の由来

成分名を名称の一部とした。「EE」は社名 (Elmed Eisai Co., Ltd.) の略名を表す。

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)

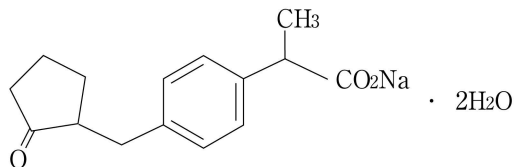
(2) 洋名 (命名法)

Loxoprofen Sodium Hydrate (JAN)
Loxoprofen (INN)

(3) ステム (stem)

抗炎症薬 (イブプロフェン誘導体) : -profen

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{15}H_{17}NaO_3 \cdot 2H_2O$
分子量 : 304.31

5. 化学名 (命名法)

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

なし

7. CAS 登録番号

Loxoprofen Sodium : 80382-23-6
Loxoprofen : 68767-14-6

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

溶 媒	日本薬局方の溶解度表記
水	極めて溶けやすい
メタノール	極めて溶けやすい
エタノール (95)	溶けやすい
ジエチルエーテル	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

融点：約 197℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

pKa：4.20

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

本品の水溶液（1→20）は旋光性を示さない。

本品 1.0g を新たに煮沸して冷却した水 20mL に溶かした液の pH は 6.5～8.5 である。

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

日本薬局方 ロキソプロフェンナトリウム水和物の確認試験による。

- (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

4. 有効成分の定量法

日本薬局方 ロキソプロフェンナトリウム水和物の定量法による。

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 投与経路

経皮

(2) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	性状・剤形	大きさ
ロキソプロフェン Na テープ 50mg「EE」	無色透明～微黄色半透明の膏体を支持体に展延し、膏体表面をライナーで被覆したテープ剤である。 わずかに特異なおいがある。	7cm×10cm (膏体 1g)
ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」		10cm×14cm (膏体 2g)

(3) 製剤の物性

1) 自着力試験

製剤の長辺方向に幅 2.5cm、短辺方向に長さ 5cm に裁断した製剤 2 枚のライナーを剥がし、膏体面同士を貼り合わせ、2kg ローラーで 1 往復荷重をかけた試験サンプルを、レオメーターに固定し、300mm/分の速度で引き剥がしたときの力を自着力として測定した。

試験の結果、自着力は、ロキソプロフェン Na テープ 50mg「EE」の縦方向で $361 \pm 44\text{g}/2.5\text{cm}$ 、横方向で $538 \pm 108\text{g}/2.5\text{cm}$ であり、ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」の縦方向で $273 \pm 8\text{g}/2.5\text{cm}$ 、横方向で $596 \pm 56\text{g}/2.5\text{cm}$ であった。

2) 粘着力試験（プローブタック試験）

製剤のライナーを剥がし、膏体面を上向きにして万能試験機プローブタックの試料台に固定し、100g の分銅に幅 10mm、長さ 10mm のバークライト板を貼り合わせた 100g 荷重バークライト板と製剤の粘着面を 3 秒間接触させた。その後、300mm/分の速度で装置を稼動し、バークライト板が粘着面より剥離するときの力を粘着力として測定した。

試験の結果、粘着力は、ロキソプロフェン Na テープ 50mg「EE」で $430 \pm 17\text{g}/\text{cm}^2$ であり、ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」で $395 \pm 13\text{g}/\text{cm}^2$ であった。

3) 粘着力試験（ボールタック試験）

製剤のライナーを剥がし、膏体面を上に向けて、粘着力試験装置（下図）に固定し、次に斜面上の No.1～No.9 のスチールボール（下表）を転がし、粘着面に 5 秒以上停止する最大のボールナンバーを測定した。

試験の結果、膏体面で停止する最大のスチールボールは、ロキソプロフェン Na テープ 50mg「EE」で No.8 であり、ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」で No.7 であった。

図 粘着力試験装置

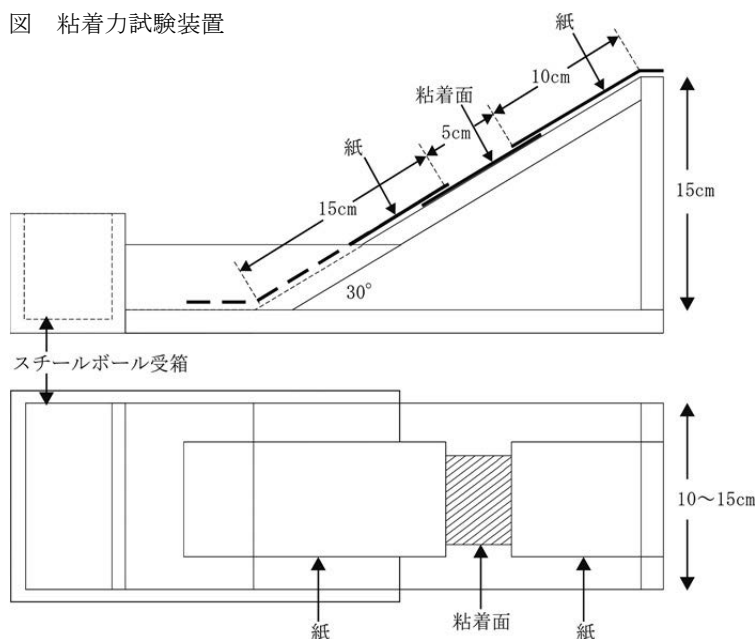


表 スチールボールの種類

No.	直径 (mm)	質量 (g)
1	3.2	0.13
2	4.8	0.46
3	6.3	1.0
4	7.9	2.1
5	9.5	3.6
6	11.1	5.7
7	12.7	8.5
8	14.3	12.1
9	15.9	16.6

IV. 製剤に関する項目

- (4) 識別コード
なし
- (5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等
該当資料なし
- (6) 無菌の有無
本剤は無菌製剤ではない。

2. 製剤の組成

- (1) 有効成分（活性成分）の含量
 - ロキソプロフェン Na テープ 50mg「EE」：1 枚（7×10cm）中にロキソプロフェンナトリウム水和物 56.7mg
（無水物として 50mg）含有
 - ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」：1 枚（10×14cm）中に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
- (2) 添加物
エステルガム、ジブチルヒドロキシトルエン、スチレン・イソプレン・スチレンブロック共重合体、*l*-メントール、流動パラフィン、その他 3 成分
- (3) 添付溶解液の組成及び容量
該当しない

3. 用時溶解して使用する製剤の調製法

該当しない

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

IV. 製剤に関する項目

5. 製剤の各種条件下における安定性

(1) ロキソプロフェン Na テープ 50mg「EE」

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃・60%RH、24 ヶ月）の結果、ロキソプロフェン Na テープ 50mg「EE」は通常の市場流通下において2年間安定であることが確認された。(2)

試験方法	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	試験結果	
					試験開始時	試験終了時
長期保存試験	25℃・60%RH	アルミ袋包装品 (本品をアルミラミネート袋に入れ、紙箱に入れた状態)	24 ヶ月	性状	無色透明の膏体を支持体に展延し、膏体表面をライナーで被覆したテープ剤で、わずかに特異なおいがあった。	無色透明の膏体を支持体に展延し、膏体表面をライナーで被覆したテープ剤で、わずかに特異なおいがあった。
				確認試験*1	適合	適合
				純度試験 [類縁物質*2 (%)]	①0.052~0.070 ②N.D. ③N.D. ④N.D.	①0.130~0.161 ②0.159~0.186 ③N.D. ④N.D.
				形状*3 (mm)	長辺 0.00~0.39 短辺 0.06~1.17	長辺 -0.19~0.10 短辺 0.54~1.08
				質量試験 (%)	95.9~103.6	99.5~101.4
				粘着力 (No.)	7	7
				放出性 (%)	2 時間後 37.8~43.0 6 時間後 62.8~69.8	2 時間後 29.3 注1 38.0~57.6 6 時間後 67.6~80.2
				含量 (%)	103.0~103.8	100.6~102.4

*1 薄層クロマトグラフィー

*2 ① 酸化分解物 ② メントールエステル ③ ①、②以外の個々の類縁物質 ④ 総類縁物質
N.D. : ロキソプロフェンのピークに対して0.05%以上のピークなし

*3 表示された大きさとの差

注1 2時間の放出率が30.0~60.0%未満から外れたものが3ロットのうち1ロットの試験で12枚中1枚だったので適合

IV. 製剤に関する項目

(2) ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃・60%RH、24 ヶ月）の結果、ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」は通常の市場流通下において2年間安定であることが確認された。(2)

試験方法	保存条件	保存形態	保存期間	試験項目	試験結果	
					試験開始時	試験終了時
長期保存試験	25℃・60%RH	アルミ袋包装品 (本品をアルミラミネート袋に入れ、紙箱に入れた状態)	24 ヶ月	性状	無色透明の膏体を支持体に展延し、膏体表面をライナーで被覆したテープ剤で、わずかに特異なおいがあった。	無色透明の膏体を支持体に展延し、膏体表面をライナーで被覆したテープ剤で、わずかに特異なおいがあった。
				確認試験*1	適合	適合
				純度試験 [類縁物質*2(%)]	①0.046~0.055 ②N.D. ③N.D. ④N.D.	①0.126~0.140 ②0.162~0.177 ③N.D. ④N.D.
				形状*3 (mm)	長辺 0.85~1.30 短辺 -0.86~0.08	長辺 0.84~1.11 短辺 -1.00~-0.01
				質量試験 (%)	97.3~102.9	95.9~99.3
				粘着力 (No.)	7	7
				放出性 (%)	2 時間後 25.0 ^{注1} 31.2~43.9 6 時間後 46.3 ^{注2} 64.6~72.7	2 時間後 40.5~57.1 6 時間後 65.7~79.5
				含量 (%)	103.5~104.0	100.4~101.8

*1 薄層クロマトグラフィー

*2 ① 酸化分解物 ② メントールエステル ③ ①、②以外の個々の類縁物質 ④ 総類縁物質
N.D.: ロキソプロフェンのピークに対して0.05%以上のピークなし

*3 表示された大きさとの差

注1 2時間の放出率が30.0~60.0%未満から外れたものが3ロットのうち1ロットの試験で12枚中1枚だったので適合

注2 6時間の放出率が60.0%以上から外れたものが3ロットのうち1ロットの試験で12枚中1枚だったので適合

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

8. 溶出性

<放出性>

試験条件

試験回数: 6ベッセル

装置: パドル法

試験液量: 500mL

試験液温度: 32℃±0.5℃

試験液: 日本薬局方 溶出試験第2液

試験結果

本品の各含量の試料3ロットについて3回ずつ試験を行ったところ、すべて規格に適合した。

9. 生物学的試験法

該当しない

IV. 製剤に関する項目

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

薄層クロマトグラフィー

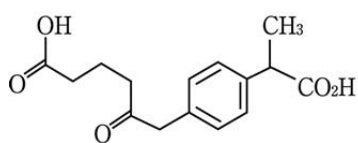
11. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

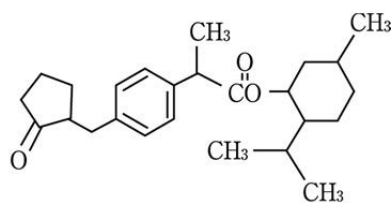
12. 力価

該当しない

13. 混入する可能性のある夾雑物



酸化分解物



メントールエステル

14. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

15. 刺激性

「IX.-2.(4)1) 局所刺激性」の項参照

16. 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. 用法及び用量

1日1回、患部に貼付する。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

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

酸性非ステロイド性消炎鎮痛剤

インドメタシン、ケトプロフェン、フルルビプロフェン、ジクロフェナクナトリウム、フェルピナク

2. 薬理作用

(1) 作用部位・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、活性代謝物のトランス 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。 (①)

(2) 薬効を裏付ける試験成績

炎症、疼痛および慢性炎症モデルとして代表的なラットを用いたカラゲニン足浮腫抑制試験、ビール酵母誘発炎症足圧疼痛試験、アジュバント関節炎試験を行い、本剤の薬理効果を確認した。

試験の結果、本剤の無処置群及び基剤と比較して優位に浮腫抑制作用、疼痛反応閾値の低下抑制が認められた。 (③)

(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・測定法

- (1) 治療上有効な血中濃度
該当資料なし
- (2) 最高血中濃度到達時間
該当資料なし
- (3) 臨床試験で確認された血中濃度
該当資料なし
- (4) 中毒域
該当資料なし
- (5) 食事・併用薬の影響
該当資料なし
- (6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因
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) バイオアベイラビリティ
該当資料なし
- (4) 消失速度定数
該当資料なし
- (5) クリアランス
該当資料なし
- (6) 分布容積
該当資料なし
- (7) 血漿蛋白結合率
該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

- (1) 血液-脳関門通過性
該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

(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

＜生物学的同等性試験＞

ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」と標準製剤の直径 20mm、面積 3.14cm² (ロキソプロフェンナトリウム水和物 2.54mg 含有) の円形に裁断した製剤について、健康成人男性 8 名の背部皮膚に 24 時間貼付したときの角質層中のロキソプロフェン量を指標として、両製剤の生物学的同等性を検証した。

本剤と標準製剤の貼付 4 時間及び 24 時間における角質層中ロキソプロフェン量の対数値の平均値の差の 90%信頼区間は、いずれも $\log(0.70) \sim \log(1.43)$ の範囲内であったことから、両製剤は、「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 18 年 11 月 24 日付薬食審査発 1124004 号 別紙 4)」に基づき、生物学的に同等であると判断された。 (4)

表 角質層中ロキソプロフェン量

	角質層中ロキソプロフェン量 ($\mu\text{g}/3.14\text{cm}^2$)			
	貼付 4 時間後	貼付 8 時間後	貼付 12 時間後	貼付 24 時間後
ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」	21.68 \pm 5.26	22.18 \pm 4.69	21.98 \pm 3.73	25.04 \pm 5.33
標準製剤	20.98 \pm 5.84	22.88 \pm 5.71	22.18 \pm 4.81	24.02 \pm 4.99

(Mean \pm SD., n=8)

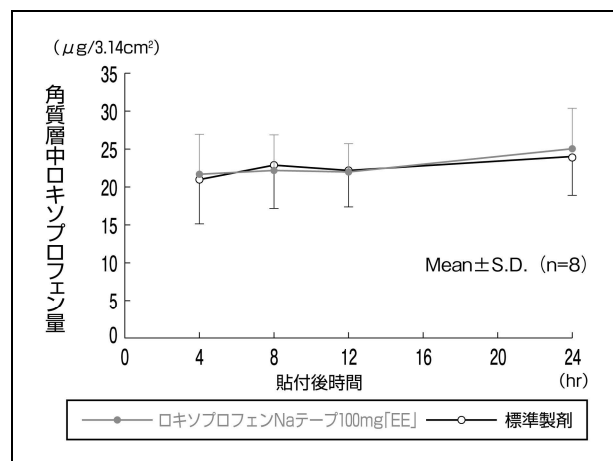


図 角質層中ロキソプロフェン量平均値推移

5. 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 (CYP450 等) の分子種

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

- (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比率
該当資料なし
- (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ
該当資料なし

6. 排泄

- (1) 排泄部位及び経路
該当資料なし
- (2) 排泄率
該当資料なし
- (3) 排泄速度
該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【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。〕

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

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。〕

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

該当しない

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。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。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(2) 重大な副作用と初期症状

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。

(3) その他の副作用

	頻度不明
皮膚	水疱、腫脹、痒痒、紅斑、接触性皮膚炎、皮疹、皮下出血、皮膚刺激、色素沈着
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

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

【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。〕

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。〕

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。

9. 高齢者への投与

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。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (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まわると判断される場合にのみ使用すること。〔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。

11. 小児等への投与

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）。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 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。

15. その他の注意

該当資料なし

16. その他

特になし

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) 副次的薬理試験
該当資料なし

(3) 安全性薬理試験
該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験
該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

1) 局所刺激性

ウサギを用いた 14 日間皮膚累積刺激性試験

ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」を、直径 20mm、面積 3.14cm²（ロキソプロフェンナトリウム水和物 2.54mg 含有）の円形に裁断した製剤について、ウサギの背部健常皮膚及び損傷皮膚に約 23 時間貼付し、製剤の貼付・除去を 14 日間繰り返した。製剤貼付部の皮膚反応の観察は、投与製剤の剥離 30 分後に行い、Draize の判定基準に従って、皮膚反応の評点付けを行い、皮膚累積刺激性を評価した。

試験の結果、ごく軽度の紅斑が認められたが、いずれも浮腫は観察されなかった。経時的な刺激スコアの上昇は認められず、累積皮膚刺激性はないと考えられた。

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：ロキソプロフェンナトリウム水和物 劇薬

2. 有効期間又は使用期限

有効期間：2年間（安定性試験結果に基づく。「IV.-5. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照）

3. 貯法・保存条件

室温保存、遮光した気密容器に保存。

開封後はチャックを閉めて保存すること。

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

くすりのしおり：有り

「VIII.-14. 適用上の注意」の項参照

(3) 調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

なし

6. 包装

販 売 名	包装
ロキソプロフェン Na テープ 50mg「EE」	70 枚（7 枚×10）
	700 枚（7 枚×100）
ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」	70 枚（7 枚×10）
	700 枚（7 枚×100）

7. 容器の材質

内袋	箱
ポリエチレン、アルミニウム、セロハン	紙

X. 管理的事項に関する項目

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ロキソニン（第一三共）、ロキソプロフェン錠 60mg「EMEC」（エルメッド エーザイ）

同効薬：

[インドメタシン製剤]	カトレップ（帝國製薬）、セラスター（救急薬品工業＝アステラス）
[ケトプロフェン製剤]	モーラス（久光＝祐徳）
[フルルビプロフェン製剤]	ヤクバン（トクホン＝大正富山）
[ジクロフェナクナトリウム製剤]	ボルタレン（同仁＝ノバルティス）、ナボール（久光）
[フェルビナク製剤]	セルタッチ（帝國製薬＝ファイザー）、ファルジー（ニプロファーマ＝ニプロ）、 フェルビナクテープ 70mg「EMEC」（救急薬品工業＝エルメッド エーザイ）

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
ロキソプロフェン Na テープ 50mg「EE」	2013年2月15日	22500AMX00130000
ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」	2013年2月15日	22500AMX00131000

11. 薬価基準収載年月日

2013年6月21日

12. 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

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	包装	HOT (13桁) 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト 電算コード
ロキソプロフェン Na テープ 50mg「EE」	70枚 (7枚×10)	1225280010101	2649735S2040	622252801
	700枚 (7枚×100)	1225280010102		
ロキソプロフェン Na テープ 100mg「EE」	70枚 (7枚×10)	1225297010101	2649735S3047	622252901
	700枚 (7枚×100)	1225297010102		

17. 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第十七改正日本薬局方解説書（廣川書店） C-5998-C-6002 （2016）
- ②安定性に関する資料（エルメッド エーザイ株式会社 社内資料）
- ③川村尚久ら：医学と薬学, **69**, 399 (2013)
- ④生物学的同等性に関する資料（エルメッド エーザイ株式会社 社内資料）

2. その他の参考文献

なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

本剤は外国で発売されていない。

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XII. 備考

その他の関連資料

(1) 文献請求先

エルメッド エーザイ株式会社


FAX 03-3980-6634

〒170-0013 東京都豊島区東池袋 3-23-5

(2) お問い合わせ先

エーザイ hhc ホットライン フリーダイヤル 0120-223-698

製造販売元  エルメッド エーザイ株式会社
東京都豊島区東池袋3-23-5

販売提携  エーザイ株式会社
東京都文京区小石川4-6-10