

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

薬価基準収載

ロキソプロフェンナトリウムテープ50mg「ファイザー」
ロキソプロフェンナトリウムテープ100mg「ファイザー」
ロキソプロフェンナトリウムパップ100mg「ファイザー」
LOXOPROFEN Na Tape 50mg・100mg, Pap 100mg [Pfizer]

ロキソプロフェンナトリウム水和物貼付剤

剤形	貼付剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	ロキソプロフェンナトリウムテープ50mg「ファイザー」 1枚（膏体質量1g/70cm ² ）中（日局）ロキソプロフェンナトリウム水和物 56.7mg（ロキソプロフェンナトリウムとして50mg） ロキソプロフェンナトリウムテープ100mg「ファイザー」 1枚（膏体質量2g/140cm ² ）中（日局）ロキソプロフェンナトリウム水和物 113.4mg（ロキソプロフェンナトリウムとして100mg） ロキソプロフェンナトリウムパップ100mg「ファイザー」 1枚（膏体質量10g/140cm ² ）中（日局）ロキソプロフェンナトリウム水和物 113.4mg（ロキソプロフェンナトリウムとして100mg）
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 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2013年 2月15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	製造販売元：株式会社大石膏盛堂 販売：ファイザー株式会社 提携：マイラン製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ファイザー株式会社 製品情報センター 学術情報ダイヤル 0120-664-467 FAX 03-3379-3053 医療用製品情報 http://pfizerpro.jp/cs/sv/druginfo

本IFは2021年2月改訂（ロキソプロフェンナトリウムテープ50mg・100mg「ファイザー」）及び2021年2月改訂（ロキソプロフェンナトリウムパップ100mg「ファイザー」）の添付文書の記載に基づき改訂した。最新の添付文書情報は、PMDAホームページ「医薬品に関する情報」<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

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新たな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ホームページ（<http://www.pmda.go.jp/>）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・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判、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)

目次

I. 概要に関する項目	1
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	2
1. 販売名	2
2. 一般名	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）	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3
7. CAS登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
1. 物理化学的性質	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4
3. 有効成分の確認試験法	4
4. 有効成分の定量法	4
IV. 製剤に関する項目	5
1. 剤形	5
2. 製剤の組成	6
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	6
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6
5. 製剤の各種条件下における安定性	7
6. 溶解後の安定性	9
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	9
8. 溶出性	9
9. 生物学的試験法	9
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	9
11. 製剤中の有効成分の定量法	9
12. 力価	9
13. 混入する可能性のある夾雑物	9
14. 治療上注意が必要な容器に関する情報	9
15. 刺激性	10
16. その他	10

V. 治療に関する項目	11
1. 効能又は効果	11
2. 用法及び用量	11
3. 臨床成績	11
VI. 薬効薬理に関する項目	12
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	12
2. 薬理作用	12
VII. 薬物動態に関する項目	13
1. 血中濃度の推移・測定法	13
2. 薬物速度論的パラメータ	13
3. 吸収	14
4. 分布	14
5. 代謝	16
6. 排泄	16
7. 透析等による除去率	16
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	17
1. 警告内容とその理由	17
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	17
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	17
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	17
5. 慎重投与内容とその理由	17
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	17
7. 相互作用	18
8. 副作用	18
9. 高齢者への投与	19
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	19
11. 小児等への投与	19
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	19
13. 過量投与	19
14. 適用上の注意	19
15. その他の注意	19
16. その他	20
IX. 非臨床試験に関する項目	21
1. 薬理試験	21
2. 毒性試験	21

X. 管理的事項に関する項目	22
1. 規制区分	22
2. 有効期間又は使用期限	22
3. 貯法・保存条件	22
4. 薬剤取扱い上の注意点	22
5. 承認条件等	22
6. 包装	22
7. 容器の材質	23
8. 同一成分・同効薬	23
9. 国際誕生年月日	23
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	23
11. 薬価基準収載年月日	23
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.....	23
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	23
14. 再審査期間	23
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	24
16. 各種コード	24
17. 保険給付上の注意	24
XI. 文献	25
1. 引用文献	25
2. その他の参考文献	25
XII. 参考資料	26
1. 主な外国での発売状況	26
2. 海外における臨床支援情報	26
XIII. 備考	27
その他の関連資料	27

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、生体内でプロスタグランジン生合成抑制作用を示す活性代謝物トランス OH 体に変換され、非ステロイド性抗炎症薬 (NSAIDs) としての作用を示す¹⁾。経口剤が広く臨床で使用されている中、貼付剤としての安定性、放出性、接着性に優れた処方が見出され、国内で初めて 1 日 1 回貼付の NSAIDs 含有パップ剤が開発された。さらに、より患部への密着性が高く剥がれにくい新たな貼付剤としてテープ剤が開発された。

ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg・100mg、パップ 100mg「ファイザー」は、後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号 (平成 17 年 3 月 31 日) に基づく規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2013 年 2 月に承認を得た製剤である。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 1 日 1 回貼付で速やかな効果を発揮する経皮吸収型鎮痛・抗炎症剤

ロキソプロフェンナトリウム水和物はプロドラッグであり、吸収後、生体内で活性代謝物に変換され、シクロオキシゲナーゼを阻害し、プロスタグランジン産生を抑制することにより、抗炎症作用、解熱作用、鎮痛作用を示し¹⁾、変形性関節症、筋肉痛、外傷後の腫脹・疼痛を改善する。

2. 患者に合わせて 3 種類の製剤が選択可能

本剤はサイズの異なる 2 種類のテープ剤とパップ剤 (ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg「ファイザー」(7cm×10cm)、ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg「ファイザー」(10cm×14cm)、ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg「ファイザー」(10cm×14cm)) を有し、患部部位、患部の広さ、また、患者の好みに応じた選択が可能である。

3. 誤投与・貼り違い防止のための認識性向上の取り組み

- 1) 包装 (小函、薬袋) にユニバーサルデザイン仕様の「つたわるフォント*」を採用することで、誤認防止と低視力状態に対応できるように可読性を高めている^{2)~4)}
- 2) 規格取り違えを防ぐ試みとして、複数規格の製剤は、上の規格 (高用量) がある場合、記載含量の上に▲を配置し、下の規格 (低用量) がある場合、記載含量の下に▼を配置している^{2)~4)}
- 3) 薬袋の裏面に薬の貼り方と注意事項の説明を表示している

4. 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、ショック、アナフィラキシー、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、胃不快感、上腹部痛、下痢・軟便、AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、γ-GTP 上昇、浮腫が報告されている。

*「つたわるフォント」は慶応義塾大学、博報堂ユニバーサルデザイン、株式会社タイプバンクにより共同で開発された書体である。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg 「ファイザー」
ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg 「ファイザー」
ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」

(2) 洋名

LOXOPROFEN Na Tape 50mg [Pfizer]
LOXOPROFEN Na Tape 100mg [Pfizer]
LOXOPROFEN Na Pap 100mg [Pfizer]

(3) 名称の由来

有効成分であるロキソプロフェンナトリウム水和物に剤形、含量及び「ファイザー」を付した。

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）

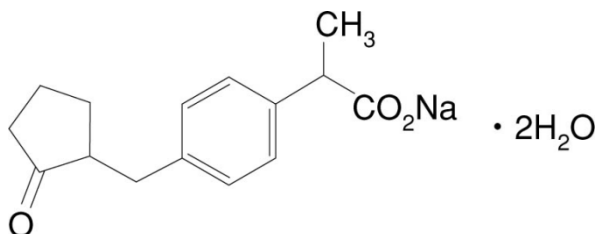
(2) 洋名（命名法）

Loxoprofen Sodium Hydrate（JAN）

(3) ステム

-profen：抗炎症薬（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：C₁₅H₁₇NaO₃ · 2H₂O

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

該当資料なし

7. CAS 登録番号

80382-23-6

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。
においはなく、収れん性の味があり、後にわずかに甘味と塩味がある。

(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

融点：約 197°C（分解）

(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

旋光度：ロキソプロフェンナトリウム水和物の水溶液（1→20）は旋光性を示さない。
pH：6.5～8.5（1.0gに新たに煮沸して冷却した水 20mLを加える）

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¹⁾

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

4. 有効成分の定量法¹⁾

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

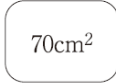
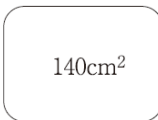
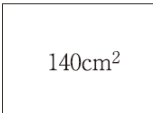
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 投与経路

経皮

(2) 剤形の区別、規格及び性状

販売名	外形	性状	
ロキソプロフェンナトリウム テープ 50mg 「ファイザー」	 70cm ²	淡黄色～淡褐色半透明の特異な芳香のある膏体を支持体に展延し、膏体表面をライナーで被覆した貼付剤である。	
	7cm×10cm		
ロキソプロフェンナトリウム テープ 100mg 「ファイザー」	 140cm ²		
	10cm×14cm		
ロキソプロフェンナトリウム パップ 100mg 「ファイザー」	 140cm ²		白色～淡黄色の特異なおいのある膏体を支持体に展延し、膏体表面をライナーで被覆したパップ剤である。
	10cm×14cm		

(3) 製剤の物性

該当資料なし

(4) 識別コード

該当しない

(5) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg 「ファイザー」

1 枚（膏体質量 1g/70cm²）中（日局）ロキソプロフェンナトリウム水和物 56.7mg（ロキソプロフェンナトリウムとして 50mg）を含有する

ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg 「ファイザー」

1 枚（膏体質量 2g/140cm²）中（日局）ロキソプロフェンナトリウム水和物 113.4mg（ロキソプロフェンナトリウムとして 100mg）を含有する

ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」

1 枚（膏体質量 10g/140cm²）中（日局）ロキソプロフェンナトリウム水和物 113.4mg（ロキソプロフェンナトリウムとして 100mg）を含有する

(2) 添加物

ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg・100mg 「ファイザー」

スチレン・イソプレン・スチレンブロック共重合体、ポリイソブチレン、脂環族飽和炭化水素樹脂、BHT、中鎖脂肪酸トリグリセリド、軽質無水ケイ酸、*l*-メントール、流動パラフィン、その他 3 成分
ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」

エデト酸塩、D-ソルビトール、グリセリン、カルボキシビニルポリマー、ポリアクリル酸部分中和物、カルメロースナトリウム、メチルセルロース、ポリソルベート 80、*l*-メントール、酸化チタン、pH 調節剤、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

5. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 長期保存試験

①ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg 「ファイザー」⁵⁾

試験条件：25±2℃、60±5%RH

包装形態：アルミニウム箔/ポリエチレン複合フィルム

項目	試験開始時	6ヵ月後	12ヵ月後	18ヵ月後	24ヵ月後	36ヵ月後
性状	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
形状	適合	適合	適合	適合	適合	適合
膏体質量*	-	-	-	-	適合	適合
粘着力	適合	適合	適合	適合	適合	適合
放出性**	適合	適合	適合	適合	適合	適合

各ロット n=3

*各ロット n=20×3

**各ロット n=6×3

長期保存試験（温度 25℃、相対湿度 60%、3 年間）の結果、ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg 「ファイザー」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが確認された。

②ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg 「ファイザー」⁶⁾

試験条件：25±2℃、60±5%RH

包装形態：アルミニウム箔/ポリエチレン複合フィルム

項目	試験開始時	6ヵ月後	12ヵ月後	18ヵ月後	24ヵ月後	36ヵ月後
性状	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
形状	適合	適合	適合	適合	適合	適合
膏体質量*	-	-	-	-	適合	適合
粘着力	適合	適合	適合	適合	適合	適合
放出性**	適合	適合	適合	適合	適合	適合

各ロット n=3

*各ロット n=20×3

**各ロット n=6×3

長期保存試験（温度 25℃、相対湿度 60%、3 年間）の結果、ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg 「ファイザー」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが確認された。

③ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」⁷⁾

試験条件：25±2℃、60±5%RH

包装形態：紙/アルミニウム箔/ポリエチレン積層フィルム

項目	試験開始時	6 ヶ月後	12 ヶ月後	18 ヶ月後	24 ヶ月後	30 ヶ月後
性状	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
定量試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合
形状	適合	適合	適合	適合	適合	適合
膏体質量*	-	-	-	-	-	適合
粘着力	適合	適合	適合	適合	適合	適合
放出性**	適合	適合	適合	適合	適合	適合

各ロット n=3

*30 ヶ月のみ実施、各ロット n=20×3

**各ロット n=6×3

長期保存試験 (温度 25℃、相対湿度 60%、2.5 年間) の結果、ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」は通常の市場流通下において 2.5 年間安定であることが確認された。

(2) 開封後安定性試験

①ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg・100mg 「ファイザー」⁸⁾

試験条件：25±2℃、60±5%RH

包装形態：アルミニウム箔/ポリエチレン複合フィルム

保存条件：開封後、チャックを閉めて保存

保存期間：4 週間

ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg 「ファイザー」、同 100mg 「ファイザー」を開封後再びチャックを閉め、恒温恒湿条件下 (25℃、相対湿度 60%) にて性状、定量試験、粘着力及び放出性の各項目について試験を行った結果、全ての試験項目において、試験開始時と比較して変化が認められなかったことから、本品は開封後 4 週間安定であることが確認された。

②ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」⁹⁾

試験条件：25±2℃、60±5%RH

包装形態：紙/アルミニウム箔/ポリエチレン積層フィルム

保存条件：開封後、チャックを閉めて保存

保存期間：4 週間

ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」を開封後再びチャックを閉め、恒温恒湿条件下 (25℃、相対湿度 60%) にて性状、定量試験、粘着力及び放出性の各項目について試験を行った結果、全ての試験項目において、試験開始時と比較して変化が認められなかったことから、本品は開封後 4 週間安定であることが確認された。

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）

該当しない

8. 溶出性

該当しない

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

日本薬局方一般試験法「薄層クロマトグラフィー」による

11. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方一般試験法「液体クロマトグラフィー」による

12. カ価

該当しない

13. 混入する可能性のある夾雑物

テープ剤： 6- [4- (1-Carboxyethyl) phenyl] -5-oxo-hexanoic acid

パップ剤： ロキソプロフェンの*l*-メントールエステル

ロキソプロフェンのグリセリンエステル

ロキソプロフェンのソルビトールエステル

14. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

15. 刺激性

(1) ウサギを用いた皮膚一次刺激性試験 (24 時間単回投与)

①ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg「ファイザー」の皮膚刺激性試験¹⁰⁾

ウサギを用いて標準品、ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg「ファイザー」及びその基剤を比較検討した結果、すべての被験製剤において、いずれの投与部位にも刺激性反応は認められず、一次刺激性がないものと判断された。

②ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg「ファイザー」の皮膚刺激性試験¹¹⁾

ウサギを用いて標準品、ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg「ファイザー」及びその基剤を比較検討した結果、すべての被験製剤において、いずれの投与部位にも刺激性反応は認められず、一次刺激性がないものと判断された。

(2) ウサギを用いた劣化品 (40℃で 6 ヶ月保存) の皮膚一次刺激性試験 (24 時間単回投与)

①ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg「ファイザー」劣化品の皮膚一次刺激性試験¹²⁾

ウサギを用いてロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg「ファイザー」劣化品を標準品と比較検討した結果、両剤ともにいずれの投与部位にも刺激性反応は認められず、一次刺激性がないものと判断された。

②ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg「ファイザー」劣化品の皮膚一次刺激性試験¹³⁾

ウサギを用いてロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg「ファイザー」劣化品を標準品と比較検討した結果、両剤ともに軽度の刺激性反応が認められたが、その刺激性の程度は極めて軽く、かつ一過性の反応であった。

(3) ウサギを用いた劣化品 (25℃で 30 ヶ月保存) の皮膚累積刺激性試験

①ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg「ファイザー」劣化品の皮膚累積刺激性試験¹⁴⁾

ウサギを用いて 14 日間経皮投与を行い、ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg「ファイザー」劣化品を標準品と比較検討した結果、両剤ともに、いずれの投与部位にも刺激性反応は認められず、累積刺激性がないものと判断された。

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：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

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試験の概要

該当資料なし

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 (NSAIDs)

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序¹⁾

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。

(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・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) コンパートメントモデル

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

(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

①ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg「ファイザー」¹⁵⁾

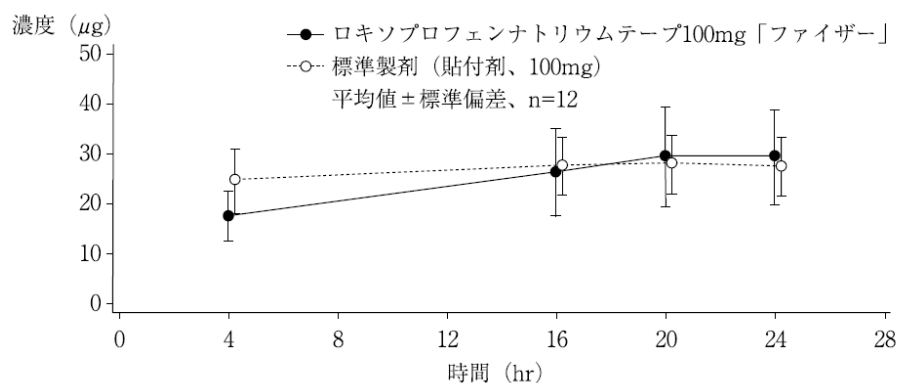
ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg「ファイザー」及び標準製剤を、健康成人男子を対象に、単回局所皮膚適用後に粘着テープを用いて角層剥離を行い、角層から得られたロキソプロフェンナトリウム回収量を求めた（皮膚薬物動態学試験）。

ロキソプロフェンナトリウム回収量についての統計解析を行った結果、薬物回収量の対数変換値の平均値の差の90%信頼区間が $\log(0.70) \sim \log(1.43)$ の範囲内であり、両製剤の生物学的同等性が確認された。

角層内ロキソプロフェンナトリウム濃度

	角層内ロキソプロフェンナトリウム濃度 (μg)			
	貼付4時間後	貼付16時間後	貼付20時間後	貼付24時間後
ロキソプロフェンナトリウム テープ100mg「ファイザー」	17.593 ± 4.869	26.416 ± 8.747	29.525 ± 9.905	29.425 ± 9.491
標準製剤	24.786 ± 6.387	27.910 ± 5.687	28.240 ± 5.819	27.515 ± 5.983

平均値 \pm 標準偏差 n=12



②ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」¹⁶⁾

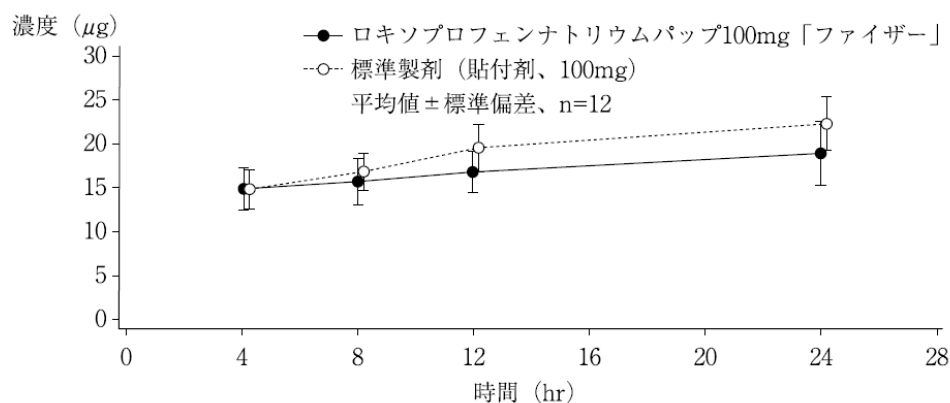
ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」及び標準製剤を、健康成人男子を対象に、単回局所皮膚適用後に粘着テープを用いて角層剥離を行い、角層から得られたロキソプロフェンナトリウム回収量を求めた（皮膚薬物動態学試験）。

ロキソプロフェンナトリウム回収量についての統計解析を行った結果、薬物回収量の対数変換値の平均値の差の90%信頼区間が $\log(0.70) \sim \log(1.43)$ の範囲内であり、両製剤の生物学的同等性が確認された。

角層内ロキソプロフェンナトリウム濃度

	角層内ロキソプロフェンナトリウム濃度 (μg)			
	貼付4時間後	貼付8時間後	貼付12時間後	貼付24時間後
ロキソプロフェンナトリウムパップ100mg 「ファイザー」	14.934 ±2.224	15.858 ±2.545	16.985 ±2.260	19.259 ±3.694
標準製剤	14.980 ±2.125	17.083 ±2.125	19.829 ±2.542	22.714 ±2.998

平均値±標準偏差 n=12



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

(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. 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。

(2) 重大な副作用（頻度不明）と初期症状

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

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。

	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

(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

該当資料なし

9. 高齢者への投与

高齢者への使用

他社が実施したロキソプロフェンナトリウム製剤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は、65歳未満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。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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対して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。〔妊娠中の使用に関する安全性は確立していない。〕
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。
- (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。

11. 小児等への投与

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）。

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

該当しない

16. その他

該当しない

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」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ウサギを用いた皮膚一次刺激性試験

ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg「ファイザー」及びロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg「ファイザー」をウサギに24時間貼付しても、皮膚刺激性は認められなかった。^{10)、11)}

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg 「ファイザー」 該当しない
ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg 「ファイザー」 該当しない
ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」 該当しない

有効成分：（日局）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

使用期限：外箱、内袋等に表示

（「IV. 製剤に関する項目」の「5. 製剤の各種条件下における安定性」の項を参照）

3. 貯法・保存条件

室温保存、遮光した気密容器に保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

該当しない

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」の「14. 適用上の注意」の項を参照

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg 「ファイザー」：70 枚（7 枚/1 袋×10 袋）
350 枚（7 枚/1 袋×50 袋）
ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg 「ファイザー」：70 枚（7 枚/1 袋×10 袋）
350 枚（7 枚/1 袋×50 袋）
ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」：70 枚（7 枚/1 袋×10 袋）
350 枚（7 枚/1 袋×50 袋）

7. 容器の材質

ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg・テープ 100mg 「ファイザー」
アルミニウム箔/ポリエチレン複合フィルム
ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」
紙/アルミニウム箔/ポリエチレン積層フィルム

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ロキソニン錠 60mg、ロキソニン細粒 10%、ロキソニンゲル 1%、ロキソニンパップ 100mg、
ロキソニンテープ 50mg・100mg（第一三共株式会社）、ロキソプロフェンナトリウム錠 60mg
「ファイザー」（ファイザー株式会社）、ロキソプロフェン Na 錠 60mg 「トーワ」（東和薬
品株式会社）等
同効薬：非ステロイド性消炎鎮痛剤

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	製造承認年月日	承認番号
ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg 「ファイザー」	2013年2月15日	22500AMX00090000
ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg 「ファイザー」	2013年2月15日	22500AMX00091000
ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」	2013年2月15日	22500AMX00089000

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、厚生労働省告示第 107 号（平成 18 年 3 月 6 日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

16. 各種コード

販売名	HOT（9 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
ロキソプロフェンナトリウム テープ 50mg「ファイザー」	122325501	2649735S2253	622232501
ロキソプロフェンナトリウム テープ 100mg「ファイザー」	122326201	2649735S3250	622232601
ロキソプロフェンナトリウム パップ 100mg「ファイザー」	122327901	2649735S1141	622232701

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品に該当する。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 日本薬局方解説書編集委員会編：「(処) ロキソプロフェンナトリウム」第十七改正 日本薬局方解説書 廣川書店：C-6001, 2016
- 2) 中野 泰志ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (1) -明朝体、ゴシック体、ユニバーサルデザイン書体の可読性の比較-」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：25, 2009 [L20110124004]
- 3) 新井 哲也ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (2) -低視力状態での可視性の比較-」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：29, 2009 [L20110124005]
- 4) 山本 亮ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発 (3) -低コントラスト状態での可視性の比較-」：第 35 回感覚代行シンポジウム講演論文集：33, 2009 [L20110124006]
- 5) 社内資料：長期保存試験 (ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg 「ファイザー」) [L20130218006]
- 6) 社内資料：長期保存試験 (ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg 「ファイザー」) [L20130128001]
- 7) 社内資料：長期保存試験 (ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」) [L20121218082]
- 8) 社内資料：開封後安定性試験(ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg 「ファイザー」、同 100mg 「ファイザー」) [L20130405001]
- 9) 社内資料：開封後安定性試験(ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」) [L20130405002]
- 10) 社内資料：皮膚一次刺激性試験(ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg 「ファイザー」) [L20121017046]
- 11) 社内資料：皮膚一次刺激性試験(ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」) [L20130405004]
- 12) 社内資料：劣化品の皮膚一次刺激性試験(ロキソプロフェンナトリウムテープ 100mg 「ファイザー」) [L20130405003]
- 13) 社内資料：劣化品の皮膚一次刺激性試験(ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」) [L20130405005]
- 14) 社内資料：劣化品の皮膚累積刺激性試験(ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」) [L20130405006]
- 15) 社内資料：生物学的同等性試験 (皮膚薬物動態学試験) (ロキソプロフェンナトリウムテープ 50mg 「ファイザー」、同 100mg 「ファイザー」) [L20121018025]
- 16) 社内資料：生物学的同等性試験 (皮膚薬物動態学試験) (ロキソプロフェンナトリウムパップ 100mg 「ファイザー」) [L20121218081]

2. その他の参考文献

該当資料なし

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

その他の関連資料

該当資料なし

文献請求先・製品情報お問い合わせ先

ファイザー株式会社 製品情報センター
〒151-8589 東京都渋谷区代々木3-22-7
学術情報ダイヤル 0120-664-467
FAX 03-3379-3053

製造販売元

株式会社大石膏盛堂
〒841-0037 佐賀県鳥栖市本町1丁目933番地

販売

ファイザー株式会社
〒151-8589 東京都渋谷区代々木3-22-7

提携

マイラン製薬株式会社
〒541-0053 大阪市中央区本町2丁目6番8号