

経皮吸収型鎮痛・抗炎症剤

# ロキソプロフェンNa外用ポンプスプレー1%「TCK」

《ロキソプロフェンナトリウムスプレー》

LOXOPROFEN Na

貯法：室温保存、気密容器（【取扱い上の注意】の項参照）  
使用期限：外装に表示

承認番号	22700AMX00588000
薬価収載	2015年6月
販売開始	2015年6月

## 【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】

ロキソプロフェンNa外用ポンプスプレー1%「TCK」は1g中にロキソプロフェンナトリウム水和物を11.3mg（無水物として10mg）含有する無色～微黄色透明の液で、芳香を有する。添加物として、ヒプロメロース、1,3-ブチレングリコール、クエン酸水和物、クエン酸Na水和物、メチルパラベン、1-メントール、エタノールを含有する。

## 【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

## 【用法及び用量】

症状により、適量を1日数回患部に噴霧する。

## 【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  
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。
  - (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。

頻度不明	
皮膚	そう痒、紅斑、接触性皮膚炎、皮疹、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、 $\gamma$ -GTP上昇
その他	浮腫

## 4. 高齢者への使用

ロキソプロフェンナトリウム水和物製剤（パップ剤及びテープ剤）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との報告がある。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、噴霧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。（使用経験がない）

## 7. 適用上の注意

- (1) 使用部位
  - 1) 損傷皮膚、眼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。
- (2) 使用方法  
密封包帯法（ODT）での使用により、全身的投与と同様の副作用が発現する可能性があるため、密封包帯法で使わないこと。

## 【薬物動態】

### 生物学的同等性試験

ロキソプロフェンNa外用ポンプスプレー1%「TCK」と標準製剤を皮膚薬物動態学的試験によりそれぞれ健康成人男子の背部に塗布したときの角層中未変化体量を測定した。得られた評価パラメータ（角層中未変化体量）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

	評価パラメータ（角層中未変化体量（ $\mu\text{g}/3.14\text{cm}^2$ ））			
	2時間塗布	4時間塗布	6時間塗布	8時間塗布
ロキソプロフェンNa外用ポンプスプレー1%「TCK」	12.8 ± 6.7	14.4 ± 6.9	14.5 ± 6.4	16.1 ± 6.7
標準製剤（ゲル剤、1%）	10.8 ± 4.0	11.3 ± 4.7	12.6 ± 5.2	13.2 ± 6.4

(Mean ± S.D., n = 12)

## 【薬効薬理】

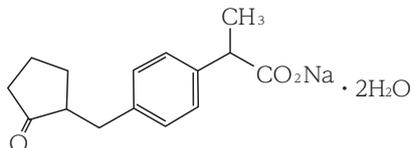
プロドラッグであり、活性代謝物のトランスOH体が酸性非ステロイド性抗炎症薬としての作用を示す。すなわち、プロスタグランジン合成の律速酵素であるシクロオキシゲナーゼ（COX）を阻害し、プロスタグランジンの産生を抑制することにより、抗炎症作用、解熱作用、鎮痛作用を現す。構成型COX（COX-1）と誘導型COX（COX-2）に対する選択性はない。<sup>2)</sup>

## 【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： $\text{C}_{15}\text{H}_{17}\text{NaO}_3 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$

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。  
1.0 g 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。

**＊【 取扱い上の注意 】**

**保管方法**

- (1) 使用後はきちんとキャップをしめ、なるべく涼しい所に保管すること。
- (2) 小児の手の届かない所に保管すること。

**安定性試験**

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度60%、3年)の結果、ロキソプロフェン Na 外用ポンプスプレー1%「TCK」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。<sup>3)</sup>

**【 包装 】**

100g × 5本

**【 主要文献 】**

- 1) 辰巳化学株式会社：生物学的同等性試験
- 2) 第十六改正 日本薬局方解説書
- 3) 辰巳化学株式会社：安定性試験

**【 文献請求先 】**

主要文献に記載の社内資料につきましては下記にご請求下さい。

辰巳化学株式会社 薬事・学術課  
〒921-8164 金沢市久安3丁目406番地  
TEL 076-247-2132  
FAX 076-247-5740



製造販売元  
**辰巳化学株式会社**  
金沢市久安3丁目406番地