

経皮吸収型鎮痛消炎剤
日本薬局方 フェルビナクパップ
フェルビナクパップ70mg「サワイ」
FELBINAC Cataplasm [SAWAI]

| | |
|------|------------------|
| 承認番号 | 22700AMX00048000 |
| 販売開始 | 1999年7月 |

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- 2.1 本剤又は他のフェルビナク製剤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。][9.1.1参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

| | |
|---------------|---|
| 有効成分 [1枚中] | 日局フェルビナク 70mg |
| 添加剤 | アクリル酸デンプン、クロタミトン、水酸化アルミナマグネシウム、ゼラチン、D-ソルビトール、1,3-ブチレングリコール、ポリアクリル酸部分中和物、ポリソルベート80、メタクリル酸・アクリル酸n-ブチルコポリマー、メタリン酸Na、モノオレイン酸ソルビタン、pH調節剤 |

3.2 製剤の性状

| | |
|-------|--|
| 剤形 | 貼付剤 |
| 性状 | 白色～淡黄色半透明の膏体を支持体に展延し、ライナーで被覆したパップ剤で、わずかに特異なおいがある |
| 大きさ | 10cm×14cm |
| 膏体重量 | 10g |
| 識別コード | SW-472(アルミ袋に記載) |

4. 効能又は効果

下記疾患並びに症状の鎮痛・消滅

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

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 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。
- 8.2 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。

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)

喘息発作を誘発するおそれがある。[2.2参照]

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

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。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を妊娠中期以降の妊婦に使用し、胎児の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。

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、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)
ショック、アナフィラキシー(蕁麻疹、血管浮腫、呼吸困難等)があらわれることがある。

11.2 その他の副作用

| | 0.1～1%未満 | 0.1%未満 | 頻度不明 |
|----|--------------------------------|--------|------|
| 皮膚 | 皮膚炎(発疹、湿疹を含む)、 そう痒、発赤、接触皮膚炎 | 刺激感 | 水疱 |

14. 適用上の注意

14.1 薬剤使用時の注意

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

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回貼付

フェルビナク貼付剤 4枚(1枚中にフェルビナク70mgを含有)を健康成人男子5例の背部に12時間単回貼付したときのフェルビナクの血中薬物動態パラメータは以下のとおりであった¹⁾。

| T _{max} (hr) | C _{max} (ng/mL) | AUC(μg·hr/mL) | T _{1/2} (hr) |
|-----------------------|--------------------------|---------------|-----------------------|
| 11.2±0.8 | 835±127 | 17.0±2.6 | 6.82±0.33 |

(平均値±S. E., n=5)

16.3 分布

0.5% ¹⁴C-フェルビナク貼付剤(パップ剤)3cm×4cmを雄性ラットの剃毛した正常背部皮膚に24時間貼付したとき、ほとんどの組織において放射能濃度は8時間後に最高値を示した。特に貼付部位皮膚で高濃度(219μg/g)が認められ、次いで血液、血漿、肝臓、腎臓及び貼付部位筋肉等に高濃度の放射能が認められた。

また、同様の実験をカラゲニン足浮腫ラットを用いて行ったとき、1、3及び6時間後の炎症部位の滲出液中放射能濃度は非貼付部位の約90～130倍の値を示した²⁾。

16.5 排泄

血中濃度測定と同時に測定した尿中排泄では、代謝物として主にフェルビナク抱合体並びに4'-OH-フェルビナク及びその抱合体が尿中に認められた。投与72時間後までのこれらの累積排泄量は、18.4mg(フェルビナク換算値、貼付量の6.6%)であり、そのうち未変化体フェルビナクの排泄量は約0.3mgであった¹⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

疼痛、急性炎症・慢性炎症に対し、鎮痛・抗炎症作用を示す。

18.1.1 プロスタグランジン合成抑制作用

フェルビナクは、モルモット肺より抽出したプロスタグランジン合成酵素のシクロオキシゲナーゼに対し、阻害作用が認められた(IC₅₀=0.61μg/mL)³⁾。

18.1.2 抗プロスタグランジン作用

フェルビナクは、プロスタグランジンE₁によるスナネズミ結腸の収縮に対し、抑制作用を示した³⁾。

18.2 鎮痛作用

フェルビナク貼付剤は、ラットのRandall-Selitto法及び硝酸銀関節炎等の炎症性疼痛に対し、鎮痛作用を示した⁴⁾。

18.3 抗炎症作用

フェルビナク貼付剤は、ラットのカラゲニン足浮腫、打撲足浮腫及びアジュバント関節炎等の急性・慢性炎症反応に対して抗炎症作用を示した。また、ウサギの抗原誘発膝関節炎に対して、膝関節腫脹を抑制し、炎症滑膜中のプロスタグランジンE₂含量を低下させた⁴⁾。

18.4 生物学的同位性試験

フェルビナクパップ70mg「サワイ」とセルタッチパップ70について、カラゲニン足浮腫抑制試験(ラット)およびアジュバント関節炎抑制試験(ラット)により抗浮腫作用を、酵母による炎症性疼痛抑制試験(ラット)により鎮痛作用を比較検討した。その結果、両剤とも無処置群および基剤貼付群に比して有意な抑制作用を示し、両剤間に有意な差は認められず、両剤は生物学的に同等であると判断された⁵⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：フェルビナク (Felbinac)

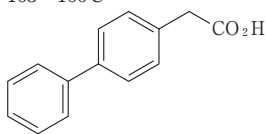
化学名：Biphenyl-4-ylacetic acid

分子式：C₁₄H₁₂O₂

分子量：212.24

融点：163~166℃

構造式：



性状：白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。メタノール又はアセトンにやや溶けやすく、エタノール(95)にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

20. 取扱い上の注意

20.1 保管方法

20.1.1 開封後は、開封口のチャックを合わせて袋を密閉すること。

22. 包装

350枚(7枚×50袋)

23. 主要文献

- 1) 大西明弘他：薬理と治療, 1992; 20(1) : 115-138
- 2) 山下憲昭他：薬理と治療, 1992; 20(10) : 3957-3971
- 3) Tolman, E. L. et al. : Prostaglandins, 1975; 9(3) : 349-359
- 4) 柴富志治他：薬理と治療, 1992; 20(10) : 3943-3956
- 5) 社内資料：生物学的同等性試験

*24. 文献請求先及び問い合わせ先

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター

〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30

TEL : 0120-381-999 FAX : 06-7708-8966

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

沢井製薬株式会社

大阪市淀川区宮原5丁目2-30