

**2024年10月改訂(第2版)

*2023年9月改訂(第1版)

日本標準商品分類番号

872649

貯法: 室温保存

有効期間: 3年

	70mg	140mg
承認番号	22500AMX00596000	22500AMX00597000
販売開始	1999年7月	2010年5月

経皮鎮痛消炎パップ剤

日本薬局方 フェルビナクパップ

フェルビナクパップ 70mg「ラクール」

FELBINAC PAPS 70mg「RAKOOL」

フェルビナクパップ 140mg「ラクール」

FELBINAC PAPS 140mg「RAKOOL」

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]

9.1.1 気管支喘息の患者(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。

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	フェルビナクパップ 70mg「ラクール」	フェルビナクパップ 140mg「ラクール」
有効成分	1枚中 日局フェルビナク 70mg	1枚中 日局フェルビナク 140mg
添加剤	ポリビニルアルコール(部分けん化物)、カルボキシビニルポリマー、ポリアクリル酸部分中和物、D-ソルビトール、グリセリン、ポリソルベート80、N-メチル-2-ピロリドン、ケイ酸アルミン酸Mg、カオリン、酸化チタン	

3.2 製剤の性状

販売名	フェルビナクパップ 70mg「ラクール」	フェルビナクパップ 140mg「ラクール」
性状	白色～淡黄色の膏体を不織布に展延し、膏体表面をプラスチックフィルムで被覆した貼付剤であり、わずかに特異なおいを有する。	
1枚の大きさ	10cm×14cm	14cm×20cm
膏体の質量	14g	28g
識別コード	02	10

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

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

**9.5 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

	副作用の頻度		
	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

フェルビナクパップ 70mg 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平均血清中濃度及び薬物動態パラメータは、下図のような推移を示した¹⁾。

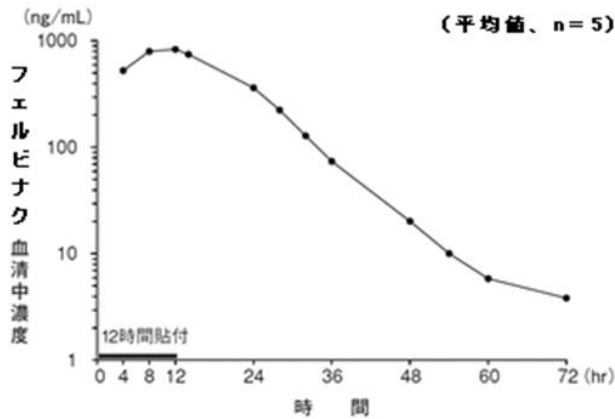


図 フェルビナクパップ 70mg 4 枚 (1 枚中にフェルビナク 70mg を含有) 単回貼付後の血清中フェルビナク濃度推移

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 (219 μg/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

血清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⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

国内で総計 40 例について実施された一般臨床試験の概要は次の通りである³⁾。

疾患名	改善率	
	中等度改善以上	軽度改善以上
変形性膝関節症	55.0% (11/20)	90.0% (18/20)
肩関節周囲炎	66.7% (4/6)	83.3% (5/6)
筋肉痛	71.4% (5/7)	100% (7/7)
外傷後の腫脹・疼痛	100% (5/5)	100% (5/5)
その他	100% (2/2)	100% (2/2)

副作用：40 例中 1 例 (2.5%) に軽度な接触性皮膚炎が認められたが、治験は継続し、発現後 3 日で症状は全て回復した。

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=0.61 μg/mL)⁴⁾。

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⁴⁾。

18.2 鎮痛作用

フェルビナクパップは、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⁵⁾。

18.3 抗炎症作用

フェルビナクパップは、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⁵⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：フェルビナク (Felbinac) [JAN]

化学名：Biphenyl-4-ylacetic acid

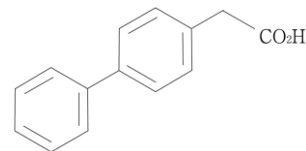
分子式：C₁₄H₁₂O₂

分子量：212.24

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。

化学構造式：



融点：163~166°C

20. 取扱い上の注意

20.1 保管方法

20.1.1 直射日光や高温を避けて保存すること。

20.1.2 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

〈フェルビナクパップ 70mg 「ラクール」〉

*300 枚 (6 枚×50)、350 枚 (7 枚×50)、
600 枚 (6 枚×100)、700 枚 (7 枚×100)

〈フェルビナクパップ 140mg 「ラクール」〉

280 枚 (7 枚×40)

23. 主要文献

- 1) 大西明弘ほか：薬理と治療。1992；20 (1)：115-138
- 2) 山下憲昭ほか：薬理と治療。1992；20 (10)：3957-3971
- 3) 社内資料：臨床試験成績 (1998 年 12 月承認、申請資料)
- 4) Tolman E.L., et al. : Prostaglandins. 1975；9 (3)：349-359
- 5) 柴富志治ほか：薬理と治療。1992；20 (10)：3943-3956

24. 文献請求先及び問い合わせ先

ラクール薬品販売株式会社 DI 室

〒123-0864 東京都足立区鹿浜 1 丁目 9 番 14 号

TEL：03-3899-8881 FAX：03-3853-9641

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

三友薬品株式会社

東京都足立区鹿浜 1 丁目 9 番 14 号

26.2 発売元

ラクール薬品販売株式会社

東京都足立区鹿浜 1 丁目 9 番 14 号