

貯 法：室温保存
有効期間：3年

承認番号	21900AMX01118000
販売開始	1986年8月

経皮鎮痛消炎剤

ケトプロフェン ゲル

セクター[®]ゲル 3% SECTOR[®] Gel 3%

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- 2.1 本剤又は本剤の成分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、11.1.2参照]
- 2.3 チアプロフェン酸、スプロフェン、フェノフィブラート並びにオキシベンゾン及びオクトクリレンを含有する製品(サンスクリーン、香水等)に対して過敏症の既往歴のある患者[これらの成分に対して過敏症の既往歴のある患者では、本剤に対しても過敏症を示すおそれがある¹⁾]
- 2.4 光線過敏症の既往歴のある患者[5、8.1、11.1.4参照]
- 2.5 妊娠後期の女性[9.5.1参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

販 売 名	セクターゲル3%
有 効 成 分	1g中 日局ケトプロフェン 30mg
添 加 剤	アジピン酸ジイソプロピル、エタノール、オキシベンゾン、カルボキシビニルポリマー、ジイソプロパノールアミン、ジブチルヒドロキシトルエン、フェニルエチルアルコール、プロピレングリコール、その他1成分を含有する。

3.2 製剤の性状

販 売 名	セクターゲル3%
色 調 ・ 性 状	無色～微黄色透明なゼリー状の軟膏で、特異な芳香がある。
識 別 コード	HP211G

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、腱周炎、上腕骨上顆炎(テニス肘等)、筋肉痛、外傷後の腫脹・疼痛

5. 効能又は効果に関連する注意

本剤の使用により重篤な接触皮膚炎、光線過敏症が発現することがあり、中には重度の全身性発疹に進展する例が報告されているので、疾病の治療上の必要性を十分に検討の上、治療上の有益性が危険性を上回る場合にのみ使用すること。[2.4、8.1、9.8、11.1.3、11.1.4参照]

6. 用法及び用量

症状により、適量を1日数回患部に塗擦する。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 接触皮膚炎又は光線過敏症を発現することがあり、中には重度の全身性発疹に至った症例も報告されているので、使用前に患者に対し次の指導を十分に行うこと。[2.4、5、9.8、11.1.3、11.1.4参照]
 - ・紫外線曝露の有無にかかわらず、接触皮膚炎を発現することがあるので、発疹・発赤、そう痒感、刺激感等の皮膚症状が認められた場合には、直ちに使用を中止し、患部を遮光し、受診すること。なお、使用後数日を経過して発現する場合があるので、同様に注意すること。

・光線過敏症を発現することがあるので、使用中は天候にかかわらず、戸外の活動を避けるとともに、日常の外出時も、塗布部を衣服、サポーター等で遮光すること。なお、白い生地や薄手の服は紫外線を透過させるおそれがあるので、紫外線を透過させにくい色物の衣服などを着用すること。また、使用後数日から数カ月を経過して発現することもあるので、使用後も当分の間、同様に注意すること。異常が認められた場合には直ちに使用を中止し、患部を遮光し、適切な処置を行うこと。また使用後は手をよく洗うこと。

- 8.2 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。
- 8.3 慢性疾患(変形性関節症等)に対し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)

アスピリン喘息でないことを十分に確認すること。気管支喘息の患者の中にはアスピリン喘息患者が潜在していることが考えられており、それらの患者では喘息発作を誘発するおそれがある。[2.2、11.1.2参照]
 - 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
 - 9.5.1 妊娠後期の女性

使用しないこと。ケトプロフェンの外用剤を妊娠後期の女性に使用した場合、胎児動脈管収縮が起きることがある。[2.5参照]
 - 9.5.2 妊婦(妊娠後期を除く)又は妊娠している可能性のある女性

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。必要最小限の使用にとどめるなど慎重に使用すること。ケトプロフェンの外用剤を妊娠中期の女性に使用し、羊水過少症が起きたとの報告がある。また、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。
- 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。
- 9.8 高齢者

適用部の皮膚の状態に注意しながら慎重に使用すること。類薬(0.3%ケトプロフェン貼付剤)の市販後調査の結果、高齢者で副作用(接触皮膚炎)の発現率が有意に高かった。[5、8.1、11.1.3参照]

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(頻度不明)、アナフィラキシー(0.1%未満)
ショック、アナフィラキシー(蕁麻疹、呼吸困難、顔面浮腫等)があらわれることがある。
- 11.1.2 喘息発作の誘発(アスピリン喘息)(0.1%未満)
乾性ラ音、喘鳴、呼吸困難等の初期症状が発現した場合は使用を中止すること。なお、本剤による喘息発作の誘発は、使用後数時間で発現している。[2.2、9.1.1参照]
- 11.1.3 接触皮膚炎(5%未満、重篤例は頻度不明)
塗布部に発現したそう痒感、刺激感、紅斑、発疹・発赤等が悪化し、腫脹、浮腫、水疱・びらん等の重度の皮膚炎症状や色素沈着、色素脱失が発現し、さらに全身に皮膚炎症状が拡大し重篤化することがある。なお、使用後数日を経過してから発現することもある。[5、8.1、9.8参照]
- 11.1.4 光線過敏症(0.1%未満)
塗布部を紫外線に曝露することにより、強いそう痒を伴う紅斑、発疹、刺激感、腫脹、浮腫、水疱・びらん等の重度の皮膚炎症状や色素沈着、色素脱失が発現し、さらに全身に皮膚炎症状が拡大し重篤化することがある。なお、使用後数日から数カ月を経過してから発現することもある。[2.4、5、8.1参照]

11.2 その他の副作用

分類	頻度	1%未満	頻度不明
皮膚		発赤、発疹、かぶれ、そう痒感、皮膚炎	適用部の腫脹、刺激感、水疱・びらん、色素沈着、皮膚乾燥

14. 適用上の注意

14.1 薬剤使用時の注意

14.1.1 使用時

- 眼及び粘膜に使用しないこと。
- 表皮が欠損している場合に使用すると一時的にしみる、ヒリヒリ感を起こすことがあるので使用に際し注意すること。
- 密封包帯法で使用しないこと。

14.1.2 使用後

- 手をよく洗うこと。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

本剤10g(ケトプロフェンとして300mg)を健康成人男子5名の背部900cm²に24時間単回塗布した試験の結果、血中濃度は8時間後に最高となり、246ng/mLであった²⁾。

16.1.2 反復投与

健康成人男子6名の背部連続塗布試験(3.3g/300cm²/回、4時間塗布×3回/日、14日間)の結果、最高血中濃度は2日目以降ほぼ一定となり、94~173ng/mLであった。塗布終了後は速やかに血中より消失した²⁾。

16.1.3 モルモットに50mg/4cm²を単回塗布した実験で、角質層を除去した損傷皮膚に塗布した場合の血中濃度は塗布後2時間で最高に達し、経口投与と同程度であった³⁾。

16.2 吸収

健康成人男子5名の前腕部への40μL/4cm²(ケトプロフェン:1.2mg)塗布において、8時間後のケトプロフェン経皮吸収量は155.43±14.28μgで、経皮吸収率は15.20±1.40%であった⁴⁾。

16.3 分布

16.3.1 変形性膝関節症患者7名の単回塗布試験(4g/400cm²)の結果、塗布後2時間で滑液中にケトプロフェンが検出された。施術患者7名に単回塗布(1g/100cm²)したとき、6時間後の組織内濃度は皮膚で最も高く、以下、皮下脂肪、筋肉、滑膜、血清の順であった。また、変形性膝関節症患者3名の片膝100cm²に7日間連続塗布した結果(1日3~4回塗布、計25g)で、最終塗布後4時間の血清中濃度は15ng/mLで、滑液中では6.4ng/mLであった⁵⁾。

16.3.2 モルモットに50mg/4cm²を単回塗布した実験で、塗布部直下の筋肉内濃度は6時間で最高に達した。このときの筋肉内濃度は5mg/kgを経口投与した場合と同程度で、非塗布部の約10倍であった。他の臓器への分布は全般的に少なかったが、腎臓、肝臓及び肺では他の臓器に比較して若干高かった³⁾。

16.4 代謝

経皮適用による代謝物は非経皮投与による代謝物と著しく異なるとは考えられず、貼付後の尿中代謝物は主にケトプロフェングルクロナイドと考えられる²⁾。

16.5 排泄

16.5.1 主に腎臓から排泄される²⁾。

16.5.2 本剤10g(ケトプロフェンとして300mg)を健康成人男子5名の背部900cm²に24時間単回塗布した試験の結果、塗布後72時間で排泄をほぼ終了し、このときの尿中総排泄量は塗布量の2.8%で大部分はグルクロン酸抱合体であった²⁾。

16.5.3 健康成人男子6名の背部連続塗布試験(3.3g/300cm²/回、4時間塗布×3回/日、14日間)の結果、この間の尿中排泄量は3.0~5.6mg/日で、塗布終了後は速やかに尿中より消失した²⁾。

16.5.4 モルモットに50mg/4cm²を単回塗布した実験で、塗布後120時間までに投与量の19%が尿中に、2%が糞中に排泄された³⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

総計1,182例について実施された二重盲検試験を含む臨床試験結果の概要は以下のとおりである⁶⁻¹²⁾。

疾患名	使用量	使用期間	改善率(中等度改善以上)
変形性関節症	1日3~4回、 1回約1gを 患部に 単回塗布	2週間	59.0%(128/217例)
肩関節周囲炎			51.4%(73/142例)
腱・腱鞘炎			60.0%(108/180例)
腱周囲炎			65.4%(17/26例)
上腕骨上顆炎			59.3%(96/162例)
筋肉痛		68.9%(93/135例)	
外傷後の腫脹・疼痛		1週間	76.3%(190/249例)

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

プロスタグランジン生合成抑制作用、血管透過性亢進抑制作用、白血球遊走阻止作用、蛋白熱変性抑制作用、細胞膜安定化作用及びブラジキニン遊離抑制作用などが考えられている¹³⁾。

18.2 抗炎症作用

ザイモザン筋肉炎抑制試験(モルモット)、カラゲニン足浮腫抑制試験(ラット)、打撲足浮腫抑制試験(ラット)、コットンベレット肉芽増殖抑制試験(ラット)、アジュバント関節炎抑制試験(ラット)、紫外線紅斑抑制試験(モルモット)においてインドメタシン1%含有軟膏と同等かそれより優れた抗炎症作用が認められた^{14、15)}。

18.3 鎮痛作用

カラゲニン炎症足疼痛抑制試験(ラット)及びアジュバント関節炎疼痛抑制試験(ラット)においてインドメタシン1%含有軟膏と同等以上の局所鎮痛作用が認められた^{14、15)}。

18.4 プロスタグランジン生合成抑制作用

ウシ血清アルブミン誘発関節炎(ウサギ)で亢進したプロスタグランジンの滑膜における生合成を抑制した¹⁶⁾。

19. 有効成分に関する理化学的見聞

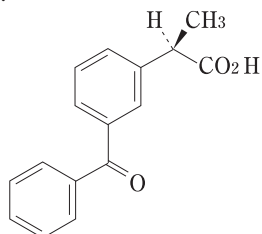
一般的名称:ケトプロフェン(Ketoprofen)

化学名:(2R)-2-(3-Benzoylphenyl)propanoic acid

分子式:C₁₆H₁₄O₃

分子量:254.28

構造式:



及び鏡像異性体

性状:本品は白色の結晶性の粉末である。本品はメタノールに極めて溶けやすく、エタノール(95)又はアセトンに溶けやすく、水にほとんど溶けない。本品は光によって微黄色になる。

融点:94~97°C

22. 包装

250g[25g(チューブ)×10本]

23. 主要文献

- 1) Veyrac G, et al: *Thérapie* 2002; 57(1): 55-64.
- 2) 笹井陽一郎 ほか: *薬理と治療* 1984; 12(6): 2273-84.
- 3) 矢野忠則 ほか: *医薬品研究* 1985; 16(1): 32-41.
- 4) 久光製薬社内資料, ヒトにおける経皮吸収と尿中排泄.
- 5) 菅原幸子 ほか: *薬理と治療* 1985; 13(2): 1105-12.
- 6) 景山孝正 ほか: *薬理と治療* 1984; 12(6): 2297-317.
- 7) 池田定倫 ほか: *薬理と治療* 1984; 12(6): 2319-31.
- 8) 景山孝正 ほか: *薬理と治療* 1984; 12(6): 2333-60.
- 9) 七川欽次 ほか: *薬理と治療* 1984; 12(6): 2379-93.
- 10) 池田定倫 ほか: *薬理と治療* 1984; 12(6): 2395-408.
- 11) 菅原幸子: *薬理と治療* 1984; 12(6): 2409-17.
- 12) 景山孝正 ほか: *薬理と治療* 1986; 14(4): 2759-86.
- 13) 斉田勝 ほか: *医薬品研究* 1986; 17(6): 1133-43.
- 14) 斉田勝 ほか: *応用薬理* 1985; 29(6): 1023-9.
- 15) 斉田勝 ほか: *応用薬理* 1985; 29(5): 833-43.
- 16) 斉田勝 ほか: *応用薬理* 1985; 29(5): 845-56.

24. 文献請求先及び問い合わせ先

久光製薬株式会社 お客様相談室
〒135-6008 東京都江東区豊洲三丁目3番3号
TEL. 0120-381332
FAX.(03)5293-1723
受付時間/9:00-17:50(土日・祝日・会社休日を除く)

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元
久光製薬株式会社
〒841-0017 鳥栖市田代大官町408番地

製造販売元

 **久光製薬株式会社**
〒841-0017 鳥栖市田代大官町408番地