

貯 法	室温保存
使用期限	包装に表示の使用期限内に使用すること。
注 意	火気に近づけないこと。

日本標準商品分類番号	8 7 2 6 4 9
------------	-------------

承認番号	22200AMX00377
薬価収載	2010年9月
販売開始	2010年10月
再審査結果	2014年9月
国際誕生	1986年3月

経皮吸収型鎮痛・抗炎症剤

# ロキソニンゲル1%

LOXONIN® GEL

ロキソプロフェンナトリウム水和物ゲル

**【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】****1. 組 成**

1g中に次の成分を含有

販 売 名	有効成分	添 加 物
ロキソニンゲル1%	ロキソプロフェンナトリウム水和物(日局) 11.3mg (無水物として10mg)	エタノール、1,3-ブチレングリコール、ヒプロメロース、カルボキシビニルポリマー、2,2',2"-トリロトリエタノール

**2. 製剤の性状**

無色～微黄色透明のゼリー状のゲル剤である。

**【効 能 ・ 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 ・ 用 量】**

症状により、適量を1日数回患部に塗擦する。

**【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、副作用発現頻度が明確となる臨床試験を実施していない。なお、ロキソニンパップ100mgにおいて承認時までに報告された副作用(自覚症状及び臨床検査値異常)は、安全性評価対象例1,075例中91例(8.5%)であった。その主なものは、そう痒(2.1%)、紅斑(1.5%)、接触性皮膚炎(1.4%)等の皮膚症状、胃不快感(0.6%)等の消化管症状、ALT(GPT)上昇(0.6%)、AST(GOT)上昇(0.5%)等の臨床検査値異常であった。

ロキソニンパップ100mg及びロキソニンテープ50mg・100mgにおいて製造販売後調査3,038例中87例(2.9%)に副作用が報告され、主なものは、接触性皮膚炎(1.4%)、そう痒(0.5%)、紅斑(0.4%)等の皮膚症状であった。

[再審査終了時]

**\* (1) 重大な副作用(頻度不明<sup>注</sup>)**

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。

	0.5～3%未満	0.5%未満	頻度不明 <sup>注</sup>
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、γ-GTP上昇	
その他		浮腫	

[ロキソニンパップ100mg及びロキソニンテープ50mg・100mgの集計]

注)自発報告において認められている副作用のため頻度不明。

**4. 高齢者への使用**

ロキソニンパップ100mg及びロキソニンテープ50mg・100mg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(3.7%、1,738例中65例)は、65歳未満(1.7%、1,300例中22例)と比較して有意に高かった。主な副作用が使用部位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、塗擦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、密封包帯法で使用しないこと。

### 【薬物動態】<sup>1)</sup>

健康成人男性の背部に、本剤及び1%ロキソプロフェンナトリウム水和物含有パップ剤を投与したとき、両剤の角層中ロキソプロフェン量は同等であった。

### 【臨床成績】<sup>2~8)</sup>

ロキソプロフェンナトリウム水和物含有パップ剤における国内で実施された二重盲検比較試験を含む臨床試験成績の概要は次のとおり。

疾患名	改善率(改善以上例数/評価例数)
変形性関節症	75.5%(240/318)
筋肉痛	80.7%(184/228)
外傷後の腫脹・疼痛	98.1%(101/103)

### 【薬効薬理】

ロキソプロフェンナトリウム水和物は皮膚から吸収された後、活性代謝物trans-OH体に変換され、急性炎症・慢性炎症、疼痛に対して、優れた抗炎症・鎮痛作用を示す。

#### 1. 抗炎症作用<sup>9)</sup>

ロキソプロフェンナトリウム水和物含有パップ剤は、急性炎症モデルであるカラゲニン浮腫(ラット)、慢性炎症モデルであるアジュバント関節炎(ラット)のいずれに対しても有意な抗炎症作用を示した。

#### 2. 鎮痛作用<sup>9,10)</sup>

ロキソプロフェンナトリウム水和物含有パップ剤は、ランダルセリット法(ラット)において、鎮痛作用を示した。また、アジュバント慢性関節炎疼痛(ラット)に対しても鎮痛作用を示した。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

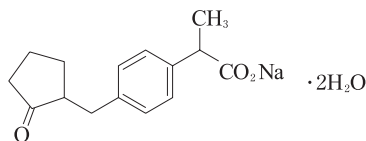
一般名：ロキソプロフェンナトリウム水和物(Loxoprofen Sodium Hydrate)

化学名：Monosodium 2-{4-[(2-oxocyclopentyl)methyl]phenyl}propanoate dihydrate

分子式：C<sub>15</sub>H<sub>17</sub>NaO<sub>3</sub>・2H<sub>2</sub>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。

分配係数：

有機溶媒	水相のpH	分配係数K
1-オクタノール	日局、第1液(pH1.2)	190
	日局、第2液(pH6.8)	0.82
クロロホルム	日局、第1液(pH1.2)	87
	日局、第2液(pH6.8)	0.95

## 【包装】

ロキソニンゲル1% 25g×10 50g×10

## 【主要文献】

- 1) 社内資料：生物学的同等性の検討
- 2) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22(4)：311-326
- 3) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22(5)：393-409
- 4) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22(5)：411-426
- 5) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2006；22(5)：427-442
- 6) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2007；23(1)：55-71
- 7) 菅原幸子ほか：臨床医薬 2007；23(2)：127-141
- 8) 社内資料：変形性膝関節症に対する一般臨床試験
- 9) 浜本哲和ほか：臨床医薬 2006；22(3)：179-186
- 10) 社内資料：ラットにおける鎮痛効果に関する検討

### 【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

第一三共株式会社 製品情報センター

〒103-8426 東京都中央区日本橋本町3-5-1

TEL：0120-189-132

製造販売元



Daiichi-Sankyo

第一三共株式会社

東京都中央区日本橋本町3-5-1