

貯 法：室温保存

有効期間：3年

経皮鎮痛消炎パップ剤（無香性）

日本薬局方 フェルビナクパップ

フェルビナクパップ70mg「ユートク」

F E L B I N A C P A P S

承認番号 22700AMX00101000

販売開始 2000年9月

## 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 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
- 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（膏体14g）中 日局フェルビナク70mg
添加剤	ジイソプロパノールアミン、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、ポリアクリル酸部分中和物、カルボキシビニルポリマー、グリセリン、D-ソルビトール、エデト酸ナトリウム水和物、ゼラチン、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、ヒマシ油、pH調節剤、その他2成分

### 3.2 製剤の性状

性状	白色～淡黄色の膏体を不織布に展延し、膏体表面をライナーで被覆した外用貼付剤
1枚の大きさ	10cm×14cm
識別コード	YP-DCF70

## 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

- 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。
- 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。

### 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

- 損傷皮膚及び粘膜に使用しないこと。
- 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薬物動態パラメータは、次のとおりであった<sup>1)</sup>。

T <sub>max</sub> (hr)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	AUC (μg・hr/mL)	T <sub>1/2</sub> (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% <sup>14</sup>C-フェルビナクパップ剤 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<sup>2)</sup>。

### 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<sup>1)</sup>。

## 17. 臨床成績

### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

国内で実施された第Ⅲ相臨床試験の改善率は次のとおりであった<sup>3)</sup>。

疾患名	症例数	著明改善	中等度改善	軽度改善	不変	悪化	中等度改善以上
変形性膝関節症	23 (100)	5 (21.7)	8 (34.8)	7 (30.4)	3 (13.0)	0 (0.0)	13 (56.5)
外傷後の腫脹・疼痛	21 (100)	5 (23.8)	11 (52.4)	4 (19.0)	1 (4.8)	0 (0.0)	16 (76.2)

( ) 内%

## 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<sup>4)</sup>。

#### 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E<sub>2</sub>によるスナネズミ結腸の収縮に対し、抑制作用を示した<sup>4)</sup>。

### 18.2 鎮痛作用

フェルビナクパップ剤は、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<sup>5)</sup>。

#### 18.2.1 ビール酵母誘発炎症性疼痛に対する作用

起炎剤投与前にラット (n=10) の右後肢足蹠にフェルビナクパップ70mg「ユートク」を4時間貼付し、Randall-Selitto法によるビール酵母誘発炎症に対する試験を行った結果、鎮痛作用を示した。このとき、フェルビナクパップ70mg「ユートク」とセルタッチパップ70の鎮痛作用に有意差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>6)</sup>。

### 18.3 抗炎症作用

フェルビナクパップ剤は、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E<sub>2</sub>含量を低下させた<sup>5)</sup>。

#### 18.3.1 カラゲニン誘発足蹠浮腫に対する作用

起炎剤投与前にラット (n=10) の右後肢足蹠にフェルビナクパップ70mg「ユートク」を4時間貼付し、カラゲニン足浮腫抑制試験を行った結果、抗炎症作用を示した。このとき、フェルビナクパップ70mg「ユートク」とセルタッチパップ70の抗炎症作用に有意差は認められず、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>6)</sup>。

## 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

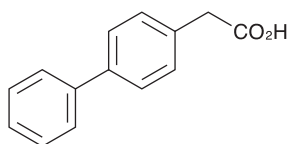
分子式：C<sub>14</sub>H<sub>12</sub>O<sub>2</sub>

分子量：212.24

性状：本品は白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

本品は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℃

## 22. 包装

140枚 (7枚/袋×20袋)

350枚 (7枚/袋×50袋)

700枚 (7枚/袋×100袋)

## 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) 株式会社大石膏盛堂 社内資料 (比較臨床試験)
- 4) Tolman EL, 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
- 6) 株式会社大石膏盛堂 社内資料 (薬力学的試験)

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

祐徳薬品工業株式会社 学術研修部

〒812-0039 福岡市博多区冷泉町5番32号 オーシャン博多ビル

TEL 092-271-7702

FAX 092-271-6405

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

株式会社大石膏盛堂

佐賀県鳥栖市本町1丁目933番地

### 26.2 発売元

祐徳薬品工業株式会社

佐賀県鹿島市大字納富分2596番地1

発売元  祐徳薬品工業株式会社  
佐賀県鹿島市大字納富分2596番地1

製造販売元  株式会社大石膏盛堂  
佐賀県鳥栖市本町1丁目933番地