

貯法：室温保存
有効期間：3年

経皮鎮痛消炎剤(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「NP」

FELBINAC CATAPLASMS

承認番号	22400AMX01014
販売開始	2012年12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

販売名	フェルビナクパップ70mg「NP」
有効成分	1枚中 日本薬局方 フェルビナク 70mg
添加剤	ポリアクリル酸部分中和物、ポリアクリル酸ナトリウム、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ゼラチン、エデト酸ナトリウム水和物、ジイソプロパノールアミン、濃グリセリン、プロピレングリコール、D-ソルビトール液、軽質無水ケイ酸、酸化チタン、pH調節剤、その他2成分

3.2 製剤の性状

販売名	フェルビナクパップ70mg「NP」
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パップ剤
大きさ	14cm×10cm
膏体の質量	10g

4. 効能・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・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¹⁾。

Tmax (hr)	Cmax (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⁾。

16.8 その他

16.8.1 生物学的同等性試験

フェルビナクパップ70mg「NP」とセルタッチパップ70を健康成人男性の背部皮膚に貼付し、貼付8時間後及び12時間後の角質層中薬物量(角質層中フェルビナク量)を測定した。得られた値について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、角質層中フェルビナク量の平均値の差はlog(0.70)～log(1.43)の範囲内であり、両製剤の生物学的同等性が確認された³⁾。

*18. 薬効薬理

18.1 作用機序

フェンブフェンの活性本体であり、酸性非ステロイド性抗炎症薬としてプロスタグランジン生合成の律速酵素であるシクロオキシゲナーゼ(COX)を阻害し、プロスタグランジンの産生を抑制することにより、抗炎症作用、解熱作用、鎮痛作用を現す。構成型

COX (COX-1) と誘導型 COX (COX-2) に対する選択性はない^{4), 5)}。

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 ($IC_{50}=0.61 \mu\text{g/mL}$)⁶⁾。

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_1 によるスナネズミ結腸の収縮に対し、抑制作用を示した⁶⁾。

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⁷⁾。

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_2 含量を低下させた⁷⁾。

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

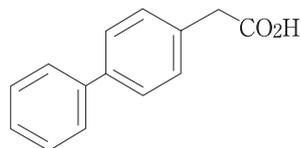
分子式： $C_{14}H_{12}O_2$

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。

構造式：



融点：163～166℃

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/1 袋×50 袋)

700 枚 (7 枚/1 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) 社内資料：生物学的同等性試験
- 4) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店 2021; C-4644-C-4646
- 5) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店 2021; C-4663-C-4666
- 6) Tolman E.L., et al.: Prostaglandins. 1975; 9(3): 349-359
- 7) 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

ニプロ株式会社 医薬品情報室

〒566-8510 大阪府摂津市千里丘新町3番26号

TEL 0120-226-898

FAX 050-3535-8939

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

ニプロファーマ株式会社

大阪府摂津市千里丘新町3番26号

26.2 販売元

ニプロ株式会社

大阪府摂津市千里丘新町3番26号