

経皮吸収型鎮痛・消炎温感貼付剤
インドメタシン貼付剤ラクティオンパップ[®] 70mg
LACTION PAP 70mg貯法：室温保存
有効期間：3年

| | |
|------|------------------|
| 承認番号 | 22000AMX00495000 |
| 販売開始 | 1997年9月 |

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 本剤の成分又は他のインドメタシン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〔重症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 | ラクティオンパップ70mg |
| 有効成分 | 1枚（膏体12.0g）中 日局 インドメタシン 70mg |
| 添加剤 | カオリン、酸化チタン、ゼラチン、ヒマシ油、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、ポリアクリル酸部分中和物、尿素、カルメロースナトリウム、プロピレングリコール、D-ソルビトール液、乾燥水酸化アルミニウムゲル、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、エデト酸ナトリウム水和物、ポリソルベート80、酒石酸、 <i>l</i> -メントール、アジピン酸ジイソプロピル、マクロゴール400、トウガラシエキス |

3.2 製剤の性状

| | |
|-------|--|
| 販売名 | ラクティオンパップ70mg |
| 性状 | 白色～淡黄色のわずかに芳香のある膏体を不織布に展延し、膏体表面をライナーで被膜した外用貼付剤である。 |
| 外形 | 大きさ：10cm×14cm |
| 識別コード | MZ-LOP70 |

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）に対して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は除く）

重症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。他の非ステロイド性消炎鎮痛剤の外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。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有効性及び安全性を指標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。

11.2 その他の副作用

| | 0.1～5%未満 | 0.1%未満 |
|----|---------------|----------|
| 皮膚 | 発赤、そう痒、発疹、かぶれ | ヒリヒリ感、腫脹 |

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

- 14.1.1 損傷皮膚及び粘膜部位、湿疹又は発疹の部位には使用しないこと。
- 14.1.2 汗をかいたり、皮膚がぬれている場合は患部を清潔にふいてから使用すること。
- 14.1.3 入浴の30分以上前にはがすこと。
- 14.1.4 入浴後直ちに使用しないよう注意すること。
- 14.1.5 本剤に触れた手で、眼、鼻腔、口唇等の粘膜に触れないように注意すること。
- 14.1.6 必要に応じ、テープ等で保定することが望ましい。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回貼付

健康成人男性6名の背部に薬剤4枚（インドメタシン96mg/枚^{注1}）を12時間貼付したところ、インドメタシンの平均血漿中濃度は経時的に増加し、最高値は薬剤剥離時で14.9ng/mLとなった。薬剤剥離後は、生物学的半減期約11時間で減少した¹⁾。

16.1.2 連続貼付

健康成人男性3名の大腿部前面に薬剤2枚（インドメタシン96mg/枚^{注1}）を1日2回、28日間連続して貼付したところ、インドメタシンの平均血漿中濃度は、貼付1日目で6.2ng/mLを示し、以後28日目まで7ng/mL前後の濃度で維持した。薬剤剥離後3日目には約1/4まで低下した¹⁾。

16.3 分布

人工膝関節全置換術が予定されている患者6名の膝に薬剤1枚（インドメタシン96mg/枚^{注1}）を1日2回、数日間連続貼付したところ、各組織内濃度は次の通りで、貼付した深部へ分布し血清中より高濃度であった²⁾。

| 組織 | 皮下組織 | 関節包滑膜 | 滑膜 | 血清 |
|------------------------------|------|-------|------|------|
| インドメタシン ng/g（組織）又は ng/mL（血清） | 20.7 | 21.6 | 19.0 | 1.33 |

16.5 排泄

16.5.1 単回貼付

健康成人男性6名の背部に薬剤4枚（インドメタシン96mg/枚²⁾）を12時間貼付し、貼付開始後120時間まで遊離体および遊離体を含む抱合体の尿中排泄量を測定したところ、累積総排泄量の平均は約400 μ gで、その90%程度は48時間までに排泄された¹⁾。

16.5.2 連続貼付

健康成人男性3名の大腿部前面に薬剤2枚（インドメタシン96mg/枚²⁾）を1日2回、28日間連続して貼付し、貼付開始後31日目まで遊離体および遊離体を含む抱合体の尿中排泄量を測定したところ、1日目の平均値は67.6 μ g、7日目には212 μ gに達し、以後28日目に薬剤剥離まで200~250 μ gの排泄量を示した。薬剤剥離後3日目には剥離時の1/5程度に減少した¹⁾。

注) 本剤の承認された用法及び用量は、70mg/枚である。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 筋肉痛を対象とした国内比較臨床試験

筋肉痛を有し明らかな疼痛・炎症症状を有する患者に対し、従来のインドメタシン貼付剤を対照として、1回1枚、1日2回2週間患部に貼付を行った結果、最終全般改善度の改善率は92.6% (25/27例)、有用度でも有用率81.8% (27/33例)であり、本剤の有用性が認められた³⁾。

概括安全度は80% (28/35例)、副作用発現頻度は20% (7/35例)であった。主な副作用は、発赤 (3件)、ヒリヒリ感 (3件)、かぶれ (2例)が認められた。

17.1.2 変形性膝関節症を対象とした国内比較臨床試験

変形性膝関節症を有しX線所見上少なくとも骨棘形成が認められ明らかな疼痛・炎症症状を有する患者に対し、従来のインドメタシン貼付剤を対照として、1回1枚、1日2回、4週間患部に貼付を行った結果、最終全般改善度の改善率は70.6% (24/34例)を示し、有用度でも有用率62.2% (23/37例)であり、本剤の有用性が認められた⁴⁾。

概括安全度は83.7% (36/43)、副作用発現頻度は16.3% (7/43例)であった。主な副作用は、発赤 (5例)、そう痒 (3例)、かぶれ (1例)、疼痛 (2例)が認められた。

17.1.3 整形外科外来患者を対象とした国内臨床試験

明らかな疼痛・炎症症状を有する整形外科外来患者に対し、1回1枚、1日2回、1~2週間患部に貼付した結果、本剤の有用性が認められ、最終全般改善度の改善率は外傷性疾患で78.6% (22/28例)、肩関節周囲炎で45.5% (10/22例)、腱・腱鞘炎、腱周囲炎で66.7% (12/18例)、上腕骨上顆炎で61.9% (13/21例)を示した^{5), 6)}。

概括安全度は82.4% (28/34例)、副作用発現頻度は14.7% (5/34例)であった。主な副作用は、そう痒 (2例)、ヒリヒリ感 (2例)、発赤 (1例)が認められた。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

インドメタシンは炎症のケミカルメディエーターであるプロスタグランジン (PG) の生合成を阻害することによって抗炎症作用を現す。PGは細胞膜の構成脂質であるアラキドン酸から生合成され、その律速酵素はシクロオキシゲナーゼ (COX) であるが、非ステロイド性抗炎症薬のPG生合成阻害機序はこのCOXの阻害である。

18.2 鎮痛作用

ラット後肢足趾に起炎物質のビール酵母を皮下投与し、鎮痛作用をRandall-Selitto法で検討した結果、本剤は炎症足圧痛を抑制した⁷⁾。

18.3 抗炎症作用

ラット後肢足趾にカラゲニンを経皮下投与し、抗炎症作用を検討した結果、本剤は有意な浮腫抑制効果を示した⁸⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：インドメタシン (Indometacin)

化学名：[1-(4-Chlorobenzoyl)-5-methoxy-2-methyl-1H-indol-3-yl]acetic acid

分子式：C₁₉H₁₆ClNO₄

分子量：357.79

性状：本品は白色～淡黄色の微細な結晶性の粉末である。

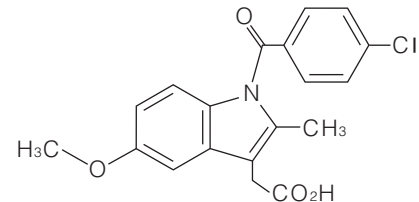
本品はメタノール、エタノール (95) 又はジエチルエーテルにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

本品は水酸化ナトリウム試液に溶ける。

本品は光によって着色する。

本品は結晶多形が認められる。

化学構造式：



融点：155~162°C

22. 包装

280枚 (7枚入×40袋)、560枚 (7枚入×80袋)

23. 主要文献


- 1) 岩倉泰一郎他.: 薬理と治療. 1986; 14: 1357-1365
- 2) 辻本正記他.: 薬理と治療. 1986; 14: 4221-4224
- 3) 倉田和夫他.: 薬理と治療. 1997; 25: 1653-1666
- 4) 倉田和夫他.: 薬理と治療. 1997; 25: 1667-1683
- 5) 菅原幸子他.: 薬理と治療. 1997; 25: 1685-1694
- 6) 菅原幸子他.: 薬理と治療. 1997; 25: 1695-1709
- 7) 社内資料: ラット炎症足圧痛抑制試験
- 8) 社内資料: ラットカラゲニン足浮腫抑制試験

24. 文献請求先及び問い合わせ先

三笠製薬株式会社 営業本部学術課
〒176-8585
東京都練馬区豊玉北二丁目3番1号
TEL (03) 3557-7287
FAX (03) 3994-7462

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

 **テイカ製薬株式会社**
富山市荒川一丁目3番27号

26.2 販売元

 **三笠製薬株式会社**
東京都練馬区豊玉北2-3-1