

非ステロイド系 消炎・鎮痛外用剤  
スプロフェン軟膏

**トパルジック<sup>®</sup>軟膏1%**  
TOPALGIC<sup>®</sup> Ointment 1%

貯 法：室温保存  
有効期間：4年

承認番号	22000AMX00643
販売開始	1989年9月

## 2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.2 ケトプロフェン(外皮用剤)、チアプロフェン酸、フェノフィブラート及びオキシベンゾンに対して過敏症の既往歴のある患者〔これら製剤との交叉感作性により、本剤の使用によって過敏症を誘発するおそれがある。〕

## 3. 組成・性状

### 3.1 組成

販売名	有効成分	添加剤
トパルジック軟膏1%	1g 中 スプロフェン 10mg(1%)	流動パラフィン、白色ワセリン

### 3.2 性状

販売名	性状
トパルジック軟膏1%	白色～微黄色半透明の軟膏剤で、おおいはない。

## 4. 効能又は効果

急性湿疹、接触皮膚炎、アトピー性皮膚炎、慢性湿疹、皮脂欠乏性湿疹、酒さ様皮膚炎・口囲皮膚炎、帯状疱疹

## 6. 用法及び用量

(急性湿疹、接触皮膚炎、アトピー性皮膚炎、慢性湿疹、皮脂欠乏性湿疹、酒さ様皮膚炎・口囲皮膚炎)

本品の適量を1日数回患部に塗布する。

(帯状疱疹)

本品の適量を1日1～2回患部に塗布又は貼布する。

## 8. 重要な基本的注意

本剤の長期使用により過敏症状があらわれる可能性がある。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

### 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。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

低出生体重児、新生児又は乳児を対象とした長期投与での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投与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	頻度不明
皮膚	刺激感、発赤、そう痒、腫脹	紅斑、丘疹	落屑、接触皮膚炎、光線過敏症

## 14. 適用上の注意

### 14.1 薬剤投与時の注意

- 14.1.1 大量又は広範囲の使用は避けること。
- 14.1.2 眼科用に使用しないこと。

## 15. その他の注意

### 15.1 臨床使用に基づく情報

外国では経口投与において側腹部痛(急激な尿酸排泄による尿酸結石)が報告されており、日本及び外国で経口剤は発売されていない。

## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

#### 16.1.1 単回投与

健康成人男子5名の背部皮膚にスプロフェン軟膏20g(スプロフェンとして200mg)をODT法により8時間塗布し、血中のスプロフェン及びその代謝産物を定量した。血中にはスプロフェンとその抱合体及び2-[p-( $\alpha$ -ヒドロキシ-2-テニル)フェニル]プロピオン酸が検出され、スプロフェンの濃度が最も高かった<sup>1)</sup>。

スプロフェンの薬物動態パラメータ

T <sub>max</sub> (hr)	C <sub>max</sub> ( $\mu$ g/mL)	T <sub>1/2</sub> (hr)
9.0 $\pm$ 0.0	0.21 $\pm$ 0.07	3.1 $\pm$ 1.3

平均 $\pm$ S.D.で示す

### 16.3 分布

スプロフェン軟膏をラット正常皮膚に8時間密封塗布した実験では、スプロフェンは代謝されることなく塗布部位の皮膚中に分布する。ラット損傷皮膚に塗布した場合、正常皮膚に比較し速やかに吸収され、血中濃度、塗布部位皮膚及び各種組織中濃度とも高い。しかし正常皮膚、損傷皮膚ともに皮膚内濃度に比較し血中濃度及び各種組織中濃度は著しく低いことが認められている。また、連続塗布による蓄積性は認められていない<sup>2,3)</sup>。

## 16.5 排泄

### 16.5.1 尿中排泄

健康成人男子5名の背部皮膚にスプロフェン軟膏20g(スプロフェンとして200mg)をODT法により8時間塗布し、尿中のスプロフェン及びその代謝産物を定量した。尿中にはスプロフェンとその代謝産物及びそれぞれの抱合体が排泄され、これらの総量は塗布後24時間までで塗布量の6.2%であった<sup>1)</sup>。また、正常皮膚に塗布したときの尿糞中排泄率は、塗布量に対してラットで約23%、モルモットで約11%である<sup>2,3)</sup>。

## 17. 臨床成績

### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

本剤の国内のべ79施設で実施された比較試験を含む臨床試験成績の概要は以下のとおりである。(承認時)

疾患名	改善度	改善症例数/症例数 (%)
急性湿疹		124/160(77.5)
接触皮膚炎		74/92(80.4)
アトピー性皮膚炎		187/311(60.1)
慢性湿疹		47/62(75.8)
皮脂欠乏性湿疹		140/169(82.8)
酒さ様・口囲皮膚炎		69/90(76.7)
帯状疱疹		125/138(90.6)
合計		766/1,022(75.0)

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

スプロフェンにはプロスタグランジン生合成阻害作用が認められており、これに基づいて種々の抗炎症作用を示すものと考えられる(ラット、モルモット、マウス)<sup>4)</sup>。

### 18.2 抗炎症作用

ラットにおける血管透過性亢進抑制作用、カラゲニン足蹠浮腫抑制作用、肉芽増殖抑制作用、モルモットにおける紫外線紅斑抑制作用等の抗炎症作用が認められている<sup>4)</sup>。

### 18.3 鎮痛作用

ラットの炎症性疼痛に対し、疼痛閾値を上昇させ、著明な鎮痛作用が認められている<sup>4)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

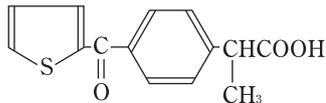
一般的名称：スプロフェン(Suprofen)

化学名：(±)-2-[p-(2-thienoyl)phenyl] propionic acid

分子式：C<sub>14</sub>H<sub>12</sub>O<sub>3</sub>S

分子量：260.31

化学構造式：



性状：白色～帯黄白色の結晶性の粉末である。メタノール、エタノール(99.5)、アセトン又は1,4-ジオキササンに溶けやすく、水に極めて溶けにくい。水酸化ナトリウム試液又はアンモニア試液に溶ける。1,4-ジオキササン溶液(1→40)は旋光性を示さない。

融点：124～127°C

## 22. 包装

10g×10、10g×50 [アルミチューブ]

500g [褐色ガラス瓶]

## 23. 主要文献

- 1) 東 純一 他：薬理と治療.1987;15(10):4041-4051
- 2) 横家房志 他：薬理と治療.1987;15(10):4009-4021
- 3) 横家房志 他：薬理と治療.1987;15(10):4023-4031
- 4) 久木浩平 他：薬理と治療.1987;15(9):3631-3641

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

アルフレッサ ファーマ株式会社 製品情報部  
〒540-8575 大阪市中央区石町二丁目2番9号  
TEL 06-6941-0306 FAX 06-6943-8212

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

**alfresa** アルフレッサ ファーマ株式会社  
大阪市中央区石町二丁目2番9号

®登録商標