

東京クリニック

医薬品情報

TEL 03-5287-5532

Web <http://www.tokyo-clinic.jp>

Mail info@tokyo-clinic.jp

※2004年10月改訂(第3版)
※2003年 3月改訂

日本標準商品分類番号
872649

非ステロイド系 消炎・鎮痛外用剤

指定医薬品

トパルジック®軟膏 トパルジック®クリーム

(スプロフェン製剤)

TOPALGIC® Ointment・Cream

貯 法：遮光、室温保存
使用期限：外箱に表示

	軟 膏	クリーム
承認番号	20100AMZ00347000	20400AMZ01097000
薬価収載	1989年 8月	1992年12月
販売開始	1989年 9月	1993年 2月
再審査結果	1998年 3月	1998年 3月

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- (1)本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
(2)ケトプロフェン(外用剤)、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。〕

【組成・性状】

	トパルジック軟膏
成分・含量	1g中にスプロフェン10mg(1%)
添加物	流動パラフィン、白色ワセリン
性 状	白色～微黄色半透明の軟膏剤で、においはない。
識別コード	NF548
	トパルジッククリーム
成分・含量	1g中にスプロフェン10mg(1%)
添加物	自己乳化型モノステアリン酸グリセリン、ポリオキ シエチレンセチルエーテル、大豆レシチン、セタノ ール、白色ワセリン、オクチルドデカノール、トリ(カ プリル・カプリン酸)グリセリン、スクワラン、プロ ピレングリコール、ジメチルポリシロキサン、酢酸 トコフェロール、パラオキシ安息香酸ブチル、パラ オキシ安息香酸メチル、水酸化カリウム
性 状	白色～淡黄白色の乳剤性の軟膏剤で、においは ないか、又はわずかに特異なにおいがある。
識別コード	NF549

【効能・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、酒皰様皮膚炎・口囲皮膚炎、帯状疱疹

【用法・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、酒皰様皮膚炎・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。

【使用上の注意】

- 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。

2. 副作用

〈軟膏製剤〉

スプロフェンを1%含有する軟膏製剤における承認時及び使
用成績調査の結果を合計したところ、安全性検討症例
14,044例中副作用が報告されたのは、186例(1.32%)であり、
主な副作用は発赤64件(0.46%)、刺激感57件(0.41%)、痒痒
53件(0.38%)、紅斑44件(0.31%)等であった。また、臨床検
査は、112例に実施し、本剤に起因すると考えられる変化は
認められなかった¹⁾。(再審査終了時)

〈クリーム製剤〉

スプロフェンを1%含有するクリーム製剤における承認時及
び使用成績調査の結果を合計したところ、安全性検討症例
1,750例中副作用は56例(3.20%)であり、主な副作用は刺激
感32件(1.83%)、発赤13件(0.74%)、痒痒10件(0.57%)、紅
斑10件(0.57%)等であった¹⁾。(再審査終了時)

	0.1～5%未満	0.1%未満
皮 膚 ²⁾	刺激感、発赤、痒痒、腫脹、 紅斑、丘疹、落屑、接触皮膚炎	光線過敏症

注)発現した場合は、使用を中止すること。

3. 小児等への投与

低出生体重児、新生児又は乳児に対する長期投与の安全性
は確立していない(使用経験が少ない)。

4. 適用上の注意

- 1)使 用 時：大量又は広範囲の使用は避けること。
- 2)投与経路：眼科用に使用しないこと。

5. その他の注意

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。

【薬物動態】

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、血清及び
尿中のスプロフェン及びその代謝産物を定量した²⁾。

1. 血中濃度

血中にはスプロフェンとその抱合体及び2-[p-(α-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。

★本剤単回経皮投与時の血中濃度パラメータ

Tmax(hr)	Cmax(μg/mL)	T _{1/2} (hr)
9.0±0.0	0.21±0.07	3.1±1.3

2. 尿中排泄

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。

(参考)吸収・分布・代謝・排泄^{3,4)}

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。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。また、連続塗布による蓄積性は認
められていない。

【臨床成績】

本剤の国内のべ84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⁵⁻¹⁵⁾。(承認時)

疾患名	改善度	改善症例数/症例数(%)	
		軟 膏	クリーム
急性湿疹		124/160(77.5)	10/13(76.9)
接触皮膚炎		74/ 92(80.4)	6/ 9(66.7)
アトピー性皮膚炎		187/311(60.1)	8/13(61.5)
慢性湿疹		47/ 62(75.8)	—
皮脂欠乏性湿疹		140/169(82.8)	12/13(92.3)
酒皰様・口囲皮膚炎		69/ 90(76.7)	—
帯状疱疹		125/138(90.6)	—
合 計		766/1,022(75.0)	36/48(75.0)

【薬効薬理】

1. 抗炎症作用¹⁶⁾

ラットにおける血管透過性亢進抑制作用、カラゲニン足趾浮腫抑制作用、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。

2. 鎮痛作用¹⁶⁾

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。

3. 作用機序¹⁶⁾

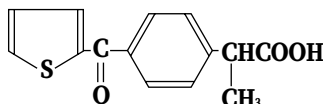
スプロフェンにはプロスタグランジン生合成阻害作用が認められており、これに基づいて種々の抗炎症作用を示すものと考えられる(ラット、モルモット、マウス)。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：スプロフェン(Suprofen)

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

構造式：



分子式：C₁₄H₁₂O₃S

分子量：260.31

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-ジオキサン溶液(1→40)は旋光性を示さない。

融点：124～127℃

【包装】

軟膏：10g×10、10g×50(アルミチューブ)
500g(ガラス容器)

クリーム：10g×10、10g×50(アルミチューブ)

【主要文献】

1)社内資料

- 2)東 純一 他：薬理と治療，15，4041(1987)
- 3)横家房志 他：薬理と治療，15，4009(1987)
- 4)横家房志 他：薬理と治療，15，4023(1987)
- 5)原田昭太郎 他：臨床医薬，3，1187(1987)
- 6)原田昭太郎 他：臨床医薬，3，1197(1987)
- 7)原田昭太郎 他：臨床医薬，3，1209(1987)
- 8)原田昭太郎 他：臨床医薬，3，1229(1987)
- 9)朝田康夫 他：薬理と治療，15，4899(1987)
- 10)大河原章 他：臨床医薬，3，1239(1987)
- 11)石橋康正 他：臨床医薬，3，1255(1987)
- 12)中溝慶生 他：薬理と治療，15，4315(1987)
- 13)坂井秀彰 他：薬理と治療，15，4911(1987)
- 14)植木裕美子 他：薬理と治療，15，4919(1987)
- 15)原田昭太郎：薬理と治療，19，4287(1991)
- 16)久木浩平 他：薬理と治療，15，3631(1987)

※【文献請求先】

アルフレッサ ファーマ株式会社 医薬推進部
〒540-8575 大阪市中央区石町二丁目2番9号
TEL 06-6941-0306

alfresa

※製造
※販売元

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