

貼る、を知る。

経皮薬物送達システム(TDDS)

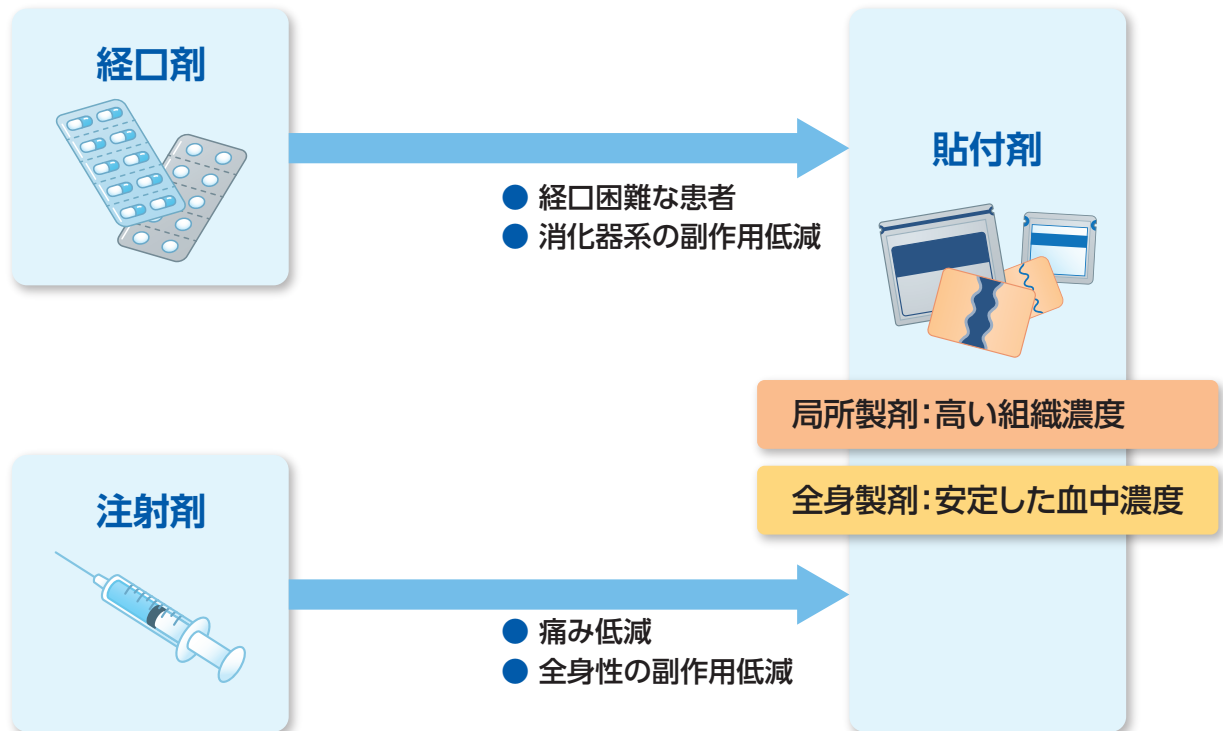
Transdermal Drug Delivery System

貼付剤の分類と特徴 ～局所製剤と全身製剤～

監修:大谷道輝 先生 杏雲堂病院診療技術部長・薬剤科長

貼付剤開発の意義

貼付剤は、経口剤や注射剤の課題解決に繋がる新たな剤形です。



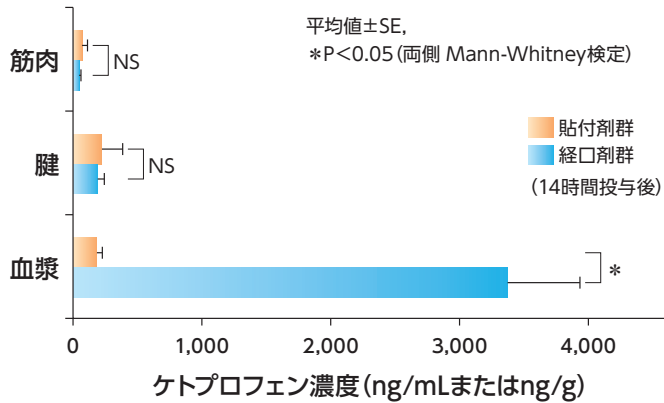
貼付剤の利点と欠点

| | |
|----|--|
| 利点 | <ul style="list-style-type: none"> ● 肝初回通過効果を受けないため、薬物のバイオアベイラビリティを高めることができる ● 消化器系の副作用を回避し、全身性の副作用を軽減させることができる ● 長時間、一定した薬物血中濃度が得られる ● 副作用発現などで投与を中止したい場合、剥がすことで投与を中止できる ● 注射剤のような専門的手技を必要とせず、適用方法が簡便である ● 服用有無を視認できるため、アドヒアランスの向上につながる ● 嚥下が困難な小児や高齢者などの患者にも投与できる |
|----|--|

| | |
|----|--|
| 欠点 | <ul style="list-style-type: none"> ● 皮膚に対する刺激性を有することがある ● 貼付部位により吸収が異なる ● 剥がし忘れることがある |
|----|--|

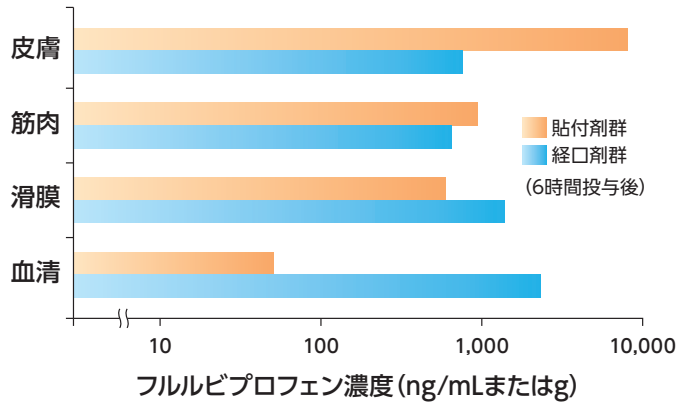
局所製剤の特徴: 血中濃度を著しく上昇させずに、標的組織の薬物濃度を高めることができる

前十字靭帯再建術施行患者における
ケトプロフェンの局所及び経口投与後の組織内薬物濃度



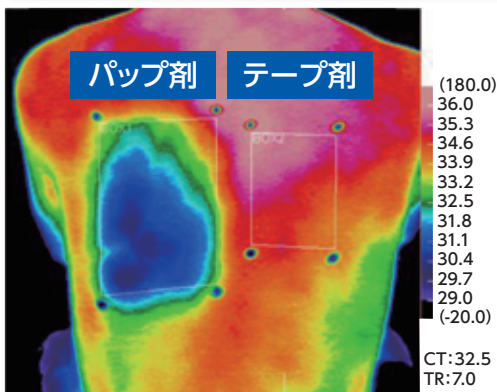
Sekiya I, et al.: AAPS PharmSciTech 2010; 11 (1): 154-8.

変形性関節症等の患者における
フルルビプロフェンの局所及び経口投与後の組織内薬物濃度



大井一弥 ほか: そこが知りたい! 貼付剤—皮膚特性に応じた適正使用—. 講談社サイエンティフィク; 2014. p.4 を基に作図

パップ剤とテープ剤の選択: 長所と短所を理解して選択する

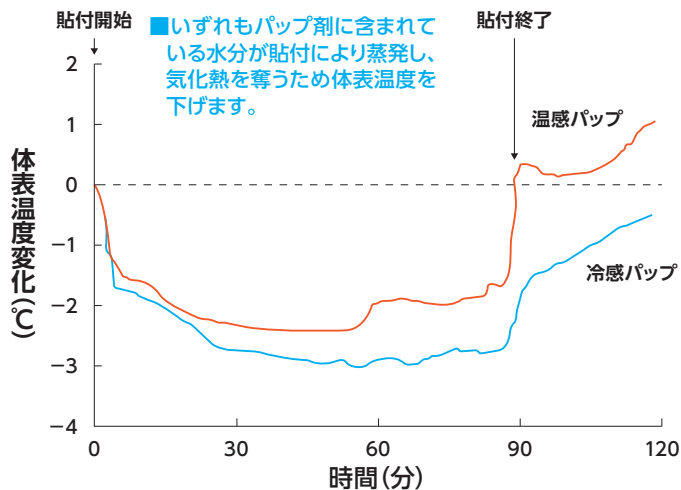


1時間適用したパップ剤の冷却効果

| 剤形 | 長所 | 短所 |
|------------------|--------------------|-----------------|
| パップ剤 (水を含む) | 水による冷却効果 肌に優しい | 厚みがある 粘着力が弱い |
| テープ剤 (水を含まない) | 製剤の厚みが薄い 粘着力が強い | 皮膚刺激が 比較的強い |

使用感がアドヒアランスに影響を与えるため、患者さんの希望も考慮して選択する必要があります。

冷感パップ・温感パップの貼付後: いずれも体表温度を下げる



冷感パップ・温感パップの処方

| 分類 | 主薬 |
|-------|--------------------------------------|
| 冷感パップ | サリチル酸メチル 2.0% |
| | dl-カンフル 0.5% |
| | l-メントール 0.3% |
| 温感パップ | サリチル酸メチル 1.0% |
| | dl-カンフル 0.5% |
| | 上記に加えいずれか トウガラシエキス ノニル酸ワニリルアミド |



全身製剤

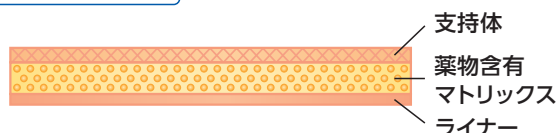
経皮吸収により薬物が血流に到達することで全身への効果が期待できる

Transdermal
Drug
Delivery
System

全身製剤の構造(放出制御機構)

全身製剤は肝初回通過効果を回避させるとともに、長時間血中濃度を一定に維持させるために放出制御機構が施されています。

マトリックス型

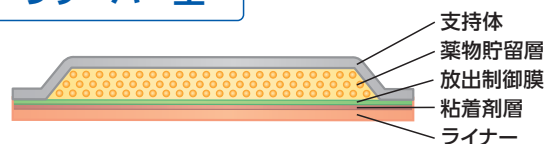


現在の主流。全身製剤に限らず、局所製剤でも使われている

特徴

- 薬物含有マトリックスが放出を制御している
- 薬物の過量放出の可能性が低い
- 面積による用量調整が容易
- 皮膚への付着性が良い

リザーバー型



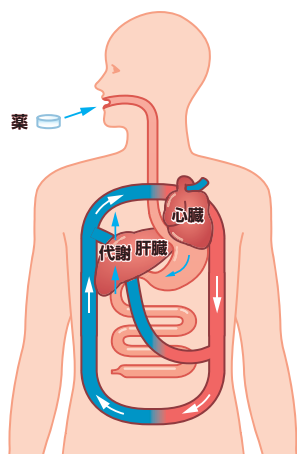
破損による過量投与のリスクや構造が複雑なことから少なくなっている

特徴

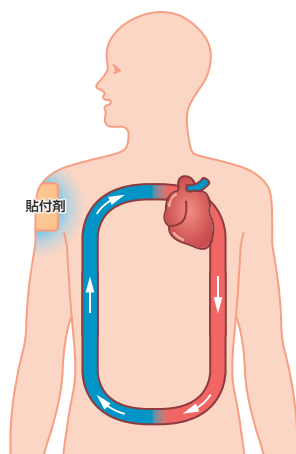
- 薬物貯留層を持ち、放出制御膜で放出量を調整する
- 粘着剤に溶解性があまり良くない添加剤を使用できる
- 膜の厚さを変えることで放出速度を調整することができる

全身製剤の薬物代謝経路

経口剤



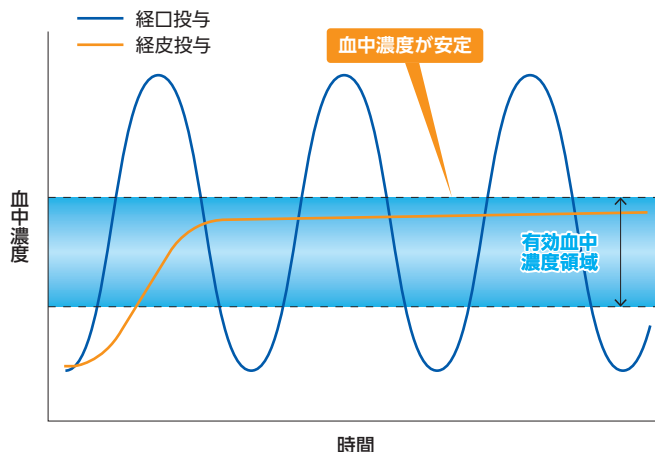
貼付剤



イメージ図

貼付剤は、肝初回通過効果の影響を受けない

経口投与後と経皮投与後の血中濃度の推移(イメージ)

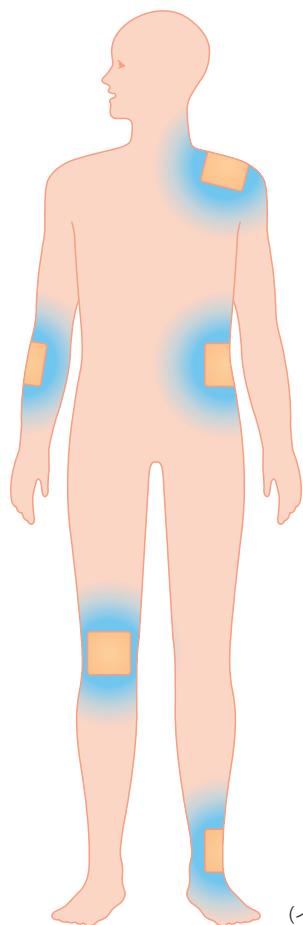


貼付剤は、安定した血中濃度が期待できるため、朝方の症状緩和にも注目されている

貼る、を知る。POINT

- ▶ 局所製剤は血中濃度を著しく上昇させずに、標的組織の薬物濃度を高めるため、全身性の副作用の低減と適用部位での効果が期待できます。
- ▶ 全身製剤は血中濃度を長時間一定に維持させることで、安定した効果と副作用の低減が期待できます。

本邦で承認されている貼付剤 (2020年7月現在)



(イメージ図)

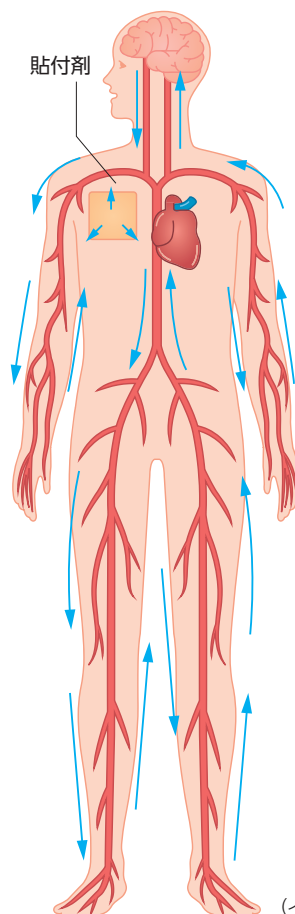
● 局所製剤

| 主な適応症 | 有効成分 一般名 |
|-------------------|------------------|
| 鎮痛消炎 | サリチル酸メチル等 |
| 鎮痛消炎 | ケトプロフェン |
| 鎮痛消炎 | フルルビプロフェン |
| 鎮痛消炎 | インドメタシン |
| 鎮痛消炎 | フェルビナク |
| 鎮痛消炎 | サリチル酸グリコール |
| 鎮痛消炎 | ジクロフェナクナトリウム |
| 鎮痛消炎 | ロキソプロフェンナトリウム水和物 |
| 鎮痛消炎 | エスフルルビプロフェン・ハッカ油 |
| 湿疹・皮膚炎群 | フルドロキシコルチド |
| 湿疹・皮膚炎群 | デプロドンプロピオン酸エステル |
| 静脈留置針穿刺時の疼痛緩和 | リドカイン |
| 皮膚レーザー照射療法時の疼痛緩和 | |
| 伝染性軟属腫摘除時の疼痛緩和 | |
| 注射針・静脈留置針穿刺時の疼痛緩和 | リドカイン・プロピトカイン |
| 皮膚レーザー照射療法時の疼痛緩和 | |
| 外傷・熱傷及び手術創等の二次感染 | フラジオマイシン硫酸塩 |

各薬剤の添付文書を基に作成

● 全身製剤

| 主な適応症 | 有効成分 一般名 |
|--------------|---------------------|
| 狭心症 | 硝酸イソソルビド |
| 狭心症 | ニトログリセリン |
| 更年期障害 | エストラジオール |
| 更年期障害 | エストラジオール・酢酸ノルエチステロン |
| 気管支拡張 | ツロブテロール |
| 禁煙補助 | ニコチン |
| がん疼痛 | フェンタニル |
| 慢性疼痛 | |
| がん疼痛 | フェンタニルクエン酸塩 |
| 慢性疼痛 | |
| 慢性疼痛 | ブプレノルフィン |
| アルツハイマー型認知症 | リバスチグミン |
| パーキンソン病 | ロチゴチン |
| レストレスレッグス症候群 | |
| パーキンソン病 | ロピニロール塩酸塩 |
| 過活動膀胱 | オキシブチニン塩酸塩 |
| 本態性高血圧症 | ビソプロロール |
| 頻脈性心房細動 | |
| アレルギー性鼻炎 | エメダスチンフマル酸塩 |
| 統合失調症 | ブロナンセリン |



(イメージ図)

各薬剤の添付文書を基に作成

