

副腎皮質ホルモン外用剤
アルクロメタゾンプロピオン酸エステル軟膏

アルクロメタゾンプロピオン酸エステル軟膏0.1%「IWAKI」

Alclometasone Dipropionate Ointment 0.1% “IWAKI”

貯法：室温保存
有効期間：3年

承認番号	30200AMX00708
販売開始	2001年7月

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 細菌・真菌・スピロヘータ・ウイルス皮膚感染症及び動物性皮膚疾患（疥癬、けじらみ等）[これらの疾患が増悪するおそれがある。]
- 2.2 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.3 鼓膜に穿孔のある湿性外耳道炎[穿孔部位の治癒の遅延及び感染のおそれがある。]
- 2.4 潰瘍（ベアチェット病は除く）、第2度深在性以上の熱傷・凍傷[皮膚の再生が抑制され、治癒が遅延するおそれがある。]

3. 組成・性状

* 3.1 組成

有効成分	1g中 アルクロメタゾンプロピオン酸エステル 1mg (0.1%)
添加剤	流動パラフィン、サラシミツロウ、モノステアリン酸グリセリン、ベンジルアルコール、プロピレングリコール、白色ワセリン（抗酸化剤としてジブチルヒドロキシルエンを含む）、pH調節剤

3.2 製剤の性状

性状・剤形	白色～微黄色、半透明の油性の軟膏剤で、においはないか、又はわずかに特異なにおいがある。
-------	---

4. 効能又は効果

湿疹・皮膚炎群（進行性指掌角皮症を含む）、乾癬、痒疹群（ストロフルス、じん麻疹様苔癬、固定じん麻疹を含む）、虫さされ、掌蹠膿疱症、扁平苔癬、ジベル薔薇色靴糠疹、紅斑症（多形滲出性紅斑、ダリエ遠心性環状紅斑）、薬疹・中毒疹、紅皮症、特発性色素性紫斑（シャンパーニュ病、マヨッキー紫斑、紫斑性色素性苔癬様皮膚炎）、慢性円板状エリテマトーデス

5. 効能又は効果に関連する注意

皮膚感染を伴う湿疹・皮膚炎には使用しないことを原則とするが、やむを得ず使用する必要がある場合には、あらかじめ適切な抗菌剤（全身適用）、抗真菌剤による治療を行うか、又はこれらとの併用を考慮すること。

6. 用法及び用量

通常、1日1～数回、適量を患部に塗布する。
なお、症状により適宜増減する。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 大量又は長期にわたる広範囲の密封法（ODT）等の使用により、副腎皮質ホルモン剤を全身投与した場合と同様な症状があらわれることがある。[9.5、9.7、9.8、11.1.1 参照]
- 8.2 本剤の使用により症状の改善がみられない場合又は症状の悪化をみる場合は、使用を中止すること。
- 8.3 症状改善後は、できるだけ速やかに使用を中止すること。

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対する、大量又は長期にわたる広範囲の使用を避けること。[8.1 参照]

9.7 小児等

長期・大量使用又は密封法（ODT）により発育障害¹⁾を来すおそれがある。

また、おむつは密封法（ODT）と同様の作用があるので注意すること。[8.1 参照]

9.8 高齢者

大量又は長期にわたる広範囲の密封法（ODT）等の使用に際しては特に注意すること。一般に副作用があらわれやすい。[8.1 参照]

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行的、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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 眼圧亢進、緑内障、後嚢白内障（頻度不明）

眼瞼皮膚への使用に際しては眼圧亢進、緑内障²⁾を起こすことがある。

大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法（ODT）により、緑内障、後嚢白内障等があらわれることがある。[8.1 参照]

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症		皮膚の刺激感	発疹
皮膚	そう痒、接触皮膚炎	皮膚乾燥	
皮膚の感染症 ^{注1)}			細菌感染症（伝染性膿痂疹、毛囊炎・せつ等）、真菌症（カンジダ症、白癬等）、ウイルス感染症
その他の皮膚症状 ^{注2)}	ステロイド疹、ステロイド皮膚（皮膚萎縮、ステロイド潮紅・毛細血管拡張）、紫斑		ステロイド酒さ・口囲皮膚炎（口囲、顔面全体に紅斑、丘疹、毛細血管拡張、痂皮、鱗屑）、魚鱗癬様皮膚変化、多毛、色素脱失
下垂体・副腎皮質系			下垂体・副腎皮質系機能の抑制 ^{注3)}

注1) このような症状があらわれた場合には、適切な抗菌剤、抗真菌剤等を併用し、症状が速やかに改善しない場合には、本剤の使用を中止すること。密封法（ODT）の場合に起こりやすい。

注2) 長期連用により、このような症状があらわれた場合には徐々にその使用を差し控え、副腎皮質ホルモンを含有しない薬剤に切り替えること。

注3) 大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法（ODT）により発現した事象。投与中止により急性副腎皮質機能不全に陥る危険性があるため、投与を中止する際は患者の状態を観察しながら徐々に減量すること。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

患者に対し以下の点に注意するよう指導すること。

14.1.1 使用時

化粧下、ひげそり後等に使用することのないよう注意すること。

14.1.2 使用部位

眼科用として使用しないこと。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

ステロイドは細胞質に存在する熱ショック蛋白質、抑制蛋白質と複合体を形成したステロイド受容体に結合後核内に移行し、ステロイド反応性の遺伝子を活性化させ、その薬理作用を発揮すると考えられている。また、血管内皮細胞やリンパ球等の細胞膜の障害を抑制するような膜の安定性に関与する作用や、フォスホリパーゼ A₂ と呼ばれる細胞膜リン脂質からロイコトリエンやプロスタグランジンなど種々の炎症惹起物質を誘導する重要な酵素の機能を抑える作用も知られている。

その作用機序としては、単量体のステロイドとその受容体が複合体を形成することで、NFκB や AP-1 と呼ばれるサイトカイン産生の誘導や細胞接着分子の発現等を調節している細胞内転写因子の機能を抑制することで、2量体の受容体と結合した場合、リポコルチン等の誘導を介して、炎症を制御すると考えられている。免疫抑制作用に関しては、リンパ球に対する直接的な機能抑制、アポトーシスの誘導によると考えられている³⁾。

18.2 薬理作用

18.2.1 皮膚血管収縮試験

健康成人 18 例を対象とする皮膚蒼白度試験（肉眼的判定）において、アルクロメタゾンプロピオン酸エステル軟膏は 0.1% ヒドロコルチゾン酪酸エステル軟膏に比べて、1.25～2.85 倍の皮膚血管収縮能を示した⁴⁾。

表 18-1 ヒドロコルチゾン酪酸エステル軟膏の効力を 1 としたときのアルクロメタゾンプロピオン酸エステル軟膏の効力比

判定基準	塗布方法	効力比
蒼白度 (+) のみを陽性とする	密封法 (ODT)	2.08
	単純塗布	1.70
蒼白度 (+) 及び (±) を陽性とする	密封法 (ODT)	2.85
	単純塗布	1.25

18.2.2 各種炎症に対する作用

(1) マウスのクロトン油耳殻浮腫、ラットのカラゲニン足蹠浮腫、paper disk 肉芽腫、アジュバント関節炎、ヒスタミン血管透過性の各炎症モデルに対して、アルクロメタゾンプロピオン酸エステルはヒドロコルチゾン酪酸エステルと比較して、強い局所抗炎症作用を示した⁵⁾。

(2) アルクロメタゾンプロピオン酸エステルは、ヒドロコルチゾン酪酸エステルとのマウス（クロトン油耳殻浮腫抑制作用）、ラット（paper disk 肉芽腫抑制作用）での比較試験において、局所抗炎症作用が強く、主作用（局所抗炎症作用）と副作用（皮膚萎縮、全身作用）との乖離性が大きかった⁵⁾。

18.2.3 生物学的同等性試験

(1) 血管収縮作用

アルクロメタゾンプロピオン酸エステル軟膏 0.1% 「イワキ」とアルメタ軟膏を、それぞれ健康成人男子 27 名に単回経皮投与し、皮膚血管収縮試験を行い、血管収縮反応（皮膚蒼白化）を判定した。判定結果をスコア化し、統計解析をした結果、両剤の生物学的同等性が確認された⁶⁾。

表 18-2 血管収縮反応の平均スコア

製剤\製剤除去後経過時間(hr)	2	4	6	24
アルクロメタゾンプロピオン酸エステル軟膏 0.1% 「イワキ」	1.26 ± 0.59	1.96 ± 0.76	2.30 ± 0.78	0.07 ± 0.27
アルメタ軟膏	1.19 ± 0.56	1.96 ± 0.76	2.26 ± 0.59	0.07 ± 0.27

(平均 ± 標準偏差, n=27)

血管収縮反応のスコアは、被験者の選択、血管収縮反応の測定回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(2) 抗炎症作用

マウスを用いたクロトン油耳浮腫抑制試験及びラットを用いたペーパーディスク肉芽形成抑制試験において、アルクロメタゾンプロピオン酸エステル軟膏 0.1% 「イワキ」及びアルメタ軟膏を塗布し、浮腫抑制率及び肉芽形成抑制率を指標に統計解析した結果、両剤の生物学的同等性が確認された⁶⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：アルクロメタゾンプロピオン酸エステル (Alclometasone Dipropionate)

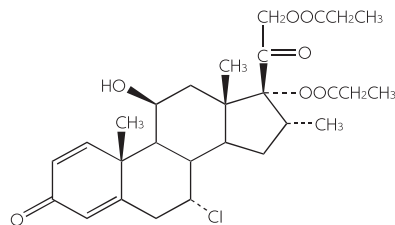
化学名：(+)-7α-Chloro-11β,17,21-trihydroxy-16α-methyl-1,4-pregnadiene-3,20-dione 17,21-dipropionate

分子式：C₂₈H₃₇ClO₇

性状：本品は白色の結晶性の粉末である。

本品はアセトンにやや溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けにくく、メタノール又はエタノール (99.5) に溶けにくく、ジエチルエーテルに極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。

化学構造式：



20. 取扱い上の注意

高温条件下で軟膏基剤中の低融点物質（液体）が滲出すること（Bleeding 現象）がある。

22. 包装

10 本 [5g (チューブ) × 10]
50 本 [5g (チューブ) × 50]
50 本 [10g (チューブ) × 50]
500g [ボトル]

23. 主要文献

- 1) Vermeer, B. J. et al.: Dermatologica. 1974;149:299-304
- 2) Zuger, C. et al.: Arch. Dermatol. 1976;112:1326
- 3) 片山一朗: アレルギー. 2006;55:1279-1283
- 4) 石原勝: 基礎と臨床. 1986;20:6995-7002
- 5) 中村益久ほか: 応用薬理. 1986;32:715-732
- 6) 岩城製薬株式会社 社内資料（生物学的同等性試験）

24. 文献請求先及び問い合わせ先

岩城製薬株式会社 マーケティング部 学術グループ
〒103-8434 東京都中央区日本橋本町 4-8-2
TEL 03-6626-6251 FAX 03-6626-6261

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元



岩城製薬株式会社

東京都中央区日本橋本町4-8-2