

第26回医療用から要指導・一般用への転用に関する評価検討会議
議事次第

令和5年12月7日(木) 16:00~18:00
場所：TKP東京駅カンファレンスセンター

議 事

1. パブリックコメントを踏まえたスイッチ OTC 化の課題点とその対応策について
2. 候補成分のスイッチ OTC 化について
3. スイッチ OTC 医薬品の候補となる成分の検討状況等
4. その他

配付資料一覧

パブリックコメントを踏まえたスイッチ OTC 化の課題点とその対応策について

- β -ガラクトシダーゼ(アスペルギルス)、 β -ガラクトシダーゼ(ペニシリウム)
 - 資料 1-1 検討会議結果(案) . . . p1
 - 資料 1-2 御意見等 . . . p6
- オキシブチニン塩酸塩
 - 資料 2-1 検討会議結果(案) . . . p8
 - 資料 2-2 御意見等 . . . p14

候補成分のスイッチ OTC 化について

- デプロドンプロピオン酸エステル(軟膏、クリーム、ローション)
 - 資料 3-1 成分情報等 . . . p17
 - 資料 3-2 関係医学会・医会見解 . . . p29
- デプロドンプロピオン酸エステル(テープ)
 - 資料 4-1 成分情報等 . . . p33
 - 資料 4-2 関係医学会・医会見解 . . . p43
- モメタゾンフランカルボン酸エステル水和物
 - 資料 5-1 成分情報等 . . . p47
 - 資料 5-2 関係医学会・医会見解 . . . p65

スイッチ OTC 医薬品の候補となる成分の検討状況等

- 資料 6 スイッチ OTC 医薬品の候補となる成分の検討状況について . . . p69

- 参考資料 1 「医療用から要指導・一般用への転用に関する評価検討会議」開催要綱
- 参考資料 2 「医療用から要指導・一般用への転用に関する評価検討会議」構成員
- 参考資料 3 日本におけるスイッチ OTC 成分

候補成分のスイッチ OTC 化に関する検討会議結果（案）

1. 候補成分の情報

成分名（一般名）	β-ガラクトシダーゼ（アスペルギルス） β-ガラクトシダーゼ（ペニシリウム）
効能・効果	健康な成人・小児等の乳糖不耐症により生ずる消化不良の改善

2. 検討会議結果（案）

※ 太字記載については、「スイッチ OTC 化のニーズ等」においては必要性が高いという意見が、「スイッチ OTC 化する上での課題点等」においては重要性が高いという意見が、「課題点等に対する対応策、考え方、意見等」においては賛成意見が、各々多かったもの。

スイッチ OTC 化のニーズ等	
<ul style="list-style-type: none"> ○ 乳糖不耐症協会は、現行の医薬品区分により入手が困難であるということ、市販薬化が当事者の生活の質（QOL）向上に直結するということ等の理由で本成分のスイッチ化を提言している。また、本団体は「健康な成人」もスイッチ OTC の対象とすることを要望している。国内には乳糖不耐症患者は 2~3 千万人いるが、現状、海外からの個人輸入に頼らざるをえない状況にあり、海外での使用経験や安全性を理由にスイッチ OTC は成人も対象とすることを要望している。 ○ とりわけ乳幼児期に粉ミルクや牛乳が飲めないのは、栄養価の点から課題がある。OTC 化により保護者が薬局で購入できるようになれば、負担軽減の点からもメリットがある。また、給食を食べる学童期の小中学生には、栄養の観点に加えて、社会的・心理的な課題解決になる可能性がある。OTC 化により入手しやすくなることは、子供の社会生活の点からもメリットがあると考えられる。 ○ 乳糖不耐症の場合、無乳糖ミルクに切り替える方法もあるものの、本品のスイッチ OTC 化により通常ミルク+本剤という選択肢が増えることは有用性が高いと思われる。 ○ 乳糖不耐症は日本人に多いと言われており、乳糖摂取により、下痢や腹痛症状が出ても受診することなく我慢している方も多いと推測され、ニーズはあると判断する。 ○ 下痢症状に苦しむ方の多くは、自身の下痢の原因が乳糖である可能性に気づいていない。本品のスイッチ OTC 化により、その効果を確認する機会が生まれ、受診勧奨につながられるのではないかと。 ○ 夜間など医療機関に受診するまでに下痢による脱水症状を避けることができる。 ○ 乳糖不耐症等の疾患を対象とせず、牛乳でお腹を壊しやすい人が購入できるようにしてほしい。場合によっては、食品区分とすることも検討してほしい。（パブリックコメントで提出された意見） 	
スイッチ OTC 化する上での課題点等	課題点等に対する対応策、考え方、意見等
【①薬剤の特性】	

(特になし)

【②疾患の特性】

- 乳糖不耐症の診断は、各種下痢症の鑑別を行いながら到達するものであり、医師の適切な診断が必要となる。
- 乳児の乳糖不耐症と診断(判断)するのは医師であり、家族が判断するのは困難である。診断されれば医療用医薬品が処方される。また、乳児の下痢の原因は乳糖不耐症以外に多様であり医師の診断が必要である。そのため OTC 化は望ましくない。
- 成人であっても、医師の診断の上、アレルギーとの区別がついているということを前提条件とする必要がある。

【③適正使用】

<投与対象>

- 医療用医薬品とは異なり、対象として健康な成人・小児等が想定されている。

- 効能・効果を「牛乳や母乳、ミルクなど乳糖を含む食品による下痢や消化不良および体重減少の改善」と置き換えた方がよい。(短期的課題)
- 医療用医薬品は健康な成人の乳糖不耐症は対象外であるので、適正使用できる条件のもと一般化の議論をする意義はある。(短期的課題)
- 小児における体重減少は大きな問題であることから、慎重な対応が必要。仮に効能・効果に「体重減少」という表現を含める場合には、どの程度の体重減少を対象とするのか、学会等で検討の上、目安となる数値を記入すべき。(短期的課題)
- 牛乳アレルギーとの鑑別が困難な場合があり、医師の診断を受けたことがある人に限って販売することが望ましい。(短期的課題)
- 投与開始の際は医師の判断が必要であり、医師の指示の元で購入することが望ましい。(短期的課題)
- 下痢症状について、アレルギー性腸炎や感染性腸炎を除外する必要があるため、販売時にはアレルギー歴の有無や発熱など感染症の症状がないことを確認する必要がある。(パブリックコメントで提出された意見)
- 医療用医薬品と対象者が異なっており、データが存在していないため、慎重な議論が必要になる。しかし、本邦ではβ-ガラクトシダーゼ製剤は医療用しかなく、使用者の利便性を考えれば、前向きな OTC 化の議論が必要と考える。(短期的課題)
- 小児は年齢に幅があるため年齢設定をしっかりと考える必要がある。(短期的課題)
- 乳幼児のみでなく成人でも牛乳などで頻繁に

<用法・用量>

- 通常、摂取乳糖量を把握できる使用者は限られており、1回あたりの用量をどのように設定するか、いつ服用するかが課題となる。

下痢を生ずる場合には適用となりうると考えられる。(短期的課題)

- 海外での OTC 実績 (ドイツ: TilactaMed) を鑑み、対象者は3歳以上の小児と成人とすることが考えられる。(短期的課題)
- 乳糖不耐症に対して本剤を使用している時点で、「健康な」という表現には疑問がある。(短期的課題)
- 対象年齢については、小児からとし、幼児は除くのが現実的ではないか。(短期的課題)
- 1週間程度服用しても症状が改善しない場合に医療機関への受診勧奨が確実に行われるような体制としてほしい。(短期的課題)
- ドイツで OTC として薬事承認かつ販売実績のある TilactaMed の用法用量は、日本における用法・用量の設定の参考となりうるものと考えられる。また、海外での使用状況の情報を収集し、国内での用法・用量の設定を検討すべきと考えられる。(短期的課題)
- 使用期間の上限を規定する必要はないと考えるが、効果に乏しい場合は、漫然と服薬せず速やかに受診を促すよう薬剤師に求めたい。(短期的課題)
- 過剰摂取した場合の危険性についても考慮する必要がある。(短期的課題)
- 乳糖含有食品ごとの用量調整が確立されていないため、含有食品に含有される乳糖の量と服用に必要となる投与量を具体的に示すことが重要と考える。(中長期的課題)
- 1回 0.25~0.5 g に固定し、乳製品摂取時に服用させることが基本になると思われるが、データが存在せず確信はもてない。(短期的課題)
- 体重によって適正な用量が異なることも考慮する必要がある。(短期的課題)
- 年齢 (あるいは体重) に応じた一包化を検討し、使いやすい形状で販売してほしい。(短期

【④販売体制】

- 使用者及び薬剤師が対象となる症状・疾患を理解している必要がある。(理解している使用者や薬剤師は少ない。)
- 乳糖不耐症協会は、本剤が必要な人が2~3千万人いると述べている。この人数が適切にアクセスできる販売店舗数を確保すべきと考える。また、子供が使う OTC と考えると、親族等が購入できる仕組みを予め考えておくべきである。

【⑤OTC 医薬品を取り巻く環境】

- 乳糖不耐症の病態に関する知識が消費者に十分でなく、販売を開始しても購入が進まず国民医療の向上に十分貢献できない可能性がある。

【⑥その他】

- 現在、医療用の β -ガラクトシダーゼ製剤の供給不安が課題となっている。スイッチ OTC 化された場合、必要としない方が使用する可能性があり、それにより本来必要な患者に医療用の β -ガラクトシダーゼ製剤が行き届かなくなる可能性がある。
- 薬局で OTC を提供すると同時に、医療とネットワークを持てるような環境をつくり、悩

的課題)

- 成人の臨床試験データを揃えるべき。(例：用量、投与間隔、どのように使うか、いつ使うのか(食前等))(中長期的課題)

○ 症状と疾患との関連について説明できる知識が薬剤師に求められる。(短期的課題)

- 過去に医師の診断を受けていることを明確にするため、お薬手帳等の活用を検討すべき。(短期的課題)
- 診断がついていない最初の段階で薬剤師や保護者が判断することはあってはならない。(短期的課題)

○ スイッチ OTC 化と並行して啓蒙活動を実施する必要がある。(中長期的課題)

- 医療用の β -ガラクトシダーゼ製剤の安定供給がしっかりとなされることがスイッチ OTC 化の前提条件である。
- スイッチ OTC 化された場合の需要は非常に大きいと予想される。
- 長期に使う薬であり、利用者は同じ薬局で購入することが考えられる。栄養課題や長期の疾

<p>んでいる方のQOLの改善につなげることが重要と考える。</p> <p>○ β-ガラクトシダーゼは、日本の食薬区分において、「専ら医薬品として使用される成分本質（原材料）リスト」に記載されているため、日本では食品には配合できない。</p>	<p>患を抱える子供の育児は、保護者の負担が大きいことから、薬局が親子を支えるネットワークの一環として機能することを期待する。かかりつけ医との連携だけでなく、子ども・子育て包括支援センター、子育てサロンなどの情報を持ち、地域包括ケアの網の目を密にする役割を果たしてほしい。</p>
<p>総合的意見（総合的な連携対応策など）</p>	
<p>（特になし）</p>	

（編注）

網掛け：パブリックコメントで御提出頂いた御意見を踏まえ新たな課題点及び対応策を追記。なお、最終的な検討会議結果報告書においては網掛けを外して公表する予定。

**「候補成分のスイッチ OTC 化に係る検討会議での議論」
に対して寄せられた御意見等について**

令和5年7月4日（火）から令和5年8月2日（水）まで御意見を募集したところ、β-ガラクトシダーゼ（アスペルギルス）・β-ガラクトシダーゼ（ペニシリウム）に関して4件の御意見が提出された。お寄せ頂いた御意見は以下のとおり。

No.	提出者等	御意見
1	個人	<p>OTC 化へ賛成します。</p> <p>自分自身昔から牛乳などが苦手で下しやすい体質でした。</p> <p>食後の腹痛や軟便、下痢などは QOL の低下につながりやすい反面、受診しようという動機形成につながりにくかったり、原因特定されないまま整腸剤や胃薬などを処方されてしまうこともあります。</p> <p>これらの成分が承認され市販化されたり、市販の整腸剤に配合されることでこれらの症状の改善に寄与する可能性があり、助かる人は多いと考えます。</p>
2	個人	<p>乳糖不耐性は日本人に多いと言われているが、現在の医療用医薬品では、（1）乳児の乳糖不耐により生ずる消化不良の改善（2）経管栄養食、経口流動食など摂取時の乳糖不耐により生ずる下痢などの改善に限定されている。スイッチ OTC 化により、「健康な成人」も対象にすることで、小児（3歳以上を対象とすることが妥当）の栄養摂取とともに、成人以降のカルシウム摂取にも有意義である。</p> <p>また下痢症状について、アレルギー性腸炎や感染性腸炎を除外する必要があるため、販売時にはアレルギー歴の有無や発熱など感染症の症状がないことを確認する必要がある。</p> <p>さらには一定期間服用しても便性の改善や便回数の減少がみられない場合に受診勧奨をすること、また副作用発現を防ぐためにも薬剤師の適切な指導が必要と考える。さらに本医薬品の性質上、長期に服用することが考えられるため、薬局が地域ネットワークの中で、医薬品とともに情報を提供する役割を担うことが大切である。</p>
3	不明	<p>β-ガラクトシダーゼについては、乳糖不耐症などの疾患ではなく、牛乳でお腹を壊しやすい人を対象に購入できるようにしてほしい。場合によっては、食品区分とすることも検討してほしい。『乳幼児期に粉ミルクや牛乳が飲めないのは、栄養価の点から課題がある』という指摘は、医学的に必要であれば医師が処方すればいい。</p> <p>ただ、この時代に牛乳で栄養補給しなければならない状況はなく、過剰な指摘といえる。本成分は、古い承認時期であることから、現在の科学水準の臨床試験で評価されていない。仮にスイッチ OTC とする場合でも、副作用がほぼないことから、追加の臨床試験は不要とし、厳密な用量設定と厳格な投与対象集団の設定は不要であると考えます。長期的に使用されても特に問題はないが、他の疾患であることは常に考えておかなければならない。安全性が極めて高く、要指導医薬品とする必要性はない。薬剤師や登録販売者で十分対応できます。</p>
4	不明	<p>「安全性については問題ないと書かれていますが、過剰摂取のことにに対して何も考</p>

		<p>えていないわけですね。データがない状況で、どのように用量、投与間隔、投与時期、時刻等を考えるのかは、しっかりと宛てがっていないといけない。」(議事録の抜粋) に対する意見：</p> <p>Safety evaluation of the food enzyme β-galactosidase from the genetically modified <i>Aspergillus niger</i> strain TOL EFSA J. 2022 Oct 11;20(10):e07570. doi: 10.2903/j.efsa.2022.7570. eCollection 2022 Oct.</p> <p>Safety evaluation of the food enzyme β-galactosidase from the non-genetically modified <i>Aspergillus oryzae</i> strain GL 470 EFSA J. 2022 Oct 19;20(10):e07572. doi: 10.2903/j.efsa.2022.7572. eCollection 2022 Oct.</p> <p>株が違うと思われませんがそのほかにもたくさん結果があります。1970年代から使われている薬に対して(乳児にも使う薬に対して)安全性どうこう言うのは針小棒大では? 開業医が新薬を処方するよりよっぽど安全では。</p>
--	--	--

候補成分のスイッチ OTC 化に関する検討会議結果（案）

1. 候補成分の情報

成分名（一般名）	オキシブチニン塩酸塩
効能・効果	尿意切迫感（急に尿がしたいとの我慢し難い訴え）及びそれを伴う頻尿（尿の回数が多い）、尿もれ

2. 検討会議結果（案）

※ 太字記載については、「スイッチ OTC 化のニーズ等」においては必要性が高いという意見が、「スイッチ OTC 化する上での課題点等」においては重要性が高いという意見が、「課題点等に対する対応策、考え方、意見等」においては賛成意見が、各々多かったもの。

スイッチ OTC 化のニーズ等	
<ul style="list-style-type: none"> ○ 過活動膀胱の推定患者は 40 歳以上男女の 12.4%（約 810 万人）いると報告されているが、尿意切迫感や尿漏れの相談は気恥ずかしい側面があるため、特に女性の医療機関への受診率は低いことが報告されている。OTC 化によって、過活動膀胱に対する認知度が高まり、QOL の向上が期待できる。 ○ 1 日 1 回のテープ剤であり、抗コリン性副作用が低減されていることから、過活動膀胱で日常的な QOL 低下に悩む方の新たな選択肢になると考える。 ○ OAB の有病率の約半数は男性であり、夜間トイレが近いなど日常生活にも影響がある場合もある。OTC 医薬品として選択肢をふやすことで、生活者の QOL の改善に役立つものとする。 ○ アドヒアランスが低下する高齢者において確実な投与が可能な貼付剤が OTC として手に入ることで、頻回の尿意による介護者の負担が軽減されるため高齢者へのニーズが高いと考える。 ○ 誤飲等の危険性も考えられる内服薬に比べて、貼付薬は大変利便性が高く、高齢者や在宅医療の患者からのスイッチ OTC 化へのニーズは高いと考える。 ○ 軽度の過活動膀胱患者の最初の治療機会になると考えられ、適切な用量、対象設定、副作用の周知、モニターを行えば有用と考える。 ○ 尿意切迫症や尿漏れがあっても受診をためらう人は多く、本剤の OTC 化が受診への足掛かりになることが期待される。 	
スイッチ OTC 化する上での課題点等	課題点等に対する対応策、考え方、意見等
<p>【①薬剤の特性】</p> <ul style="list-style-type: none"> ○ 抗コリン作用による口内乾燥、便秘、排尿障害、頻度は少ないものの閉塞性隅角緑内障の悪化を来すことがある。また抗コリン剤の投与により認知症への影響が指摘され、最新版の過活動膀胱診療ガイドライン（第 3 版 2022） 	<ul style="list-style-type: none"> ○ 同効薬が OTC 化されており、先行して OTC 化された薬剤についての問題は生じていないとのこと。どう製品化し、売り方や使い方をどうコントロールしていくかが課題と思われる。（短期的課題）

では、β3 アドレナリン受容体作動薬が第一選択薬となり抗コリン薬は第二選択薬となっている。

- 本成分を使用する際に副作用に注意すべき疾患リストを包装に明記する。(短期的課題)
- 過量投与により副作用の出現頻度が増加すると考えられるため、販売の際に適正な用量での使用が必要な旨の説明を行う。(短期的課題)
- 医療用として抗コリン作用を有する、その他の薬剤を服用している可能性があるため、購入時、お薬手帳を持参していただき、抗コリン作用を有する、その他の薬剤を服用していないか確認することが望ましい。(短期的課題)
- 特に高齢者はポリファーマシーの問題を有する。近年多剤服用時の総抗コリン作用負荷の認知機能への影響等が指摘されている。(短期的課題)
- 抗コリン作用による症状の悪化が懸念される閉塞性隅角緑内障についても確認が必要と思われる。(短期的課題)
- 医療用医薬品(73.5mg 製剤)の再審査報告書(令和2年11月16日)においては、重要な特定されたリスクとして適用部位皮膚炎、適用部位紅斑、抗コリン作用に基づく有害事象、血小板減少について、特性使用成績調査(解析対象症例 2,035 例)で検討されており、発現割合及び重篤度について臨床上の懸念となる事項はなかったと評価されている。また、再審査期間中の副作用分析が行われているが、再審査申請時の添付文書の「使用上の注意」から予測できない副作用のうち、基本語別で総数5例以上収集されたいずれの副作用に関しても、医療用医薬品との関連が強く疑われる症例が集積していないことから、新たな安全確保措置は不要と判断されている。そのような再審査におけるPMDAの評価結果を考えると、73.5 mg 製剤のままOTCとしての用法・用量を設定して良いと考える。(短期的課題)
- 経口薬であるものの同効薬があるため、副作用に関する比較データに基づき対策を検討する必要があるか。(短期的課題)

- 貼付剤であるため、適用部位の皮膚炎、掻痒感、紅斑を起こす可能性がある。
- 医療用医薬品における皮膚炎の頻度は46.6%と非常に高い。皮膚の保湿剤を同時に処方するケースが多いが、それでも皮膚炎が生じるため、注意する必要がある。

- 副作用（口渇、便秘、認知機能への影響、排尿困難）の出現抑制のため、用量を医療用医薬品の半量程度とすることが妥当と考える。なお、その際は半量での薬効の評価が必要と考える。（短期的課題）
- 緑内障は本人に自覚がないことが多く、仮に自覚がある場合にも閉塞性隅角緑内障であるかは眼科に問い合わせないと判断できない。（短期的課題）
- 本剤は貼付薬であり、吸収は緩やかである。また内服薬とは異なり、剥がせばそれ以上血中濃度を上げることはない。排尿困難、尿閉等の前兆を使用者本人が自覚することができれば、血中濃度が上がり切らないうちに本剤を剥がすことで、最悪の重篤な副作用は防げるのではないかと。（短期的課題）
- OTCとして使用するには血中濃度の上がり方が急であるように感じる。血中濃度の上がり方を緩やかにするために、面積はそのまま成分の含有量を半分にすべき。用量を半分にしない位でないと、皮膚疾患等の問題が多く起こることが想像される。（短期的課題）
- 半量とする根拠が不明である。薬効が得られず有害事象のみ発現する可能性がないか。（パブリックコメントで提出された意見）
- **貼付部位の皮膚症状に対する対処方法の周知は不可欠と考える。（短期的課題）**
- **テープ剤として徐放化することで抗コリン性副作用が低減されることが報告されている。一方で適用部位に皮膚炎の副作用が高頻度で発現することへの情報提供・注意喚起が必要である。（短期的課題）**
- 貼付した薬剤を確実に剥がし、次の薬剤は剥がした場所と異なる箇所に貼付することについて、図等でわかりやすく添付文書に記載する。（短期的課題）
- 皮膚症状の出にくい方が使用する場合には大

- 本剤は副作用の多い薬剤である。また、本剤は貼付剤であり、高い頻度で皮膚障害を起こすことも考慮する必要がある。
- 緑内障や認知症等への使用に関して問題が多く、セカンドチョイスの薬となっている。どう使われていくのかを考えていく必要がある。
- OTC 化により、泌尿器科専門医に受診する機会を減らす可能性があり、尿閉により救急医療に負担をかけ、副作用により皮膚科診療に負担をかける可能性もある他、認知症が増加する可能性も考慮され、慎重さを要すると考える。

【②疾患の特性】

(特になし)

【③適正使用】

- 前立腺肥大症等の膀胱出口部閉塞を伴う場合、急性尿閉を含む排尿困難の増悪を誘発する可能性がある。

きな問題とならず、本剤は新たな選択肢になるのではないか。(短期的課題)

- 皮膚障害に対しては皮膚科専門医に受診勧奨が必要と考える。(短期的課題)
- 医療用医薬品の特定使用成績調査(安全性解析対象:2,035例)において認められた適用部位皮膚炎・適用部位紅斑はいずれも非重篤であり、再審査において新たな対応は不要と判断されている。(短期的課題)
- 貼付部位の皮膚症状の発現率が46.6%というのは広く一般の人が使う薬剤として販売される製品として高すぎるため、怖く感じる。(パブリックコメントで提出された意見)

- 薬局での副作用についての説明を徹底し、副作用出現時には、泌尿器科医、皮膚科医等へ受診勧奨を行う。副作用軽減の観点から低用量より開始することが望ましい(薬効に関するエビデンスはない)。(短期的課題)

○ 単に対象を女性に限定するのではなく、どのようにすれば男性にも適用できるのかを検討すべきではないか。(短期的課題)

- 医師の診察の元で医療用医薬品を使用している男性において、リスクが小さいと医師から判断された場合には、OTCを使用できないか。(短

- 高齢者の認知機能への影響が懸念される。
- 「オキシブチニン（経口）」は、「高齢者の安全な薬物療法ガイドライン 2015」（日本老年医学会編集）の「特に慎重な投与を要する薬物」のリストの中に含まれている。

- 過活動膀胱診療ガイドライン（第 3 版 2022）では、残尿量 100 mL 以上の患者、特に前立腺肥大症で 50 mL 以上の患者は泌尿器科専門医に受診することが推奨されている。

- 他の抗コリン作用薬において、医療用医薬品（バップフォー）では「閉塞隅角緑内障の患者」が禁忌だが、一般用医薬品（バップフォーレディ）では「緑内障の患者」が禁忌になっている等、不整合が起きている。

- 夏場の水分摂取による水分過多や、内科における脳梗塞予防のための水分摂取指導により、尿の総量が多いという点で起こる頻尿が潜在的にある。（患者が自分で頻尿の原因を判

期的課題)

- 男性にも 73.5 mg 剤の OTC の使用を認めて良いと考える。（短期的課題）
- 対象は女性に限定すること。（短期的課題）

- 長期服用の禁止及び年齢上限の設定が必要。（短期的課題）

- 高齢者の認知症又は認知機能障害がどの程度であれば使用できるのかを明確化する必要がある。（中長期的課題）

- 高齢者（75 歳以上）への販売は控える。（短期的課題）

- **初回投与で症状が改善しない者には、再販売することなく泌尿器科専門医の受診勧奨をする条件が必要と考える。（短期的課題）**

- **無効な場合だけでなく有効であった場合でも長期服用は避け、医師の診察、治療を推奨することが望ましいと考える。（短期的課題）**

- **長期投与の安全性、特に皮膚炎や尿閉などの排尿障害の出現、認知症、目の症状等、詳しくフォローする必要があると考える。（短期的課題）**

- OTC 化の際に単に「緑内障」表記とすることで、必要以上に適応を狭めることのないよう配慮してほしい。（短期的課題）

- 医療用医薬品の特定使用成績調査（安全性解析対象：2,035 例）において認められた抗コリン作用に基づく有害事象の発現割合は 6.8%、そのうち重篤例は 1 例のみであり、再審査において新たな対応は不要と判断されている。（短期的課題）

- **水分過多による頻尿であっても、そのことを理解していない方は、本剤を使用すれば良いと考える可能性があるため、薬剤師等による配慮が必要。（短期的課題）**

断することは危険)

【④販売体制】

- 実診療では、医療用医薬品の主な対象患者は、経口薬内服コンプライアンス不良の高齢患者である。剥がさないよう、患者の手が届かない背部などに貼付することにより、見えにくい部位のため、皮膚障害に気づくことが遅れ重症化の例が増えている。また、最近、糖尿病や脊柱管狭窄症を原因とする神経因性膀胱による尿閉・頻尿に対して抗コリン製剤が投与され尿閉となり、泌尿器科に運ばれる頻度が増加している。
- 検討されている効能・効果は一般の方にはわかりにくい。使用者・薬剤師が対象となる症状・疾患を理解している必要がある。(理解している使用者・薬剤師は少ない。)

【⑤OTC 医薬品を取り巻く環境】

(特になし)

【⑥その他】

(特になし)

- 多飲など生活習慣を見直すことで改善が図れる場合があるため、チェックシートを活用する。(短期的課題)
- 本剤を扱う薬局では近隣の泌尿器科等の情報提供が可能な体制を整えてほしい。(短期的課題)
- 介護者向けのチェックシートを作成する。(短期的課題)
- 適正な管理下で使用することに重きを置くべきである。これまで安全性の問題が表に現れていないのは、医師の適正な管理が前提条件にあるからではないか。(短期的課題)
- 要指導医薬品になった3年後に、インターネット販売が可能になった場合の怖さや懸念がある。(中長期的課題)
- 症状と疾患との関連について説明できる知識が薬剤師に求められる。(短期的課題)

総合的意見 (総合的な連携対応策など)

(特になし)

(編注)

網掛け: パブリックコメントで御提出頂いた御意見を踏まえ新たな課題点及び対応策を追記。なお、最終的な検討会議結果報告書においては網掛けを外して公表する予定。

**「候補成分のスイッチ OTC 化に係る検討会議での議論」
に対して寄せられた御意見等について**

令和5年7月4日（火）から令和5年8月2日（水）まで御意見を募集したところ、オキシブチニン塩酸塩に関して5件の御意見が提出された。お寄せ頂いた御意見は以下のとおり。

No.	提出者等	御意見
1	個人	<p>OTC 化へ賛成します。</p> <p>抗コリン薬という性質上、注意事項が多くなってしまうことは理解しますが、頻尿というのも大きく QOL を低下させる原因になると考えています。</p> <p>十分に PR されないことで、バップフォーは現在売上としてはそこまで大きくないかと思いますが、潜在的なニーズは一定数あり、選択肢が増えることで市場自体が拡大することも考えられます。（実際に八味地黄丸などは OTC で多く販売されていると思います）</p> <p>薬剤師による指導時に注意すべきことや受診の目安などを明確にし、添付文書にも記載することでリスクを低減させて利用することができると思います。</p>
2	個人	<p>先行して OTC 化された薬剤は医療用医薬品の半分の用量で製品化されていると聞きました。ポリファーマシーの問題や薬剤の安全性を考えると今回の製品も投与量を下げることや、対象を先行薬と揃えることが必要であると思う。</p> <p>また、今回の成分は貼付部位の皮膚症状の発現率が 46.6% というのは広く一般の人が使う薬剤として販売される製品として高すぎるため、怖く感じます。OTC として多くの方が使うために安全に使用できる製品にしてください。</p>
3	個人	<p>40 歳以上の男女で尿意切迫感や尿漏れの悩みを抱えながら受診を控えている人は多く、潜在需要は高い。既に同薬効の内服薬がスイッチ OTC 化されているが、需要者の利便性を考えるとテープ剤は QOL 改善に有効である。ただし、医療用テープ剤における皮膚症状の副作用は 46.6% と非常に高いこと、口渇など抗コリン剤特有の注意事項、禁忌については薬剤師からの説明が必須であり、第 2 類医薬品への移行はしない事例として、スイッチ OTC 化を検討する必要がある。</p>
4	不明	<p>オキシブチニンについては、特にスイッチ化について異論はない。これくらいの OTC を適切に販売できないのであれば、薬剤師の存在価値に疑問がある。</p>
5	不明	<p>配合風邪薬同様、どうしてこんな前時代的成分をいまさら OTC として売り出そうとするのか？ 現在でもよく分かってない医師が一番に抗コリン作用のある OAB 薬を高齢者に出し入院時迷惑している。抗コリン作用という高齢者にとって致命的な副作用であるデメリットを上回るメリット（統計的に有意差はついていないが大して効いていなさそう）を見いだせない。</p> <p>安全な PPI やロゼレムが不可で、抗コリン作用のあるオキシブチンは可になったら意味不明である。ビベグロンを OTC にしたいのであれば賛成。</p> <p>他に PPI や経口避妊薬など OTC 化すべき薬剤がたくさんある中でこの薬剤にリソースを割く理由が見当たりません。</p>

会議では抗コリン作用について十分注意を払っておられる先生ばかりですが、実臨床はひどいもので不適切患者に処方される事が多々あり日常的に困っております。医師会におかれましては処方権ということで放置するのではなく医科向けについてしっかりマネジメントしていただきたい。

○1日1回のテープ剤であり、・・・

→ネオキシテープが承認された10年以上前のメーカー売り文言そのままでは？本剤の貼付剤は2013.3に薬事・食品衛生審議会医薬品第一部会で承認されたものである。が、プラセボに対する優越性、プロピペリンに対する非劣勢は統計的に示されたものの群間差は少なく、当初より臨床的に効果が本当にあるのか疑問視していた薬剤でした。薬事委員会が厳しいところでは院内採用却下される施設もあった。また、採用した施設でも処方が出ないから採用削除に至った施設もある。実感としてはもっぱら処方していたのは新しもの好きの開業医くらいであった。(個人の感想)

○副作用(口渇、便秘、認知機能への影響、排尿困難)の出現抑制のため、・・・

→なんかとりあえず半分ですればいいと言っているように見えますが、国の専門家が集まる会議なので半量とした根拠を示されたい。有害事象だけ出て薬効を得られない可能性はどうなのでしょう？そもそも薬効得られるまで数週間必要な場合があります。

■OTCとして使用するには血中濃度の上がり方が急であるように感じる。・・・

→科学的な解説していただけますでしょうか？血中濃度の立ち上がり急だとOTCとしてダメなのはどういう関係があるのでしょうか？また、“皮膚疾患等の問題が多く起こることが想像される。“の出典をお願いいたします。PMDA承認審査報告書、再審査報告書、海外情報ともそんな事一言も記載されておりませんが、何か知見をお持ちでしょうか。

○アドヒアランスが低下する高齢者において確実な投与が可能な貼付剤が・・・

→過活動膀胱の薬のアドヒアランスが低下したところで別に何も問題ありません。逆に訪問看護等は無理やり用法用量通り使わせようとするので有害事象が起きている場合でも無理やり貼ってしまい危険です

○誤飲等の危険性も考えられる内服薬に比べて、貼付薬は大変利便性が高く、・・・

→誤飲の危険がないからと貼付薬が安全とする根拠は？そもそも誤飲で危険になるような薬剤ですか？まあそもそも貼付剤ニーズが高ければ医科用でも成功したいと思われそうですが、失敗してます(売れてない)

○皮膚障害に対しては皮膚科専門医に受診勧奨が必要と考える。(短期的課題)

	<p>→使うのをやめればいいだけでは・・・それでも収まらないなら受診すればいいわけで。過剰受診の誘導では</p> <p>○貼付剤であるため、適用部位の皮膚炎、掻痒感、紅斑を起こす可能性がある。・・・ →頻度は高いが、Grade は？ニュープロパッチだとロコイド軟膏も一緒に出される場合もあるが、他に代替手段のあるこのテープでそこまでするか？という問題もある（適応外処方？）</p> <p>○薬局での副作用についての説明を徹底し、副作用出現時には、・・・ →なんかやたらと皮膚科医という文言が出てきますが、数少ない医科の処方でもそんなことしているの見たことありません。CTCAE Grade 1-2 程度でも受診させる気ですか？同じく市販されているステロイド軟膏で様子見でもいいでしょう（皮膚科にかかったところでステロイド軟膏出されておしまいが関の山）</p> <p>○無効な場合だけでなく有効であった場合でも・・・ →結局、開業医が延々do 処方するだけなのに、この意見どうなのでしょう？セルフメディケーションの意義を否定しているのでは。考えに至った根拠？</p> <p>○検討されている効能・効果は一般の方にはわかりにくい。・・・ →ことあるごとにこの（理解している使用者・薬剤師は少ない。）を入れてきますが、薬剤師を貶したいのでしょうか？一部の排尿障害専門泌尿器科医以外の医師、医療関係者全般同じです。</p>
--	---

スイッチ OTC 医薬品の候補成分の成分情報等

1. 候補成分に関連する事項

候補成分 の情報	成分名 (一般名)	デプロドンプロピオン酸エステル
	スイッチ OTC とした際の 効能・効果	しっしん、皮ふ炎、あせも、かぶれ、かゆみ、しもやけ、虫 さされ、じんましん
候補成分に 対する医療 用医薬品の 情報	販売名	エクラー軟膏 0.3% エクラークリーム 0.3% エクラーローション 0.3% (投与経路：経皮) (剤形：軟膏、クリーム、ローション)
	効能・効果	湿疹・皮膚炎群（進行性指掌角皮症、ピダール苔癬、日光皮 膚炎、皮脂欠乏性湿疹、脂漏性皮膚炎を含む）、薬疹・中毒 疹、虫さされ、痒疹群 [じん麻疹様苔癬、ストロフルス、結 節性痒疹（固定じん麻疹）を含む]、乾癬、紅皮症、紅斑症 （多形滲出性紅斑、ダリエ遠心性環状紅斑）、ジベル薔薇色 枇糠疹、掌蹠膿疱症、特発性色素性紫斑（マヨッキー紫斑、 シャンバーグ病）、円形脱毛症
	用法・用量	通常 1 日 1～数回、適量を患部に塗布する。
	会社名	久光製薬株式会社

2. スイッチ OTC 化の妥当性評価にあたっての必要情報

医療用医薬品 の特徴・概要	承認年月日	[軟膏、クリーム] ・1992年3月27日（承認） ・2003年2月27日（販売名変更の代替承認） [ローション] ・1997年10月9日（承認） ・2003年2月27日（販売名変更の代替承認）
	再審査期間	[軟膏、クリーム] 1992年3月27日～1998年3月26日（終了） [ローション] 1997年10月9日～1998年3月26日（終了）
	再審査結果 通知日	[軟膏、クリーム] 2002年9月25日（再審査結果通知年月日） [ローション] 2002年9月25日（再審査結果通知年月日）
	再審査結果	薬事法第14条第2項各号のいずれにも該当しない
	開発の経緯 (インタビュー フォーム等より)	エクラーは英国ブーツ社により合成された、デプロドンプロピオン酸エステルを主成分とする非ハロゲン合成副腎皮質ホルモン外用剤である。 基礎試験においては、ラットを用いた各種炎症モデルに対しベタメタゾン吉草酸エステルとほぼ同等の抗炎症作用を示した。又、ヒト健常皮膚を用いた血管収縮試験においてもベタメタゾン吉草酸エステルより強い作用を示した。 臨床試験は、1985年（昭和60年）3月から第I相試験、同年7月から第II相試験、1988年（昭和63年）1月から比較試験が開始され、その結果本剤の有用性及び安全性が確認された。1992年（平成4年）3月に製造承認され、同年5月に薬価基準収載され、6月に「エクラー軟膏」「エクラークリーム」として発売された。ローション剤の開発として、1987年（昭和62年）より前臨床試験、薬物動態試験及び一般臨床試験が行われた。ローション剤は薬効薬理試験、及び血管収縮試験において、クリーム剤とほぼ同等であると認められたことから、1997年（平成9年）10月に製造承認され、同年12月に薬価基準収載され、「エクラーローション」として発売された。2003年（平成15年）2月、販売名を変更した「エクラー軟膏0.3%」「エクラークリーム0.3%」「エクラーローション0.3%」が製造承認され、同年7月に薬価基準収載された。

	<p>治療学的・製剤学的特性 (インタビュフォー ム等より)</p>	<ul style="list-style-type: none"> ・本剤は局所抗炎症作用と全身作用の乖離を目的に開発されたデプロドンプロピオン酸エステルを含有する外用副腎皮質ホルモン剤である。 ・デプロドンプロピオン酸エステル軟膏・クリームは健常成人男性を対象に、皮膚の蒼白化を指標とした血管収縮試験において、ベタメタゾン吉草酸エステル軟膏・クリーム剤（0.12%）より強い作用を示した。 ・デプロドンプロピオン酸エステル軟膏・クリームはラットを用いた各種炎症モデルに対して、各々ベタメタゾン吉草酸エステル軟膏・クリームとほぼ同等の抗炎症作用を示した。また、デプロドンプロピオン酸エステルローションはクリーム剤と同程度の抗炎症作用を示した。 ・最終全般改善度*は、軟膏剤で 84.3%（721 例/855 例）、クリーム剤で 81.4%（664 例/816 例）、ローション剤で 78.5%（520/662 例）であった。 *各種皮膚疾患患者を対象とした開発時の一般臨床試験における「かなり軽快」以上の比率を示す。 ・副作用発現率は、軟膏剤で 0.43%（16 例/3,753 例）、クリーム剤で 1.60%（34 例/2,119 例）であった（承認時及び再審査終了時までの調査）。また、ローション剤では 1.65%（12 例/728 例）であった（承認時）。
	<p>臨床での使われ方</p>	<p>アトピー性皮膚炎の治療において、中等度までの紅斑、鱗屑、少数の丘疹などの炎症所見、掻破痕などを主体とする場合にはストロング（III 群）ないしミディウム（IV 群）のステロイド外用薬を第一選択とする。乾燥を基盤とするアトピー性皮膚炎の治療には軟膏を選択するのが基本である。一方で、アドヒアランスを上げるため、夏期などには使用感を優先し、クリーム基剤を選択することもある。頭の病変には一般にはローションを使用する。¹⁾</p> <p>接触皮膚炎の治療において、ステロイド外用薬は高く推奨されている。²⁾</p> <p>痒疹の治療において、ステロイド外用薬は効果があり、第一選択として使用して良いが、ステロイド外用薬に抵抗する例では漫然と使用を継続せず、保湿剤外用を含めた他の治療法への変更を考慮することとされている。³⁾</p> <p>円形脱毛症の治療において、単発型から融合傾向のない多発型の円形脱毛症に対しては、1 日 1~2 回のストロング、ベリーストロング、ストロングストクラスのステロイド外用療法を行うよう勧められている。⁴⁾</p>

	安全性に関する情報(添付文書より)	<p>副作用</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th data-bbox="600 237 874 309">重大な副作用</th> <th data-bbox="874 237 1390 309">高頻度（5%以上）又は頻度不明の副作用</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td data-bbox="600 309 874 808">緑内障、後のう白内障（頻度不明）</td> <td data-bbox="874 309 1390 808"> <p><皮膚の感染症> 皮膚の真菌性（カンジダ症、白癬等）・細菌性（伝染性膿痂疹、毛のう炎等）感染症、ウイルス感染症 <その他の皮膚症状> ステロイドざ瘡、ステロイド酒さ・口囲皮膚炎（顔面の紅斑、丘疹、毛細血管拡張、痂皮、鱗屑） <過敏症> 皮膚の刺激感、発疹等 <下垂体・副腎皮質系機能> 大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法（ODT）により、下垂体・副腎皮質系機能の抑制</p> </td> </tr> </tbody> </table>	重大な副作用	高頻度（5%以上）又は頻度不明の副作用	緑内障、後のう白内障（頻度不明）	<p><皮膚の感染症> 皮膚の真菌性（カンジダ症、白癬等）・細菌性（伝染性膿痂疹、毛のう炎等）感染症、ウイルス感染症 <その他の皮膚症状> ステロイドざ瘡、ステロイド酒さ・口囲皮膚炎（顔面の紅斑、丘疹、毛細血管拡張、痂皮、鱗屑） <過敏症> 皮膚の刺激感、発疹等 <下垂体・副腎皮質系機能> 大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法（ODT）により、下垂体・副腎皮質系機能の抑制</p>
重大な副作用	高頻度（5%以上）又は頻度不明の副作用					
緑内障、後のう白内障（頻度不明）	<p><皮膚の感染症> 皮膚の真菌性（カンジダ症、白癬等）・細菌性（伝染性膿痂疹、毛のう炎等）感染症、ウイルス感染症 <その他の皮膚症状> ステロイドざ瘡、ステロイド酒さ・口囲皮膚炎（顔面の紅斑、丘疹、毛細血管拡張、痂皮、鱗屑） <過敏症> 皮膚の刺激感、発疹等 <下垂体・副腎皮質系機能> 大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法（ODT）により、下垂体・副腎皮質系機能の抑制</p>					
	禁忌・注意事項(添付文書より)	<p><禁忌>（次の患者には投与しないこと）</p> <ul style="list-style-type: none"> ・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。] ・本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者 ・鼓膜に穿孔のある湿疹性外耳道炎 [穿孔部位の治癒の遅延及び感染のおそれがある。] ・潰瘍（ベーチェット病は除く）、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。] <p><効能又は効果に関連する注意></p> <p>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。</p> <p><重要な基本的注意></p> <ul style="list-style-type: none"> ・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、副腎皮質ステロイド剤を全身的投与した場合と同様な症状があらわれることがある。 ・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。 ・症状改善後は、できるだけ速やかに使用を中止すること。 <p><特定の背景を有する患者に関する注意></p>				

		<ul style="list-style-type: none"> ・妊婦 妊婦又は妊娠している可能性のある女性に対しては大量又は長期にわたる広範囲の使用をしないこと。 ・小児等 長期・大量使用又は密封法（ODT）により発育障害をきたすおそれがある。 ・高齢者 大量又は長期にわたる使用に際しては特に注意すること。一般に生理機能が低下している。
	習慣性、依存性、耽溺性について	該当しない
	毒薬、劇薬等への該当性について	該当しない
推定使用者数等	<p>不明 ＜参考＞ 厚生労働省の患者調査によるとアトピー性皮膚炎の推計患者数は 53.6 千人となっている（令和 2 年）。</p>	
同種同効薬・類薬のスイッチ OTC 化の状況について	<p>同様の効能・効果を持つ一般用医薬品として、ストロングクラスのステロイド剤としてはリンデロン Vs クリーム、リンデロン Vs 軟膏（有効成分：ベタメタゾン吉草酸エステル）が、ミディアムクラスのステロイド剤としてはリビメックスコーワクリーム、リビメックスコーワローション、リビメックスコーワ軟膏、新リビメックスコーワクリーム、新リビメックスコーワローション、新リビメックスコーワ軟膏（有効成分：プレドニゾン吉草酸エステル酢酸エステル）、ロコイダン軟膏、ロコイダンクリーム（有効成分：ヒドロコルチゾン酪酸エステル）等がスイッチ OTC 化されている。</p>	
OTC 化された際の使われ方	<p>本製剤が OTC 化された場合には、使い心地も含め、治療薬の選択肢が広がり、セルフメディケーションの向上につながる。</p> <p>本剤はストロングクラスのステロイド剤であることから購入者の適正使用を担保するため、チェックシート、販売時に必要な情報提供資材（「薬局・販売店向け情報提供資料」及び「使用者向け情報提供資料」）を充実させる。</p>	
関連するガイドライン等	<p>アトピー性皮膚炎診療ガイドライン 2021 接触皮膚炎診療ガイドライン 2020 痒疹診療ガイドライン 2020 日本皮膚科学会円形脱毛症診療ガイドライン 2017 年版</p>	

その他	
-----	--

3. 候補成分の欧米等での承認状況

欧米等6か国 での承認状 況	一般用医薬品としての承認状況		
	<input type="checkbox"/> 英国 <input type="checkbox"/> 仏国 <input type="checkbox"/> 独国 <input type="checkbox"/> 米国 <input type="checkbox"/> 加国 <input type="checkbox"/> 豪州		
	〔欧米等6か国での承認内容〕		
		欧米各国での承認内容（関連する箇所に下線）	
	英国	販売名（企業名）	
		効能・効果	
		用法・用量	
		備考	
	仏国	販売名（企業名）	
		効能・効果	
		用法・用量	
		備考	
	独国	販売名（企業名）	
		効能・効果	
		用法・用量	
		備考	
	米国	販売名（企業名）	
		効能・効果	
		用法・用量	
		備考	
加国	販売名（企業名）		
	効能・効果		
	用法・用量		
	備考		
豪州	販売名（企業名）		
	効能・効果		
	用法・用量		
	備考		
医療用医薬品としての承認状況			
<input type="checkbox"/> 英国 <input type="checkbox"/> 仏国 <input type="checkbox"/> 独国 <input type="checkbox"/> 米国 <input type="checkbox"/> 加国 <input type="checkbox"/> 豪州			
〔備考〕			

	<p>食品、サプリメント等としての販売状況</p> <p><input type="checkbox"/>英国 <input type="checkbox"/>仏国 <input type="checkbox"/>独国 <input type="checkbox"/>米国 <input type="checkbox"/>加国 <input type="checkbox"/>豪州</p> <p>[備考]</p>

参考資料一覧

<p>1) 日本皮膚科学会、日本アレルギー学会編：アトピー性皮膚炎診療ガイドライン 2021（日皮会誌：131（13），2691-2777，2021（令和 3））</p> <p>2) 日本皮膚科学会編：接触皮膚炎診療ガイドライン 2020（日皮会誌：130（4），523-567，2020（令和 2））</p> <p>3) 日本皮膚科学会編：痒疹診療ガイドライン 2020（日皮会誌：130（7），1607-1626，2020（令和 2））</p> <p>4) 日本皮膚科学会編：日本皮膚科学会円形脱毛症診療ガイドライン 2017 年版（日皮会誌：127（13），2741-2762，2017（平成 29））</p>
--

貯 法：室温保存
有効期間：36カ月

	エクラー軟膏0.3%	エクラークリーム0.3%
承認番号	21500AMZ00069000	21500AMZ00070000
販売開始	1992年6月	1992年6月

外用副腎皮質ホルモン剤
(デブドロンプロピオン酸エステル製剤)

エクラー[®]軟膏0.3%

エクラー[®]クリーム0.3%

ECLAR[®]

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 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
- 2.3 鼓膜に穿孔のある湿疹性外耳道炎[穿孔部位の治療の遅延及び感染のおそれがある。]
- 2.4 潰瘍(ペーチェット病は除く)、第2度深在性以上の熱傷・凍傷[皮膚の再生が抑制され、治療が遅延するおそれがある。]

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	エクラー軟膏0.3%	エクラークリーム0.3%
有効成分	1g中 デブドロンプロピオン酸エステル 3mg(0.3%)	
添加剤	軽質流動パラフィン、ジブチルヒドロキシトルエン、白色ワセリン	アジピン酸ジイソプロピル、クエン酸、クエン酸ナトリウム、ジブチルヒドロキシトルエン、セタノール、白色ワセリン、パラオキシ安息香酸ブチル、パラオキシ安息香酸メチル、プロピレングリコール、ポリオキシエチレンセチルエーテル、モノステアリン酸グリセリン

3.2 製剤の性状

販売名	エクラー軟膏0.3%	エクラークリーム0.3%
剤形・性状	白色～微黄色の軟膏で、においはない。	白色のクリーム剤で、わずかに特異なおいがある。
識別コード	HP2100-O	HP2101C

4. 効能又は効果

- 湿疹・皮膚炎群(進行性指掌角皮症、ピダール苔癬、日光皮膚炎、皮脂欠乏性湿疹、脂漏性皮膚炎を含む)
- 薬疹・中毒疹
- 虫さされ
- 痒疹群[じん麻疹様苔癬、ストロフルス、結節性痒疹(固定じん麻疹)を含む]
- 乾癬
- 紅皮症
- 紅斑症(多形滲出性紅斑、ダリエ遠心性環状紅斑)
- ジベル薔薇色靴擦疹
- 掌蹠膿疱症
- 特発性色素性紫斑(マヨッキー紫斑、シャンバーグ病)
- 円形脱毛症

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。

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、副腎皮質ステロイド剤を全身的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 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しては大量又は長期にわたる広範囲の使用をしないこと。[8.1参照]
- 9.7 小児等
長期・大量使用又は密封法(ODT)により発育障害をきたすおそれがある。[8.1参照]
- 9.8 高齢者
大量又は長期にわたる使用に際しては特に注意すること。一般に生理機能が低下している。[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。

11.1 重大な副作用

- 11.1.1 緑内障、後のう白内障(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、後のう白内障、緑内障等の症状があらわれることがある。[8.1参照]

11.2 その他の副作用

種類	頻度	5%以上又は頻度不明	0.1～5%未満
皮膚の感染症 ^{注1)}		皮膚の真菌性(カンジダ症、白癬等)・細菌性(伝染性膿痂疹、毛のう炎等)感染症、ウイルス感染症	
その他の皮膚症状 ^{注2)}		ステロイドざ瘡 ^{注3)} 、ステロイド酒さ・口囲皮膚炎(顔面の紅斑、丘疹、毛細血管拡張、痂皮、鱗屑)	ステロイド皮膚(皮膚萎縮、毛細血管拡張)、魚鱗癬様皮膚変化、紫斑、多毛、色素脱失等
過敏症		皮膚の刺激感、発疹等	
下垂体・副腎皮質系機能		大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法(ODT)により、下垂体・副腎皮質系機能の抑制	

注1)密封法(ODT)の場合、起こりやすい。このような症状があらわれた場合には、適切な抗真菌剤、抗菌剤等を併用し、症

状が速やかに改善しない場合には、使用を中止すること。
 注2) 長期連用により生じることがある。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、副腎皮質ステロイドを含有しない薬剤に切り替えること。
 注3) 尋常性ざ瘡に似るが、白色の面皰が多発する傾向がある。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 使用部位

眼科用として使用しないこと。

14.1.2 使用方法

患者に化粧下、ひげそり後等に使用することのないよう注意すること。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人男子の腰背部に、軟膏及びクリーム2g(デプロドンプロピオン酸エステルとして6mg)を12時間密封塗布し、デプロドンプロピオン酸エステル及びその主代謝物である6β-ヒドロキシ体の血中濃度を経時的に測定したところ、両剤形とも同じような濃度推移をたどり、デプロドンプロピオン酸エステルは投与約12時間後、6β-ヒドロキシ体については約15時間後まで上昇し、以後緩やかに消失し、投与48時間後には全例とも検出限界(4pg/mL)付近あるいは検出限界以下となった¹⁾。

16.5 排泄

上記試験において、総累積尿中排泄率は、投与量の約0.06%と低値であった¹⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

一般臨床試験として964例、比較臨床試験として707例の総計1,671例について臨床試験を実施し、本剤の有効性が認められている^{2,3)}。

疾患名	有効率(%) (かなり軽快以上/評価例数)	
	軟膏	クリーム
湿疹・皮膚炎群	91.4 (352/385)	88.8 (310/349)
薬疹・中毒疹	95.0 (38/40)	92.1 (35/38)
虫さされ	95.5 (42/44)	88.6 (39/44)
痒疹群	82.6 (38/46)	71.4 (30/42)
乾癬	69.7 (106/152)	69.2 (92/133)
紅皮症	85.2 (23/27)	81.3 (13/16)
紅斑症	91.2 (31/34)	94.7 (36/38)
ジベル蓄膿色秕糠疹	84.4 (27/32)	95.0 (38/40)
掌蹠膿疱症	75.7 (28/37)	59.5 (22/37)
特発性色素性紫斑	80.8 (21/26)	78.8 (26/33)
円形脱毛症	46.9 (15/32)	50.0 (23/46)
計	84.3 (721/855)	81.4 (664/816)

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

副腎皮質ホルモンは標的細胞と接触すると、細胞膜を通過して細胞質の中に入り込む。細胞質の中には副腎皮質ホルモンに特異的な受容体蛋白が存在し、この蛋白と結合してホルモン・受容体複合体が形成される。この複合体がさらに活性化されて核膜を通過して核の中に入り、DNAと結合し、次いでRNAポリメラーゼがこのDNAに結合すると遺伝子情報がmRNAに転写され、特異的なmRNAが形成される。さらに特異的なmRNAは核の外に出て細胞質で特異的な蛋白が合成され、この蛋白が抗炎症作用を発現する^{4,5)}。

18.2 血管収縮作用

健康成人男性を対象に、皮膚の蒼白化を指標とした血管収縮試験において、ベタメタゾン吉草酸エステル(0.12%)より強い作用を示した。

18.3 抗炎症作用

ラットでのカラゲニン足蹠浮腫、ペーパー・ディスク肉芽腫、アジュバント関節炎に対して、ベタメタゾン吉草酸エステル(0.12%)とほぼ同等の抗炎症作用を示した⁶⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名: デプロドンプロピオン酸エステル

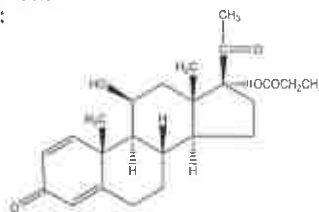
(Deprodone Propionate)

化学名: (+)-11β,17-dihydroxy-1,4-pregnadiene-3,20-dione 17-propionate

分子式: C₂₄H₃₂O₅

分子量: 400.51

構造式:



性状: 本品は白色～帯黄白色の結晶性の粉末で、においはないか、又はわずかに特異なおいがある。本品は1,4-ジオキサンに溶けやすく、メタノール又はエタノール(95)にやや溶けやすく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

融点: 225～230℃

22. 包装

〈エクラー軟膏0.3%〉

50g[5g(チューブ)×10]

250g[5g(チューブ)×50]

100g[10g(チューブ)×10]

500g(ボトル)

〈エクラークリーム0.3%〉

50g[5g(チューブ)×10]

250g[5g(チューブ)×50]

100g[10g(チューブ)×10]

23. 主要文献

- 1) 久光製薬社内資料. 吸収、分布、代謝及び排泄に関する資料.
- 2) 石橋康正 ほか: 臨床医薬. 1989; 5(9): 1915-46.
- 3) 石橋康正 ほか: 臨床医薬. 1989; 5(11): 2435-49.
- 4) 牧野荘平: 治療. 1985; 67(10): 1935-40.
- 5) 鹿取信: Therapeutic Research. 1986; 5(6): 955-61.
- 6) 大野洋光 ほか: 基礎と臨床. 1989; 23(15): 5735-43.

24. 文献請求先及び問い合わせ先

鳥居薬品株式会社 お客様相談室
 〒103-8439 東京都中央区日本橋本町3-4-1
 TEL 0120-316-834
 FAX 03-3231-6890


26. 製造販売業者等


26.1 製造販売元

久光製薬株式会社
 〒841-0017 鳥栖市田代大官町408番地

26.2 販売元

鳥居薬品株式会社
 東京都中央区日本橋本町3-4-1

販売元

鳥居薬品株式会社
 東京都中央区日本橋本町3-4-1

製造販売元

久光製薬株式会社
 〒841-0017 鳥栖市田代大官町408番地

貯 法：室温保存
有効期間：36カ月

承認番号	21500AMZ00071000
販売開始	1997年12月

外用副腎皮質ホルモン剤
デプロドンプロピオン酸エステルローション

エクラーローション0.3%

®
ECLAR® Lotion 0.3%

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 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
- 2.3 鼓膜に穿孔のある湿疹性外耳道炎[穿孔部位の治療の遅延及び感染のおそれがある。]
- 2.4 潰瘍(ベーチェット病は除く)、第2度深在性以上の熱傷・凍傷[皮膚の再生が抑制され、治療が遅延するおそれがある。]

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	エクラーローション0.3%
有効成分	1g中 デプロドンプロピオン酸エステル 3mg(0.3%)
添加剤	安息香酸ナトリウム、カルボキシビニルポリマー、ヒドロキシプロピルセルロース、プロピレングリコール

3.2 製剤の性状

販売名	エクラーローション0.3%
剤形・性状	白色の懸濁性ローションで、においはない。
識別コード	HP2102L

4. 効能又は効果

- 湿疹・皮膚炎群(進行性指掌角皮症、ビダール苔癬、日光皮膚炎、皮脂欠乏性湿疹、脂漏性皮膚炎を含む)
- 薬疹・中毒疹
- 虫さされ
- 痒疹群[じん麻疹様苔癬、ストロフルス、結節性痒疹(固定じん麻疹)を含む]
- 乾癬
- 紅皮症
- 紅斑症(多形滲出性紅斑、ダリエ遠心性環状紅斑)
- ジベル薔薇色粧糠疹
- 掌蹠膿疱症
- 特発性色素性紫斑(マヨッキー紫斑、シャンバーグ病)
- 円形脱毛症

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。

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、副腎皮質ステロイド剤を全身的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 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しては大量又は長期にわたる広範囲の使用をしないこと。[8.1参照]
- 9.7 小児等
長期・大量使用又は密封法(ODT)により発育障害をきたすおそれがある。[8.1参照]
- 9.8 高齢者
大量又は長期にわたる使用に際しては特に注意すること。一般に生理機能が低下している。[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。

11.1 重大な副作用

- 11.1.1 緑内障、後のう白内障(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、後のう白内障、緑内障等の症状があらわれることがある。[8.1参照]

11.2 その他の副作用

種類	頻度	5%以上又は頻度不明	0.1~5%未満
皮膚の感染症 ^{注1)}		皮膚の真菌性(カンジダ症、白癬等)・細菌性(伝染性膿痂疹、毛のう炎等)感染症、ウイルス感染症	
その他の皮膚症状 ^{注2)}		ステロイドざ瘡 ^{注3)} 、ステロイド酒さ・口囲皮膚炎(顔面の紅斑、丘疹、毛細血管拡張、痂皮、鱗屑)	ステロイド皮膚(皮膚萎縮、毛細血管拡張)、魚鱗癬様皮膚変化、紫斑、多毛、色素脱失等
過敏症		皮膚の刺激感、発疹等	
下垂体・副腎皮質系機能		大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法(ODT)により、下垂体・副腎皮質系機能の抑制	

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

注2) 長期連用により、生じることがある。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、副腎皮質ステロイドを含有しない薬剤に切り替えること。

注3) 尋常性ざ瘡に似るが、白色の面皰が多発する傾向がある。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

- 14.1.1 使用部位
眼科用として使用しないこと。

14.1.2 使用方法

- (1) 患者に化粧下、ひげそり後等に使用することのないよう注意すること。
- (2) よく振ってから使用すること。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人男子の腰部部に、本剤2g(デプロドンプロピオン酸エステルとして6mg)を12時間密封塗布し、デプロドンプロピオン酸エステル及びその主代謝物である6β-ヒドロキシ体の血中濃度を経時的に測定したところ、デプロドンプロピオン酸エステルは投与開始約12時間後、6β-ヒドロキシ体については約15時間後まで上昇し、以後緩やかに消失した。投与開始48時間後にはデプロドンプロピオン酸エステルについては約半数例が、6β-ヒドロキシ体では全例が検出限界(4pg/mL)以下となった¹⁾。

16.5 排泄

上記試験において、総累積尿中排泄率は、投与量の約0.06%と低値であった¹⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

一般臨床試験における662例中の有効率は下記のとおりであった²⁾。

疾患名	有効率(%) (かなり軽快以上/評価例数)
湿疹・皮膚炎群	83.2 (252/303)
薬疹・中毒疹	100 (33/33)
虫さされ	92.3 (72/78)
痒疹群	71.4 (30/42)
乾癬	77.8 (7/9)
紅皮症	41.7 (5/12)
紅斑症	90.5 (19/21)
ジベル蓄積性枇糠疹	91.7 (22/24)
掌蹠膿疱症	51.1 (23/45)
特発性色素性紫斑	71.1 (27/38)
円形脱毛症	52.6 (30/57)
計	78.5 (520/662)

副作用発現頻度は1.65%(12/728例)であり、主な副作用は、皮膚の刺激感0.82%(6/728例)、そう痒感0.69%(5/728例)、皮膚乾燥0.55%(4/728例)等であった。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

副腎皮質ホルモンは標的細胞と接触すると、細胞膜を通過して細胞質の中に入り込む。細胞質の中には副腎皮質ホルモンに特異的な受容体蛋白が存在し、この蛋白と結合してホルモン・受容体複合体が形成される。この複合体がさらに活性化されて核膜を通過して核の中に入り、DNAと結合し、次いでRNAポリメラーゼがこのDNAに結合すると遺伝子情報がmRNAに転写され、特異的なmRNAが形成される。さらに特異的なmRNAは核の外に出て細胞質で特異的な蛋白が合成され、この蛋白が抗炎症作用を発現する^{3,4)}。

18.2 血管収縮作用

健康成人男性を対象に、皮膚の蒼白化を指標とした血管収縮試験において、ベタメタゾン吉草酸エステルより強い作用を示すデプロドンプロピオン酸エステルクリームと同等の成績が得られた⁵⁾。

18.3 抗炎症作用

ラットでのカラゲニン足蹠浮腫、アジュバント関節炎に対して、ベタメタゾン吉草酸エステルとほぼ同等の

抗炎症作用を示すデプロドンプロピオン酸エステルクリームと同等の成績が得られた⁶⁻⁹⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

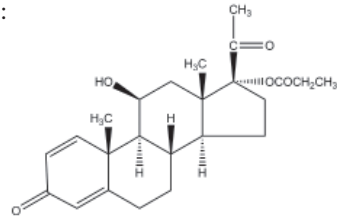
一般名:デプロドンプロピオン酸エステル
(Deprodone Propionate)

化学名:(+)-11β,17-dihydroxy-1,4-pregnadiene-3,20-dione-17-propionate

分子式:C₂₄H₃₂O₅

分子量:400.51

構造式:



性状:本品は白色～帯黄白色の結晶性の粉末で、においはないか、又はわずかに特異なにおいがある。本品は1,4-ジオキサンに溶けやすく、メタノール又はエタノール(95)にやや溶けやすく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

融点:225～230℃

22. 包装

100g[10g(プラスチック容器)×10本]

500g[10g(プラスチック容器)×50本]

23. 主要文献

- 1) 久光製薬社内資料. Deprodone propionateローションの薬物動態試験。
- 2) 久光製薬社内資料. 臨床試験に関する資料。
- 3) 牧野荘平:治療. 1985; 67(10): 1935-40.
- 4) 鹿取信:Therapeutic Research. 1986; 5(6): 955-61.
- 5) 久光製薬社内資料. Deprodone propionateローションの血管収縮試験について-Deprodone propionateクリームとの比較-。
- 6) 大野洋光 ほか:基礎と臨床. 1989; 23(15): 5735-43.
- 7) 久光製薬社内資料. Deprodone propionateの抗炎症作用。
- 8) 久光製薬社内資料. Deprodone propionateローションの抗炎症作用。
- 9) 久光製薬社内資料. Deprodone propionateローションの抗炎症試験。

24. 文献請求先及び問い合わせ先

久光製薬株式会社 学術部 お客様相談室
〒100-6330 東京都千代田区丸の内二丁目4番1号

フリーダイヤル 0120-381332

FAX.(03)5293-1723

受付時間/9:00-17:50(土日・祝日・会社休日を除く)

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

久光製薬株式会社

〒841-0017 鳥栖市田代大官町408番地

製造販売元



久光製薬株式会社

〒841-0017 鳥栖市田代大官町408番地

< 日本小児科学会 見解 >

スイッチOTC医薬品の候補成分に関する見解

1. 候補成分に関連する事項

候補成分 の情報	成分名 (一般名)	デプロドンプロピオン酸エステル(軟膏、クリーム、ローション)
	効能・効果	湿疹・皮膚炎群(進行性指掌角皮症、ビダール苔癬、日光皮膚炎、皮脂欠乏性湿疹、脂漏性皮膚炎を含む)、蕁麻疹・中毒疹、虫さされ、痒疹群[じん麻疹様苔癬、ストロフルス、結節性痒疹(固定じん麻疹)を含む]、乾癬、紅皮症、紅斑症(多形滲出性紅斑、ダリエ遠心性環状紅斑)、ジベル薔薇色粧糠疹、掌蹠膿疱症、特発性色素性紫斑(マヨッキー紫斑、シャンバーグ病)、円形脱毛症

2. スイッチOTC化の妥当性に関連する事項

スイッチ OTC化の 妥当性	<p>1. OTC とすることの妥当性について</p> <p>【薬剤特性の観点から】 妥当と思われる。</p> <p>【対象疾患の観点から】 妥当と思われる。</p> <p>【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 妥当と思われる。</p> <p>〔上記と判断した根拠〕 リンデロン-V軟膏0.12%及び同クリーム0.12%と同様の効能・効果であることより軟膏、クリーム、ローションに関しては良いように思われる。</p> <p>2. OTC とする際の留意事項、課題点について 既にスイッチOTC化されたリンデロンVs軟膏及び同クリームやミディウムクラスのステロイド外用剤と同様、5~6日間使用しても症状がよくなる場合を受診を行うように強く注意喚起する。</p> <p>〔上記と判断した根拠〕</p> <p>3. その他</p>
備考	

＜日本皮膚科学会 見解＞

スイッチOTC医薬品の候補成分に関する見解

1. 候補成分に関連する事項

候補成分 の情報	成分名 (一般名)	デプロドンプロピオン酸エステル(軟膏、クリーム、ローション)
	効能・効果	しっしん、皮ふ炎、あせも、かぶれ、かゆみ、しもやけ、虫さされ、じんましん

2. スイッチ OTC 化の妥当性に関する事項

スイッチ OTC 化の 妥当性	<p>1. OTC とすることの妥当性について OTC とすることは妥当と考える。</p> <p>【薬剤特性の観点から】 本剤はステロイド外用薬の III 群(ストロング)に相当する薬剤(軟膏、クリーム、ローション)であり、このような薬剤は今までも OTC 化されているので、妥当と考える。</p> <p>【対象疾患の観点から】 特に問題ない。</p> <p>【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 特に問題ない。</p> <p>〔上記と判断した根拠〕 ステロイド外用薬の III 群(ストロング)に相当する薬剤(軟膏、クリーム、ローション)であること。</p> <p>2. OTC とする際の留意事項、課題点について 顔や首などの薬剤吸収率の高い部位への外用は出来るだけ短期間に留めるべきである。</p> <p>〔上記と判断した根拠〕 ステロイドの局所的副作用(皮膚萎縮、毛細血管拡張など)が起きやすい部位のため。</p> <p>3. その他</p>
備考	

< 日本臨床皮膚科医会 見解 >

スイッチOTC医薬品の候補成分に関する見解

1. 候補成分に関連する事項

候補成分 の情報	成分名 (一般名)	デプロドンプロピオン酸エステル 軟膏・クリーム・ローション
	効能・効果	しっしん、皮ふ炎、あせも、かぶれ、かゆみ、しもやけ、虫さされ、じんましん

2. スイッチ OTC 化の妥当性に関連する事項

スイッチ OTC 化の 妥当性	<p>1. OTC とすることの妥当性について</p> <p>【薬剤特性の観点から】 OTC 化が妥当とは言い難い。</p> <p>【対象疾患の観点から】 あせも、単なるかゆみ、じんましんは、効能・効果から削除すべきである。</p> <p>【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 ステロイド外用剤は、皮膚科専門医の指導の下、使用するべきであり、OTC 化されたことにより不適切な使用による副作用等の懸念がある。そのため OTC 化が妥当とは言い難い。</p> <p>[上記と判断した根拠] 本剤は strong クラスのステロイド外用剤であり、決して力価が低いわけではないため、本来は皮膚科専門医の指導の下塗布することが好ましい。また漫然と塗布し続けることによる、毛のう炎（ステロイドざ瘡）、皮膚萎縮、毛細血管拡張、ステロイド皮膚炎等の副作用の懸念がある。</p> <p>医療用エクラーの適応は、添付文書にあるように様々な湿疹・皮膚炎が含まれるが、あせも、単なるかゆみ、じんましんは含まれていない。これら疾患・病態は内服や他の外用を使用すべきであり、効能・効果から削除すべきである。</p> <p>かつて報道された、顔面に長期連用したために発症した「重度顔面ステロイド皮膚炎」は二度と起こしてはならない。</p> <p>2. OTC とする際の留意事項、課題点について</p> <p>定期的に皮膚科を受診している患者に関して、急場しのぎとして販売することは仕方ないと思われるが、新規患者の皮膚疾患の診断が難しい薬剤師が、患者の訴えを鵜呑みにして販売することは大変</p>
-----------------------	--

	<p>危険である。かりに OTC 化された場合には、薬剤師による十分な説明（ステロイド外用剤の特徴、副作用等）及び、一定期間（数日～1 週間程度）使用しても効果が認められないときには、皮膚科受診を強く勧めることの徹底が必要である。</p> <p>〔上記と判断した根拠〕</p> <p>上述したように、ステロイド外用剤を不適切（感染症等に対し）に使用し症状を悪化させることや、漫然と使用し続けることによる副作用の危惧がある以上 OTC 化が妥当とは言い難い。</p> <p>3. その他</p> <p>しかし本邦では、既に mild クラスのステロイド外用剤は多くの商品名で販売されているだけでなく、strong クラスのステロイド外用剤（フルコート、ベトネベート）が OTC 化され販売されている事実がある以上、strong クラスのデプロドンプロピオン酸エステル軟膏・クリーム・ローションの OTC 化は「やむなし」と言わざるをえないであろう。</p>
備考	

スイッチ OTC 医薬品の候補成分の成分情報等

1. 候補成分に関連する事項

候補成分 の情報	成分名 (一般名)	デプロドンプロピオン酸エステル
	スイッチ OTC とした際の 効能・効果	しっしん、皮ふ炎、あせも、かぶれ、かゆみ、しもやけ、虫 さされ、じんましん、きず・やけどのあとの皮ふのしこり・ つぶり (顔面を除く)
候補成分に 対する医療 用医薬品の 情報	販売名	エクラー plaster-20 μ g/cm ² (投与経路：経皮) (剤形：テープ剤)
	効能・効果	湿疹・皮膚炎群 (進行性指掌角皮症、ピダール苔癬を含む)、 虫さされ、痒疹群 [じん麻疹様苔癬、ストロフルス、結節性 痒疹 (固定じん麻疹) を含む]、乾癬、掌蹠膿疱症、肥厚性 癬痕・ケロイド、扁平紅色苔癬、慢性円板状エリテマトー デス、環状肉芽腫
	用法・用量	患部を軽く洗浄し、よく乾燥させた後、本品を膏体面被覆 ポリエステルフィルムに付着させたまま適当な大きさに切 り取り、ポリエステルフィルムを取り除き、患部に膏体面 を当てて貼付する。本品は、貼付後 12 時間又は 24 時間毎 に貼りかえる。必要な場合、夜間のみ貼付する方法もある。 なお、貼りかえるときにも患部の洗浄及び乾燥を行う。
	会社名	久光製薬株式会社

2. スイッチ OTC 化の妥当性評価にあたっての必要情報

医療用医薬品 の特徴・概要	承認年月日	<ul style="list-style-type: none"> ・2001年3月15日（承認） ・2008年2月28日（販売名変更の代替承認）
	再審査期間	<p>なし</p> <p><参考></p> <p>エクラーテープ：1992年3月27日～1998年3月26日</p> <p>エクラーテープは、2006年5月に供給停止となっている。</p>
	再審査結果 通知日	<p>なし</p> <p><参考></p> <p>エクラーテープ</p> <p>公表年月日：2002年9月25日（再審査結果通知年月日）</p>
	再審査結果	<p>なし</p> <p><参考></p> <p>エクラーテープ</p> <p>薬事法第14条第2項各号のいずれにも該当しない</p>
	開発の経緯 （インタビ ューフォー ム等より）	<p>ステロイド剤による密封療法（ODT療法）は一般に難治性皮膚疾患や慢性皮膚病変に用いられている。</p> <p>密封療法に用いられる貼付剤の基剤は油脂性と水溶性に大別され、油脂性基剤は水溶性基剤に比べて粘着力が強く、高い密封効果が期待できる一方、水溶性基剤では油脂性基剤に比べて薬剤剥離時の角質剥離が生じにくいと考えられる。その為、密封療法においては患部の状態や疾患部位に応じた基剤の使い分けが必要であるといえる。</p> <p>エクラーは英国ブーツ社（現 クノール社）により合成された、デプロドンプロピオン酸エステルを主成分とする非ハロゲン合成副腎皮質ホルモン外用剤である。水溶性基剤を用いた「エクラーテープ」がエスエス製薬より1992年に発売され、続いて油脂性基剤の「エクラープラスター」が2001年に発売された。2008年2月、販売名を変更したエクラープラスター20$\mu\text{g}/\text{cm}^2$が製造販売承認された。なお、エクラーテープは2006年5月に供給停止となっている。</p>
	治療学的・製剤学的特性 （インタビ ューフォー ム等より）	<ul style="list-style-type: none"> ・エクラープラスター20$\mu\text{g}/\text{cm}^2$はエクラーテープ※との生物学的同等性が認められている。 ※エクラーテープは、2006年5月に供給停止となっている。 <p><参考>エクラーテープの治療学的・製剤学的特性</p> <ul style="list-style-type: none"> ・エクラーテープは水溶性基剤を用いたステロイドテープ剤である。 ・エクラーテープは、ヒト皮膚血管収縮試験においてフル

		<p>ドロキシコルチドテープ、フルオシノロンアセトニドテープ及び吉草酸ベタメタゾンテープより強い作用を示した。</p> <p>・難治性を含む各種皮膚疾患を対象とした臨床試験におけるエクラーテープの改善率は、湿疹・皮膚炎群 90.7% (166例/183例)*、虫さされ 90.2% (37例/41例)*、痒疹群 79.6% (113例/142例)*、乾癬 94.0% (126例/134例)、掌蹠膿疱症 92.9% (39例/42例)*、肥厚性瘢痕・ケロイド 51.9% (28例/54例)*、扁平紅色苔癬 88.9% (32例/36例)*、慢性円板状エリテマトーデス 81.4% (35例/43例)*、環状肉芽腫 91.3% (21例/23例)であった。</p> <p>*：かなり軽快以上/例数</p> <p>・エクラーテープの副作用発現率は 2.8% (20例/708例)であり、その主な内訳はステロイド潮紅・毛細血管拡張 7件 (0.99%)、接触皮膚炎 5件 (0.71%)、皮膚萎縮 4件 (0.56%)、毛のう炎・癬 3件 (0.42%) 等であった。(承認時)</p>
	<p>臨床での使われ方</p>	<p>アトピー性皮膚炎の治療において、中等度までの紅斑、鱗屑、少数の丘疹などの炎症所見、掻破痕などを主体とする場合にはストロング (III群) ないしミディウム (IV群) のステロイド外用薬を第一選択とする。剤型の選択は、病変の性状、部位などを考慮して選択する。乾燥を基盤とするアトピー性皮膚炎の治療には軟膏を選択するのが基本である。一方で、アドヒアランスを上げるため、痒疹や苔癬化皮疹にはテープ剤の使用も考慮する。¹⁾</p> <p>またケロイド・肥厚性瘢痕治療における第一選択は、成人においては強いステロイドのテープ剤 (軽症例には弱いステロイドのテープ剤を使用してもよい)、小児においては弱いステロイドのテープ剤となっている。²⁾</p> <p>接触皮膚炎の治療において、ステロイド外用薬は高く推奨されている。³⁾</p> <p>痒疹の治療において、ステロイド外用薬は効果があり、第一選択として使用して良いが、ステロイド外用薬に抵抗する例では漫然と使用を継続せず、保湿剤外用を含めた他の治療法への変更を考慮することとされている。⁴⁾</p>
	<p>安全性に関する情報 (添付文書より)</p>	<p>エクラープラスター 20μg/cm² においては、使用成績調査等は実施されていない。なお、デプロドンプロピオン酸エステルのテープ剤において報告された副作用 (承認時及び再審査終了時までの調査) は、910 例中 24 例 (2.64%) で、その主なものは毛細血管拡張 9 件 (0.99%)、接触皮膚炎 5 件 (0.55%)、皮膚萎縮 4 件 (0.44%)、毛のう炎 4 件 (0.44%)</p>

		<p>等であった。</p> <p>なお、本項には頻度が算出できない副作用報告を含む。</p> <p>副作用</p> <table border="1"> <thead> <tr> <th data-bbox="600 376 876 450">重大な副作用</th> <th data-bbox="876 376 1374 450">高頻度（5%以上）又は頻度不明の副作用</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td data-bbox="600 450 876 1025"> 緑内障、後のう白内障 </td> <td data-bbox="876 450 1374 1025"> <皮膚の感染症> 皮膚の真菌性（カンジダ症、白癬等）・細菌性（伝染性膿痂疹、毛のう炎、癬等）感染症、ウイルス感染症 <その他の皮膚症状> ステロイドざ瘡、ステロイド酒さ・口囲皮膚炎（顔面の紅斑、丘疹、毛細血管拡張、痂皮、鱗屑） そう痒、疼痛、ヒリヒリ感、潮紅、紫斑、水疱、び爛等の皮膚刺激症状や汗疹、過乾燥、亀裂、出血、貼付部位のムレや悪臭、皮疹の悪化 <過敏症> 皮膚の刺激感、発疹等 <下垂体・副腎皮質系機能> 下垂体・副腎皮質系機能の抑制 </td> </tr> </tbody> </table>	重大な副作用	高頻度（5%以上）又は頻度不明の副作用	緑内障、後のう白内障	<皮膚の感染症> 皮膚の真菌性（カンジダ症、白癬等）・細菌性（伝染性膿痂疹、毛のう炎、癬等）感染症、ウイルス感染症 <その他の皮膚症状> ステロイドざ瘡、ステロイド酒さ・口囲皮膚炎（顔面の紅斑、丘疹、毛細血管拡張、痂皮、鱗屑） そう痒、疼痛、ヒリヒリ感、潮紅、紫斑、水疱、び爛等の皮膚刺激症状や汗疹、過乾燥、亀裂、出血、貼付部位のムレや悪臭、皮疹の悪化 <過敏症> 皮膚の刺激感、発疹等 <下垂体・副腎皮質系機能> 下垂体・副腎皮質系機能の抑制
重大な副作用	高頻度（5%以上）又は頻度不明の副作用					
緑内障、後のう白内障	<皮膚の感染症> 皮膚の真菌性（カンジダ症、白癬等）・細菌性（伝染性膿痂疹、毛のう炎、癬等）感染症、ウイルス感染症 <その他の皮膚症状> ステロイドざ瘡、ステロイド酒さ・口囲皮膚炎（顔面の紅斑、丘疹、毛細血管拡張、痂皮、鱗屑） そう痒、疼痛、ヒリヒリ感、潮紅、紫斑、水疱、び爛等の皮膚刺激症状や汗疹、過乾燥、亀裂、出血、貼付部位のムレや悪臭、皮疹の悪化 <過敏症> 皮膚の刺激感、発疹等 <下垂体・副腎皮質系機能> 下垂体・副腎皮質系機能の抑制					
	禁忌・注意事項（添付文書より）	<p><禁忌>（次の患者には投与しないこと）</p> <ul style="list-style-type: none"> ・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。] ・本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者 ・鼓膜に穿孔のある湿疹性外耳道炎 [穿孔部位の治癒の遅延及び感染のおそれがある。] ・潰瘍（ベーチェット病は除く）、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。] ・血清の浸出している病巣及び特に発汗の強い部位 [皮膚感染症の誘発、悪化、また発汗による汗疹のおそれがある。] <p><効能又は効果に関連する注意></p> <p>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。</p> <p><重要な基本的注意></p> <ul style="list-style-type: none"> ・大量又は長期にわたる広範囲の使用により、副腎皮質ス 				

		<p>ステロイド剤を全身的投与した場合と同様な症状があらわれることがある。</p> <ul style="list-style-type: none"> ・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。 ・症状改善後は、できるだけ速やかに使用を中止すること。 <p><特定の背景を有する患者に関する注意></p> <ul style="list-style-type: none"> ・妊婦 妊婦又は妊娠している可能性のある女性に対しては大量又は長期にわたる広範囲の使用をしないこと。 ・小児等 長期・大量使用又は密封法（ODT）により発育障害をきたすおそれがある。 ・高齢者 大量又は長期にわたる使用に際しては特に注意すること。一般に生理機能が低下している。
	習慣性、依存性、耽溺性について	該当しない
	毒薬、劇薬等への該当性について	該当しない
推定使用者数等	<p>不明</p> <p><参考></p> <p>厚生労働省の患者調査によるとアトピー性皮膚炎の推計患者数は 53.6 千人となっている（令和 2 年）。</p>	
同種同効薬・類薬のスイッチ OTC 化の状況について	<p>「しっしん、皮ふ炎、あせも、かぶれ、かゆみ、しもやけ、虫さされ、じんましん」の効能・効果を持つ OTC 医薬品として、ストロングクラスのステロイド剤としてはリンデロン Vs クリーム、リンデロン Vs 軟膏（有効成分：ベタメタゾン吉草酸エステル）が、ミディアムクラスのステロイド剤としてはリビメックスコーワクリーム、リビメックスコーワローション、リビメックスコーワ軟膏、新リビメックスコーワクリーム、新リビメックスコーワローション、新リビメックスコーワ軟膏（有効成分：プレドニゾロン吉草酸エステル酢酸エステル）、ロコイダン軟膏、ロコイダンクリーム（有効成分：ヒドロコルチゾン酪酸エステル）等がスイッチ OTC 化されている。</p> <p>「きず・やけどのあとの皮ふのしこり・つぶり（顔面を除く）」の効能・効果を持つスイッチ OTC 化されているステロイド剤は現状ない。</p>	

<p>OTC 化された際の使われ方</p>	<p>「しっしん、皮ふ炎、あせも、かぶれ、かゆみ、しもやけ、虫さされ、じんましん」の効能・効果を持つ一般用医薬品は軟膏やクリームなどの剤型はあるが貼付剤の剤型は現状ない。本製剤が OTC 化された場合には剤型の選択肢が広がり、使用者の要望に応じて使い分けることができるようになる。</p> <p>また「きず・やけどのあとの皮ふのしこり・つっぱり（顔面を除く）」の効能・効果を持つ OTC 医薬品はヘパリン類似物質を主薬とする製剤が中心で、ステロイド外用剤は現状ない。本製剤が OTC 化された場合には形成外科診療ガイドラインでケロイド症状に効果があるとされている、ステロイド薬での治療という選択肢を取ることが可能となる。⁵⁾</p> <p>本剤は患部の大きさに合わせて使用するため、スイッチ OTC 化する上で用法・用量は「患部を軽く洗浄し、よく乾燥させた後、本品を適当な大きさに切り取り、貼付する。1日1~2回1枚を患部に貼付する。」とし、貼付時にかゆみを感じ、長時間貼り続けることが難しい場合には、12時間での貼り換えを行うようにする（1日2回貼付）。</p> <p>本剤はストロングクラスのステロイド剤であることから、購入者の適正使用を担保するため、チェックシート、販売時に必要な情報提供資材（「薬局・販売店向け情報提供資料」及び「使用者向け情報提供資料」）を充実させる。</p>
<p>関連するガイドライン等</p>	<p>アトピー性皮膚炎診療ガイドライン 2021 ケロイド・肥厚性癬痕 診断・治療指針 2018 接触皮膚炎診療ガイドライン 2020 痒疹診療ガイドライン 2020 形成外科診療ガイドライン</p>
<p>その他</p>	

3. 候補成分の欧米等での承認状況

欧米等6か国 での承認状 況	一般用医薬品としての承認状況		
	<input type="checkbox"/> 英国 <input type="checkbox"/> 仏国 <input type="checkbox"/> 独国 <input type="checkbox"/> 米国 <input type="checkbox"/> 加国 <input type="checkbox"/> 豪州		
	〔欧米等6か国での承認内容〕		
		欧米各国での承認内容（関連する箇所に下線）	
	英国	販売名（企業名）	
		効能・効果	
		用法・用量	
		備考	
	仏国	販売名（企業名）	
		効能・効果	
		用法・用量	
		備考	
	独国	販売名（企業名）	
		効能・効果	
		用法・用量	
		備考	
	米国	販売名（企業名）	
		効能・効果	
		用法・用量	
		備考	
加国	販売名（企業名）		
	効能・効果		
	用法・用量		
	備考		
豪州	販売名（企業名）		
	効能・効果		
	用法・用量		
	備考		
医療用医薬品としての承認状況			
<input type="checkbox"/> 英国 <input type="checkbox"/> 仏国 <input type="checkbox"/> 独国 <input type="checkbox"/> 米国 <input type="checkbox"/> 加国 <input type="checkbox"/> 豪州			
〔備考〕			

	<p>食品、サプリメント等としての販売状況</p> <p><input type="checkbox"/> 英国 <input type="checkbox"/> 仏国 <input type="checkbox"/> 独国 <input type="checkbox"/> 米国 <input type="checkbox"/> 加国 <input type="checkbox"/> 豪州</p> <p>[備考]</p>

参考資料一覧

<p>1) 日本皮膚科学会、日本アレルギー学会編：アトピー性皮膚炎診療ガイドライン 2021（日皮会誌：131（13），2691-2777，2021（令和 3））</p> <p>2) 瘢痕・ケロイド治療研究会編：ケロイド・肥厚性瘢痕 診断・治療指針 2018</p> <p>3) 日本皮膚科学会編：接触皮膚炎診療ガイドライン 2020（日皮会誌：130（4），523-567，2020（令和 2））</p> <p>4) 日本皮膚科学会編：痒疹診療ガイドライン 2020（日皮会誌：130（7），1607-1626，2020（令和 2））</p> <p>5) 日本形成外科学会、日本創傷外科学会、日本頭蓋顎顔面外科学会編：形成外科診療ガイドライン</p>
--

貯 法：室温保存
有効期間：36カ月

承認番号	22000AMX00248000
販売開始	2001年7月

外用副腎皮質ホルモン剤
デプロドンプロピオン酸エステルプラスター

エクラー[®]プラスター 20 μ g/cm²

ECLAR[®] Plasters 20 μ g/cm²

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 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
- 2.3 鼓膜に穿孔のある湿疹性外耳道炎[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(バーチェット病は除く)、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。]
- 2.5 血清の浸出している病巣及び特に発汗の強い部位[皮膚感染症の誘発、悪化、また発汗による汗疹のおそれがある。]

3. 組成・性状

3.1 組成

販 売 名	エクラープラスター20 μ g/cm ²
有 効 成 分	1cm ² 中 デプロドンプロピオン酸エステル 20 μ g
添 加 剤	エステルガムHG、クロタミトン、ジブチルヒドロキシトルエン、スチレン・イソブレン・スチレンブロック共重合体、ポリイソブチレン、流動パラフィン、その他1成分

3.2 製剤の性状

販 売 名	エクラープラスター20 μ g/cm ²
剤 形・性 状	無色透明～淡黄色透明の特異なにおいのある膏体を支持体に均一に展延し、膏体面をポリエステルフィルムで被覆した貼付剤である。
大 き さ	7.5cm×10cm
識 別 コード	HP3102T

4. 効能又は効果

- 湿疹・皮膚炎群(進行性指掌角皮症、ピダール苔癬を含む)
- 虫さされ
- 痒疹群[じん麻疹様苔癬、ストロフルス、結節性痒疹(固定じん麻疹)を含む]
- 乾癬
- 掌蹠膿疱症
- 肥厚性癬痕・ケロイド
- 扁平紅色苔癬
- 慢性円板状エリテマトーデス
- 環状肉芽腫

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

患部を軽く洗浄し、よく乾燥させた後、本品を膏体面被覆ポリエステルフィルムに付着させたまま適当な大きさに切り取り、ポリエステルフィルムを取り除き、患部に膏体面を当てて貼付する。本品は、貼付後12時間又は24時間毎に貼りか

える。必要な場合、夜間のみ貼付する方法もある。なお、貼りかえるときにも患部の洗浄及び乾燥を行う。

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使用により、副腎皮質ステロイド剤を全身的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 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しては大量又は長期にわたる広範囲の使用をしないこと。[8.1参照]
- 9.7 小児等
発育障害をきたすおそれがある。[8.1参照]
- 9.8 高齢者
大量又は長期にわたる使用に際しては特に注意すること。一般に生理機能が低下している。[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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 緑内障、後のう白内障(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により、後のう白内障、緑内障等の症状があらわれることがある。[8.1参照]

11.2 その他の副作用

種類	頻度	5%以上又は頻度不明	0.1~5%未満
皮膚の感染症 ^{注1)}		皮膚の真菌性(カンジダ症、白癬等)・細菌性(伝染性膿痂疹、毛のう炎、癩等)感染症、ウイルス感染症	
その他の皮膚症状		ステロイドざ瘡 ^{注2、3)} 、ステロイド酒さ・口囲皮膚炎(顔面の紅斑、丘疹、毛細血管拡張、痂皮、鱗屑) ^{注3)} 、そう痒、疼痛、ヒリヒリ感、潮紅、紫斑、水疱、び爛等の皮膚刺激症状や汗疹、過乾燥、亀裂、出血、貼付部位のムレや悪臭、皮疹の悪化	ステロイド皮膚(皮膚萎縮、毛細血管拡張)、魚鱗癬様皮膚変化、紫斑、多毛、色素脱失等 ^{注3)}
過敏症		皮膚の刺激感、発疹等	
下垂体・副腎皮質系機能		下垂体・副腎皮質系機能の抑制	

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

注2) 尋常性ざ瘡に似るが、白色の面皰が多発する傾向がある。
 注3) 長期連用により、生じることがある。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、副腎皮質ステロイドを含有しない薬剤に切り替えること。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

健康成人男子20人の腰背部に、デプロドンプロピオン酸エステルテープ剤4枚(デプロドンプロピオン酸エステルとして6mg)を12時間貼付し、デプロドンプロピオン酸エステルの血中濃度を経時的に測定したところ、投与約12時間後まで上昇し($C_{max}=111.3\text{pg/mL}$)、以後緩やかに消失した。また、このときの $AUC_{0-\infty}$ は $1688.5\text{pg}\cdot\text{h/mL}$ であった¹⁾。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

デプロドンプロピオン酸エステルテープ剤における一般臨床試験として386例、比較臨床試験として312例の総計698例について臨床試験を実施し、デプロドンプロピオン酸エステルテープ剤の有効性が認められている^{2,3)}。

疾患名	有効率(%) (かなり軽快以上/評価例数)
湿疹・皮膚炎群	90.7 (166/183例)
虫さされ	90.2 (37/41例)
痒疹群	79.6 (113/142例)
乾癬	94.0 (126/134例)
掌蹠膿疱症	92.9 (39/42例)
肥厚性癬痕・ケロイド	51.9 (28/54例)
扁平紅色苔癬	88.9 (32/36例)
慢性円板状エリテマトーデス	81.4 (35/43例)
環状円芽腫	91.3 (21/23例)
計	85.5 (597/698例)

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

副腎皮質ホルモンは標的細胞と接触すると、細胞膜を通過して細胞質の中に入り込む。細胞質の中には副腎皮質ホルモンに特異的な受容体蛋白が存在し、この蛋白と結合してホルモン・受容体複合体が形成される。この複合体がさらに活性化されて核膜を通過して核の中に入り、DNAと結合し、次いでRNAポリメラーゼがこのDNAに結合すると遺伝子情報がmRNAに転写され、特異的なmRNAが形成される。さらに特異的なmRNAは核の外に出て細胞質で特異的な蛋白が合成され、この蛋白が抗炎症作用を発現する^{4,5)}。

18.2 抗炎症作用

ラットのカラゲニン誘発浮腫及びアジュバント関節炎に対して、抗炎症反応を示した⁶⁾。

18.3 血管収縮作用

本剤及び対照薬としてエクラーテープ(デプロドンプロピオン酸エステルテープ剤)を直径約1.5cmの円形に切り、健康成人男子20人の背部に貼付し、血管収縮反応による皮膚蒼白化の程度を測定した。薬剤は4時間後に除去した。その結果、本剤とエクラーテープとの間に統計学的差はなく、生物学的に同等であると判断された⁷⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

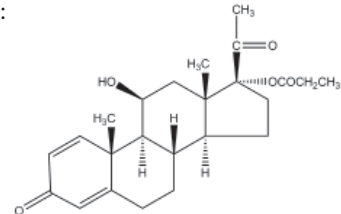
一般的名称: デプロドンプロピオン酸エステル
(Deprodone Propionate)

化学名: (+)-11 β ,17-dihydroxy-1,4-pregnadiene-3,20-dione
17-propionate

分子式: $C_{24}H_{32}O_5$

分子量: 400.51

構造式:



性状: 本品は白色～帯黄白色の結晶性の粉末で、においはないか、又はわずかに特異なおいがある。本品はクロロホルムに極めて溶けやすく、1,4-ジオキサンに溶けやすく、メタノール又はエタノール(95)にやや溶けやすく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

融点: 225～230℃

22. 包装

(7.5cm×10cm)×50

23. 主要文献

- 1) 久光製薬社内資料. Deprodone propionateテープ(DP-TN)の血中濃度.
- 2) 石橋康正 ほか: 臨床医薬. 1989; 5(9): 1947-66.
- 3) 石橋康正 ほか: 臨床医薬. 1989; 5(10): 2177-85.
- 4) 牧野荘平: 治療. 1985; 67(10): 1935-40.
- 5) 鹿取信: Therapeutic Research. 1986; 5(6): 955-61.
- 6) 久光製薬社内資料. 薬理作用に関する資料.
- 7) 久光製薬社内資料. 健康人を対象としたDeprodone propionateプラスターの皮膚血管収縮試験.

24. 文献請求先及び問い合わせ先

久光製薬株式会社 お客様相談室

〒135-6008 東京都江東区豊洲三丁目3番3号

TEL. 0120-381332

FAX. (03)5293-1723

受付時間/9:00-17:50(土日・祝日・会社休日を除く)

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

久光製薬株式会社

〒841-0017 鳥栖市田代大官町408番地

製造販売元



久光製薬株式会社

〒841-0017 鳥栖市田代大官町408番地

< 日本小児科学会 見解 >

スイッチOTC医薬品の候補成分に関する見解

1. 候補成分に関連する事項

候補成分 の情報	成分名 (一般名)	デプロドンプロピオン酸エステル (プラスター)
	効能・効果	湿疹・皮膚炎群 (進行性指掌角皮症、ピダール苔癬、日光皮膚炎、皮脂欠乏性湿疹、脂漏性皮膚炎を含む)、薬疹・中毒疹、虫さされ、痒疹群 [じん麻疹様苔癬、ストロフルス、結節性痒疹 (固定じん麻疹) を含む]、乾癬、紅皮症、紅斑症 (多形滲出性紅斑、ダリエ遠心性環状紅斑)、ジベル薔薇色糝糠疹、掌蹠膿疱症、特発性色素性紫斑 (マヨッキー紫斑、シャンバーグ病)、円形脱毛症

2. スイッチ OTC 化の妥当性に関連する事項

スイッチ OTC 化の 妥当性	<p>1. OTC とすることの妥当性について</p> <p>【薬剤特性の観点から】 要注意と思われる。</p> <p>【対象疾患の観点から】 要注意と思われる。</p> <p>【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 要注意と思われる。</p> <p>[上記と判断した根拠] 下記に示す。</p> <p>2. OTC とする際の留意事項、課題点について</p> <p>密封法 (プラスター) (ODT) の OTC として使用を考えた場合、小児では難しく小児には適応を考えたほうが良いと思われる。</p> <p>[上記と判断した根拠]</p> <ul style="list-style-type: none"> ・密封法 (ODT) の長期にわたる広範囲の使用により、副腎皮質ステロイド剤を全身的投与した場合と同様な症状があらわれることがある。 ・皮膚感染症も密封法 (ODT) の場合、起こりやすい。 ・使用の煩雑性もある。 <p>以上のことより、プラスターの OTC での小児適応は慎重に考えるべきである。</p> <p>3. その他</p>
備考	

＜日本皮膚科学会 見解＞

スイッチOTC医薬品の候補成分に関する見解

1. 候補成分に関連する事項

候補成分 の情報	成分名 (一般名)	デプロドンプロピオン酸エステル (テープ)
	効能・効果	しっしん、皮ふ炎、あせも、かぶれ、かゆみ、しもやけ、虫さされ、じんましん、きず・やけどのあとの皮ふのしこり・つっぱり (顔面を除く)

2. スイッチ OTC 化の妥当性に関連する事項

スイッチ OTC 化の 妥当性	<p>1. OTC とすることの妥当性について OTC とすることは妥当でないと考える。</p> <p>【薬剤特性の観点から】 本剤はステロイド外用薬の III 群 (ストロング) に相当する薬剤であるが、テープ剤であるため、効果が増強する点、不適切な用法により皮膚感染症などのリスクが増大する点などが懸念され、OTC 化は妥当でないと考える。</p> <p>【対象疾患の観点から】 ケロイドや肥厚性瘢痕の治療で OTC 化が認められたステロイド外用薬はなく、適正使用に関して懸念がある。</p> <p>【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 ステロイド外用薬のテープ剤に関しては、OTC 化された場合に適正使用を薬局でマネジメントできるか疑念がある。</p> <p>[上記と判断した根拠] ステロイド外用薬の III 群 (ストロング) に相当する薬剤であるが、テープ剤 (密封療法を行う剤型) であること。</p> <p>2. OTC とする際の留意事項、課題点について</p> <p>[上記と判断した根拠]</p> <p>3. その他</p>
備考	

< 日本臨床皮膚科医会 見解 >

スイッチOTC医薬品の候補成分に関する見解

1. 候補成分に関連する事項

候補成分 の情報	成分名 (一般名)	デプロドンプロピオン酸エステル テープ
	効能・効果	しっしん、皮ふ炎、あせも、かぶれ、かゆみ、しもやけ、虫さされ、じんましん

2. スイッチ OTC 化の妥当性に関連する事項

スイッチ OTC 化の 妥当性	<p>1. OTC とすることの妥当性について</p> <p>【薬剤特性の観点から】 OTC 化が妥当とは言い難い。</p> <p>【対象疾患の観点から】 あせも、かぶれ、かゆみ、しもやけ、虫さされ、じんましんは効能・効果から削除すべきです。</p> <p>【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 OTC 化が妥当とは言い難い。</p> <p>[上記と判断した根拠] ステロイドテープ剤は ODT (Occlusive Dressing Technique) 療法を行うための製剤であり、軟膏やクリームなどの吸収が悪い部位(掌蹠等)や、鱗屑(カサカサ)が顕著な局面、苔癬化(慢性湿疹・皮膚炎)した病変などに使用する。そのため皮膚科専門医の的確な診断・指導の下適切に使用しなければならず、あせも、かぶれ、かゆみ、しもやけ、虫さされ、じんましんには適さない。</p> <p>ステロイドテープ剤とは、皮膚が本来持っているバリア機能を低下させることにより、薬剤の浸透・吸収が高まり強い治療効果を発揮する。デプロドンプロピオン酸エステルが strong クラスであることを考えると、密封療法であるテープ剤の力価は、1~2 クラスアップ、つまり berry strong、strongest に相当するものと考えられ、高い治療効果がある一方で、皮膚のバリア機能を低下させるため、適切な病変・部位に使用しなければ皮膚症状の悪化や感染症のリスクが高くなってしまう可能性があるため十分な注意が必要である。</p> <p>2. OTC とする際の留意事項、課題点について 定期的に皮膚科を受診している患者に関して、急場しのぎとして</p>
-----------------------	---

	<p>販売することは仕方ないと思われるが、新規患者の皮膚疾患の診断が難しい薬剤師が、患者の訴えを鵜呑みにして販売することは大変危険である。かりに OTC 化された場合には、薬剤師による十分な説明（ステロイド外用剤の特徴、副作用等）及び、一定期間（数日～1 週間程度）使用しても効果が認められないときには、皮膚科受診を強く勧めることの徹底が必要である。</p> <p>〔上記と判断した根拠〕</p> <p>上述したように、ステロイドテープ剤を不適切（感染症等に対し）に使用し症状を悪化させることや、漫然と使用し続けることによる副作用の危惧がある以上 OTC 化には絶対反対である。</p> <p>3. その他</p> <p>最近、ドレニゾン®テープの販売中止が正式に決まり、ステロイド貼付剤がエクラープラスターのみとなった。ODT 療法の選択肢が無くなってしまふことを危惧している。</p>
備考	

スイッチ OTC 医薬品の候補成分の成分情報等

1. 候補成分に関連する事項

候補成分 の情報	成分名 (一般名)	モメタゾンフランカルボン酸エステル水和物
	スイッチ OTC とした際の 効能・効果	花粉による季節性アレルギーの次のような症状の緩和：鼻 づまり，鼻みず（鼻汁過多），くしゃみ
候補成分に 対する医療 用医薬品の 情報	販売名	ナゾネックス点鼻液 50 µg 56 噴霧用 ナゾネックス点鼻液 50 µg 112 噴霧用 (投与経路：点鼻) (剤形：定量噴霧式懸濁剤)
	効能・効果	アレルギー性鼻炎
	用法・用量	〈成人〉 通常、成人には、各鼻腔に 2 噴霧ずつ 1 日 1 回投与する（モ メタゾンフランカルボン酸エステルとして 1 日 200 µg）。 〈小児〉 通常、12 歳未満の小児には、各鼻腔に 1 噴霧ずつ 1 日 1 回 投与する（モメタゾンフランカルボン酸エステルとして 1 日 100 µg）。 通常、12 歳以上の小児には、各鼻腔に 2 噴霧ずつ 1 日 1 回 投与する（モメタゾンフランカルボン酸エステルとして 1 日 200 µg）。
	会社名	オルガノン株式会社

2. スイッチ OTC 化の妥当性評価にあたっての必要情報

医療用医薬品 の特徴・概要	承認年月日	2008年7月16日（成人：56噴霧用、112噴霧用） 2012年5月25日（小児用法・用量の追加）
	再審査期間	2008年7月16日～2016年7月15日（成人） 2012年5月25日～2016年7月15日（小児）
	再審査結果 通知日	2018年3月29日（成人・小児）
	再審査結果	医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第14条第2項第3号イからハまでのいずれにも該当しない。
	開発の経緯 （インタビュー フォーム等より）	<p>ナゾネックス点鼻液（以下、本剤）は米国シェリング・プラウ社（現 Merck Sharp & Dohme Corp., a subsidiary of Merck & Co., Inc., Kenilworth, N.J., U.S.A.）によって創製された副腎皮質ステロイドであるモメタゾンフランカルボン酸エステル水和物を含有する定量噴霧式点鼻液である。</p> <p>モメタゾンフランカルボン酸エステルは、非臨床試験においてグルココルチコイド受容体に対する親和性が高く、局所抗炎症作用を示した。また、複数の試験結果から本剤の絶対的バイオアベイラビリティは低いと考えられた。</p> <p>本剤は、季節性及び通年性アレルギー性鼻炎の治療を適応として、2018年7月現在、欧米をはじめとする世界約130の国及び地域で既に承認（販売名：Nasonex等）されている。そのうち、約120の国及び地域では小児適応を有している。国内の臨床試験においても、本剤1日1回投与にて、アレルギー性鼻炎に対する有効性及び安全性が確認され、成人については2008年7月に、「アレルギー性鼻炎」を効能・効果として承認された。</p> <p>2008年9月に本剤50µg 56噴霧用の国内販売が、2009年10月に112噴霧用の国内販売が開始された。</p> <p>2010年10月に旧製剤（有香製剤）から特異なおいを無くした現製剤（無香製剤）への処方変更が承認された。</p> <p>小児については国内臨床試験成績等から小児のアレルギー性鼻炎に対する有効性及び安全性が確認されたため、小児用量追加に係る承認事項一部変更承認申請が行われ、2012年5月に「アレルギー性鼻炎」を効能・効果として承認された。</p> <p>3,721例の特定使用成績調査（長期使用に関する調査）及び403例の特定使用成績調査（小児に関する調査）が実施され、「成人の用法・用量」及び「小児の用法・用量」の</p>

		<p>再審査申請が行われた結果、2018年3月29日に医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないとの再審査結果が得られた¹⁾。</p>																	
	<p>治療学的・製剤学的特性 (インタビューフォーム等より)</p>	<p><治療学的特性>¹⁾</p> <ol style="list-style-type: none"> 1. 成人及び小児アレルギー性鼻炎の適応を有する。 2. 通年性アレルギー性鼻炎に対する国内第Ⅱ相試験<成人>及び国内第Ⅲ相試験<小児>において、アレルギー性鼻炎の各鼻症状（くしゃみ、鼻汁、鼻閉、鼻内そう痒感）に対して、70%以上の改善効果を示した。 3. 1日1回使用することで、通年性アレルギー性鼻炎の各症状に対して、70%以上の改善効果を示した。 4. 重大な副作用として、アナフィラキシーが報告されている。（成人及び小児における承認時までの国内臨床試験ではアナフィラキシーの報告はないが、海外の市販後で報告されている。） <p><製剤学的特性>¹⁾</p> <p>1日1回投与の鼻噴霧用ステロイド薬（無香製剤）である。</p> <table border="1" data-bbox="609 1120 1382 1355"> <tr> <td rowspan="2">販売名</td> <td colspan="2">ナゾネックス点鼻液 50 µg</td> </tr> <tr> <td>56 噴霧用</td> <td>112 噴霧用</td> </tr> <tr> <td>有効成分</td> <td colspan="2">モメタゾンフランカルボン酸 エステル水和物</td> </tr> <tr> <td>1 容器の噴霧回数</td> <td>56 回</td> <td>112 回</td> </tr> <tr> <td>剤型</td> <td colspan="2">定量噴霧式懸濁剤</td> </tr> <tr> <td>内容物の性状</td> <td colspan="2">白色の懸濁液</td> </tr> </table>	販売名	ナゾネックス点鼻液 50 µg		56 噴霧用	112 噴霧用	有効成分	モメタゾンフランカルボン酸 エステル水和物		1 容器の噴霧回数	56 回	112 回	剤型	定量噴霧式懸濁剤		内容物の性状	白色の懸濁液	
販売名	ナゾネックス点鼻液 50 µg																		
	56 噴霧用	112 噴霧用																	
有効成分	モメタゾンフランカルボン酸 エステル水和物																		
1 容器の噴霧回数	56 回	112 回																	
剤型	定量噴霧式懸濁剤																		
内容物の性状	白色の懸濁液																		
	<p>臨床での使われ方</p>	<p>本剤はアレルギー性鼻炎の治療に使用されている。</p> <p>本邦で使用できる鼻噴霧用ステロイド薬は、ベクロメタゾンプロピオン酸エステル、フルチカゾンプロピオン酸エステル、モメタゾンフランカルボン酸エステル水和物、フルチカゾンプランカルボン酸エステル、デキサメタゾンシペシル酸エステルである。いずれも微量で局所効果が強く、吸収されにくく、吸収されてもすぐに分解されるため、ベクロメタゾンプロピオン酸エステルを除き、1年以上の連用でも、全身的副作用が少なく、効果は確実である²⁾。</p> <p>同種同効品も含めて、本剤は効果発現が早く、約1～2日で効果がみられる。長期連用により改善効果が上がる。重症例にも効果があり著効例も多い。抗ヒスタミン薬に抵抗する鼻閉にも有効で、点鼻用血管収縮剤の離脱にも有効である。効果発現が早いので、これまでの初期療法には必要</p>																	

		ないと考えられていたが、 minimum persistent inflammation の考え方から初期の炎症から使用することで飛散ピーク時の症状増悪を抑制できることが明らかとなり、初期療法にも用いられる ²⁾ 。			
安全性に関する情報 (添付文書より)	<副作用> ³⁾				
	<table border="1"> <tr> <td>重大な副作用</td> <td>高頻度(5%以上)の副作用</td> </tr> <tr> <td>アナフィラキシー(頻度不明)</td> <td>該当なし</td> </tr> </table>	重大な副作用	高頻度(5%以上)の副作用	アナフィラキシー(頻度不明)	該当なし
重大な副作用	高頻度(5%以上)の副作用				
アナフィラキシー(頻度不明)	該当なし				
禁忌・注意事項(添付文書より)	<p><禁忌>(次の患者には投与しないこと)³⁾</p> <ol style="list-style-type: none"> 有効な抗菌剤の存在しない感染症、全身性の真菌症の患者〔症状を増悪させるおそれがある。〕 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者 <p><重要な基本的注意>³⁾</p> <ol style="list-style-type: none"> 鼻・咽喉頭真菌症が発現した場合、本剤の投与を中止し、適切な処置を行うこと。 全身性ステロイド剤と比較し可能性は低いですが、点鼻ステロイド剤の投与により全身性の作用(クッシング症候群、クッシング様症状、副腎皮質機能抑制、小児の成長遅延、骨密度の低下、白内障、緑内障を含む)が発現する可能性がある。特に長期間、大量投与の場合には定期的に検査を行い、全身性の作用が認められた場合には適切な処置を行うこと。 通年性アレルギー性鼻炎の患者において長期に使用する場合、症状の改善状態が持続するようであれば、本剤の減量につとめること。 本剤の投与が数ヵ月以上にわたる場合は、鼻中隔潰瘍等の鼻所見に注意すること。 季節性の疾患に対しては、好発期を考えて、その直前から治療を開始し、抗原との接触がなくなるまで続けることが望ましい。 <p><特定の背景を有する患者に関する注意>³⁾</p> <ol style="list-style-type: none"> 合併症・既往歴等のある患者 <ol style="list-style-type: none"> 結核性疾患、未治療の感染症(有効な抗菌剤の存在しない感染症、全身性の真菌症を除く)及び眼の単純ヘルペス患者 症状を増悪させるおそれがある。 反復性鼻出血の患者 				

		<p>出血を増悪させるおそれがある。</p> <p>1.3 鼻中隔潰瘍のある患者、鼻の手術を受けた患者、あるいは鼻外傷のある患者 患部が治癒するまで本剤を投与しないこと。ステロイド剤は創傷治癒を抑制する作用がある。</p> <p>1.4 ステロイド剤の全身投与から局所投与に切り替えた患者 副腎皮質機能不全又は離脱症状（関節あるいは筋肉の疼痛、倦怠感及びうつ等）の徴候、症状があらわれた場合には、適切な処置を行うこと。また、全身性ステロイド剤の減量中並びに離脱後も副腎皮質機能検査を行い、外傷、手術、重症感染症等の侵襲には十分に注意を払うこと。</p> <p>2. 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投与すること。経皮又は経口投与による動物実験（ラット、ウサギ）で催奇形性作用が報告されている。</p> <p>3. 授乳婦 治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。</p> <p>4. 小児等</p> <p>4.1 長期間投与する場合には、身長等の経過の観察を十分行うこと。また、使用にあたっては、使用法を正しく指導すること。全身性ステロイド剤と比較し可能性は低いですが、点鼻ステロイド剤を特に長期間、大量に投与する場合に小児の成長遅延をきたすおそれがある。</p> <p>4.2 国内において、3歳未満の幼児、乳児、新生児及び低出生体重児を対象とした臨床試験は実施していない。</p> <p>5. 高齢者 患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。一般に生理機能が低下している。</p>
	習慣性、依存性、耽溺性について	該当なし
	毒薬、劇薬等への該当性について	該当なし

<p>推定使用者数等</p>	<p>鼻がつまる・鼻汁が出る：621.6万人（2019年）⁴⁾ アレルギー性鼻炎の有病率：49.2%（2019年）²⁾ 花粉症の有病率：42.5%（2019年）²⁾</p> <p>【参考：一般用医薬品市場 販売金額・販売個数】 鼻炎用点鼻薬 一般用医薬品市場⁵⁾ 販売金額：106.7億円、販売個数（年間）：1,435.5万個</p>
<p>同種同効薬・類薬のスイッチOTC化の状況について</p>	<p>鼻噴霧用ステロイド薬としてスイッチOTC化された成分は、ベクロメタゾンプロピオン酸エステル（製品名：ナザールAR<季節性アレルギー専用>2010年11月承認、他）、フルニソリド（製品名：ロートアルガードクリアノーズ季節性アレルギー専用 2018年10月承認）、フルチカゾンプロピオン酸エステル（製品名：フルナーゼ点鼻薬<季節性アレルギー専用>2019年4月承認）である。</p> <p>フルチカゾンプロピオン酸エステルは平成29年7月26日開催の第2回医療用から要指導・一般用への転用に関する評価検討会議（以下、検討会議）で議論され、同年11月15日開催の第3回検討会議で「可」とされた。また、令和4年1月14日に開催された第18回検討会議では、フルチカゾンプランカルボン酸エステルについて議論された。</p>
<p>OTC化された際の使われ方</p>	<p>鼻噴霧用ステロイド薬は効果発現が早く、全身的副作用が少ないなどの特徴を有するため、一般用医薬品の鼻噴霧用ステロイド薬が季節性アレルギー性鼻炎の治療に使用されている。</p> <p>既承認の鼻噴霧用ステロイド薬では、1日2回が最も少ない用法であるが、本剤は1日1回の用法であることから、持ち歩く必要がなくなるなどの利便性が向上する。本剤のスイッチOTC化により、季節性アレルギー性鼻炎に対する新たなセルフメディケーションの選択肢を提供するとともに、国民のQOL及び服薬コンプライアンスの向上が期待できる。</p>
<p>関連するガイドライン等</p>	<p>鼻アレルギー診療ガイドライン 2020年版（改訂第9版）</p>
<p>その他</p>	<p>【鼻噴霧用ステロイド薬とガイドライン】</p> <p>鼻アレルギー診療ガイドラインでは、皮膚科領域のようなステロイドの強さによる使い分けはなく、強さのランクによる区分もない。鼻噴霧用ステロイド薬は、いずれも微量で局所効果が強く、吸収されにくく、吸収されてもすぐに分解されるため、連用しても全身的副作用は少なく、効果は確実であるとされている。鼻噴霧用ステロイド薬はスギ花粉症に対する初期治療として、くしゃみ・鼻漏型、鼻閉型のいずれにも推奨されている（推奨度A）。重症度によるステロイドの使い分けがない点はアトピー性皮膚炎診療ガイドラインと異なっており、鼻炎では重症度が高くなるに伴い、作用機序が異なる他の薬剤との併用が推奨されている²⁾。</p>

【小児適用】

第 18 回検討会議では、フルチカゾンフランカルボン酸エステルの小児に対する適用について議論された。モメタゾンフランカルボン酸エステル水和物の医療用医薬品は小児にも適用可能であるため、スイッチ OTC 化された際の小児に対する適用については議論の余地がある。

3. 候補成分の欧米等での承認状況

欧米等6か国での承認状況	一般用医薬品としての承認状況		
	<input checked="" type="checkbox"/> 英国 <input type="checkbox"/> 仏国 <input checked="" type="checkbox"/> 独国 <input checked="" type="checkbox"/> 米国 <input checked="" type="checkbox"/> 加国 <input checked="" type="checkbox"/> 豪州		
	〔欧米等6か国での承認内容〕		
		欧米各国での承認内容（関連する箇所を下線）	
	英国	販売名（企業名）	Nasonex Allergy Control 0.05% Nasal Spray (Bayer PLC)
		効能・効果	成人の季節性アレルギー性鼻炎及び通年性アレルギー性鼻炎の症状の治療。
		用法・用量	[18歳以上の成人（高齢者を含む）] 1日1回、各鼻腔に2噴霧ずつ投与する。 症状に応じて、各鼻腔に1噴霧ずつに減量可。
		備考	—
	仏国	販売名（企業名）	承認なし
		効能・効果	—
		用法・用量	—
		備考	—
	独国	販売名（企業名）	MomeAllerg NASENSPRAY (GALENpharma GmbH)
		効能・効果	花粉症によるアレルギー症状の緩和： <u>くしゃみ、かゆみ、鼻づまり、鼻水</u>
		用法・用量	[成人] 1日1回、各鼻腔に2噴霧ずつ投与する。 症状に応じて、各鼻腔に1噴霧ずつに減量可。
		備考	—
	米国	販売名（企業名）	NASONEX 24HR ALLERGY (PERRIGO PHARMA INTL)
		効能・効果	花粉症又は上気道アレルギーの症状の一時的な緩和： <u>鼻づまり・鼻水・くしゃみ・鼻のかゆみ</u>
		用法・用量	[成人及び12歳以上の小児] 鼻を軽くすすりながら1日1回、各鼻腔に2噴霧ずつ投与する。 [2～11歳の小児] 1日1回、各鼻腔に1噴霧ずつ投与する。
		備考	—
	加国	販売名（企業名）	NASONEX ALLERGY AND CONGESTION (MERCK CANADA INC)
		効能・効果	成人及び12歳以上の小児の <u>季節性アレルギー性鼻炎</u> または通年性アレルギー性鼻炎
		用法・用量	[成人（高齢者を含む）及び12才以上の小児] 1日1回、各鼻腔に2噴霧ずつ投与する。 症状に応じて、各鼻腔に1噴霧ずつに減量可。
		備考	—
豪州	販売名（企業名）	NASONEX ALLERGY mometasone furoate 50 micrograms/spray (Bayer Australia Ltd)	
	効能・効果	花粉症やほこり、ペット、カビなどによるアレルギー症状の治療及び予防。	

	花粉症によるアレルギー症状の緩和： 鼻づまり、鼻水、くしゃみ、鼻のかゆみ
用法・用量	[成人及び12歳以上の小児] 1日1回、各鼻腔に2噴霧ずつ投与する。 症状に応じて、各鼻腔に1噴霧ずつに減量可。
備考	—

医療用医薬品としての承認状況

英国 仏国 独国 米国 加国 豪州

[備考]

欧米各国での承認内容	
英国	販売名（企業名） Nasonex 50 micrograms/actuation Nasal Spray, Suspension (Organon Pharma (UK) Limited)
	効能・効果 ・成人及び3歳以上の小児の <u>季節性アレルギー性鼻炎</u> 及び <u>通年性鼻炎</u> の症状の治療 ・18歳以上の成人における鼻茸の治療
	用法・用量 <季節性及び通年性アレルギー性鼻炎> ・成人（高齢者を含む）及び12歳以上の小児：通常、各鼻腔に2噴霧ずつ（50 µg/回）1日1回投与（総投与量：200 µg）が推奨される。症状がコントロールできた場合には、各鼻腔に1噴霧ずつ（総投与量：100 µg）に減量しても効果が維持できる。症状が十分にコントロールできない場合には、各鼻腔に最大4噴霧ずつ1日1回投与（総投与量：400 µg）に増量することができる。 ・3～11歳の小児：通常、各鼻腔に1噴霧ずつ（50 µg/回）1日1回投与（総投与量：100 µg）が推奨される。 <鼻茸> ・通常、鼻茸に対する開始用量は、各鼻腔に2噴霧ずつ（50 µg/回）1日1回投与（1日総投与量：200 µg）が推奨される。治療開始5～6週間後、症状が十分にコントロールできない場合には、各鼻腔に2噴霧ずつ1日2回投与（1日総投与量：400 µg）に増量することができる。
	備考 —
仏国	販売名（企業名） NASONEX 50 microgrammes/dose, suspension pour pulvérisation nasale (ORGANON France)
	効能・効果 ・成人及び3歳以上の小児における <u>季節性アレルギー性鼻炎</u> 及び <u>通年性アレルギー性鼻炎</u> ・18歳以上の成人の鼻茸の対症療法
	用法・用量 <季節性及び通年性アレルギー性鼻炎> ・成人及び12歳以上の小児：通常の推奨用量は、各鼻腔に1日1回2噴霧（50 µg/回）（1日総投与量：200 µg）。症状がコ

			<p>ントロールできた場合、各鼻腔に1回噴霧ずつに減量しても効果が得られる場合もある。症状が十分にコントロールできない場合は、投与量を1日1回各鼻腔に4回ずつに増量することができる（1日総投与量：400 µg）。</p> <ul style="list-style-type: none"> 3～11歳の小児：通常の推奨用量は、1日1回各鼻腔に1回噴霧（50 µg/回）（1日総投与量：100 µg）。 <p><鼻茸></p> <ul style="list-style-type: none"> 通常、鼻茸には、1日1回、各鼻腔に2噴霧（50 µg/回）（1日総投与量：200 µg）から開始することが推奨されている。5～6週間経過しても症状が十分にコントロールできない場合は、1日2回、各鼻腔に2噴霧（1日総投与量：400 µg）まで増量することができる。
		備考	—
独国	販売名（企業名）	Nasonex 50 µg pro Sprühstoß Nasenspray, Suspension (Organon Healthcare GmbH)	
	効能・効果	<ul style="list-style-type: none"> 成人及び3歳以上の小児における<u>季節性アレルギー性鼻炎</u>及び<u>通年性アレルギー性鼻炎</u> 18歳以上の成人における鼻茸の対症療法 	
	用法・用量	<p><季節性及び通年性アレルギー性鼻炎></p> <ul style="list-style-type: none"> 成人及び12歳以上の小児：通常、各鼻腔に2噴霧ずつ1日1回投与する。1日最大使用量は各鼻腔に4噴霧ずつ1日1回投与である。 3～11歳の小児：通常の推奨用量は、1日1回各鼻腔に1回噴霧。 <p><鼻茸></p> <ul style="list-style-type: none"> 18歳以上の成人での使用：通常、鼻茸には、1日1回、各鼻腔に2噴霧から開始することが推奨されている。5～6週間経過しても症状が十分に改善できない場合は、1日2回、各鼻腔に2噴霧まで増量することができる。 	
		備考	—
米国	販売名（企業名）	NASONEX (mometasone furoate monohydrate) Nasal Spray 50 mcg (Organon Global Inc.)	
	効能・効果	<ul style="list-style-type: none"> アレルギー性鼻炎の鼻症状の治療 <u>季節性アレルギー性鼻炎の鼻閉の治療</u> 季節性アレルギー性鼻炎の予防 鼻茸の治療 	
	用法・用量	<p>鼻腔内噴霧用としてのみ使用すること。</p> <p><アレルギー性鼻炎の鼻症状の治療></p> <ul style="list-style-type: none"> 成人及び青年（12歳以上）：各鼻腔に2噴霧ずつ1日1回投与する。 小児（2～11歳）：各鼻腔に1噴霧ずつ1日1回投与する。 <p><季節性アレルギー性鼻炎の鼻閉の治療></p> <ul style="list-style-type: none"> 成人及び青年（12歳以上）：<u>各鼻腔に2噴霧ずつ1日1回投与する。</u> 	

		<ul style="list-style-type: none"> ・小児（2～11歳）：各鼻腔に1噴霧ずつ1日1回投与する。 <p><季節性アレルギー鼻炎の予防></p> <ul style="list-style-type: none"> ・成人及び青年（12歳以上）：各鼻腔に2噴霧ずつ1日1回投与する。 <p><鼻茸の治療></p> <ul style="list-style-type: none"> ・成人（18歳以上）：各鼻腔に2噴霧ずつ1日2回投与する。一部の患者では各鼻腔に2噴霧ずつ1日1回投与することで効果が見られる場合もある。
	備考	—
加国	販売名（企業名）	NASONEX mometasone furoate monohydrate aqueous nasal spray (Organon Canada Inc.)
	効能・効果	<ul style="list-style-type: none"> ・成人、青年及び3～11歳の小児の季節性アレルギー鼻炎及び通年性アレルギー鼻炎の症状の治療 ・成人及び12歳以上の小児における細菌感染症の兆候又は症状を伴う急性鼻副鼻腔炎に対する抗生物質療法の補助療法 ・成人及び12歳以上の小児における細菌感染症の兆候又は症状を伴わない軽度～中等度の合併症のない急性鼻副鼻腔炎の症状の治療 ・18歳以上の成人患者の鼻茸の治療
	用法・用量	<p><季節性又は通年性アレルギー鼻炎></p> <ul style="list-style-type: none"> ・成人（高齢者を含む）及び12歳以上の小児：<u>通常、各鼻腔に2噴霧ずつ（50 µg/回）1日1回投与が推奨される（1日総投与量：200 µg）</u>。症状がコントロールできた場合には、各鼻腔に1噴霧ずつ（1日総投与量：100 µg）に減量しても効果が維持できる。症状が十分にコントロールできない場合には、各鼻腔に4噴霧ずつ1日1回投与（1日総投与量：400 µg）に増量することができる。 ・3～11歳の小児：通常、各鼻腔に1噴霧ずつ（50 µg/回）1日1回投与が推奨される（1日総投与量：100 µg）。 <p><急性鼻副鼻腔炎に対する抗生物質療法の補助療法></p> <ul style="list-style-type: none"> ・成人（高齢者を含む）及び12歳以上の小児：<u>通常、各鼻腔に2噴霧ずつ（50 µg/回）1日2回投与が推奨される（1日総投与量：400 µg）</u>。症状が十分にコントロールできない場合には、各鼻腔に4噴霧ずつ（50 µg/回）1日2回投与（1日総投与量：800 µg）に増量することができる。 <p><軽度～中等度の合併症を伴わない急性鼻副鼻腔炎の治療></p> <ul style="list-style-type: none"> ・成人（高齢者を含む）及び12歳以上の小児：<u>通常、各鼻腔に2噴霧ずつ（50 µg/回）1日2回投与が推奨される（1日総投与量：400 µg）</u>。 <p><鼻茸の治療></p> <ul style="list-style-type: none"> ・成人（高齢者を含む）及び18歳以上の青年：通常、各鼻腔に2噴霧ずつ（50 µg/

		回) 1日2回投与が推奨される(1日総投与量:400 µg)。症状がコントロールできた場合には、各鼻腔に2噴霧ずつ(50 µg/回)1日1回投与(1日総投与量:200 µg)に減量しても効果が維持できる。
	備考	—
豪州	販売名(企業名)	NASONEX AQUEOUS NASAL SPRAY 0.05% (Organon Pharma Pty Ltd)
	効能・効果	<ul style="list-style-type: none"> ・成人、青年及び3~11歳の小児の季節性アレルギー性鼻炎及び通年性アレルギー性鼻炎の症状の治療及び季節性アレルギー性鼻炎の予防 ・18歳以上の成人患者の鼻茸の治療 ・成人及び12歳以上の患者における重度の細菌感染の徴候や症状のない急性鼻副鼻腔炎の症状の治療
	用法・用量	<p><アレルギー性鼻炎></p> <ul style="list-style-type: none"> ・中等度から重度の季節性アレルギー鼻炎の既往がある患者は、予測される花粉の季節の開始の2~4週間前から予防的に投与することが推奨される。 ・成人(高齢者を含む)及び12歳以上の小児:通常、予防及び治療には、<u>各鼻腔に2噴霧ずつ(50 µg/回)1日1回投与が推奨される(1日総投与量:200 µg)</u>。症状がコントロールできた場合には、各鼻腔に1噴霧ずつ(1日総投与量:100 µg)に減量しても効果が維持できる。 ・3~11歳の小児:通常、各鼻腔に1噴霧ずつ(50 µg/回)1日1回投与が推奨される(1日総投与量:100 µg)。 <p><鼻茸></p> <ul style="list-style-type: none"> ・成人(高齢者を含む)及び18歳以上の青年:通常、各鼻腔に2噴霧ずつ(50 µg/回)1日1回投与が推奨される(1日総投与量:200 µg)。症状が十分にコントロールできない場合には、各鼻腔に2噴霧ずつ1日2回投与(1日総投与量:400 µg)に増量することができる。 <p><急性鼻副鼻腔炎></p> <ul style="list-style-type: none"> ・通常、各鼻腔に2噴霧ずつ(50 µg/回)1日2回投与が推奨される(1日総投与量:400 µg)。
	備考	—
<p>食品、サプリメント等としての販売状況</p> <p><input type="checkbox"/> 英国 <input type="checkbox"/> 仏国 <input type="checkbox"/> 独国 <input type="checkbox"/> 米国 <input type="checkbox"/> 加国 <input type="checkbox"/> 豪州</p> <p>[備考]</p> <p>なし</p>		

参考資料一覧

【検索方法】

文献検索は実施していない。

関連するガイドライン及び医療用医薬品のインタビューフォームや添付文書等を参考資料とした。

- 1) ナゾネックス点鼻液 50 µg 56 噴霧用／ナゾネックス点鼻液 50 µg 112 噴霧用 医薬品インタビューフォーム 2023 年 1 月改訂（第 12 版）
- 2) 鼻アレルギー診療ガイドライン 2020 年版（改訂第 9 版）
- 3) ナゾネックス点鼻液 50 µg 56 噴霧用／ナゾネックス点鼻液 50 µg 112 噴霧用 添付文書 2023 年 1 月改訂（第 3 版）
- 4) 厚生労働省 2019 年 国民生活基礎調査の概況
- 5) (株)インテージヘルスケア 2021 年 11 月～2022 年 10 月

<海外添付文書>

英国 Nasonex Allergy Control 0.05% Nasal Spray (OTC)

https://assets.publishing.service.gov.uk/government/uploads/system/uploads/attachment_data/file/571059/Nasonex_Allergy_Control_public_reclassification_report_for_consultation_final1.pdf?msclkid=69d8c543b18a11ecb01c675a0dd1b920

独国 MomeAllerg Nasenspray (OTC)

https://www.medikamente-per-klick.de/images/ecommerce/12/40/12409645_2019-11_de_o.pdf

米国 NASONEX 24HR ALLERGY (OTC)

https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2022/215712Orig1s0001bl.pdf

加国 NASONEX ALLERGY AND CONGESTION (OTC)

https://pdf.hres.ca/dpd_pm/00031606.PDF

豪州 NASONEX ALLERGY mometasone furoate 50 micrograms/spray (OTC)

<https://www.nasonexallergy.com.au/products/nasonex-allergy-nasal-spray-140-sprays>

英国 Nasonex 50 micrograms/actuation Nasal Spray, Suspension (Rx)

<https://www.medicines.org.uk/emc/product/1663/smpc>

仏国 NASONEX 50 microgrammes/dose, suspension pour pulvérisation nasale (Rx)

<http://agence->

[prd.anism.sante.fr/php/ecodex/frames.php?specid=63566855&typedoc=R&ref=R0370212.htm](http://agence-prd.anism.sante.fr/php/ecodex/frames.php?specid=63566855&typedoc=R&ref=R0370212.htm)

独国 Nasonex 50 µg pro Sprühstoß Nasenspray, Suspension (Rx)

<https://www.patienteninfo-service.de/a-z-liste/n/nasonexR-50-ug-pro-spruehstoss-nasenspray-suspension>

米国 NASONEX (mometasone furoate monohydrate) Nasal Spray (Rx)

https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2010/020762s0381bl.pdf

加国 NASONEX mometasone furoate monohydrate aqueous nasal spray (Rx)

https://pdf.hres.ca/dpd_pm/00061018.PDF

豪州 NASONEX AQUEOUS NASAL SPRAY 0.05% (Rx)

<https://www.ebs.tga.gov.au/ebs/picmi/picmirepository.nsf/pdf?OpenAgent&id=CP-2010-PI-06105-3&d=20220323172310101>

	56噴霧用	112噴霧用
承認番号	22000AMX01710000	22000AMX01711000
販売開始	2008年9月	2009年10月

定量噴霧式アレルギー性鼻炎治療剤

貯法：室温保存
有効期間：3年

モメタゾンフランカルボン酸エステル水和物点鼻液

ナゾネックス® 点鼻液50 μ g56噴霧用 ナゾネックス® 点鼻液50 μ g112噴霧用

NASONEX® Nasal 50 μ g 56sprays, 112 sprays

処方箋医薬品：注意—医師等の処方箋
により使用すること

ORGANON

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 有効な抗菌剤の存在しない感染症、全身性の真菌症の患者【症状を増悪させるおそれがある。】
- 2.2 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	ナゾネックス® 点鼻液50 μ g 56噴霧用	ナゾネックス® 点鼻液50 μ g 112噴霧用
有効成分	モメタゾンフランカルボン酸エステル水和物	
分量 ^{注)}	1g中	0.5mg
	1回噴霧中	50 μ g
1容器の噴霧回数	56回	112回
添加剤	ベンザルコニウム塩化物液、ポリソルベート80、結晶セルロース・カルメロースナトリウム、濃グリセリン、pH調節剤	

注) モメタゾンフランカルボン酸エステルとして

3.2 製剤の性状

販売名	ナゾネックス® 点鼻液50 μ g 56噴霧用	ナゾネックス® 点鼻液50 μ g 112噴霧用
剤型	定量噴霧式懸濁液	
性状	白色の懸濁液	

4. 効能又は効果

アレルギー性鼻炎

6. 用法及び用量

〈成人〉

通常、成人には、各鼻腔に2噴霧ずつ1日1回投与する（モメタゾンフランカルボン酸エステルとして1日200 μ g）。

〈小児〉

通常、12歳未満の小児には、各鼻腔に1噴霧ずつ1日1回投与する（モメタゾンフランカルボン酸エステルとして1日100 μ g）。
通常、12歳以上の小児には、各鼻腔に2噴霧ずつ1日1回投与する（モメタゾンフランカルボン酸エステルとして1日200 μ g）。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 鼻・咽喉頭真菌症が発現した場合、本剤の投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 8.2 全身性ステロイド剤と比較し可能性は低いですが、点鼻ステロイド剤の投与により全身性の作用（クッシング症候群、クッシング様症状、副腎皮質機能抑制、小児の成長遅延、骨密度の低下、白内障、緑内障を含む）が発現する可能性があります。特に長期間、大量投与の場合には定期的に検査を行い、全身性の作用が認められた場合には適切な処置を行うこと。
- 8.3 通年性アレルギー性鼻炎の患者において長期に使用する場合、症状の改善状態が持続するようであれば、本剤の減量につとめること。
- 8.4 本剤の投与が数ヶ月以上にわたる場合は、鼻中隔潰瘍等の鼻所見に注意すること。

8.5 季節性の疾患に対しては、好発期を考慮して、その直前から治療を開始し、抗原との接触がなくなるまで続けることが望ましい。

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 結核性疾患、未治療の感染症（有効な抗菌剤の存在しない感染症、全身性の真菌症を除く）及び眼の単純ヘルペス患者症状を増悪させるおそれがある。

9.1.2 反復性鼻出血の患者

出血を増悪させるおそれがある。

9.1.3 鼻中隔潰瘍のある患者、鼻の手術を受けた患者、あるいは鼻外傷のある患者

患部が治癒するまで本剤を投与しないこと。ステロイド剤は創傷治癒を抑制する作用がある。

9.1.4 ステロイド剤の全身投与から局所投与に切り替えた患者

副腎皮質機能不全又は離脱症状（関節あるいは筋肉の疼痛、倦怠感及びうつ等）の徴候、症状があらわれた場合には、適切な処置を行うこと。また、全身性ステロイド剤の減量中並びに離脱後も副腎皮質機能検査を行い、外傷、手術、重症感染症等の侵襲には十分に注意を払うこと。

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投与すること。経皮又は経口投与による動物実験（ラット、ウサギ）で催奇形性作用が報告されている¹⁾。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

9.7 小児等

9.7.1 長期間投与する場合には、身長等の経過の観察を十分行うこと。また、使用にあたっては、使用法を正しく指導すること。全身性ステロイド剤と比較し可能性は低いですが、点鼻ステロイド剤を特に長期間、大量に投与する場合に小児の成長遅延をきたすおそれがある。

9.7.2 国内において、3歳未満の幼児、乳児、新生児及び低出生体重児を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。一般に生理機能が低下している。

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 アナフィラキシー（頻度不明）

アナフィラキシー（呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、じん麻疹等）があらわれることがある。

11.2 その他の副作用

	1～5%未満	1%未満	頻度不明
過敏症		じん麻疹等の発疹	
鼻腔	鼻症状（刺激感 ^注 ）、そう痒感、乾燥感 ^注 、疼痛、発赤、不快感 ^注 等）、真菌検査陽性	鼻出血 ^注 、鼻漏、鼻閉、くしゃみ、嗅覚障害	鼻中隔穿孔、鼻潰瘍、鼻症状（灼熱感）
口腔並びに呼吸器	咽喉頭症状（刺激感、疼痛、不快感、乾燥等）	咳嗽、上気道炎	
肝臓		肝機能障害、ALT上昇 ^注 、AST上昇 ^注 、ビリルビン上昇、Al-P上昇、ウロビリリン尿	
血液		好中球増多、好酸球増多、単球増多、白血球減少、白血球増多、白血球分画異常、赤血球減少 ^注 、ヘモグロビン減少 ^注 、ヘマトクリット減少 ^注 、リンパ球減少、血小板減少 ^注 、カリウム上昇	
精神神経系		頭痛、倦怠感	
眼			眼圧亢進、霧視、中心性漿液性網脈絡膜症
その他	コルチゾール減少 ^注	蛋白尿 ^注 、尿糖、BUN上昇、コルチゾール上昇	味覚障害

注) 小児及び成人の臨床試験で認められた副作用；他の発現頻度のある副作用はすべて成人のみで認められた。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

患者には添付の携帯袋及び使用説明書を渡し、以下の使用方法を指導すること。

- ・鼻腔内噴霧用のみ使用すること。
- ・本剤の使用前に容器を上下によく振ること。
- ・本剤の初回使用時のみ空打ちを行い（10回程度）、液が完全に霧状になることを確認し使用すること。
- ・噴霧口を針やピンなどで突かないこと。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 反復投与

健康成人男性（日本人各群6例）に本剤200 μ g又は400 μ gを1日2回^注7日間反復鼻腔内投与した際、血漿中モメタゾンフランカルボン酸エステル濃度は200 μ g 1日2回投与群の1例において初回投与後30分に定量下限をわずかに上回る値（57.2 pg/mL）が認められたが、他の被験者は全測定時点で定量下限未満（<50pg/mL）であった²⁾。

16.4 代謝

ヒト肝ミクロソームを用いた*in vitro*試験では広範な代謝が認められ、生成する複数の代謝物の1つとして6 β 水酸化体が確認された³⁾。6 β 水酸化体の生成に関与するP450分子種はCYP3A4であることが確認されている⁴⁾。

注) 本剤の成人の承認用法・用量は、「通常、成人には、各鼻腔に2噴霧ずつ1日1回投与する（モメタゾンフランカルボン酸エステルとして1日200 μ g）」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 国内第Ⅱ相用法用量設定試験（成人）

通年性アレルギー性鼻炎を対象とした第Ⅱ相試験⁵⁾において、本剤あるいはプラセボを2週間投与した。4鼻症状スコア^{注1)}の投与前値及び投与終了時の変化量を下表に示した。本剤はプラセボと比較していずれの投与量でも有意に優れていた（ $p < 0.01$ ）。

注1) くしゃみ発作、鼻汁、鼻閉、鼻内そう痒感の程度をそれぞれ0～3点にスコア化して合計したスコア（最大スコアは12点）。

表1 第Ⅱ相試験における投与2週後又は中止時の4鼻症状スコア

投与群 ^{注2)}	n	平均値（標準誤差）	
		投与前	変化量
100 μ g/日（分1）	75	7.3 (0.2)	-2.7 (0.3)
200 μ g/日（分1）	74	8.1 (0.2)	-4.3 (0.3)
400 μ g/日（分1）	79	7.9 (0.2)	-4.2 (0.2)
200 μ g/日（分2）	75	7.3 (0.2)	-4.0 (0.2)
400 μ g/日（分2）	75	7.7 (0.2)	-4.1 (0.3)
プラセボ	77	7.6 (0.2)	-1.7 (0.2)

注2) 本剤の成人の承認用法・用量は、「通常、成人には、各鼻腔に2噴霧ずつ1日1回投与する（モメタゾンフランカルボン酸エステルとして1日200 μ g）」である。

本剤200 μ g/日（分1）における副作用は、74例中15例（20.3%）に認められた。主なものは、咽喉頭疼痛3例（4.1%）であった。

17.1.2 国内第Ⅲ相比較試験（成人）

通年性アレルギー性鼻炎を対象とした第Ⅲ相試験⁶⁾において、本剤200 μ g/日（分1）、フルチカゾンプロピオン酸エステル（FP）200 μ g/日（分2）あるいはプラセボを2週間投与した。4鼻症状スコア^{注1)}の投与前値及び投与終了時の変化量を下表に示した。

表2 第Ⅲ相試験における投与2週後又は中止時の4鼻症状スコア

投与群 ^{注3)}	n	調整平均値（標準誤差）		比較 ^{注4)}
		投与前	変化量	
本剤200 μ g/日（分1）	143	8.3 (0.1)	-3.9 (0.2)	本剤vs本剤プラセボ 差の点推定値 (調整平均値) -2.3 95%CI: -3.1～-1.5
FP200 μ g/日（分2）	142	8.3 (0.2)	-3.7 (0.2)	
本剤プラセボ	32	7.8 (0.3)	-1.4 (0.3)	本剤vsFP 差の点推定値 (調整平均値) -0.2 95%CI: -0.7～0.3
FPプラセボ	34	8.4 (0.3)	-1.8 (0.4)	

注3) それぞれの実薬に対するプラセボを設定した。

注4) 調整平均値、95%両側信頼区間（95%CI）、標準誤差は投与前値及び投与群を共変量とした共分散分析から算出された。

本剤における副作用は、143例中19例（13.3%）に認められた。主なものは、血中ビリルビン増加4例（2.8%）、咽喉頭疼痛3例（2.1%）であった。

17.1.3 国内第Ⅲ相比較試験（小児）

通年性アレルギー性鼻炎を対象とした二重盲検比較試験⁷⁾において、本剤 [5歳以上12歳未満：100 μ g/日（分1）、12歳以上16歳未満：200 μ g/日（分1）] あるいはプラセボを2週間投与した。4鼻症状スコア^{注1)}の投与前値及び投与終了時の変化量を下表に示した。その結果、プラセボに対する本剤の優越性が検証された。

表3 小児通年性アレルギー性鼻炎を対象とした比較試験における投与2週後又は中止時の4鼻症状スコア

投与群	n	調整平均値（標準誤差）		比較 ^{注5)}
		投与前	変化量	
本剤（分1）	220	7.5 (0.1)	-3.9 (0.2)	差の点推定値 (調整平均値) -2.1 95%CI: -2.6～-1.5
プラセボ	113	7.6 (0.2)	-1.9 (0.2)	

注5) 調整平均値、95%両側信頼区間（95%CI）、標準誤差は投与前値、投与群及び年齢層（5歳以上12歳未満、12歳以上16歳未満）を共変量とした共分散分析から算出された。

本剤における副作用は、220例中6例（2.7%）に認められた。主なものは、鼻部不快感3例（1.4%）であった。

17.1.4 海外第Ⅱ相比較試験（小児）

小児季節性アレルギー性鼻炎（6歳以上12歳未満）を対象とした第Ⅱ相試験⁸⁾において、本剤100 μ g/日（分1）、ベクロメタゾンプロピオン酸エステル（BDP）168 μ g/日（分2）あるいはプラセボを4週間投与した。合計鼻症状スコア^{注6)}の投与前値、投与1週後及び投与終了時の変化量を下表に示した。投与1週後及び投与終了時では、本剤はプラセボと比較して有意に優れていた（ $p < 0.01$ ）。

注6) 医師の評価によるくしゃみ発作、鼻汁、鼻閉、鼻内そう痒感の程度をそれぞれ0～3点にスコア化して合計したスコア（最大スコアは12点）。

表4 小児季節性アレルギー性鼻炎を対象とした第Ⅱ相試験における合計鼻症状スコア（海外試験）

投与群	n ^{注7)}	投与前 ^{注8)}	投与1週後		投与4週後又は中止時	
			変化量 ^{注8)}	比較 ^{注9)}	変化量 ^{注8)}	比較 ^{注9)}
本剤 100 μ g/日 (分1)	135	8.1 (1.7)	-2.8 (2.6)	本剤vsプラ セボの差 0.9 p=0.01	-3.6 (2.9)	本剤vsプラ セボの差 1.2 p<0.01
BDP 168 μ g/日 (分2)	136	8.0 (1.7)	-2.8 (2.4)	BDPvsプラ セボの差 0.9 p=0.01	-3.6 (2.9)	BDPvsプラ セボの差 1.2 p<0.01
プラセボ	134	8.0 (1.5)	-1.9 (2.2)	0.9 p=0.01	-2.4 (2.8)	1.2 p<0.01

注7) 投与前及び投与4週後又は中止時の例数

注8) 平均値（標準偏差）

注9) 投与群及び施設を因子とした分散分析

本剤100 μ g/日（分1）における副作用は、135例中27例（20.0%）に認められた。主なものは、鼻出血8例（5.9%）、頭痛、くしゃみ各4例（3.0%）、鼻刺激3例（2.2%）であった。

17.3 その他

17.3.1 海外第Ⅲ相試験（成長及び視床下部-下垂体-副腎皮質系機能に対する影響）（小児）

小児の通年性アレルギー性鼻炎（3歳以上10歳未満）を対象とした海外臨床試験⁹⁾において、本剤100 μ g/日（分1）あるいはプラセボを1年間投与した。治療1年後プラセボと比較して、本剤による有意な成長抑制は認められなかった。また、視床下部-下垂体-副腎皮質系機能（血漿コルチゾール）への有意な影響は認められなかった。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

モメタゾンフランカルボン酸エステルは抗アレルギー作用及び抗炎症作用を有する。鼻腔内投与によりアレルギー性鼻炎モデルにおいて各種鼻症状抑制作用を示した。ヒトのヘルパーT（Th）細胞からのインターロイキン-4（IL-4）及びIL-5産生（Th2細胞の活性化）を抑制した¹⁰⁾（*in vitro*）。鼻腔内投与により能動感作マウスのIgE及びIgG1抗体産生を抑制した¹¹⁾（*in vivo*）。さらに、ラット好酸球の走化性因子による遊走能を低下させた¹²⁾（*in vitro*）。

18.2 アレルギー性鼻炎抑制作用

モメタゾンフランカルボン酸エステルは能動感作ラットの抗原誘発鼻腔内色素漏出反応（水性鼻漏）、くしゃみ、鼻掻き行動、鼻閉及び鼻過敏性亢進に対して、鼻腔内投与により抑制作用を示した¹³⁾⁻¹⁶⁾（*in vivo*）。

18.3 局所抗炎症作用

モメタゾンフランカルボン酸エステルは亜急性炎症モデルであるマウスクロトン油耳浮腫に対して、局所投与により抑制作用を示し、その作用はベクロメタゾンプロピオン酸エステルよりも低用量で発現した¹⁷⁾（*in vivo*）。

18.4 全身性のステロイド作用の比較

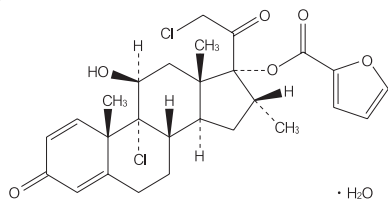
経口投与した時のマウスにおける胸腺萎縮作用、視床下部-下垂体-副腎皮質系抑制作用及び体重増加抑制作用、並びにモルモットにおける末梢血リンパ球減少作用の発現にはベクロメタゾンプロピオン酸エステルよりも高用量を要した¹⁸⁾（*in vivo*）。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：モメタゾンフランカルボン酸エステル水和物（Mometasone Furoate Hydrate）

化学名：(+)-9,21-Dichloro-11 β ,17 α -dihydroxy-16 α -methyl-1,4-pregnadiene-3,20-dione17- (2-furoate) monohydrate

化学構造式：



分子式：C₂₇H₃₀Cl₂O₆ · H₂O

分子量：539.44

性状：本品は白色の粉末である。本品はN,N-ジメチルアセトアミドに溶けやすく、ジオキサソランにやや溶けやすく、メタノール、エタノール（99.5）又はアセトニトリルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

融点：約220℃（分解）

22. 包装

〈ナゾネックス®点鼻液50 μ g56噴霧用〉

1本（10g）×5

〈ナゾネックス®点鼻液50 μ g112噴霧用〉

1本（18g）×5

23. 主要文献

- 1) 社内資料：毒性試験（2008年7月16日承認、CTD2.6.6.1）
- 2) 社内資料：全身吸収性試験（2008年7月16日承認、CTD2.7.2.2）
- 3) 社内資料：薬物動態試験・代謝物（2008年7月16日承認、CTD2.7.2.2）
- 4) 社内資料：薬物動態試験・代謝物（2008年7月16日承認、CTD2.7.2.2）
- 5) 石川 哮ほか。耳鼻咽喉科臨床。2008；補123：1-18.
- 6) 宗 信夫ほか。アレルギー・免疫。2009；16：394-413.
- 7) 社内資料：小児を対象としたプラセボ対照比較試験（2012年5月25日承認、CTD2.7.6.6）
- 8) Meltzer EO, et al. J Allergy Clin Immunol. 1999；104：107-14.
- 9) Schenk EJ, et al. Pediatrics. 2000；105：E22.
- 10) Umrand SP, et al. J Allergy Clin Immunol. 1997；100：511-9.
- 11) Magari M, et al. Immunopharmacol Immunotoxicol. 2006；28：491-500.
- 12) Sugimoto Y, et al. Int Immunopharmacol. 2003；3：845-52.
- 13) Kamei C, et al. Jpn Pharmacol Ther. 1995；23：2979-82.
- 14) Sugimoto Y, et al. Pharmacology. 2000；61：91-5.
- 15) 社内資料：アレルギー性鼻炎抑制作用（2008年7月16日承認、CTD2.6.2.2）
- 16) Tsumuro T, et al. Eur J Pharmacol. 2005；524：155-8.
- 17) 社内資料：局所抗炎症作用（2008年7月16日承認、CTD2.6.2.2）
- 18) 社内資料：全身作用（2008年7月16日承認、CTD2.6.2.4）

24. 文献請求先及び問い合わせ先

杏林製薬株式会社 くすり情報センター

〒101-8311 東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地

電話 0120-409341

受付時間 9：00～17：30（土・日・祝日を除く）

26. 製造販売業者等

* 26.1 製造販売元

オルガノン株式会社

東京都港区南青山1-24-3

26.2 発売元

杏林製薬株式会社

東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地

< 日本小児科学会 見解 >

スイッチOTC医薬品の候補成分に関する見解

1. 候補成分に関連する事項

候補成分 の情報	成分名 (一般名)	モメタゾンフランカルボン酸エステル水和物
	効能・効果	アレルギー性鼻炎

2. スイッチ OTC 化の妥当性に関連する事項

スイッチ OTC 化の 妥当性	<p>1. OTC とすることの妥当性について</p> <p>【薬剤特性の観点から】 小児にとって妥当とは思えない</p> <p>【対象疾患の観点から】 小児にとって妥当とは思えない</p> <p>【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 小児にとって妥当とは思えない</p> <p>[上記と判断した根拠]</p> <ul style="list-style-type: none"> ・ 小児の適応年齢 <ul style="list-style-type: none"> → フルチカゾンフランカルボン酸エステルのスイッチOTC化の検討の際、日本耳鼻咽喉科頭頸部外科学会及び日本臨床耳鼻咽喉科医会より、小児の長期使用による粘膜の薄層化の懸念から、使用対象に15歳未満を含めることは望ましくないとの見解が提出された。有効成分は異なるが、本薬についても同様と思われる。 ・ 使用期間の上限 <ul style="list-style-type: none"> → 他の疾病の治療機会を喪失しないよう、使用期間の上限を設定する必要があると考えられる。フルチカゾンフランカルボン酸エステルのスイッチOTC化の検討の際に日本耳鼻咽喉科頭頸部外科学会及び日本臨床耳鼻咽喉科医会から提出された見解のように、本薬についても1年間に3ヶ月を超えて使用しないこととするのが妥当で、小児では、さらに短いほうが良いと思われる。 ・ モメタゾンフランカルボン酸エステル水和物の外用剤は、アトピー性皮膚炎診療ガイドライン 2021 において、ベリーストロングのステロイドに分類されている。同じくベリーストロングに分類されるベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステルの外用剤については、「効果が強力で局所的な副作用が出やす
-----------------------	--

	<p>く、医療用でも使用にあたって医師により慎重に管理されている」という理由により、スイッチ不可と判断されている。鼻アレルギー診療ガイドラインでは、皮膚科領域のようなステロイドの強さによる使い分けはなく、強さのランクによる区分もないが、本薬の点鼻剤をスイッチ OTC 化することへの懸念はある。</p> <p>2. OTC とする際の留意事項、課題点について 上記を参照してください。</p> <p>3. その他</p>
備考	

< 日本耳鼻咽喉科頭頸部外科学会 見解 >

< 日本臨床耳鼻咽喉科医会 見解 >

スイッチOTC医薬品の候補成分に関する見解

1. 候補成分に関連する事項

候補成分 の情報	成分名 (一般名)	モメタゾンフランカルボン酸エステル水和物
	効能・効果	花粉による季節性アレルギーの次のような症状の緩和： 鼻づまり，鼻みず（鼻汁過多），くしゃみ

2. スイッチ OTC 化の妥当性に関連する事項

スイッチ OTC 化の 妥当性	<p>1. OTC とすることの妥当性について</p> <p>【薬剤特性の観点から】 本剤のバイオアベイラビリティは低く、鼻腔粘膜から吸収され肝での代謝を受けずに全身循環に回る薬剤量はベクロメタゾン（既にOTC化）等よりもかなり低く抑えられており、OTC化には特に大きな問題は生じないものとする。</p> <p>【対象疾患の観点から】 花粉症・季節性アレルギー性鼻炎による鼻閉や鼻汁過多等の症状緩和に対しては、本薬剤投与により高い効果が期待できる。一方、花粉症による皮膚症状や眼症状は対象外である点、注意喚起が必要である。</p> <p>【適正販売、スイッチ化した際の社会への影響の観点から】 年齢（小児、高齢者）を考慮し、また内科的（高血圧、糖尿病等）、眼科的（白内障、緑内障）合併症等がないことを十分に確認していれば、副作用発現を低く抑えられると考えられ、患者 QOL は高く維持できる。 しかし、血管収縮薬が主成分の点鼻薬と混同し、乱用にいたる懸念もあり、適切な指導が必要である。</p> <p>[上記と判断した根拠] 本剤の低い副作用発現と十分な効果等を総合的に判断し、適切な指導の下に、OTC化することについては妥当性があるものとする。</p>
-----------------------	--

	<p>2. OTC とする際の留意事項、課題点について</p> <p>「全身性ステロイド剤と比較し可能性は低いが、点鼻ステロイド剤の投与により全身性の作用（クッシング症候群、クッシング様症状、副腎皮質機能抑制、小児の成長遅延、骨密度の低下、白内障、緑内障を含む）が発現する可能性がある。」と記載されているため注意が必要である。</p> <p>特に小児においては粘膜菲薄を考慮し、長期間投与とならないよう十分な配慮が必要である。また成人を含めて即効性のある薬剤ではない旨を十分に周知して頻回投与を回避する（特に12歳未満の小児には「各鼻腔に1噴霧ずつ1日1回」）指導も必要と考える。</p> <p>1回の処方量を最小限にし、漫然と使用しないことが重要である。</p> <p>〔上記と判断した根拠〕</p> <p>薬剤のリスクに関わる厚労省の成分情報等には、副作用として血中コルチゾールの減少・増加、眼圧上昇等がみられたとの報告がある。バイオアベイラビリティが低い薬剤であっても長期間の投与によりこれらの副作用が発現するリスクがあり、ことに小児、高齢者においては眼症状、全身症状に変化がないか十分に注意すべきである。</p> <p>3. その他</p> <p>鼻づまり、鼻みず（鼻汁過多）、くしゃみが花粉による季節性アレルギーによるものとは限らず、副鼻腔炎等に起因する場合もあるため、症状が軽快しない場合には漫然と使用することなく耳鼻咽喉科専門医への受診を促していただきたい。</p>
備考	

スイッチOTC医薬品の候補となる成分の検討状況について(令和4年度受付分)(2022年4月1日～2023年3月31日)

資料 6

No.	成分名	検討する効能・効果	候補成分に対応する医療用医薬品の情報				備考
			販売名	会社名	効能・効果	用法・用量	
1	モメタゾンフランカルボン酸エステル水和物	花粉による季節性アレルギーの次のような症状の緩和: 鼻づまり, 鼻みず(鼻汁過多), くしゃみ	ナゾネックス 点鼻液50 µg 56噴霧用 同点鼻液50 µg 112噴霧用	オルガノン株式会社	アレルギー性鼻炎	<p>〈成人〉 通常、成人には、各鼻腔に2噴霧ずつ1日1回投与する(モメタゾンフランカルボン酸エステルとして1日200 µg)。</p> <p>〈小児〉 通常、12歳未満の小児には、各鼻腔に1噴霧ずつ1日1回投与する(モメタゾンフランカルボン酸エステルとして1日100 µg)。</p> <p>通常、12歳以上の小児には、各鼻腔に2噴霧ずつ1日1回投与する(モメタゾンフランカルボン酸エステルとして1日200 µg)。</p>	第26回で検討
2	アダパレン	尋常性ざ瘡(ニキビ)	ディフェリンゲル0.1%	マルホ株式会社	尋常性ざ瘡	1日1回、洗顔後、患部に適量を塗布する。	
3	ツロブテロール	せき、喘鳴(ぜーぜー、ひゅーひゅー)をともなうせき、たん	ホクナリンテープ0.5mg 同テープ1mg 同テープ2mg	ヴィアトリス製薬株式会社	下記疾患の気道閉塞性障害に基づく呼吸困難など諸症状の緩解 気管支喘息、急性気管支炎、慢性気管支炎、肺気腫	通常、成人にはツロブテロールとして2mg、小児にはツロブテロールとして0.5～3才未満には0.5mg、3～9才未満には1mg、9才以上には2mgを1日1回、胸部、背部又は上腕部のいずれかに貼付する。	

テリパラチドの検討の進め方について

成分情報等

※令和3年度受付

<候補成分の情報>

成分名（一般名）：テリパラチド酢酸塩

スイッチOTCとした際の効能・効果：骨折の危険性の高い骨粗鬆症

<候補成分に対する医療用医薬品の情報>

販売名：テリボン皮下注28.2μgオートインジェクター

効能・効果：骨折の危険性の高い骨粗鬆症

用法・用量：通常、成人には、テリパラチドとして28.2μgを1日1回、週に2回**皮下注射**する。

なお、本剤の投与は24カ月間までとすること。

会社名：旭化成ファーマ株式会社

剤形に関する規制

- 医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第四十九条第一項の規定に基づき厚生労働大臣の指定する医薬品（平成17年厚生労働省告示第24号）において、注射剤は処方箋医薬品に指定されている。
- 「医薬品の承認申請について」（平成26年11月21日付け薬食発1121第2号）において、医師、歯科医師が自ら使用し、又は医師、歯科医師の指導監督下で使用することが適当な医薬品は、原則として医療用医薬品として取扱うものとされている。

対応の方向性（案）

- OTCは一般の人が自らの判断で適用できるよう、一般の人が使いやすい剤形である必要があり、現行製剤の剤形はスイッチOTC化の課題の1つと考えられる。
- 剤形に関する課題についての解決策の検討は困難と考えられるため、本検討会議としては、スイッチOTC化のニーズを把握するのみとしてはどうか。

テリパラチドの検討の進め方について

<参考資料>

- 医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第四十九条第一項の規定に基づき厚生労働大臣の指定する医薬品（平成17年厚生労働省告示第24号）

次に掲げる医薬品(専ら疾病の診断に使用されることが目的とされている医薬品であって、人の身体に直接使用されることのないものを除く。)

- 一 放射性医薬品(放射性医薬品の製造及び取扱規則(昭和三十六年厚生省令第四号)第一条第一号に規定する放射性医薬品をいう。)
- 二 麻薬(麻薬及び向精神薬取締法(昭和二十八年法律第十四号)第二条第一号に規定する麻薬をいう。)
- 三 向精神薬(麻薬及び向精神薬取締法第二条第六号に規定する向精神薬をいう。)
- 四 覚醒剤(覚醒剤取締法(昭和二十六年法律第二百五十二号)第二条第一項に規定する覚醒剤をいう。)
- 五 覚醒剤原料(覚醒剤取締法第二条第五項に規定する覚醒剤原料をいう。)
- 六 特定生物由来製品(医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律(昭和三十五年法律第百四十五号)第二条第十一項に規定する特定生物由来製品をいう。)
- 七 注射剤(前各号に掲げるものを除く。)**
- 八 次に掲げるもの、その誘導體、それらの水和物及びそれらの塩類を有効成分として含有する製剤(前各号に掲げるもの及び殺そ剤を除く。)。ただし、二以上の有効成分を含有する製剤にあつては、次に掲げるものに限る。
(以下略)

- 「医薬品の承認申請について」（平成26年11月21日付け薬食発1121第2号）記第1総則2（2）

(2) 医療用医薬品とは、医師若しくは歯科医師によって使用され又はこれらの者の処方せん若しくは指示によって使用されることを目的として供給される医薬品をいう。

また、次のいずれかに該当する医薬品は、原則として医療用医薬品として取扱うものとする。

ア 処方せん医薬品、毒薬又は劇薬。ただし、毒薬、劇薬のうち、人体に直接使用しないもの（殺虫剤等）を除く。

イ 医師、歯科医師が自ら使用し、又は医師、歯科医師の指導監督下で使用しなければ重大な疾病、障害若しくは死亡が発生するおそれのある疾患を適応症にもつ医薬品

ウ その他剤形、薬理作用等からみて、医師、歯科医師が自ら使用し、又は医師、歯科医師の指導監督下で使用することが適当な医薬品（※）