

貯法：室温保存  
有効期間：3年6ヶ月

## 抗真菌剤

スルコナゾール硝酸塩クリーム・外用液

日本標準商品分類番号  
872655

# エクセルダーム<sup>®</sup> クリーム1% エクセルダーム<sup>®</sup> 外用液1%

EXELDERM<sup>®</sup> Cream, Solution

	クリーム 1%	外用液 1%
承認番号	22000AMX01532	22000AMX01531
販売開始	1986年 2月	1986年 2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

### 3. 組成・性状

#### 3.1 組成

販売名	エクセルダームクリーム1%	エクセルダーム外用液1%
有効成分	スルコナゾール硝酸塩	
	1g中 10mg	1mL中 10mg
添加剤	自己乳化型ステアリン酸 グリセリン、ステアリル アルコール、ステアリン 酸ソルビタン、セタノー <sup>ル</sup> ル、パルミチン酸アスコ <sup>ルビン</sup> 酸、プロピレングリコール、 ポリソルベート60、ミリスチン酸イソ <sup>ブロピル</sup> その他の添加剤としてpH調整剤（塩酸、水酸化ナト <sup>リウム</sup> ）を含有する	BHA、1,3-ブチレングリコール、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール、ポリソルベート20

#### 3.2 製剤の性状

販売名	エクセルダームクリーム1%	エクセルダーム外用液1%
性状・剤形	水中油型の乳剤性基剤を使用した白色～微黄色のクリームで、においはないか、又は僅かに特異なにおいがある。	無色～微黄色澄明の粘稠な液で、においはないか、又は僅かに特異なにおいがある。

### 4. 効能又は効果

#### 下記の皮膚真菌症の治療

- 白癬：足白癬、股部白癬、体部白癬
- カンジダ症：間擦疹、乳児寄生菌性紅斑、指間びらん症、爪団炎
- 癪風

### 6. 用法及び用量

1日2～3回、適量を患部に塗布する。

### 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

#### 9.5 妊婦

妊娠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。

#### 9.7 小児等

低出生体重児、新生児を対象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使用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
皮膚	局所のそう痒感、刺激感・熱感、接触皮膚炎、発赤	腫脹感、浸軟、丘疹、乾燥

注) 発現頻度は、製造販売後調査の結果を含む。

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤使用時の注意

##### 〈製剤共通〉

14.1.1 眼科用として角膜、結膜には使用しないこと。

14.1.2 著しいびらん面には使用しないこと。

##### 〈外用液〉

14.1.3 刺激を生じることがあるので、亀裂、びらん面には注意して使用すること。

### 16. 薬物動態

#### 16.1 血中濃度

1%-<sup>3</sup>H-スルコナゾール硝酸塩クリーム剤4.5gを、健康成人7例の腹部正常皮膚2ヵ所に12時間間隔で2回単純塗布、1回目の塗布後24時間の時点で、皮膚を洗浄した。この時の血漿中濃度は塗布後24時間にピークに達し、以後ゆるやかに減少した<sup>1)</sup>（外国人データ）。

#### 16.2 吸収

1%-<sup>3</sup>H-スルコナゾール硝酸塩クリーム剤4.5gを、健康成人7例の腹部正常皮膚2ヵ所に12時間間隔で2回単純塗布、1回目の塗布後24時間の時点で、皮膚を洗浄した。塗布後7日までに尿糞中へ排泄された放射能量から、経皮吸収率は8.7%であった<sup>1)</sup>（外国人データ）。

#### 16.3 分布

経皮投与時の臓器組織内分布は、塗布部位と腸内容物に高い他は、副腎、肝臓、腎臓内に僅かに分布したにすぎなかつた<sup>2)</sup>（ラット）。

### 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

本剤を1日2～3回、病巣の範囲に応じた適量を患部に塗布した、白癬、カンジダ症及び癪風に対する対照薬との比較臨床試験の結果、本剤の有用性が認められている。この比較試験を含む国内で実施された臨床試験で、本剤の有効率は下表のとおりであった<sup>3)～13)</sup>。

	有効率 (%)	
	クリーム1%	外用液1%
白癬	210/247 ( 85.0%)	102/121 ( 84.3%)
	116/122 ( 95.1%)	53/59 ( 89.8%)
	133/155 ( 85.8%)	72/83 ( 86.7%)
皮膚カンジダ症	108/114 ( 94.7%)	47/51 ( 92.2%)
	22/22 ( 100.0%)	15/15 ( 100.0%)
	7/7 ( 100.0%)	8/8 ( 100.0%)
	19/20 ( 95.0%)	1/1 ( 100.0%)
癪風	109/116 ( 94.0%)	45/51 ( 88.2%)
総計	724/803 ( 90.2%)	343/389 ( 88.2%)

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

スルコナゾール硝酸塩は、真菌の細胞膜の透過性に関与する物性の変化及び細胞膜結合性ATPase活性の変化を促すことによって膜透過性機能及び輸送機能を障害し、真菌を死滅させると考えられている<sup>14)</sup>。

### 18.2 抗菌作用

18.2.1 酵母様真菌、皮膚糸状菌、子のう菌等の広い範囲の真菌に強い抗真菌活性を示し、その作用は殺菌的である<sup>14) ~16)</sup> (in vitro)。

18.2.2 C. albicansについては、発育期のみならず、休止期の細胞に対しても強い抗真菌作用を示す<sup>17)</sup> (in vitro)。

18.2.3 一部の嫌気性菌を含むグラム陽性菌に対しても抗菌作用を示す<sup>16)</sup> (in vitro)。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名：スルコナゾール硝酸塩 (Sulconazole Nitrate)

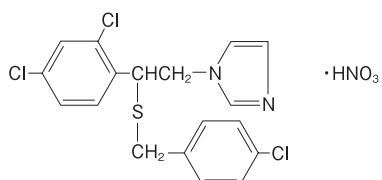
化学名：(±)-1-[2,4-dichloro-β-[(4-chlorobenzyl)thio]phenethyl] imidazole nitrate

分子式：C<sub>18</sub>H<sub>15</sub>Cl<sub>3</sub>N<sub>2</sub>S · HNO<sub>3</sub>

分子量：460.77

性 状：白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはないか、又は僅かに特異なにおいがある。ジメチルホルムアミドに溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、冰酢酸にやや溶けにくく、無水エタノール又はクロロホルムに溶けにくく、水又はエーテルにほとんど溶けない。ジメチルホルムアミド溶液 (1→20) は旋光性を示さない。本品1gに水100mLを加え、振り混ぜて得た懸濁液のpHは約4である。

構造式：



融 点：約130℃ (分解)

## 22. 包装

〈エクセルダームクリーム1%〉

100g [10g (チューブ) × 10]

〈エクセルダーム外用液1%〉

100mL [10mL (ボトル) × 10]

## 23. 主要文献

- 1) Franz TJ, et al. : J Pharm Sci. 1988 ; 77 (6) : 489-491
- 2) 藤原充雄, 他 : 応用薬理. 1984 ; 28 (1) : 145-154
- 3) R S 44872研究班 : 西日本皮膚科. 1984 ; 46 (3) : 769-782
- 4) R S 44872ソリューション研究班 : 西日本皮膚科. 1984 ; 46 (4) : 960-965
- 5) R S 44872クリーム研究班 : 皮膚科紀要. 1983 ; 78 (4) : 283-290
- 6) R S 44872臨床研究班 : 西日本皮膚科. 1984 ; 46 (3) : 783-791
- 7) 大橋 勝, 他 : 皮膚. 1983 ; 25 (5) : 896-901
- 8) 渡辺 靖, 他 : 臨牀と研究. 1984 ; 61 (10) : 3396-3400
- 9) 松尾 茂 : 臨牀と研究. 1984 ; 61 (11) : 3697-3702
- 10) 高橋伸也, 他 : 臨牀と研究. 1984 ; 61 (10) : 3401-3404
- 11) 久木田 淳, 他 : 西日本皮膚科. 1984 ; 46 (4) : 966-972
- 12) 香川三郎, 他 : 薬理と治療. 1984 ; 12 (5) : 2141-2145
- 13) R S 44872ソリューション研究班 : 西日本皮膚科. 1984 ; 46 (4) : 947-959
- 14) 山口英世, 他 : 真菌と真菌症. 1983 ; 24 (3) : 253-262
- 15) 吉田弘嗣, 他 : Chemotherapy. 1984 ; 32 (7) : 477-484
- 16) 岩田和夫, 他 : 真菌と真菌症. 1982 ; 23 (4) : 314-317
- 17) 岩田和夫, 他 : 真菌と真菌症. 1984 ; 25 (2) : 147-157

## \*24. 文献請求先及び問い合わせ先

田辺ファーマ株式会社 くすり相談センター

〒541-8505 大阪市中央区道修町3-2-10

電話 0120-753-280

## 26. 製造販売業者等

### \*26.1 製造販売元

田辺ファーマ株式会社

大阪市中央区道修町3-2-10