

抗真菌剤

アスタット[®]クリーム1%

Astat[®] Cream

アスタット[®]外用液1%

Astat[®] Solution

アスタット[®]軟膏1%

Astat[®] Ointment

ラノコナゾール 製剤

貯 法：室温保存。遮光、気密容器。(「取扱い上の注意」の項参照)
使用期限：包装箱、直接の容器に表示。

	クリーム	外用液	軟膏
* 承認番号	22000AMX02086000	22000AMX02084000	22000AMX02085000
* 薬価収載	2008年12月	2008年12月	2008年12月
販売開始	1994年9月	1994年9月	1996年6月
再審査結果	2003年6月	2003年6月	2003年6月

〔禁忌(次の患者には使用しないこと)〕
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

〔組成・性状〕

販売名	アスタット クリーム1%	アスタット 外用液1%	アスタット 軟膏1%
成分	ラノコナゾール	ラノコナゾール	ラノコナゾール
含量	10mg/g	10mg/mL	10mg/g
添加物	ステアリルアルコール、セタノール、パラオキシ安息香酸プロピル、パラオキシ安息香酸メチル、ジブチルヒドロキシトルエン、セバシン酸ジエチル、中鎖脂肪酸トリグリセリド、ポリソルベート60、モノステアリン酸ソルビタン	エタノール、マクロゴール400、メチルエチルケトン	白色ワセリン
性状	白色のクリーム剤で、わずかに特異なおいがある	無色澄明の液剤で、特異なおいがある	白色の軟膏剤で、おいはない

〔効能・効果〕

下記の皮膚真菌症の治療

白 癬：足白癬、体部白癬、股部白癬
カンジダ症：間擦疹、指間びらん症、爪囲炎
癬 風

〔用法・用量〕

1日1回患部に塗布する。

〔使用上の注意〕

1. 副作用

承認前の調査1,688例中報告された副作用は1.4% (23例)で、主な副作用は、クリームでは接触性皮膚炎0.4% (4例)の他、乾燥、小水疱、発赤、びらん等であった。外用液では刺激感1.3% (6例)、接触性皮膚炎0.4% (2例)の他、発赤、そう痒、角化の悪化等であった。軟膏では接触性皮膚炎1.2% (3例)、刺激感であった。なお、本剤に起因すると思われる臨床検査値の異常変動は認められなかった。

承認後における使用成績調査I (1994年9月～1997年10月) 3,062例中報告された副作用は1.3% (40例)で、主な副作用は、皮膚炎・接触性皮膚炎0.8% (25件)、発赤0.1% (4件)等であった。

その他の副作用

下記のような症状があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	0.1～5%未満	0.1%未満
皮膚	皮膚炎(接触性皮膚炎等)、発赤	小水疱、刺激感、そう痒感、亀裂、乾燥、腫脹

2. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、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。〔使用経験が少ない。〕

3. 適用上の注意

投与部位：

〔クリーム、軟膏〕

- (1)著しいびらん面には使用しないこと。
- (2)眼科用として角膜、結膜には使用しないこと。

〔外用液〕

- (1)著しいびらん面には使用しないこと。
- (2)亀裂、びらん面には注意して使用すること。
- (3)眼科用として角膜、結膜には使用しないこと。

〔薬物動態〕

健康人にアスタットクリーム1%を単回あるいは7日間反復塗布、また、アスタット外用液1%を単回塗布した結果、塗布部位からの回収率はいずれも高く、皮膚からの吸収率は低いと考えられる。また、反復塗布において、血漿中に検出されるラノコナゾール濃度は低く、蓄積性は低いと考えられる¹⁾²⁾。



〔臨床成績〕

総計1,460例について実施された二重盲検及び一般臨床を含む臨床試験の概要は次のとおりであった^{3)~7)}。

対象疾患名	有効率(%)〔有効以上〕			
	クリーム	外用液	軟膏	
白癬	足白癬	78.1 [246/315]	80.0 [120/150]	71.4 [40/56]
	体部白癬	86.9 [152/175]	84.8 [56/66]	77.1 [27/35]
	股部白癬	92.8 [90/97]	92.0 [46/50]	87.5 [28/32]
カンジダ症	間擦疹	94.7 [90/95]	81.8 [36/44]	87.5 [21/24]
	指間びらん症	90.2 [46/51]	88.5 [23/26]	100.0 [17/17]
	爪囲炎	100.0 [12/12]	75.0 [3/4]	76.9 [10/13]
癬風	95.7 [110/115]	90.0 [45/50]	97.0 [32/33]	

〔薬効薬理〕

1. 抗真菌作用

- ラノコナゾールは、皮膚糸状菌(*Trichophyton* 属、*Microsporum* 属、*Epidermophyton* 属)、*Candida* 属及び*Malassezia* 属真菌に対して高い抗真菌活性を有する。特に皮膚糸状菌に対するMICはすべて0.04 μ g/mL以下であり、殺菌活性も低濃度で発現した^{8)~10)}。(in vitro)
- ラノコナゾールは種々の病原性真菌保存株(酵母状真菌、黒色真菌、二形性真菌、*Aspergillus* 属及び*Penicillium* 属)に対し、広い抗真菌スペクトルを示す⁸⁾。(in vitro)
- モルモット足白癬モデルに対し、ラノコナゾール1%クリーム、外用液及び軟膏は1日1回、10日間塗布により、完全に菌を陰性化した。また、モルモット体部白癬モデルにおいても1日1回、11~14日間の塗布で同様の作用を示すとともに感染症状の改善が認められた^{11)~14)}。
- モルモット背部にアスタットクリーム1%0.1gを前塗布した後、*Trichophyton mentagrophytes* を接種した実験では、菌接種1~4日前の1回塗布でも感染は成立せず、良好な角質内貯留性を有することが示唆された¹⁵⁾。

2. 作用機序

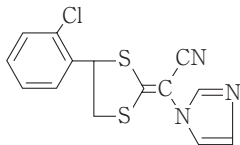
ラノコナゾールは真菌の細胞膜の構成成分であるエルゴステロールの合成阻害作用により抗真菌作用を示す¹⁶⁾¹⁷⁾。(in vitro)

〔有効成分に関する理化学的知見〕

一般名：ラノコナゾール(Lanocnazole)(JAN)

化学名：(±)-(E)-[4-(2-Chlorophenyl)-1,3-dithiolan-2-ylidene]-1-imidazolylacetone

構造式：



分子式：C₁₄H₁₀ClN₃S₂

分子量：319.84

性状：微黄色の結晶又は結晶性の粉末で、におい及び味はない。
クロロホルムに溶けやすく、アセトンにやや溶けやすく、メタノール又は酢酸エチルにやや溶けにくく、エタノールに溶けにくく、エーテルに極めて溶けにくく、水又はヘキサンにほとんど溶けない。

融点：141~146℃

〔取扱い上の注意〕

〔外用液〕

注意：合成樹脂を軟化したり、塗料を溶かすことがあるので注意すること。
火気を避けて保存すること。

〔包装〕

〔クリーム〕

チューブ：10g×10、10g×20、10g×50

〔外用液〕

10mL×10、10mL×20

〔軟膏〕

チューブ：10g×10、10g×20

〔主要文献〕

- 大西明弘ら：臨床医薬，**8**(4)，799(1992)
- 大西明弘ら：薬物動態に関する社内資料
- TJN-318クリーム研究班：西日本皮膚科，**54**(5)，954(1992)
- TJN-318クリーム研究班：西日本皮膚科，**54**(5)，962(1992)
- TJN-318クリーム研究班：西日本皮膚科，**54**(5)，977(1992)
- TJN-318液剤研究班：西日本皮膚科，**54**(5)，944(1992)
- ラノコナゾール軟膏研究会：西日本皮膚科，**57**(4)，829(1995)
- 平谷民雄ら：日本医真菌学会誌，**33**(3)，321(1992)
- 内田勝久ら：日本医真菌学会誌，**33**(2)，217(1992)
- 内田勝久ら：日本医真菌学会誌，**33**(3)，361(1992)
- Ohmi, T., et al.: Arzneimittel-Forsch. (Drug Res.), **41**(II)(8)，847(1991)
- Oka, H., et al.: Arzneimittel-Forsch. (Drug Res.), **42**(I)(3)，345(1992)
- 庭野吉己ら：Jpn. J. Antibiot., : **47**(9)，1192(1994)
- 庭野吉己ら：Jpn. J. Antibiot., : **48**(1)，150(1995)
- 岡 秀紀ら：日本医真菌学会誌，**33**(3)，313(1992)
- 近江哲人ら：日本医真菌学会誌，**33**(3)，339(1992)
- 近江哲人ら：日本医真菌学会誌，**33**(3)，349(1992)

*〔文献請求先・製品情報に関するお問い合わせ先〕

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

マルホ株式会社 製品情報センター
〒531-0071 大阪市北区中津1-5-22
TEL: 0120-12-2834

®登録商標

