

2003年6月改訂(第2版、再審査結果通知による改訂)

1998年10月改訂(新様式第1版)

貯法: しゃ光・気密容器
使用期限: 容器、外箱に表示
規制区分: 指定医薬品
注意: 取扱い上の注意参照

日本標準商品分類番号			
872655			
	クリーム	液	軟膏
承認番号	(06AM)Y1128	(06AM)Y1129	(08AM)D679
薬価収載	1994年8月	1994年8月	1996年6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		

抗真菌剤

アスタット[®]クリーム

ASTAT CREAM (ラノコナゾール製剤)

抗真菌剤

アスタット[®]液

ASTAT SOLUTION (ラノコナゾール製剤)

抗真菌剤

アスタット[®]軟膏

ASTAT OINTMENT (ラノコナゾール製剤)

【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	アスタット液	アスタット軟膏
組成	有効成分	ラノコナゾール	ラノコナゾール	ラノコナゾール
	含有量	10mg/g	10mg/mL	10mg/g
	添加物	日局ステアリルアルコール、日局精製水、日局セタノール、日局パラオキシ安息香酸プロピル、日局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	日局エタノール、日局精製水、日局マクロゴール400、メチルエチルケトン	日局白色ワセリン
性状	剤形	クリーム剤	液剤	軟膏剤
	色	白色	無色透明	白色
	におい	ない	特異なにおい	ない
	識別コード	❖-02	❖-03	❖-05

【効能又は効果】

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

【用法及び用量】

1日1回患部に塗布する。

【使用上の注意】

1 副作用

副作用発生状況の概要

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。液では刺激感1.3%(6例)、接触性皮膚炎0.4%(2例)の他、発赤、癢痒、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。

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、癢痒感、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:

- [アスタットクリーム、アスタット軟膏]
(1) 蒼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。
- [アスタット液]
(1) 蒼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】

健常人にアスタットクリームを単回あるいは7日間反復塗布、また、アスタット液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、反復塗布においても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】

臨床効果

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)}。

有効率 (%)

疾患名	販売名	アスタットクリーム	アスタット液	アスタット軟膏
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

(1) ラノコナゾールは、皮膚糸状菌(Trichophyton属、Microsporium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 µg/mL以下であり、殺菌活性も低濃度で発現した(in vitro)^{8)~12)}。



- (2) 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(*in vitro*)⁸⁾。
- (3) 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、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^{13)~16)}。
- (4) モルモット背部にアスタットクリーム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日目の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¹⁷⁾。

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¹⁸⁾¹⁹⁾。

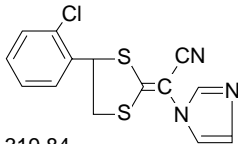
【有効成分に関する理化学的知見】

一般的名称：ラノコナゾール(Lanoconazole)

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

分子式：C₁₄H₁₀ClN₃S₂

化学構造式：



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】

注意(アスタット液)

1. 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。
2. 火気を避けて保存すること。

【包装】

アスタットクリーム：10g×10本、10g×20本、10g×50本

アスタット液：10mL×10本、10mL×20本

アスタット軟膏：10g×10本、10g×20本

【主要文献】

- 1) 大西明弘・他：臨床医薬, 8(4)799(1992)
- 2) 株式会社ツムラ社内資料
- 3) JTN-318クリーム研究班：西日本皮膚科, 54(5)954(1992)
- 4) JTN-318クリーム研究班：西日本皮膚科, 54(5)962(1992)
- 5) JTN-318クリーム研究班：西日本皮膚科, 54(5)977(1992)
- 6) JTN-318液剤研究班：西日本皮膚科, 54(5)944(1992)
- 7) ラノコナゾール軟膏研究会：西日本皮膚科, 57(4)829(1995)
- 8) 平谷民雄・他：日本医真菌学会誌, 33(3)321(1992)
- 9) 日本農薬株式会社資料
- 10) 内田勝久・他：日本医真菌学会誌, 33(2)217(1992)
- 11) 内田勝久・他：日本医真菌学会誌, 33(3)361(1992)
- 12) 日本農薬株式会社資料
- 13) T. Ohmi, et al. : *Arzneim.-Forsch./Drug Res.*, 41(8)847 (1991)
- 14) H. Oka, et al. : *Arzneim.-Forsch./Drug Res.*, 42(3)345 (1992)
- 15) 庭野吉己・他 : *Jpn. J. Antibiot.*, 47(9)1192(1994)
- 16) 庭野吉己・他 : *Jpn. J. Antibiot.*, 48(1)150(1995)
- 17) 岡 秀紀・他 : 日本医真菌学会誌, 33(3)313(1992)
- 18) 近江哲人・他 : 日本医真菌学会誌, 33(3)339(1992)
- 19) 近江哲人・他 : 日本医真菌学会誌, 33(3)349(1992)

【文献請求先】

株式会社ツムラ 商品情報センター
東京都千代田区二番町12番地7 〒102-8422

