

2020 年 4 月改訂（第 10 版）

日本標準商品分類番号：87239

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領2018に準拠して作成

口腔粘膜用剤

アフタゾン[®] 口腔用軟膏0.1%

APHTASOLON® Oral Ointment 0.1%

剤形	軟膏剤
製剤の規制区分	なし
規格・含量	1g 中、（日局）デキサメタゾン…1mg を含有
一般名	和名：デキサメタゾン 洋名：Dexamethasone
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2007 年 9 月 10 日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2007 年 12 月 21 日（販売名変更による） 販売開始年月日：1969 年 2 月
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：あゆみ製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	あゆみ製薬株式会社 くすり相談室 TEL：0120-137-413 FAX：0120-431-374 医療関係者向けホームページ http://www.ayumi-pharma.com/med

本 I F は 2020 年 4 月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MRと略す）等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会がI Fの位置付け、I F記載様式、I F記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がI F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I Fは紙媒体の冊子としての提供方式からPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加したI Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI Fは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDAと略す）の医療用医薬品情報検索のページ

(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>) にて公開されて入手可能となっている。日病薬では、2008年より新医薬品のI Fの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のI Fが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

この度、2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、新たに日病薬医薬情報委員会が記載要領を改め、「I F記載要領2018」として公表された。

2. I Fとは

I Fは「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

I Fに記載する項目及び配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠する。ただし、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（以下、薬機法と略す）に基づく承認事項を逸脱するもの、製薬企業の機密等に関わるもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はI Fの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたI Fは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

I Fの提供は、電子媒体を基本とし、必要に応じて薬剤師が印刷して使用する。製薬企業での製本は必須ではない。

3. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってI Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、I Fの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I Fが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I Fの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I Fを薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。しかし、薬機法の広告規制や医療用医薬品プロモーションコード等により、製薬企業が提供できる情報の範囲には自ずと限界がある。I Fは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

(2018年10月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的特性	1
3. 製品の製剤学的特性	1
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2
6. RMPの概要	2
II. 名称に関する項目	3
1. 販売名	3
2. 一般名	3
3. 構造式又は示性式	3
4. 分子式及び分子量	3
5. 化学名（命名法）又は本質	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4
III. 有効成分に関する項目	5
1. 物理化学的性質	5
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5
3. 有効成分の確認試験法、定量法	5
IV. 製剤に関する項目	6
1. 剤形	6
2. 製剤の組成	6
3. 添付溶解液の組成及び容量	6
4. 力価	6
5. 混入する可能性のある夾雑物	6
6. 製剤の各種条件下における安定性	7
7. 調製法及び溶解後の安定性	7
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	7
9. 溶出性	7
10. 容器・包装	7
11. 別途提供される資材類	7
12. その他	7
V. 治療に関する項目	8
1. 効能又は効果	8
2. 効能又は効果に関連する注意	8

3. 用法及び用量	8
4. 用法及び用量に関連する注意	8
5. 臨床成績	8
VI. 薬効薬理に関する項目	10
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	10
2. 薬理作用	10
VII. 薬物動態に関する項目	11
1. 血中濃度の推移	11
2. 薬物速度論的パラメータ	11
3. 母集団（ポピュレーション）解析	11
4. 吸収	12
5. 分布	12
6. 代謝	12
7. 排泄	12
8. トランスポーターに関する情報	13
9. 透析等による除去率	13
10. 特定の背景を有する患者	13
11. その他	13
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	14
1. 警告内容とその理由	14
2. 禁忌内容とその理由	14
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	14
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	14
5. 重要な基本的注意とその理由	14
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	14
7. 相互作用	15
8. 副作用	16
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
10. 過量投与	16
11. 適用上の注意	16
12. その他の注意	17
IX. 非臨床試験に関する項目	18
1. 薬理試験	18
2. 毒性試験	18
X. 管理的事項に関する項目	20
1. 規制区分	20

2. 有効期間	20
3. 包装状態での貯法	20
4. 取扱上の注意	20
5. 患者向け資材	20
6. 同一成分・同効薬	20
7. 国際誕生年月日	20
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	21
9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	21
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	21
11. 再審査期間	21
12. 投薬期間制限に関する情報	21
13. 各種コード	22
14. 保険給付上の注意	22
X I. 文献	23
1. 引用文献	23
2. その他の参考文献	23
X II. 参考資料	24
1. 主な外国での発売状況	24
2. 海外における臨床支援情報	24
X III. 備考	28
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	28
2. その他の関連資料	28

略語集

なし（個別に各項目において解説する。）

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

アフタゾロン口腔用軟膏 0.1%の有効成分であるデキサメタゾンとは、1958年に開発され、我が国ではその翌年に製造が許可されている。デキサメタゾンは分子内に $11\beta-OH$ と $9\alpha-F$ をもつ合成副腎皮質ホルモンで優れた抗炎症作用を有し、副作用の少ないコルチコイドとして開発された薬剤である。このデキサメタゾンを口腔内炎症の治療に塗布する軟膏剤として開発した。

その後、「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（厚生労働省医薬発第 935 号、平成 12（2000）年 9 月 19 日）に基づき、平成 19（2007）年 9 月 10 日に「アフタゾロン口腔用軟膏 0.1%」として販売名を変更して承認を取得し、平成 19（2007）年 12 月 21 日に薬価基準収載された。

その後、2015 年 12 月に昭和薬品化工株式会社からあゆみ製薬株式会社に製造販売承認が承継された。

2. 製品の治療学的特性

1. デキサメタゾンの有する強力な抗炎症作用のためびらん又は潰瘍を伴う難治性の口内炎又は舌炎に治療効果が認められている。
2. 軟膏基剤は、口腔の浸潤粘膜に対して優れた付着性を有し、唾液で容易に流出しにくいので、持続的薬効が期待できる。

3. 製品の製剤学的特性

1. 本剤は、歯科口腔用の粘膜治療剤で、主成分は合成副腎皮質ホルモンの中で、優れた抗炎症作用が認められているデキサメタゾン含有している。
2. 本剤の基剤は、口腔内の特殊性（常に唾液により浸潤していること、可動部が多いこと、咀嚼などによる粘膜面の機械的自浄作用が強いことなど）を考慮して、浸潤粘膜に対する付着性と口腔内滞留性が付与されている。

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、 最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無	無
最適使用推進ガイドライン	無	無
保険適用上の留意事項通知	無	無

(2020 年 4 月 1 日時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない（RMP策定対象外）

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

アフタゾロン口腔用軟膏 0.1%

(2) 洋名

APHTASOLON Oral Ointment 0.1%

(3) 名称の由来

口腔粘膜に発生する炎症を「アフタ (Aphthae)」という言葉と、口内炎等に有効な副腎皮質ホルモンの語尾である「ゾン」又は「ゾロン」を合わせた名称で、一見して適用が判る製品名 (商標登録) である。

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

デキサメタゾン (JAN)

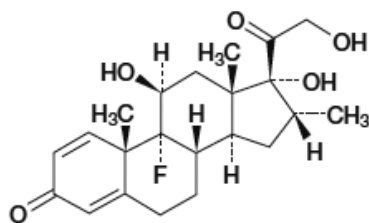
(2) 洋名 (命名法)

Dexamethasone (JAN)

(3) ステム (stem)

プレドニゾンおよびプレドニゾン誘導体: -methasone

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式: $C_{22}H_{29}FO_5$

分子量: 392.46

5. 化学名 (命名法) 又は本質

9-Fluoro-11 β , 17, 21-trihydroxy-16 α -methylpregna-1, 4-diene-3, 20-dione (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状¹⁾

白色～微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性¹⁾

メタノール、エタノール（95）又はアセトンにやや溶けにくく、アセトニトリルに溶けにくく、水にほとんど解けない。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）¹⁾、沸点、凝固点

融点：約 245℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値¹⁾

(1) $[\alpha]_D^{20}$: +86～+94°（乾燥後、0.1g、メタノール、10mL、100mm）

(2) 吸光度 : $E_{1\text{cm}}^{1\%}(238.5\text{nm}) = 394$ （メタノール）

(3) 赤外吸収（KBr錠） : 3480 cm^{-1} : ν OH、1706 cm^{-1} : 20位の ν C=O、1664 cm^{-1} : 3位の ν C=O、1622 cm^{-1} 及び1606 cm^{-1} : ν C=C、1072 cm^{-1} 及び1058 cm^{-1} : OH基の ν C-O

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法¹⁾

確認試験法

本品に水酸化ナトリウム試液を加え、酸素フラスコ燃焼法により得た検液はフッ化物の定性反応を呈する。

定量法

紫外可視吸光度測定法（波長：254nm）

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

軟膏剤

(2) 製剤の外観及び性状

白色の軟膏で、においはない。

(3) 識別コード

識別コードなし

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加物

販売名	アフタゾロン口腔用軟膏 0.1%
有効成分	（日局）デキサメタゾン
添加物	ヒプロメロース、カルボキシビニルポリマー、ゲル化炭化水素

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

製剤特有の分解生成物は認められていない。

IV. 製剤に関する項目

6. 製剤の各種条件下における安定性²⁾

保存方法	保存形態	保存期間	結果
室温	アルミニウム チューブ 紙箱入り	7 箇月	規格内
40℃ 75%RH	アルミニウム チューブ 紙箱入り	7 箇月	規格内

測定項目：性状、呈色反応、薄層クロマトグラフィー、定量

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

アフタゾロン口腔用軟膏 0.1%：チューブ：3g×10、3g×50、5g×10
患者向けしおりを同梱

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

チューブ：アルミニウム
キャップ：ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

びらん又は潰瘍を伴う難治性口内炎及び舌炎

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

通常、適量を1日1～数回患部に塗布する。なお、症状により適宜増減する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

1980年8月14日付厚生省薬務局長通知 薬発第1036号に基づく（再評価結果）。

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

1) 中島喜助 他³⁾

アフタ性口内炎、舌炎、扁平苔癬、歯肉炎、口角炎、褥瘡性口内炎、壊疽性口内炎で受診した患者 34 名（2～69 歳）に毎食後及び就寝前の 1 日 4 回十分に病巣を被覆するように塗布した。投与日数は 2～15 日の多岐にわたり、平均投与日数は 6 日であった。

〈効果判定〉

著効：5 日以内にすべての症状が消失したもの

有効：5 日以内に症状の一部が消失したもの

やや有効：7 日以内に症状の一部が消失したもの

無効：7 日以上を経過しても症状が消失しなかったもの

〈結果〉

全例を通じてみると著効 3、有効 11、やや有効 18、無効 2 であった。無効 2 例はいずれも扁平苔癬で、組織学的に上皮角化層の肥厚増殖を主体とする慢性疾患で、前癌症状とされるものである。なお、副作用は全例に認められなかった。

2) 黒須義宇 他⁴⁾

アフタ性口内炎を有する小児患者 29 例（1～6 歳）に対し、本剤を 1 日 4～5 回塗布した。投与日数は 3～5 日であった。

〈効果判定〉

3～4 日塗布後再来時に判定した。

著効：疼痛なく、びらん、潰瘍面の著効な消褪または著しい縮小を認め、出血なく
良性肉芽の再生があるもの

有効：びらん、潰瘍面の縮小を認め、出血はないか、あっても微小なもので良性肉
芽の再生があるもの

やや有効：疼痛は軽減し、びらん、潰瘍面の縮小はわずかに認められるが、出血あ
り、肉芽再生の極度に弱いもの

無効：びらん、潰瘍の良化がまったく認められず、症状の良化が認められないもの

〈結果〉

有効以上（著効・有効）は 20 例（有効率 69.0%）であった。なお、副作用は全例に認められなかった。

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

副腎皮質ステロイド

一般名：トリアムシノロン、ヒドロコルチゾン、プレドニゾロン

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

デキサメタゾンの作用機序は、細胞内に存在する特異的な受容体との相互作用を介している。ステロイド受容体は細胞質内で熱ショックタンパク heat shock protein (HSP)90 と複合体を形成している。ステロイドが受容体と結合する HSP90 は解離し、塩基性アミノ酸によって構成されている DNA 結合部位が露出される。ステロイド-受容体複合体は核内へ移行して DNA に結合し、ある種の遺伝子の発現を抑制する。その遺伝子によってコードされたタンパクの生成が調節を受ける。さらに、NF- κ B、AP-1 などの転写因子との結合を介して多くの遺伝子の転写活性を抑制する。その結果、様々なレベルで炎症性メディエーターや接着分子の産生、炎症細胞の増殖、遊走が調節される。生成が抑制される炎症性メディエーターには、ヒスタミン、補体性分、IL-1、IL-2 及びその他の多くのサイトカインが含まれる。その他、誘導型 NO 合成酵素、COX-2、ホスホリパーゼ A2 等である⁵⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 肉芽腫形成抑制作用⁶⁾

口腔粘膜に対する抗炎症作用を検討する為、ハムスター頬部コットンペレット挿入法により行った。綿球挿入直後、及び翌日より 1 日 1 回 4 日間本品をデキサメタゾンとして 0.01, 0.04, 0.06, 0.08, 0.1mg の用量で右側頬袋粘膜に塗布し、左側は塗布しなかった。6 日目に屠殺し、肉芽組織を正常組織から剥離し、肉芽腫乾燥重量を求めた。結果はデキサメタゾンとして 0.01~0.1mg を塗布した場合、17.7~54.8%の抑制率を示し、対照群と比較して有意差がみられ、用量との相関性も認められた。

2) 毛細血管透過性抑制作用⁶⁾

ハムスター頬袋粘膜キシレン刺激法にて行った。即ちハムスターをエーテル麻酔下に左右頬袋をピンセットで引き出し、キシレン浸漬ろ紙で刺激した。刺激直後、デキサメタゾンとして 0.05mg 宛右側刺激部位に塗布し、左側は塗布しなかった。次に 1% エバンズブルー水溶液を頸静脈内に投与、1 時間後屠殺した。両側頬袋を切り取り、刺激部位に出現した着色斑を分光光度計で測定した。

結果は薬剤塗布側では 55.6%の抑制率を示し、対照群と比較して有意差が見られた。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液—脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液—胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性化、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤に対し過敏症の既往歴のある患者

（解説）

本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者では、本剤の投与により過敏症状を発現するおそれがあるため設定した。

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴のある患者

9.1 合併症・既往歴のある患者

9.1.1 口腔内に感染を伴う患者

治療上やむを得ないと判断される場合を除き使用しないが、やむを得ず使用する場合には、あらかじめ適切な抗菌剤、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。感染症の増悪を招くおそれがある。

（解説）

1980年8月14日付厚生省薬務局長通知 薬発第1036号に基づく（再評価結果）。

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

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。

（解説）

「IX. 2. (5)生殖発生毒性試験」の項参照

(6) 授乳婦

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。
本剤のヒト母乳中への移行の有無は不明である。

（解説）

2017年6月8日付厚生労働省医薬・生活衛生局長通知 薬生発 0608 第1号及び厚生労働省
医薬・生活衛生局安全対策課長通知 薬生安発 0608 第1号に基づき、添付文書の新記載要
領に改訂した際に追記した。

(7) 小児等

9.7 小児

長期連用により発育障害をきたすおそれがある。

（解説）

1980年8月14日付厚生省薬務局長通知 薬発第 1036 号に基づく（再評価結果）。

(8) 高齢者

設定されていない

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

設定されていない

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	頻度不明
口腔の感染症 ^{注1)}	口腔の真菌性及び細菌性感染症
過敏症	過敏症
下垂体・副腎皮質系機能 ^{注2)}	下垂体・副腎皮質系機能の抑制

注1) 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) 長期連用によりこのような症状があらわれることがある。

(解説)

1980年8月14日付厚生省薬務局長通知 薬発第1036号に基づく（再評価結果）。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 使用時

使用後はしばらく飲食を避けさせること。

14.1.2 適用部位

眼科用として使用しないこと。

(解説)

1980年8月14日付厚生省薬務局長通知 薬発第1036号に基づく（再評価結果）。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験^{7, 8)}

動物	LD50 (mg/kg) (皮下)		
	投与後 7 日	投与後 14 日	投与後 21 日
ラット	～120	25	14
マウス	>700	648	514

(2) 反復投与毒性試験

ラットにデキサメタゾン 0.75mg/kg を 1 日 2 回 5 日間～6 週間経口投与したところ、体重減少、白血球減少、リンパ球減少、脾臓萎縮などが認められた。特に副腎に対しては明らかに萎縮が起きた。⁹⁾

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

妊娠マウスにデキサメタゾン 0.8mg を皮下あるいは静脈内注射すると、口蓋裂の発生は皮下注射で 23%、静脈内で 7% であった。¹⁰⁾

また、0.08mg を妊娠 9 日から 13 日の各日を投与初日としそれぞれ 4 日間連続投与した試験において、口蓋裂の発生が認められている。¹¹⁾

IX. 非臨床試験に関する項目

(6) 局所刺激性試験¹²⁾

本剤及び基剤のみを1日1回5日間ハムスター頬袋粘膜に塗布したが、肉眼及び病理組織学的に異常は認められなかった。

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤： 該当しない（処方箋医薬品以外の医薬品である）

有効成分： 該当しない

2. 有効期間

有効期間： 3 年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱上の注意

20. 取扱上の注意

使用後はキャップをしっかりと締めて保存すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド： なし

くすりのしおり： あり

その他の患者向け資材： 今日お渡しした軟膏の上手な使い方
「XⅢ. 備考その他の関連資料」の項参照

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬： デキサルチン口腔用軟膏 1mg/g、デキサメタゾン口腔用軟膏 0.1%「日医工」

同 効 薬： トリアムシノロンアセトニド、ベクロメタゾンプロピオン酸エステル等

7. 国際誕生年月日

不明

X. 管理的事項に関する項目

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

履歴	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
旧販売名 歯科用(口腔用) アフタゾロン	1966 年 11 月 16 日	(41A)5937	1966 年 11 月 16 日	1969 年 2 月
販売名変更 アフタゾロン 口腔用軟膏 0.1%	2007 年 9 月 10 日 (代替新規承認)	21900AMX01428000	2007 年 12 月 21 日	2007 年 12 月 21 日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

「X. 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容」の項参照

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果通知年月日 1980 年 8 月 14 日

製造(輸入)承認事項の一部を変更すれば薬事法第 14 条第 2 項各号(承認拒否事由)いずれにも該当しない。

	再評価前の承認内容	再評価結果
効能・効果	口腔領域の急慢性炎症性疾患 口内炎(アフタ性口内炎、潰瘍性口内炎、 壊疽性口内炎、義歯の刺激による口内 炎)、歯肉炎(単純性歯肉炎、潰瘍性歯肉 炎、壊疽性歯肉炎)、舌炎、舌潰瘍、口角 炎、口腔粘膜扁平苔癬、口腔内の外傷性 疾患(義歯刺激、歯槽膿漏・盲嚢搔爬・歯 石除去等の処置に伴う外傷性疾患)	びらん又は潰瘍を伴う難治性口内炎及び 舌炎
用法・用量	本剤の適量を1日1～4回塗布する。	通常、適量を1日1～数回患部に塗布す る。なお、症状により適宜増減する。

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省 薬価基準収載 医薬品コード	個別医薬品コード (Y J コード)	HOT(9 桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
アフタゾロン 口腔用軟膏 0.1%	2399706M1087	2399706M1087	105085102	620006368

14. 保険給付上の注意

本剤は保険給付上の準先発品である。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 第十七改正日本薬局方解説書.2016: C-3170-3177[AYM200072]
- 2) あゆみ製薬(株) 社内資料 アフタゾロン口腔用軟膏 0.1%の安定性試験
- 3) 中島嘉助:日本歯科評論.1974;384:168-174[AYM200073]
- 4) 黒須義宇:基礎と臨床.1984;18(3):903-908[AYM200074]
- 5) 栗山欣弥:医科薬理学(第3版).1998:498-500 及び 644-651[AYM200077]
- 6) 田村豊幸:薬理と治療.1982;12(12):6693-6697[AYM200078]
- 7) Tonelli,G:Toxicol.Appl.Pharmacol.1966;8(2):250-258(PMID:5956877)[AYM200079]
- 8) Tonelli,G:Steroids.1966;8(6):857-863(PMID:5967064)[AYM200080]
- 9) H.W.Hornstra,E.de Jager et al:Arzneim.-Forsch.1971;21(5):664-671(PMID:4328267)[AYM200081]
- 10) 藤野博:先天異常.1966;6(3):168[AYM200082]
- 11) 藤野博:先天異常.1965;5(4):235[AYM200083]
- 12) あゆみ製薬(株) 社内資料 薬効比較及び粘膜刺激性について

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II . 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

(1) 妊婦に関する海外情報（FDA, オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意「妊婦，産婦，授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、米 FDA、オーストラリア分類とは異なる。

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。

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。本剤のヒト母乳中への移行の有無は不明である。

米国の添付文書 (2019 年 5 月)	PRECAUTIONS Pregnancy Teratogenic Effects: Pregnancy Category C. Corticosteroids have been shown to be teratogenic in many species when given in doses equivalent to the human dose. Animal studies in which corticosteroids have been given to pregnant mice, rats, and rabbits have yielded an increased incidence of cleft palate in the offspring. There are no adequate and well-controlled studies in pregnant women. Corticosteroids should be used during pregnancy only if the potential benefit justifies the potential risk to the fetus. Infants born to mothers who have received substantial doses of corticosteroids during pregnancy should be carefully observed for signs of hypoadrenalism. Nursing Mothers Systemically administered corticosteroids appear in human milk and could suppress growth, interfere with endogenous corticosteroid production, or cause other untoward effects. Because of the potential for serious adverse reactions in nursing infants from corticosteroids, a decision should be made whether to discontinue nursing or to discontinue the drug, taking into account the importance of the drug to the mother.
-------------------------	---

X II. 参考資料

	分類
FDA の分類: Pregnancy Category	C *
オーストラリアの分類: An Australian categorization of risk of drug use in pregnancy	A (2020 年 4 月)

*デキサメタゾン製剤の分類を記載。FDA は 2015 年 6 月 30 日に、Pregnancy Category の表記を終了した。

参考：分類の概要

FDA の分類：Pregnancy Category

Category C：

Animal reproduction studies have shown an adverse effect on the fetus and there are no adequate and well-controlled studies in humans, but potential benefits may warrant use of the drug in pregnant women despite potential risks.

オーストラリアの分類：An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy Category A：

Drugs which have been taken by a large number of pregnant women and women of childbearing age without any proven increase in the frequency of malformations or other direct or indirect harmful effects on the fetus having been observed.

(2) 小児等に関する記載

日本の添付文書の記載は以下のとおりであり、米国の添付文書及び英国の SPC とは異なる。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.7 小児等

長期連用により発育障害をきたすおそれがある。

米国の添付文書 (2019 年 5 月)	PRECAUTIONS Pediatric Use The efficacy and safety of corticosteroids in the pediatric population are based on the well-established course of effect of corticosteroids, which is similar in pediatric and adult populations. Published studies provide evidence of efficacy and safety in pediatric patients for the treatment of nephrotic syndrome (patients >2 years of age), and aggressive lymphomas and leukemias (patients >1 month of age). Other indications for
-------------------------	--

	pediatric use of corticosteroids, e.g., severe asthma and wheezing, are based on adequate and well-controlled trials conducted in adults, on the premises that the course of the diseases and their pathophysiology are considered to be substantially similar in both populations. The adverse effects of corticosteroids in pediatric patients are similar to those in adults. Like adults, pediatric patients should be carefully observed with frequent measurements of blood pressure, weight, height, intraocular pressure, and clinical evaluation for the presence of infection, psychosocial disturbances, thromboembolism, peptic ulcers, cataracts, and osteoporosis. Pediatric patients who are treated with corticosteroids by any route, including systemically administered corticosteroids, may experience a decrease in their growth velocity. This negative impact of corticosteroids on growth has been observed at low systemic doses and in the absence of laboratory evidence of hypothalamic-pituitary-adrenal (HPA) axis suppression (i.e., cosyntropin stimulation and basal cortisol plasma levels). Growth velocity may therefore be a more sensitive indicator of systemic corticosteroid exposure in pediatric patients than some commonly used tests of HPA axis function. The linear growth of pediatric patients treated with corticosteroids should be monitored, and the potential growth effects of prolonged treatment should be weighed against clinical benefits obtained and the availability of treatment alternatives. In order to minimize the potential growth effects of corticosteroids, pediatric patients should be titrated to the lowest effective dose. DOSAGE AND ADMINISTRATION In pediatric patients, the initial dose of dexamethasone may vary depending on the specific disease entity being treated. The range of initial doses is 0.02 to 0.3 mg/kg/day in three or four divided doses (0.6 to 9 mg/m²bsa/day).
--	---

英国の SPC (2019 年 10 月)	4.2 Posology and method of administration Paediatric population The excretion of dexamethasone is approximately equal in children and adults if dosage is adjusted to their body area. Dosage should be planned bearing in mind possible effects upon growth and development and for signs of adrenal suppression. 4.4 Special warnings and precautions for use Paediatric population Corticosteroids cause a dose-dependent inhibition of growth in infancy, childhood, and adolescence since corticosteroids may give rise to early closing of the epiphyses, which may be irreversible. Therefore, during long-term treatment with dexamethasone, the indication should be very strongly presented in children and their growth rate should be checked regularly. Available evidence suggests long-term neurodevelopmental adverse events after early treatment (< 96 hours) of premature infants with chronic lung disease at starting doses of 0.25mg/kg twice daily. 4.8 Undesirable effects Paediatric population Corticosteroids cause a dose-dependent inhibition of growth in infancy, childhood, and adolescence since corticosteroids may give rise to early closing of the epiphyses, which may be irreversible.
----------------------------------	--

XⅢ. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

- 今日お渡しした軟膏の上手な使い方（「X. 5. 患者向け資材」の項参照）

患者さんへ 今日お渡しした軟膏の上手な使い方

- ①うがいを済ませたのち、軟膏をのせる指先をきれいに洗って下さい。
- ②患部をおおうだけの量を指先に取り、のせるように軽く塗布します。
決して擦り込まないで下さい。(患部に付着しやすいように工夫してあります)
- ③塗布後はしばらく(約30分)飲食をさけて下さい。
(夜、おやすみ前が効果的です)
- ④塗布後、違和感を覚えることがありますが、すぐに気にならなくなります。

AP F-11TD



2020年4月
(I-20AYM)