

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018(2019 年更新版)に準拠して作成

副腎皮質ホルモン外用剤

劇薬 サレックス®軟膏 0.05%
サレックス®クリーム 0.05%

Salex Ointment・Cream 0.05%
(ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル軟膏・クリーム)

剤形	サレックス軟膏 0.05%:軟膏 サレックスクリーム 0.05%:クリーム	
製剤の規制区分	劇薬	
規格・含量	1g 中 ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル 0.5mg (0.05%) 含有	
一般名	和名:ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル 洋名:Betamethasone butyrate propionate	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日		軟膏・クリーム
	製造販売承認年月日	2001 年 3 月 15 日
	薬価基準収載年月日	2001 年 7 月 6 日
	販売開始年月日	2001 年 7 月 6 日
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元:岩城製薬株式会社	
医薬情報担当者の 連絡先		
問い合わせ窓口	学術グループ TEL:03-6626-6251 FAX:03-6626-6261 受付時間:9:00~17:00 (12:00~13:00 休憩) 土、日、祝日、当社休日を除く 医療機関向けホームページ https://www.iwakiseiyaku.co.jp/medical.html	

本 IF は 2024 年 6 月改訂の電子化された添付文書(電子添文)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。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

－日本病院薬剤師会－

(2020 年 4 月改訂)

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)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)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF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IF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領 2008 以降、IFは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IFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品のIF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IF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。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、IF記載要領 2018 が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIF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IFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIF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IFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF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利用者自らが内容を充実させ、IF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、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、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、IF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「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、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

IFを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。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

I. 概要に関する項目

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	2
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

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	4
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	4

III. 有効成分に関する項目

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

1. 剤形	6
2. 製剤の組成	7
3. 添付溶解液の組成及び容量	7
4. 力価	7
5. 混入する可能性のある夾雑物	7
6. 製剤の各種条件下における安定性	8
7. 調製法及び溶解後の安定性	8
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8
9. 溶出性	8
10. 容器・包装	8
11. 別途提供される資材類	9
12. その他	9

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果	10
2. 効能又は効果に関連する注意	10
3. 用法及び用量	10
4. 用法及び用量に関連する注意	10
5. 臨床成績	10

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	13
2. 薬理作用	13

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移	17
2. 薬物速度論的パラメータ	17
3. 母集団(ポピュレーション)解析	17
4. 吸収	18
5. 分布	18
6. 代謝	18
7. 排泄	19
8. トランスポーターに関する情報	19
9. 透析等による除去率	19
10. 特定の背景を有する患者	19
11. その他	19

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	20
2. 禁忌内容とその理由	20
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	20
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	20
5. 重要な基本的注意とその理由	20
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	21
7. 相互作用	21
8. 副作用	22
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	23
10. 過量投与	23
11. 適用上の注意	23
12. その他の注意	23

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

- 1. 薬理試験…………… 24
- 2. 毒性試験…………… 24

X. 管理的事項に関する項目

- 1. 規制区分…………… 25
- 2. 有効期間…………… 25
- 3. 包装状態での貯法…………… 25
- 4. 取扱い上の注意…………… 25
- 5. 患者向け資材…………… 25
- 6. 同一成分・同効薬…………… 25
- 7. 国際誕生年月日…………… 25
- 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…………… 26
- 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…………… 26
- 10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその
内容…………… 26
- 11. 再審査期間…………… 26
- 12. 投薬期間制限に関する情報…………… 26
- 13. 各種コード…………… 26
- 14. 保険給付上の注意…………… 26

XI. 文献

- 1. 引用文献…………… 27
- 2. その他の参考文献…………… 27

XII. 参考資料

- 1. 主な外国での発売状況…………… 28
- 2. 海外における臨床支援情報…………… 28

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…………… 29
- 2. その他の関連資料…………… 29

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

主成分であるベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステルは副腎皮質ホルモン剤であり、国内で開発され、1993 年に発売されて以来広く使用されている。本剤は局所においては **Very Strong** としての効力を持つ。検討した結果、極めて有用性が高い薬剤であると判断し発売に至った。

2. 製品の治療学的特性

- (1) ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステルの副腎皮質ホルモン様作用である抗炎症作用、免疫抑制作用による皮膚組織炎症症状の緩和を目的としてステロイド外用剤である。

[VI.薬効薬理に関する項目]

- (2) 次の患者には投与しない。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)、過敏症の既往歴、鼓膜に穿孔のある湿疹性外耳道炎、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。

【【禁忌】、VIII.安全性(使用上の注意等)に関する項目 2. 禁忌内容とその理由]

- (3) 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。

[VIII.安全性(使用上の注意等)に関する項目 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由]]

- (4) 大量又は長期にわたる広範囲の使用[とくに密封法(ODT)]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。本剤の使用により症状の改善が見られない場合又は症状の悪化を見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。

[VIII.安全性(使用上の注意等)に関する項目 5. 重要な基本的注意]

- (5) 重大な副作用として、眼圧亢進、緑内障、白内障が報告されている。眼瞼皮膚への使用に際しては眼圧亢進、緑内障、白内障を起こすおそれがある。大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法(ODT)により、緑内障、後囊白内障等の症状があらわれるおそれがある。

[VIII.安全性(使用上の注意等)に関する項目 8. 副作用]

- (6) 副作用として、皮膚の感染症、長期連用により起こることのある副腎皮質ホルモン特有の皮膚症状、過敏症、副腎皮質ホルモンの全身性副作用としての下垂体・副腎皮質機能の抑制について注意が促されている。[VIII.安全性(使用上の注意等)に関する報告 その他の副作用]

3. 製品の製剤学的特性

本剤は軟膏については白色ワセリンを主体とした油性軟膏、クリームについては水中油型の乳剤性基剤である。ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル外用剤の局所抗炎症効果は **very strong** にランクされている。

I. 概要に関する項目

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材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

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

Ⅱ.名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

サレックス軟膏 0.05%、サレックスクリーム 0.05%

(2) 洋名

Salex Ointment 0.05%、Salex Cream 0.05%

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル (JAN)

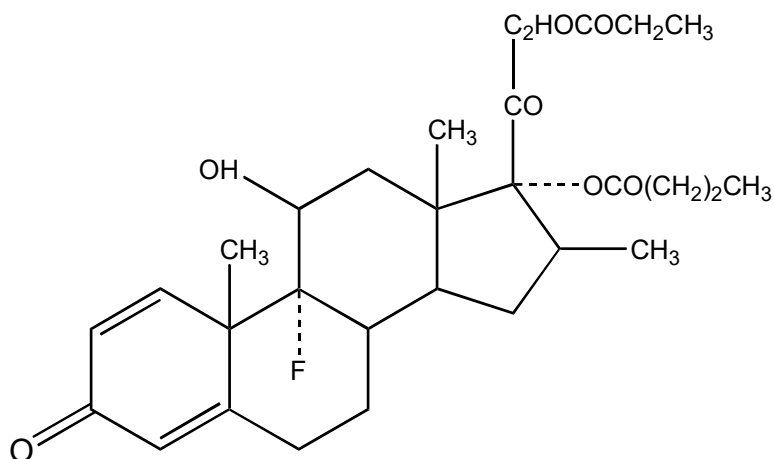
(2) 洋名(命名法)

Betamethasone butyrate propionate(JAN)

(3) ステム(stem)

プレドニゾン、プレドニゾン誘導体: -methasone or -metasone

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式: C₂₉H₃₉FO₇

分子量: 518.61

Ⅱ.名称に関する項目

5. 化学名(命名法)又は本質

(+)-9-Fuloro-11 β ,17,21-trihydroxy-16 β -methylpregna-1,4-diene-3,20-dione 17-butyrate 21-propionate
(IUPAC)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

略号:BBP

別名:酪酸プロピオン酸ベタメタゾン

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

本品は白色の結晶性の粉末で、においはない。

(2) 溶解性

クロロホルム又は 1,4-ジオキサンに極めて溶けやすく、エタノール(95)に溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、ジエチルエーテルにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点

融点: 153~155℃

(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

旋光度: $[\alpha]_D^{20}$: +64~+68° (乾燥後, 0.1g, 1-4-ジオキサン, 10mL, 100mm)

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

- 1) フェーリング試液による呈色反応
- 2) フッ化物の定性反応(2)
- 3) 紫外可視吸光度測定法(237~241nm に吸収の極大)
- 4) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)

(2) 定量法

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

製品	区別
サレックス軟膏 0.05%	軟膏
サレックスクリーム 0.05%	クリーム

(2) 製剤の外観及び性状

製品	外観及び性状
サレックス軟膏 0.05%	白色～微黄色、半透明の油性の軟膏剤で、においはない。 本品 1g に水 10mL を加え、激しく振り混ぜるとき、混和しない。
サレックスクリーム 0.05%	白色～微黄白色のクリーム剤で、においはないか、又はわずかに特異なにおいがある。 本品 1g に水 10mL を加え、激しく振り混ぜるとき、均等に白濁する。

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

[サレックスクリーム 0.05%]

本品を 55～60℃に熱したときの pH は 3.5～5.0 である。

(5) その他

該当しない

IV. 製剤に関する項目

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

販売名	サレックス軟膏 0.05%	サレックスクリーム 0.05%
有効成分	1g 中 ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル 0.5mg (0.05%)	
添加物	パラフィン、流動パラフィン、白色ワセリン(抗酸化剤としてジブチルヒドロキシトルエンを含む)	セタノール、中鎖脂肪酸トリグリセリド、セトマクロゴール 1000、ポリオキシエチレンステアリルエーテル、ポリオキシエチレンセチルエーテル、プロピレングリコール、パラオキシ安息香酸エチル、パラオキシ安息香酸ブチル、エデト酸ナトリウム水和物、pH 調節剤 2 成分、その他 1 成分

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当資料なし

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

該当資料なし

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

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、サレックス軟膏 0.05%及びサレックスクリーム 0.05%は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

[40℃75%RH における安定性試験]

剤形	容器	項目	試験 開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	4 ヶ月	6 ヶ月
軟膏	チューブ (外側:アルミニウム 内側:樹脂コーティング)	含量(%)	101.3	101.7	101.5	101.4	102.0
		外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	ポリエチレン容器	含量(%)	101.3	101.1	101.2	101.7	101.3
		外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
クリーム	チューブ (外側:アルミニウム 内側:樹脂コーティング)	含量(%)	99.2	99.5	99.6	99.9	99.8
		pH	4.6	4.5	4.4	4.4	4.4
		外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし
	ポリエチレン容器	含量(%)	99.2	99.8	100.5	99.9	100.5
		pH	4.6	4.5	4.4	4.4	4.4
		外観	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし	異常なし

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

IV. 製剤に関する項目

(2) 包装

製品	包装単位
サレックス軟膏 0.05%	10 本[5g(チューブ) × 10]、50 本[5g(チューブ) × 50]、 50 本[10g(チューブ) × 50]、500g[ボトル]
サレックスクリーム 0.05%	10 本[5g(チューブ) × 10]、50 本[5g(チューブ) × 50]、 50 本[10g(チューブ) × 50]、600g[ボトル]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

軟膏・クリーム(5g, 10g)	チューブ : アルミニウム チューブ内部: 樹脂コーティング キャップ : ポリエチレン
軟膏(500g)・クリーム(600g)	容 器 : ポリエチレン キャップ : ポリプロピレン

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当資料なし

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

湿疹・皮膚炎群（手湿疹、進行性指掌角皮症、脂漏性皮膚炎を含む）、乾癬、虫さされ、薬疹・中毒疹、痒疹群（ストロフルス、じん麻疹様苔癬、結節性痒疹を含む）、紅皮症、紅斑症（多形滲出性紅斑、ダリエ遠心性環状紅斑）、ジベル薔薇色皰糠疹、掌蹠膿疱症、扁平紅色苔癬、慢性円板状エリテマトーデス、肉芽腫症（サルコイドーシス、環状肉芽腫）、特発性色素性紫斑（マヨッキー紫斑、シャンバーク病）、円形脱毛症、肥厚性瘢痕・ケロイド、悪性リンパ腫（菌状息肉症を含む）、アミロイド苔癬、水疱症（天疱瘡群、ジューリング疱疹状皮膚炎・水疱性類天疱瘡）

2. 効能又は効果に関連する注意

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。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

通常、1日1～数回、適量を患部に塗布する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

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

V. 治療に関する項目

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

17.1 有効性及び安全性に関する試験

ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル軟膏、ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステルクリームの全国延べ 110 施設にて実施された比較試験を含む臨床試験において、効果が判定された 1,301 例（軟膏 650 例、クリーム 651 例）の疾患別有効率は、下表のとおりであり軟膏 85.4%（555/650）、クリーム 83.7%（545/651）であった。

なお 1,301 例のうち、1,285 例（98.8%）が単純塗布であった^{1・2・3・4}。

疾患名	有効率(%)（かなり軽快以上／評価症例）	
	軟膏	クリーム
湿疹・皮膚炎群	91.9（171/186）	88.7（165/186）
乾癬	86.8（92/106）	81.3（87/107）
虫さされ	96.4（27/28）	100（31/31）
薬疹・中毒疹	96.8（30/31）	100（28/28）
痒疹群	93.5（29/31）	83.9（26/31）
紅皮症	93.3（14/15）	81.3（13/16）
紅斑症	100（23/23）	95.5（21/22）
ジベル薔薇色粗糠疹	100（23/23）	92.0（23/25）
掌蹠膿疱症	74.2（23/31）	69.0（20/29）
扁平紅色苔癬	93.8（15/16）	92.3（12/13）
慢性円板状エリテマトーデス	85.7（12/14）	71.4（10/14）
肉芽腫症	78.6（11/14）	72.7（8/11）
特発性色素性紫斑	88.5（23/26）	90.9（20/22）
円形脱毛症	44.4（12/27）	44.8（13/29）
肥厚性瘢痕・ケロイド	35.7（10/28）	64.3（18/28）
悪性リンパ腫	60.0（9/15）	70.6（12/17）
アミロイド苔癬	85.7（12/14）	78.9（15/19）
水疱症	86.4（19/22）	100（23/23）

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

(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

該当しない

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

特になし

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

副腎皮質ホルモン外用剤

・薬効の強さが近い他の副腎皮質ホルモン外用剤の成分 (Very strong)

モメタゾンフランカルボン酸エステル(0.1%)、

フルオシノニド (0.05%)、ベタメタゾンジプロピオン酸エステル(0.064%)、

ジフルプレドナート(0.05%)、アムシノニド(0.1%)、ジフルコルトロン吉草酸エステル(0.1%)、

ヒドロコルチゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル(0.1%)

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

作用部位: 皮膚

作用機序:

18.1 作用機序

ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステルは合成副腎皮質ステロイドであり、グルココルチコイド受容体を刺激することにより抗炎症作用を示す。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

抗炎症作用が期待されるステロイド外用剤の薬理作用として、塗布部分における皮膚の蒼白化(血管収縮反応)が観察されることが知られている⁵⁾。

1) 血管収縮作用

① 血管収縮試験

18.2.1 血管収縮試験

健常成人男子を対象とした皮膚血管収縮試験において、ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル軟膏、クリームは血管収縮作用は、ベタメタゾン吉草酸エステルより強く、ベタメタゾンジプロピオン酸エステルと同等またはそれ以上であった⁶⁾。

VI. 薬効薬理に関する項目

②生物学的同等性試験⁷⁾

サレックス軟膏 0.05%と標準製剤(軟膏剤、0.05%)を、それぞれ健康成人男子 28 名に単回経皮投与し、皮膚毛細血管収縮試験を行い、皮膚毛細血管収縮反応により生じた皮膚蒼白化の程度を判定し、統計解析をした結果、両剤の生物学的同等性が確認された。また、サレックスクリーム 0.05%と標準製剤(クリーム剤、0.05%)について同様の試験を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

4 時間塗布後の血管収縮反応の陽性率 (%)

製剤\製剤除去後経過時間(hr)	2	4	6	24
サレックス軟膏 0.05%	3.6	10.7	28.6	0
標準製剤 (軟膏剤、0.05%)	3.6	3.6	21.4	0
サレックスクリーム 0.05%	3.6	7.1	7.1	0
標準製剤 (クリーム剤、0.05%)	0	7.1	17.9	0

皮膚毛細血管収縮反応の陽性率等は、被験者の選択、血管収縮反応の測定回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(1) 試験方法

背部皮膚に軟膏又はクリームをパッチテスト用絆創膏により各 20mg/1ユニットで貼付した。薬剤貼付時間は 4 時間とし、薬剤除去後一定時間ごとに表1における判断基準で血管収縮反応を観察した。

また安全性の確認として皮膚の自覚症状、薬剤塗布部の皮膚所見、他覚所見、生理学的検査及び臨床検査の確認を行った。

なお対照として無塗布及び各試験製剤の基剤使用の条件で同様の観察を行った。

(2) 結果

軟膏剤、クリーム剤ともに無塗布及びそれぞれの基剤塗布に対して、明らかな血管収縮反応が認められ、有効成分のベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル (酪酸プロピオン酸ベタメタゾン)の薬理効果が確認された。

なお、安全性について有害事象は認められなかった。

各製剤における薬効を裏付ける血管収縮反応についての結果を図 1、図 2 に示す。

表 1 血管収縮試験における判定基準

スコア	判定基準(血管収縮)
0	蒼白化を全く認めない
1	軽度の蒼白化
2	中等度の蒼白化
3	著明な蒼白化

VI. 薬効薬理に関する項目

図1 サレックス軟膏における血管収縮試験(n=28)

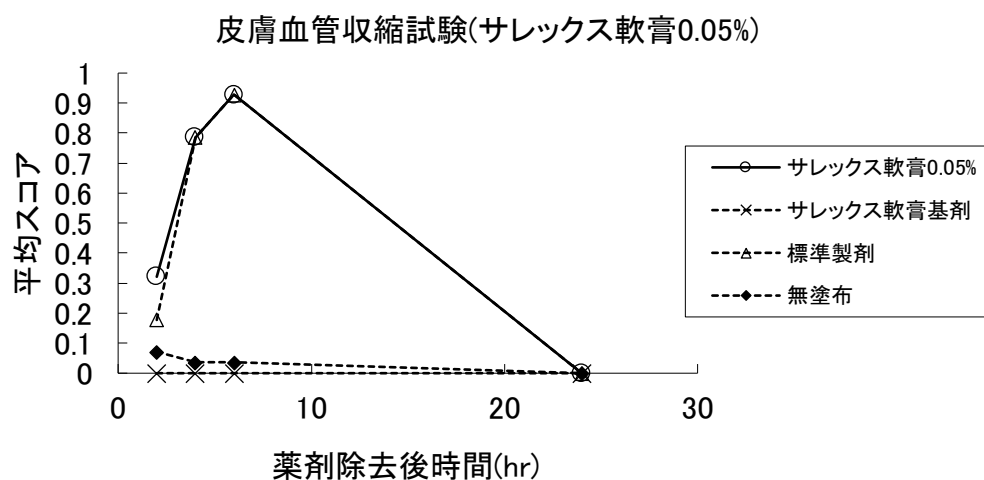
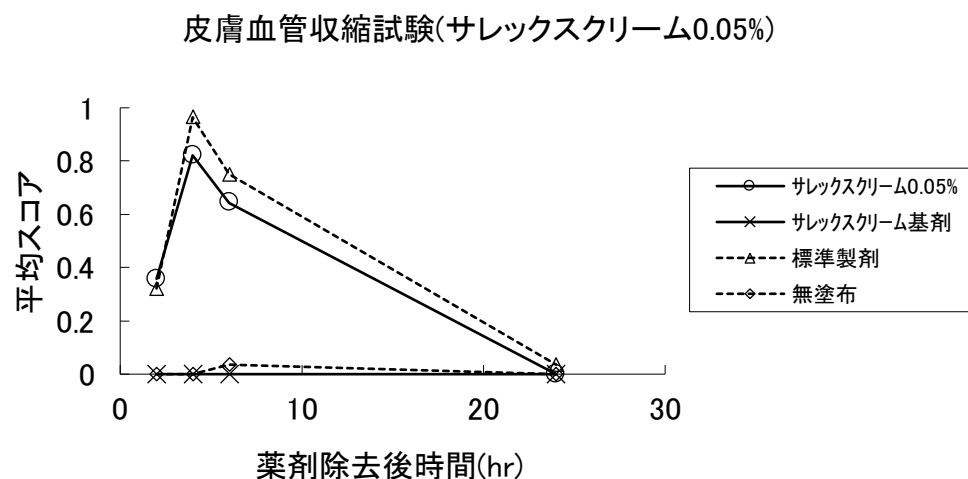


図2 サレックスクリームにおける血管収縮試験(n=28)



2) 抗炎症作用

18.3 抗炎症作用

ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル軟膏、クリームは、ラットカラゲニン足浮腫、ラットクロトン油耳浮腫、ラット 48 時間受動性皮膚アナフィラキシー (PCA) 反応等の各種実験炎症モデルに対して明らかな抗炎症作用を示し、その作用は、クロバタゾールプロピオン酸エステルに劣るものの、ベタメタゾンジプロピオン酸エステル、ベタメタゾン吉草酸エステル及びベクロメタゾンプロピオン酸エステルとほぼ同等であった^{8,9)}。

VI. 薬効薬理に関する項目

3) 抗炎症作用と全身作用の分離

18.4 抗炎症作用と全身作用の分離

ラットろ紙及びクロトン油肉芽腫形成試験において、30%肉芽腫形成抑制用量と 30%胸腺萎縮用量から求めたベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステルの抗炎症作用と全身作用の分離度は、クロベタゾールプロピオン酸エステル、ベタメタゾンジプロピオン酸エステル、ベタメタゾン吉草酸エステル及びベクロメタゾンプロピオン酸エステルのいずれよりも大きかった^{8,10)}。

(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

16.3 分布

ラットに³H-標識ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル軟膏を経皮投与したところ、塗布部の表皮及び真皮中に未変化体が高い割合で存在した（24 時間後 73%及び 79%）。

また、組織内放射能濃度は投与後 8 時間から 24 時間に最高値を示し、肝、腎、副腎及び膀胱に高濃度認められた^{11, 12)}。

(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

VII. 薬物動態に関する項目

(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比,存在比率

該当資料なし

7. 排泄

該当資料なし

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)

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）
[感染症及び動物性皮膚疾患症状を悪化させることがある。]

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

[穿孔部位の治癒が遅れるおそれがある。また、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、治癒が著しく遅れるおそれがある。また、感染のおそれがある。]

(解説)

2.1 副腎皮質ステロイドの免疫機能抑制作用により感染症の増悪を招くおそれがある。

2.3 副腎皮質ステロイドの血管新生及び肉芽増殖に対する抑制作用により上皮化が抑制され、鼓膜穿孔が拡大したり自然閉塞が阻害されるおそれがある。

2.4 副腎皮質ステロイドの血管新生及び肉芽増殖に対する抑制作用により上皮化が抑制されるおそれがある。熱傷・凍傷については真皮に障害の及ぶ第2度以上を禁忌としている。ベーチェット病については副腎皮質ステロイドの使用が必要な場合もあるため除いている。

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V.2.効能又は効果に関する注意」を参照すること

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

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〔とくに密封法（ODT）〕により、副腎皮質ステロイド剤を全身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 参照]，[9.7 参照]，[9.8 参照]，[11.1.1 参照]

8.2 本剤の使用により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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

設定されていない

(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

(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対しては大量又は長期にわたる広範囲の使用を避けること。ラット・ウサギに皮下投与した動物実験で催奇形作用が報告されている^{13,14,15,16)}。[8.1 参照]

(6) 授乳婦

設定されていない

(7) 小児等

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。また、おむつは密封法と同様の作用があるので注意すること。[8.1 参照]

(8) 高齢者

9.8 高齢者

大量又は長期にわたる広範囲の密封法（ODT）等の使用に際しては特に注意すること。一般に高齢者では副作用があらわれやすい。[8.1 参照]

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

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

(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

11.1 重大な副作用

11.1.1 眼圧亢進、緑内障、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、白内障を起こすおそれがある。大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法（ODT）により、緑内障、後囊下白内障等の症状があらわれるおそれがある。[8.1 参照]

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

種類\頻度	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明	注意・処置
皮膚の感染症	皮膚の真菌症（カンジダ症、白癬等）、細菌感染症（伝染性膿痂疹、毛囊炎・癰等）		ウイルス感染症	密封法（ODT）の場合に起こり易い。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本剤の使用を中止すること。
その他の皮膚症状	ざ瘡（痤瘡様発疹、ステロイド痤瘡等）、ステロイド皮膚（皮膚萎縮、毛細血管拡張、ステロイド潮紅等）	ステロイド酒さ・口囲皮膚炎（口囲、顔面全体に紅斑、丘疹、毛細血管拡張、痂皮、鱗屑を生じる）、紅斑、紫斑、多毛、色素脱失、色素沈着	魚鱗癬様皮膚変化	特に長期連用に際しては注意すること。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換えること。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

種類\頻度	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明	注意・処置
その他の皮膚症状	刺激感、湿疹(発赤、苔癬化、腫脹、糜爛等)	接触皮膚炎、皮膚乾燥、掻痒		
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	大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法(ODT)により、きたすことがあるので注意すること。

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

「VIII.5.重要な基本的注意とその理由」を参照すること

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

患者に化粧下、ひげそり後などに使用することのないよう注意すること。

14.2 薬剤投与時の注意

眼科用として角膜、結膜には使用しないこと。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

該当資料なし

(2) 非臨床試験に基づく情報

該当資料なし

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「Ⅵ.薬効薬理に関する項目」を参照すること

(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

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(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

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(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: サレックス軟膏 0.05% 劇薬

サレックスクリーム 0.05% 劇薬

有効成分: ベタメタゾン酪酸エステルプロピオン酸エステル 劇薬

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資料

患者向医薬品ガイド: なし

くすりのしおり: あり

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬

アンテベート軟膏 0.05%、アンテベートクリーム 0.05% 他

同効薬

副腎皮質ホルモン外用剤

・薬効の強さが近い他の副腎皮質ホルモン外用剤の成分 (Very strong)

モメタゾンフランカルボン酸エステル(0.1%)、

フルオシノニド(0.05%)、ベタメタゾンジプロピオン酸エステル(0.064%)、

ジフルプレドナート(0.05%)、アムシノニド(0.1%)、ジフルコルトロン吉草酸エステル(0.1%)、

酪酸プロピオン酸ヒドロコルチゾン(0.1%)

7. 国際誕生年月日

該当資料なし

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

製剤	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
サレックス軟膏 0.05%	2001 年 3 月 15 日	21300AMZ00236000	2001 年 7 月 6 日	2001 年 7 月 6 日
サレックスクリーム 0.05%	2001 年 3 月 15 日	21300AMZ00237000	2001 年 7 月 6 日	2001 年 7 月 6 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

該当しない

10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

該当しない

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 (YJコード)	HOT 番号(9 桁)	レセプト電算処理シ ステム用コード
サレックス軟膏 0.05%	2646730M1032	2646730M1032	114141201	660453018
サレックスクリーム 0.05%	2646730N1038	2646730N1038	114143601	660453017

14. 保険給付上の注意

該当しない

なお、2024 年 4 月薬価改定時に基礎的医薬品となり、従来の診療報酬上の後発医薬品としての取り扱いを終了した。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 久木田淳ほか: 臨床医薬.1990;6(7):1393-1405
- 2) 久木田淳ほか: 臨床医薬.1990;6(8):1693-1713
- 3) 久木田淳ほか: 臨床医薬.1990;6(9):1901-1918
- 4) 久木田淳ほか: 臨床医薬.1990;6(9):1919-1930
- 5) 石原勝:新薬と治療.1985;35:25-29
- 6) 川島眞: 臨床医薬.1990;6(8):1671-1681
- 7) 岩城製薬株式会社社内資料
- 8) 大森健守ほか: 基礎と臨床.1990;24(11):5847-5861
- 9) 大森健守ほか: 基礎と臨床.1990;24(11):5863-5868
- 10) 越山良子ほか: 薬理と臨床.1993;3(9):1493-1500
- 11) 江角凱夫ほか: 薬物動態.1990;5(6):883-902
- 12) 江角凱夫ほか: 薬物動態.1990;5(6):903-923
- 13) 竹島 勉ほか: 基礎と臨床.1990;24(11):5735-5746
- 14) 竹島 勉ほか: 基礎と臨床.1990;24(11):5747-5763
- 15) 今井節夫ほか: 基礎と臨床.1990;24(11):5765-5778
- 16) 西条 敬ほか: 基礎と臨床.1990;24(11):5779-5787

2. その他の参考文献

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

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

本項の情報に関する注意: 本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

該当資料なし

