

日本標準商品分類番号	
876429	
承認番号	22600AMX00559000
薬価収載	2014年5月
販売開始	2014年8月
※再審査結果	2019年6月

駆虫剤

スミスリン[®]ローション5%

SUMITHRIN[®] Lotion 5%

フェノトリンローション

〔禁忌（次の患者には投与しないこと）〕

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	スミスリンローション5%		
剤形	ローション剤		
有効成分	名称	フェノトリン	
	含量	1g中フェノトリン50mgを含有	
添加物	ミリスチン酸イソプロピル、流動パラフィン、グリセリン、ポリオキシエチレンセチルエーテル、モノステアリン酸グリセリン、ジブチルヒドロキシトルエン、パラオキシ安息香酸メチル、カルボキシビニルポリマー、水酸化ナトリウム、精製水		
色調・性状	白色の乳液状製剤で特異なにおいがある		

〔効能・効果〕

疥癬

〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

1. 疥癬については、確定診断された患者又はその患者と接触の機会があり、かつ疥癬の症状を呈する者に使用すること。
- ※ 2. 角化型疥癬及び爪疥癬における有効性及び安全性は確立していない。（使用経験が少ない）

〔用法・用量〕

通常、1週間隔で、1回1本（30g）を頸部以下（頸部から足底まで）の皮膚に塗布し、塗布後12時間以上経過した後に入浴、シャワー等で洗浄、除去する。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

1. ヒゼンダニを確実に駆除するため、少なくとも2回の塗布を行うこと。
2. 2回目塗布以降は1週ごとに検鏡を含めて効果を確認し、再塗布を考慮すること。
3. 疥癬は多くの場合痒疹を伴うが、本剤による治療初期に一過性に増悪することがある。
4. ヒゼンダニの死滅後もアレルギー反応として全身の痒疹が遷延することがある。痒疹が持続しても、特徴的な皮疹の発生や感染が認められない場合には、漫然と再塗布しないこと。

5. 小児では体表面積が小さいことから、1回塗布量を適宜減量すること。

〔使用上の注意〕

※ 1. 副作用

承認時の臨床試験での安全性評価対象症例102例中、臨床検査値の異常を含む副作用の発現は8例（7.8%）に認められた。主な副作用は皮膚炎2例（2.0%）、AST（GOT）上昇2例（2.0%）、ALT（GPT）上昇2例（2.0%）であった。（承認時）

使用成績調査での安全性解析対象症例3,080例中、68例（2.2%）で臨床検査値の異常を含む副作用の発現が認められた。主な副作用は紅斑17例（0.6%）、接触皮膚炎17例（0.6%）、そう痒症15例（0.5%）、皮膚乾燥5例（0.2%）であった。（再審査終了時）

次のような症状又は異常があらわれた場合には、使用を中止するなど適切な処置を行うこと。

種類/頻度	1%～5%未満	頻度不明
皮膚	皮膚炎、接触性皮膚炎、ひびあかざれ（皮膚亀裂）、水疱、末梢性浮腫	皮膚乾燥
肝臓	AST（GOT）上昇、ALT（GPT）上昇	
血液	血小板増加	
末梢神経系	ヒリヒリ感（錯感覚）	

2. 高齢者への投与

一般に高齢者は合併症を有し、もしくは他の薬剤を併用している場合が多いため、注意して使用すること。

※ 3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 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使用すること。〔妊娠中の婦人に対する使用経験が少なく、安全性は確立していない。〕
- (2) 授乳婦への使用は避けることが望ましいが、やむを得ず使用する場合は授乳を避けさせること。

※ 4. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。（低出生体重児、新生児に対しては使用経験がない。乳児、幼児又は小児に対しては使用経験が少ない。）

5. 適用上の注意

使用部位：潰瘍、びらん面への塗布を避けること。
眼、粘膜には使用しないこと。

〔薬物動態〕

健康成人男性（6例）に本剤1本30gを1週間隔で2回塗布し、薬物動態を測定した。洗浄・除去までの時間（適用時間）は初回塗布時24時間、2回目塗布時は72時間とした。本剤の塗布によりフェノトリンは皮膚角質内へ移行し、角質内および体内に吸収されたフェノトリンは洗浄・除去後、適用時間にかかわらず速やかに消失することが確認された¹⁾。

1. 角質層内濃度

初回塗布後24時間時点での皮膚角質中の未変化体(*cis*-フェノトリン及び*trans*-フェノトリン)の濃度の平均値は3.567 μ g/cm²であり、洗浄後、速やかに減少した。

2. 血漿中濃度

初回塗布後、未変化体(*cis*-フェノトリン及び*trans*-フェノトリン)の血漿中濃度はわずかに認められる程度(10ng/mL未満)で、主に代謝物である3-phenoxybenzoic acid (3-PB)として存在した。3-PBの血漿中濃度は24時間後にC_{max}(160.7 \pm 51.3ng/mL)に達し、その後は速やかに減少して168時間後には全例で定量下限値(5ng/mL)未満となった。2回目塗布後、適用時間の増加に伴いAUCの増加傾向が認められたが、初回塗布時と比べC_{max}、T_{max}には変化は認められなかった。

表 未変化体及び3-PBの血漿中の薬物動態パラメータ

	例数	T _{max} (hr)	C _{max} (ng/mL)	AUC _{0-168hr} (ng \cdot hr/mL)
初回塗布時				
<i>cis</i> -フェノトリン ^{注1)}	2	24.0, 24.0	0.6, 2.6	11, 74
<i>trans</i> -フェノトリン	6	14.3 \pm 19.0	2.0 \pm 2.5	50 \pm 71
3-PB	6	24.0 \pm 0.0	160.7 \pm 51.3	6807 \pm 2181
2回目塗布時				
<i>cis</i> -フェノトリン	5	25.6 \pm 14.3	0.9 \pm 0.5	48 \pm 56
<i>trans</i> -フェノトリン	6	17.5 \pm 10.3	1.7 \pm 1.4	114 \pm 133
3-PB	6	21.3 \pm 6.5	150.7 \pm 24.4	9583 \pm 1964

平均値 \pm 標準偏差 注1) *cis*-フェノトリンは2例の測定値を記載

3. 尿中排泄

尿中には3-phenoxybenzoic acidおよび3-(4'-hydroxy)phenoxybenzoic acidとして排出され、適用時間にかかわらず塗布7日後にはほぼ消失した。

〔臨床成績〕

疥癬(通常疥癬)患者(102例)を対象とした非盲検非対照試験において、本剤30gを頸部以下の全身に1週間隔で2回塗布したときの本剤の有効性及び安全性を検討した。主要評価項目である有効率^{注2)}は、92.6%(88/95例、PPS)であった²⁾。

注2) ヒゼンダニ(虫体、虫卵、卵の殻、糞のいずれも)を検出できず、疥癬トンネルの新生がない場合を治癒状態と定義した上で、1週間隔で2回連続して治癒状態と判定された被験者の割合。

〔薬効薬理〕

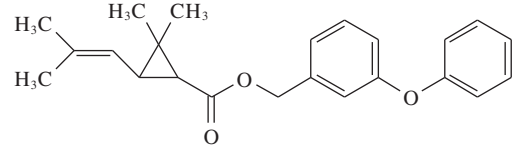
フェノトリンを含むピレスロイド系化合物は、神経細胞のNa⁺チャネルに作用し、その閉塞を遅らせることにより反復的な脱分極あるいは神経伝導を遮断する³⁾ことで殺虫作用を示すとされている。

〔有効成分に関する理化学的知見〕

一般名：フェノトリン

化学名：3-フェノキシベンジル (1*RS*, 3*RS*; 1*RS*, 3*SR*)-2, 2-ジメチル-3-(2-メチルプロポ-1-エニル)シクロプロパンカルボキシレート

化学構造式：



分子式：C₂₃H₂₆O₃

分子量：350.45

性状：微黄色～黄褐色の澄明な油状の液で、わずかに特異なおいがある。

溶解性：エタノール(99.5)、アセトンおよびヘキサンにきわめて溶けやすく、水にほとんど溶けない。

〔包装〕

スミスリンローション5% 30g \times 2本(ボトル)

〔主要文献〕

- 1) 第I相皮膚曝露試験(社内資料)
- 2) 第II/III相試験(社内資料)
- 3) Hutson DH, Roberts TR. Insecticides. New York: John Wiley & Sons Ltd; 1985. 28p.

〔文献請求先〕

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。

クラシエ薬品株式会社 医薬学術部
〒108-8080 東京都港区海岸3-20-20
TEL 03(5446)3352 FAX 03(5446)3371

〔製品情報お問合せ先〕

クラシエ薬品株式会社 お客様相談センター
〒108-8080 東京都港区海岸3-20-20
TEL 03(5446)3334 FAX 03(5446)3374
<受付時間>10:00~17:00(土、日、祝日、弊社休業日を除く)

発売元 **クラシエ薬品株式会社**
東京都港区海岸3-20-20(郵便番号 108-8080)

製造販売元 **クラシエ製薬株式会社**
東京都港区海岸3-20-20(郵便番号 108-8080)