

外用合成副腎皮質ホルモン剤

\*\* **マイザー<sup>®</sup>軟膏0.05%**  
\*\* **マイザー<sup>®</sup>クリーム0.05%**

ジフルプレドナート軟膏・クリーム

\*\* **MYSER<sup>®</sup>Ointment 0.05%, Cream 0.05%**

	軟膏0.05%	クリーム0.05%
** 承認番号	22100AMX01655	22100AMX01676
** 薬価収載	2009年9月	2009年9月
販売開始	1986年7月	1986年7月
効能追加	1991年9月	1991年9月
再審査結果	1993年9月	

貯 法：室温保存

使用期限：外箱、チューブ及びラベルに表示の使用期限内に使用すること

【禁忌】(次の場合には使用しないこと)

- (1)細菌、真菌、ウイルス皮膚感染症〔感染症を悪化させるおそれがある。〕
- (2)本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
- (3)鼓膜に穿孔のある湿疹性外耳道炎〔穿孔部位の治癒の遅延及び感染のおそれがある。〕
- (4)潰瘍(ペ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、治癒が遅延するおそれがある。〕

【組成・性状】

	軟膏0.05%	クリーム0.05%
有効成分 (1g中)	ジフルプレドナート0.5mg(0.05%)	
添加物	プロピレングリコール、ポリオキシエチレンオレイルエーテル、サラシミツロウ、流動パラフィン、白色ワセリン	クロタミトン、ステアリン酸グリセリン、ポリオキシエチレンセチルエーテル、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、クエン酸、クエン酸ナトリウム、エデト酸ナトリウム、プロピレングリコール、白色ワセリン、セタノール、ミリスチン酸イソプロピル
基剤	白色ワセリンを主体とする疎水性基剤	o/w型の親水性基剤
性状・剤形	白色の軟膏・わずかに特異なおい	白色のクリーム・わずかに特異なおい

【効能・効果】

湿疹・皮膚炎群(進行性指掌角皮症、ビダール苔癬、脂漏性皮膚炎、放射線皮膚炎、日光皮膚炎を含む)、痒疹群(蕁麻疹様苔癬、ストロフルス、固定蕁麻疹、結節性痒疹を含む)、虫さされ、乾癬、掌蹠膿疱症、扁平紅色苔癬、ジベルばら色枇糠疹、薬疹・中毒疹、慢性円板状エリテマトーデス、紅斑症(多形滲出性紅斑、ダリエ遠心性環状紅斑、遠心性丘疹性紅斑)、特発性色素性紫斑(マヨッキー紫斑、シャンパーク病、紫斑性色素性苔癬様皮膚炎)、紅皮症、肉芽腫症(サルコイドーシス、環状肉芽腫)、円形脱毛症、アミロイド苔癬(斑状アミロイドーシスを含む)、肥厚性癬痕・ケロイド

【用法・用量】

通常1日1～数回適量を患部に塗布する。  
なお、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

- (1)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。
- (2)大量又は長期にわたる広範囲の密封法(ODT)等の使用により、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。
- (3)本剤の使用により症状の改善をみ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。
- (4)症状改善後は速やかに使用を中止すること。

2. 副作用

＜マイザー軟膏0.05%＞

総症例数12,945例中112例(0.87%)127件の副作用が報告されている。主な副作用は毛のう炎・せつ31件(0.24%)、瘡瘡様発疹22件(0.17%)、ステロイド潮紅・毛細血管拡張14件(0.11%)等であった。(再審査終了時)

＜マイザークリーム0.05%＞

総症例数4,954例中65例(1.31%)70件の副作用が報告されている。主な副作用は毛のう炎・せつ16件(0.32%)、瘡瘡様発疹16件(0.32%)、ステロイド潮紅・毛細血管拡張10件(0.20%)、皮膚萎縮10件(0.20%)等であった。(再審査終了時)

(1)重大な副作用(頻度不明)

眼瞼皮膚への使用に際しては、眼圧亢進、緑内障を起こすおそれがあるので注意すること。  
大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法(ODT)により、後のう白内障、緑内障等があらわれるおそれがある。

(2)その他の副作用(まれに：0.1%未満、ときに：0.1～5%未満、副詞なし：5%以上または頻度不明)

- 1)皮膚の感染症：ときに細菌感染症(毛のう炎、伝染性膿痂疹等)、皮膚の真菌症(カンジダ症、白癬等)、またウイルス感染症があらわれることがある〔密封法(ODT)の場合起こりやすい〕。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、使用を中止すること。
- 2)その他の皮膚症状：長期連用により、ときにステロイド皮膚(毛細血管拡張、皮膚萎縮、紫斑)、瘡瘡様発疹、またまれに色素脱失、軟毛の濃色化等があらわれることがある。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替えること。またまれに刺激感、乾燥等があらわれることがある。

- 3) **過敏症**：紅斑及びときに接触皮膚炎等があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には、使用を中止すること。
- 4) **下垂体・副腎皮質系機能**：大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法(ODT)により、下垂体・副腎皮質系機能の抑制を来すことがあるので注意すること。
3. **高齢者への使用**  
 一般に高齢者では副作用があらわれやすいので、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。
4. **妊婦、産婦、授乳婦等への使用**  
 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人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。〔動物実験(ウサギ)で催奇形作用が報告されている。〕
5. **小児等への使用**  
 長期・大量使用又は密封法(ODT)により発育障害を来すおそれがある。また、おむつは密封法(ODT)と同様の作用があるので注意すること。
6. **適用上の注意**  
 (1) 使用部位：眼科用として使用しないこと。  
 (2) 使用方法：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。

### 【薬物動態】

1. **吸収**<sup>1,2)</sup>  
 〈参考〉  
 ラット又はウサギにジフルプレドナートを正常皮膚に塗布(ODT)した場合、表皮に速やかに浸透し、長時間角質層に貯留した。また、角質層を除去すると吸収が増強された。
2. **分布**<sup>1,2)</sup>  
 〈参考〉  
 ラットではジフルプレドナートは経皮吸収された後、塗布部皮膚内に最も多く分布し、そのほかの臓器としては小腸、肝臓、腎臓、大腸、副腎に分布が認められた。
3. **代謝**<sup>3)</sup>  
 〈参考〉  
 ラットではジフルプレドナートは経皮吸収された後、表皮及び真皮内で21位のアセテートが加水分解され、体循環に入り、次いで17位のブチレートが加水分解されると考えられる。
4. **排泄**<sup>1~3)</sup>  
 〈参考〉  
 ラット又はウサギではジフルプレドナートは代謝された後、主として胆汁を経て糞中に排泄された。

### 【臨床成績】<sup>4~14)</sup>

承認時及び効能・効果の追加承認時における有効性評価対象症例は1,789例であり、有効率は軟膏が89.3%(856例/959例)、クリームが88.8%(737例/830例)であった。

疾患名	有効率(%) [かなり軽快以上]	
	軟膏	クリーム
湿疹・皮膚炎群	96.8(182例/188例)	94.7(177例/187例)
脂漏性皮膚炎	96.7 (29例/30例)	92.9 (26例/28例)
放射線皮膚炎	88.0 (22例/25例)	91.3 (21例/23例)
日光皮膚炎	89.7 (26例/29例)	97.1 (33例/34例)
痒疹群	84.9 (45例/53例)	94.1 (48例/51例)
虫さされ	100.0 (27例/27例)	100.0 (30例/30例)
乾癬	87.9(189例/215例)	77.6 (83例/107例)
掌蹠膿疱症	87.9 (29例/33例)	86.2 (25例/29例)
扁平紅色苔癬	92.0 (23例/25例)	100.0 (23例/23例)
ジベルばら色靴癩疹	85.5 (47例/55例)	87.5 (42例/48例)
薬疹・中毒疹	100.0 (27例/27例)	96.3 (26例/27例)

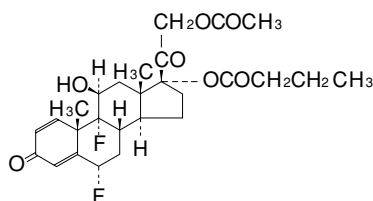
慢性円板状エリテマトーデス	91.7 (22例/24例)	93.3 (28例/30例)
紅斑症	96.3 (26例/27例)	100.0 (30例/30例)
特発性色素性紫斑	93.5 (29例/31例)	93.9 (31例/33例)
紅皮症	95.6 (43例/45例)	93.2 (41例/44例)
肉芽腫症	92.9 (13例/14例)	76.9 (10例/13例)
円形脱毛症	56.0 (14例/25例)	67.9 (19例/28例)
アミロイド苔癬(斑状アミロイドーシスを含む)	73.1 (19例/26例)	72.2 (13例/18例)
肥厚性癬痕・ケロイド	62.8 (27例/43例)	59.0 (23例/39例)
その他	100.0 (17例/17例)	100.0 (8例/8例)

### 【薬効薬理】

1. **血管収縮作用(健常成人)**<sup>15,16)</sup>  
 マイザー軟膏0.05%は密封法においてベタメタゾン吉草酸エステル軟膏に比し強く、マイザークリーム0.05%は単純塗布法においてベタメタゾンジプロピオン酸エステルクリームと同等の血管収縮能を示した。
2. **抗炎症作用(ラット)**<sup>17,18)</sup>  
 ジフルプレドナートのクロトン油耳浮腫抑制作用(局所・経皮)はクロベタゾールジプロピオン酸エステル、フルオシノニド及びジフルコルトロン吉草酸エステルと同等であった。
3. **抗アレルギー作用(マウス)**<sup>17,18)</sup>  
 ジフルプレドナートはPCA反応(皮下・経皮)を抑制し、その作用はフルオシノニドと同等であった。またArthus反応(皮下)及び遅延型アレルギー反応(皮下・経皮)を抑制し、その作用はベタメタゾン吉草酸エステルより強く、フルオシノニドと同等であった。
4. **肉芽増殖抑制作用(ラット)**<sup>17,18)</sup>  
 ジフルプレドナートは局所投与により、クロトン油及びコットンペレット肉芽増殖を有意に抑制し、その際の局所抗炎症作用と全身作用の分離度はヒドロコルチゾン酪酸エステル、ベタメタゾン吉草酸エステル及びフルオシノニドよりも大きかった。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ジフルプレドナート (Difluprednate)  
 化学名：6 $\alpha$ ,9-Difluoro-11 $\beta$ ,17,21-trihydroxy-1,4-pregnadiene-3,20-dione 21-acetate 17-butyrate  
 分子式：C<sub>27</sub>H<sub>34</sub>F<sub>2</sub>O<sub>7</sub>  
 分子量：508.55  
 構造式：



性状：白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。アセトニトリルに溶けやすく、エタノール(95)又は1,4-ジオキサンにやや溶けやすく、水にはほとんど溶けない。  
 融点：約190°C(分解)

### 【包装】

マイザー軟膏0.05% : 5g×10, 5g×50, 10g×10, 10g×50, 30g×10, 100g, 500g  
 マイザークリーム0.05% : 5g×10, 5g×50, 10g×10, 10g×50, 30g×10, 100g, 500g



## 【主要文献及び文献請求先】

### 1. 主要文献

- 1) 藤野明治 他：応用薬理 1985；29(5)：687-699
- 2) 藤野明治 他：応用薬理 1985；29(5)：701-712
- 3) 藤野明治 他：応用薬理 1985；29(5)：713-723
- 4) 渡辺 靖 他：薬理と治療 1985；13(8)：4663-4679
- 5) 久木田淳 他：西日本皮膚科 1986；48(1)：119-135
- 6) 久木田淳 他：皮膚 1985；27(5)：1067-1076
- 7) 久木田淳 他：皮膚 1985；27(5)：1052-1066
- 8) 久木田淳 他：薬理と治療 1985；13(8)：4681-4692
- 9) 齊藤胤曠 他：薬理と治療 1985；13(8)：4693-4703
- 10) 新村真人 他：臨床医薬 1990；6(5)：1027-1037
- 11) 竹村 司：基礎と臨床 1990；24(4)：2147-2155
- 12) 牧野久美 他：基礎と臨床 1990；24(4)：2112-2115
- 13) 三島 豊 他：基礎と臨床 1990；24(3)：1491-1497
- 14) 広根孝衛 他：基礎と臨床 1990；24(5)：2931-2935
- 15) 石原 勝：皮膚科紀要 1985；80(4)：359-366
- 16) 渡辺 靖：西日本皮膚科 1985；47(6)：1105-1111
- 17) 高橋和雄 他：応用薬理 1985；29(3)：343-353
- 18) 高橋和雄 他：応用薬理 1985；29(3)：355-362

### \*\* 2. 文献請求先

- \* 田辺三菱製薬株式会社 くすり相談センター  
〒541-8505 大阪市中央区北浜2-6-18  
電話 0120-753-280



製造販売元

田辺三菱製薬株式会社

大阪市中央区北浜2-6-18

