

貯法：室温保存
有効期間：製造後36箇月

原発性腋窩多汗症治療剤

ソフピロニウム臭化物ゲル

処方箋医薬品^{注)}

エクロック[®]ゲル5% ECCLOCK[®] gel

承認番号	30200AMX00928000
販売開始	2020年11月

注)注意—医師等の処方箋により使用すること

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- 閉塞隅角緑内障の患者[抗コリン作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させることがある。]
- 前立腺肥大による排尿障害がある患者[抗コリン作用により、尿閉を誘発することがある。][9.1.1 参照]
- 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

有効成分	1g中ソフピロニウム臭化物50mg
添加剤	ヒドロキシプロピルセルロース、ヘキシレングリコール、ミリスチン酸イソプロピル、無水クエン酸、無水エタノール

3.2 製剤の性状

性状	無色～微黄色の澄明なゲル又は半透明なゲルである
----	-------------------------

4. 効能又は効果

原発性腋窩多汗症

6. 用法及び用量

1日1回、適量を腋窩に塗布する。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 前立腺肥大症(排尿障害がある場合を除く)の患者
抗コリン作用により排尿障害が発現する可能性がある。当該患者は臨床試験では除外されている。[2.2 参照]

9.1.2 塗布部位に創傷や湿疹・皮膚炎等がみられる患者
使用しないことが望ましい。体内移行量が増加し、抗コリン作用に基づく副作用(散瞳、口渇等)があらわれやすくなる可能性がある。

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。動物実験(ラット：皮下投与)で胎盤通過性が報告されている¹⁾。

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。動物実験(ラット：皮下投与)において、乳汁中に移行することが報告されている¹⁾。

9.7 小児等

12歳未満の小児等を対象とした国内臨床試験は実施していない。

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。

11.2 その他の副作用

	1%以上	1%未満
適用部位	皮膚炎(6.4%)、紅斑(5.7%)、そう痒感、湿疹	汗疹
眼		散瞳、霧視 ^{注)}
消化器	口渇	
その他		ALT増加、AST増加、 γ -GTP増加、好酸球百分率増加

注)長期投与試験で認められた副作用

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 本剤が眼に入った場合、抗コリン作用による散瞳等が発現することがある。また、刺激を感じることもあるので、万一、眼に入った場合は、直ちに水で洗い流すこと。

14.2 薬剤投与時の注意

14.2.1 ボトルに充填された本剤を、ポンプで塗布具(アプリケーター)に吐出させ、塗布具を使用して腋窩に塗布すること。手に直接吐出させて塗布しないこと。手に付着した場合は直ちに手を洗うこと。

14.2.2 各腋窩あたりポンプ1押し分とすること。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 反復投与

原発性腋窩多汗症患者(20歳以上)に本剤を左右の腋窩にポンプ1押し分(ソフピロニウム臭化物として約27mg)ずつ1日1回、6週間塗布した臨床試験における薬物動態パラメータは以下のとおりであった²⁾。

	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (h)	AUC ₀₋₂₄ (ng・h/mL)
投与 2週目	0.17±0.27 (n=25)	3.6±2.2 (n=12)	2.2±3.7 (n=25)
投与 4週目	0.14±0.30 (n=25)	2.7±1.8 (n=11)	1.6±4.0 (n=25)
投与 6週目	0.098±0.17 (n=25)	2.6±2.0 (n=11)	0.87±1.8 (n=25)

Mean±SD

16.3 分布

*In vitro*試験において、ソフピロニウム臭化物のヒト血漿タンパク結合率は20～2000ng/mL(フリー体換算)の濃度範囲で34.8～37.8%であった¹⁾。

16.4 代謝

*In vitro*代謝試験より、ソフピロニウム臭化物の主な代謝経路は非酵素的加水分解反応による脱エチル化であり、CYP2D6及びCYP3A4による酸化代謝も関与することが示されている。原発性腋窩多汗症患者を対象とする28日間反復投与試験にて検出された代謝物は、加水分解による脱エチル体及びシクロペンチルマンデル酸の生成、CYPによる水酸化、水酸化体の脱水による不飽和化及びグリシン抱合の5種類の反応の組み合わせで生成すると推定された。また、本試験における未変化体、脱エチル体及びその他の代謝物の割合を検討した結果、血漿及び尿中の主代謝物は脱エチル体であると推定された¹⁾。

