

## 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2008に準拠して作成

<p>角化性・乾燥性皮膚疾患治療剤</p> <p><b>パスタロン<sup>®</sup>クリーム10%</b></p> <p>PASTARON<sup>®</sup> CREAM 10%</p> <p><b>パスタロン<sup>®</sup>ソフト軟膏10%</b></p> <p>PASTARON<sup>®</sup> SOFT OINTMENT 10%</p> <p><b>パスタロン<sup>®</sup>ローション10%</b></p> <p>PASTARON<sup>®</sup> LOTION 10%</p> <p>(尿素製剤)</p>
---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------

剤形	クリーム剤、ローション剤	
製剤の規制区分	該当しない	
規格・含量	1g中 尿素100mg（10%）を含有する。	
一般名	和名：尿素 洋名：Urea	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	パスタロン クリーム10%	製造販売承認年月日：2007年 3月 5日 薬価基準収載年月日：2007年 6月15日 発売年月日：1978年 3月10日
	パスタロン ソフト軟膏10%	製造販売承認年月日：2007年 1月25日 薬価基準収載年月日：2007年 6月15日 発売年月日：1987年10月20日
	パスタロン ローション10%	製造販売承認年月日：2007年 5月10日 薬価基準収載年月日：2007年12月21日 発売年月日：1990年10月 1日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：佐藤製薬株式会社	
医薬情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	佐藤製薬株式会社 医薬事業部 TEL 03-5412-7817 FAX 03-3796-6560 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.sato-seiyaku.co.jp/top/medical/medical.html">http://www.sato-seiyaku.co.jp/top/medical/medical.html</a>	

本IFは2007年12月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ

<http://www.info.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

# IF利用の手引きの概要

—日本病院薬剤師会—

## 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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者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インタビューフォームが誕生した。

昭和63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「医薬品インタビューフォーム」（以下、IFと略す）の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会において新たなIF記載要領が策定された。

## 2. IFとは

IF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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、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。

### [IFの様式]

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

### [IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。

- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」（以下、「IF記載要領2008」と略す）により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IFの発行]

- ①「IF記載要領2008」は、平成21年4月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2008」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

### 3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、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、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

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があり、その取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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF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。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2008年9月)

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	1	<b>V. 治療に関する項目</b> .....	10
1. 開発の経緯 .....	1	1. 効能又は効果 .....	10
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	2	2. 用法及び用量 .....	10
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	3	3. 臨床成績 .....	10
1. 販売名 .....	3	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	13
2. 一般名 .....	3	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群..	13
3. 構造式又は示性式 .....	4	2. 薬理作用 .....	13
4. 分子式及び分子量 .....	4	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	14
5. 化学名（命名法） .....	4	1. 血中濃度の推移・測定法 .....	14
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	4	2. 薬物速度論的パラメータ .....	14
7. CAS登録番号 .....	4	3. 吸収 .....	15
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	5	4. 分布 .....	15
1. 物理化学的性質 .....	5	5. 代謝 .....	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	6	6. 排泄 .....	16
3. 有効成分の確認試験法 .....	6	7. 透析等による除去率 .....	16
4. 有効成分の定量法 .....	6	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	17
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	7	1. 警告内容とその理由 .....	17
1. 剤形 .....	7	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）..	17
2. 製剤の組成 .....	7	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意と その理由 .....	17
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法 .....	8	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意と その理由 .....	17
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 .....	8	5. 慎重投与内容とその理由 .....	17
5. 製剤の各種条件下における安定性 .....	8	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	17
6. 溶解後の安定性 .....	8	7. 相互作用 .....	17
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	8	8. 副作用 .....	18
8. 溶出性 .....	9	9. 高齢者への投与 .....	20
9. 生物学的試験法 .....	9	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与.....	20
10. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	9	11. 小児等への投与 .....	21
11. 製剤中の有効成分の定量法 .....	9	12. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	21
12. 力価 .....	9	13. 過量投与 .....	21
13. 混入する可能性のある夾雑物 .....	9	14. 適用上の注意 .....	21
14. 治療上注意が必要な容器に関する情報 ...	9	15. その他の注意 .....	21
15. 刺激性 .....	9		
16. その他 .....	9		

16. その他	21
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	<b>22</b>
1. 薬理試験	22
2. 毒性試験	23
<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	<b>24</b>
1. 規制区分	24
2. 有効期間又は使用期限	24
3. 貯法・保存条件	24
4. 薬剤取扱い上の注意点	24
5. 承認条件等	24
6. 包装	24
7. 容器の材質	25
8. 同一成分・同効薬	25
9. 国際誕生年月日	25
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	26
11. 薬価基準収載年月日	26
12. 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
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	26
14. 再審査期間	26
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	26
16. 各種コード	26
17. 保険給付上の注意	26
<b>X I. 文献</b>	<b>27</b>
1. 引用文献	27
2. その他の参考文献	27
<b>X II. 参考資料</b>	<b>28</b>
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
<b>X III. 備考</b>	<b>29</b>
その他の関連資料	29

# I . 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

尿素は従来より注射剤、経口剤の形で脳圧下降剤、利尿剤として用いられてきたが、外用剤として皮膚疾患に応用されるようになったのは比較的近年のことである。すなわち、1968年、Swanbeck<sup>1)</sup>は尋常性魚鱗癬患者に10%尿素含有外用剤を適用し、その有用性を報告するとともに、魚鱗癬皮膚を用いた実験結果により、尿素の効果はその角質水分保有力増強作用にあるとした。さらに、尿素には角質溶解剥離作用が認められている。

### <クリーム>

尿素は外用剤に配合するとき、経時的にアンモニアおよび炭酸ガスへの分解あるいは結晶析出などの傾向があり、製剤化が困難であったが、パスタロンクリーム10%はこの尿素を安定に配合したものである。

### <ソフト軟膏>

日本においては、1978年3月より、パスタロン、ウレパールが薬価基準に収載され、治療に用いられてきた。これらはいずれも水中油型(O/W型)の親水性基剤である。従来より、乾燥性の皮膚疾患には保湿の目的で油脂性基剤が用いられて来たことから、尿素を含有する親油性軟膏の開発を目ざした。尿素は水溶性の成分であり、分解、結晶析出などの傾向があるが、パスタロンソフト軟膏10%は、この尿素を油中水型(W/O型)乳剤性基剤中に安定な状態で配合したものである。

### <ローション>

日本においては、1978年3月より、乾燥性皮膚疾患治療薬としてパスタロン、ウレパールが薬価基準に収載され、治療に用いられてきた。尿素は生体中成分であり、乾燥化した皮疹や角質の正常化を促進することから、比較的広範囲の疾患部位に用いられることが多いため、臨床医から、のびが良く、かつべトツキが少ないローション剤を要望する声も多い。そこで、揮発性アルコールを含有しない乳剤性ローション剤として開発したのが、パスタロンローション10%である。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 尿素の角質水分保有力増強作用により、角質の水和状態を良好にし、角化性乾燥性皮膚疾患に効果をあらわす。
- 2) 基礎研究によれば、尿素は比較的速やかに経皮吸収される。また、連続投与の場合も蓄積性は見られない<sup>2)</sup>。
- 3) パスタロンクリーム 10%は使用感の良い O/W 型乳剤性基剤である。
- 4) 従来の尿素製剤と異なり、パスタロンソフト軟膏10%はW/O型乳剤性基剤のため連続相（外相）が油脂性であり、保護性が高いとされる油脂性軟膏に近い性質を有する。
- 5) パスタロンソフト軟膏10%は、O/W型の尿素軟膏（パスタロンクリーム10%）を対照としたhalf side well controlled comparative studyの結果、刺激等の副作用が有意に少なかった<sup>3)</sup>。
- 6) パスタロンローション10%は保湿因子、塩化ナトリウムを基剤に配合。
- 7) パスタロンローション10%は延びの良いローション剤で、広範囲の患部に塗布しやすい。
- 8) パスタロンローション10%は油分が少なく、さっぱりとした使用感が得られる。

## Ⅱ．名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

パスタロンクリーム 10%

パスタロンソフト軟膏 10%

パスタロンローション 10%

#### (2) 洋名

PASTARON CREAM 10%

PASTARON SOFT OINTMENT 10%

PASTARON LOTION 10%

#### (3) 名称の由来

該当資料なし

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

尿素

#### (2) 洋名（命名法）

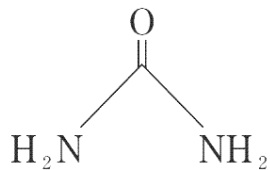
Urea

#### (3) ステム

該当資料なし



3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式： $\text{CH}_4\text{N}_2\text{O}$

分子量：60.06

5. 化学名（命名法）

Urea (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：Carbamide、Carbonyldiamide

記号番号：＜クリーム＞OS-U

＜ソフト軟膏＞SK-201

＜ローション＞SK-801

7. CAS 登録番号

57-13-6

## Ⅲ. 有効成分に関する項目

### 1. 物理化学的性質

#### (1) 外観・性状

本品は無色～白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、冷涼な塩味がある。

#### (2) 溶解性

本品は水に極めて溶けやすく、沸騰エタノール（95）に溶けやすく、エタノール（95）にやや溶けやすく、ジエチルエーテルに極めて溶けにくい。

本品の水溶液（1→100）は中性である。

#### (3) 吸湿性

該当資料なし

#### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：132.5～134.5℃

#### (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

該当資料なし

## 2. 有効成分の各種条件下における安定性

10%尿素水溶液の安定性

経時条件	尿素含量 %	NH <sub>4</sub> <sup>+</sup> 濃度 mM/L	NCO <sup>-</sup> 濃度 mM/L	pH スタート値 6.60
1 週間後	10.00	1.9	1.8	7.8
室温 2 週間後	9.94	3.5	3.1	8.3
3 週間後	9.88	4.6	4.1	8.6
1 週間後	9.96	4.9	3.9	8.2
40℃ 2 週間後	9.85	9.6	9.0	8.6
3 週間後	9.80	10.2	10.1	9.0
1 週間後	9.82	47.6	13.8	9.3
60℃ 2 週間後	9.71	86.9	14.9	9.3
3 週間後	9.69	143.9	13.4	9.4

尿素は約 133℃で融解し、更に加熱するとアンモニア及びビウレットを生じる。

アンモニア



ビウレット



## 3. 有効成分の確認試験法

1) 本品を加熱するとき、液化してアンモニアのにおいを発する。

更に液が混濁するまで加熱を続けた後、冷却し、生じた塊を水 10mL 及び水酸化ナトリウム試液 2mL の混液に溶かし、これに硫酸銅試液 1 滴を加えるとき、液は帯赤紫色を呈する。

2) 本品の水溶液に硝酸を加えるとき、白色の結晶性の沈殿を生じる。

## 4. 有効成分の定量法

日局「窒素定量法」による。

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 投与経路

経皮

#### (2) 剤形の区別、規格及び性状

剤形の区別：クリーム剤、ローション剤

性状：

<クリーム>

O/W型白色乳剤性の軟膏で、わずかに特異なおいがある。

<ソフト軟膏>

W/O型白色～微黄色乳剤性の軟膏で、わずかに特異なおいがある。

<ローション>

白色乳濁性のローション剤で、わずかに特異なおいがある。

#### (3) 製剤の物性

該当資料なし

#### (4) 識別コード

該当しない

#### (5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

該当資料なし

#### (6) 無菌の有無

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

<クリーム、ソフト軟膏、ローション>

1g 中尿素 100mg (10%) を含有する。

## (2) 添加物

### <クリーム>

トリエタノールアミン、塩化 Na、流動パラフィン、ステアリン酸、セタノール、自己乳化型ステアリン酸グリセリン、ソルビン酸、ジメチルポリシロキサン、二酸化ケイ素

### <ソフト軟膏>

ステアリン酸 Al、ステアリン酸 Mg、サラシミツロウ、マイクロクリスタリンワックス、流動パラフィン、グリセリン脂肪酸エステル、グリシン、ブチルパラベン、メチルパラベン、BHT、エデト酸 Na

### <ローション>

塩化 Na、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、トリエタノールアミン、エデト酸 Na、リン酸二水素 K、水酸化 Na、BHT、自己乳化型ステアリン酸グリセリン、セタノール、ベヘニン酸、スクワラン、プロピルパラベン、ブチルパラベン、ジメチルポリシロキサン、二酸化ケイ素

## (3) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

## 3. 用時溶解して使用する製剤の調製法

該当しない

## 4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当資料なし

## 5. 製剤の各種条件下における安定性

40°C75%RH で6ヶ月間ポリエチレン容器に保存した時の成分含量は規格内にあり、品質の劣化を認めない。

## 6. 溶解後の安定性

該当資料なし

## 7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

## 8. 溶出性

該当資料なし

## 9. 生物学的試験法

該当資料なし

## 10. 製剤中の有効成分の確認試験法

1) 本品のアルカリ性溶液を加熱するとき発生するアンモニアをリトマス紙で検出する。

2) Fearon 反応による呈色反応

3) 薄層クロマトグラフ法

薄層板：薄層クロマトグラフ用シリカゲル

展開溶媒：アセトニトリル・メチルエチルケトン・水混液（5：1：1）

検出法：p-ジメチルアミノベンズアルデヒド溶液を噴霧し、105℃で1分間加熱するとき、Rf 値 0.4 付近に黄色のスポットを認める。

## 11. 製剤中の有効成分の定量法

Ehrlich 反応による呈色物の吸収スペクトルを測定する（極大波長：423nm）。

## 12. 力価

該当しない

## 13. 混入する可能性のある夾雑物

尿素の分解生成物はアンモニア及び炭酸ガスである。

## 14. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

## 15. 刺激性

該当資料なし

## 16. その他

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

パスタロンクリーム 10%、パスタロンソフト軟膏 10%

老人性乾皮症、アトピー皮膚、進行性指掌角皮症（主婦湿疹の乾燥型）、足蹠部皸裂性皮膚炎、掌蹠角化症、毛孔性苔癬、魚鱗癬

パスタロンローション 10%

老人性乾皮症、アトピー皮膚、進行性指掌角皮症（主婦湿疹の乾燥型）、足蹠部皸裂性皮膚炎、掌蹠角化症、毛孔性苔癬、魚鱗癬、頭部秕糠疹

### 2. 用法及び用量

1日2～3回、患部を清浄にしたのち塗布し、よくすり込む。

なお、症状により適宜増減する。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ（2009年4月以降承認品目）

該当資料なし

#### (2) 臨床効果<sup>3)～15)</sup>

<クリーム>

国内延べ45施設、総症例944例について実施したパスタロンクリーム10%の二重盲検及び一般臨床を含む臨床試験の成績は次のとおりである。

疾患名	有効率
老人性乾皮症	89.3% (183/205)
アトピー皮膚	76.7% (204/266)
進行性指掌角皮症	66.7% (116/174)
足蹠部皸裂性皮膚炎	83.3% (10/12)
掌蹠角化症	41.2% (7/17)
毛孔性苔癬	42.9% (6/14)
魚鱗癬	87.1% (223/256)
総合計	79.3% (749/944)

<ソフト軟膏>

パスタロンクリーム 10%（尿素 10%配合の O/W 型乳剤性軟膏）を対照薬として国内 3 施設で実施した half side well controlled comparative study の結果は次のとおりである。

薬 剤	有 用 以 上	やや有用以上
パスタロンソフト軟膏 10%	59.2% (45/76)	89.4% (68/76)
パスタロンクリーム 10%	52.6% (40/76)	88.1% (67/76)

両薬剤の有用性には有意差は認められなかった。

薬剤	パスタロンソフト軟膏10%	
	有用以上	やや有用以上
有用率		
疾患名		
乾皮症	77.2% (17/22)	100% (22/22)
アトピー皮膚	63.6% (21/33)	84.8% (28/33)
毛孔性苔癬	33.3% ( 7/21)	85.7% (18/21)
薬剤	パスタロンクリーム10%	
	有用以上	やや有用以上
有用率		
疾患名		
乾皮症	77.2% (17/22)	95.5% (21/22)
アトピー皮膚	51.5% (17/33)	84.8% (28/33)
毛孔性苔癬	28.6% ( 6/21)	85.7% (18/21)

<ローション>

2 施設 47 例の臨床試験の結果は次の通りである。

有 効 以 上	66.0%
やや有効以上	91.5%

疾 患 名	有効性			
	著効	有効	やや有効	無効
進行性指掌角皮症	2	1		2
アトピー皮膚	1	2	4	
老人性乾皮症		4		
毛孔性苔癬	5	3	5	1
汗疱状皮膚炎	2	1		
皸裂性湿疹	2	1	1	
皮脂欠乏性湿疹	1			
足蹠角化症	4	1		1
手掌角化症			1	
魚鱗癬		2		



(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

該当資料なし

## 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

ヘパリン類似物質

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

作用部位：皮膚角質

作用機序：角質の水分保有力増強

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(参考) 尿素 10% 含有 O/W 型乳剤性軟膏 (パスタロンクリーム 10%) による試験成績  
水分保有力増強作用

: モルモット後肢足蹠皮膚切片に本剤を塗布したのち、81% 相対湿度下に放置したとき、水分保有力増強作用が認められた<sup>16)</sup>。

: ヒト足蹠正常角質切片に本剤を塗布したのち、冬場を想定した 50% 相対湿度下に放置した場合、基剤のみものものに比べ角質切片は乾燥しにくい<sup>17)</sup>。また、走査型電子顕微鏡での観察によれば、本剤塗布患部はなめらかとなり、角質細胞間隔は狭小となる<sup>18)</sup>。

#### (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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

<sup>14</sup>C-尿素の 10%0/W 型乳剤性軟膏をラット背部に塗布したとき、血中濃度は投与後 3 時間で最大値を示し、以降速やかに消失した。また、皮下投与では投与後 1 時間で最大値を示した<sup>2)</sup>。

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

(1) コンパートメントモデル

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

該当資料なし

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 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

<sup>14</sup>C-尿素をラット皮下に投与し、1、5、48 時間後に臓器の放射能を測定した結果、投与後 1 時間で最大値を示し、臓器分布は主に腎髄質、腎皮質、肺、肝、脾、睾丸、心にみられ、48 時間後にはほとんど消失した<sup>2)</sup>。

## 5. 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（CYP450 等）の分子種

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比率

該当資料なし

### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排泄

### (1) 排泄部位及び経路

### (2) 排泄率

ラットに  $^{14}\text{C}$ -尿素を皮下投与したところ、24 時間後までに尿中へ 78.37%、呼気中へ 13.83%、糞中へ 0.14% 排泄された<sup>2)</sup>。

### (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. 透析等による除去率

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

該当しない

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の場合には慎重に使用すること）

- 1) 炎症、亀裂を伴う症例 [一過性の刺激症状を生じることがある。]
- 2) 皮膚刺激に対する感受性が亢進している症例 [一過性の刺激症状を生じることがある。]

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

- 1) 皮膚への適用以外（眼粘膜等の粘膜）には使用しないこと。
- 2) 潰瘍、びらん、傷面への直接塗擦を避けること。

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

該当しない

#### (2) 併用注意とその理由

該当しない

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

パスタロンクリーム 10%を投与した総症例 4,163 例中副作用が報告されたのは 224 例 (5.4%) で、主な副作用は刺激感 (しみる、疼痛、灼熱感) 4.6%、掻痒 1.2%、潮紅 (発赤を含む) 1.3%であった。 [副作用調査終了時、1981 年]

以下のような副作用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。

種類 \ 頻度	5%以上又は 頻度不明	0.1%~5%未満	0.1%未満
一過性又は投与 初期にあらわれ る刺激症状	疼痛、熱感等	潮紅、掻痒感	
過 敏 症	過敏症状		
皮 膚		湿疹化、亀裂	腫脹、乾燥化、丘疹

### (2) 重大な副作用と初期症状

該当しない

### (3) その他の副作用

該当しない

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

<クリーム>

尿素 10%含有 O/W 型軟膏（パスタロンクリーム 10%）承認時及び承認時以降の調査<sup>19)</sup>

対 象 \ 時 期	承認時迄 の調査	承認時以降 の調査 昭和 56 年 3 月 9 日迄	計
調 査 施 設 数 ①	45	29	74
調 査 症 例 数 ②	1,059	3,104	4,163
副作用発現症例数③	183	41	224
副作用発現件数④	252	61	313
副作用発現症例率 (③ / ② × 100)	17.3%	1.3%	5.4%
副作用の種類	副作用発現件数 (%)		
刺激感 (しみる、疼痛、灼熱感など)	154 (14.5)	36 (0.3)	109 (4.6)
瘙 癢	38 (3.7)	10 (0.3)	48 (1.2)
潮紅 (発赤を含む)	43 (4.2)	10 (0.3)	53 (1.3)
亀 裂	4 (0.4)	1 (0.03)	5 (0.1)
腫 脹	1 (0.1)	1 (0.03)	2 (0.05)
乾 燥 化	1 (0.1)	2 (0.06)	3 (0.07)
つ っ ぱ り 感	-	1 (0.03)	1 (0.02)
丘 疹	3 (0.3)	-	3 (0.07)
冷 たく 感 じ る	2 (0.2)	-	2 (0.05)
湿 疹 化	6 (0.6)	-	6 (0.1)

<ソフト軟膏>

	症例数 (%)
総 症 例 数	76 例
副作用発現症例数	4 (5.3)
刺激感	3 (3.9)
潮紅 (発赤を含む)	3 (3.9)

(項目別副作用は延べ例数)

<ローション>

治験実施例 47 例中 1 例 (2.1%) に発赤が認められた<sup>20)</sup>。



(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

尿素 10%含有 O/W 型乳剤性軟膏（パスタロンクリーム 10%）承認時以降の調査<sup>19)</sup>

a 性別

対象 \ 性別	男	女	計
調査症例数	1,187	1,917	3,104
副作用発現症例数	10	31	41
副作用発現件数	10	51	61
副作用発現症例率	0.8%	1.6%	1.3%

b 年齢別

対象 \ 年齢別	0～12 歳	13～64 歳	65 歳～	計
調査症例数	618	2,202	284	3,104
副作用発現症例数	17	24	-	41
副作用発現件数	18	43	-	61
副作用発現症例率	2.8%	1.1%	0%	1.3%

c 疾患別

対象 \ 疾患別	アトピー 皮膚	進行性指 掌角皮症	老人性 乾皮症	掌 蹠 角化症
調査症例数（延）	512	819	247	160
副作用発現症例数	15	16	2	1
副作用発現件数	17	28	2	1
副作用発現症例率	2.9%	2.0%	0.8%	0.6%
対象 \ 疾患別	足蹠部 皸裂性 皮膚炎	毛孔性 苔 癬	魚鱗癬	その他
調査症例数（延）	223	214	113	837
副作用発現症例数	1	-	3	3
副作用発現件数	4	-	4	5
副作用発現症例率	0.4%	0%	2.7%	0.4%

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

該当資料なし

9. 高齢者への投与

該当しない

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

該当しない

11. 小児等への投与

該当しない

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

該当しない

15. その他の注意

該当しない

16. その他

## 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」参照)

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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

急性毒性（尿素）<sup>21)</sup>

LD<sub>50</sub> (g/kg)

動物	性	投与経路		
		経口	皮下	静脈内
マウス	♂	11.5	9.2	4.6
	♀	13.0	10.7	5.2
ラット	♂	14.3	9.4	5.4
	♀	15.0	8.2	5.3

### (2) 反復投与毒性試験<sup>21)</sup>

尿素 10%、20%及び 40%含有 O/W 型乳剤性軟膏 0.54g をラット頸背部に 1 日 1 回 4 週間及び、24 週間連続塗布した結果、一般症状及び尿、血液、血清生化学検査に特異的な異常は認められなかった。

### (3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

### (4) その他の特殊毒性<sup>22)、23)</sup>

#### 1) 刺激性

皮膚一次刺激性、眼粘膜刺激性を検討したところ、いずれも弱い刺激性が認められた（ウサギ）。

#### 2) 光毒性・光アレルギー性

10、20 及び 30%尿素含有 O/W 型乳剤性軟膏の光毒性試験を行ったところ、いずれの製剤とも光毒性反応は認められなかった（ウサギ）。

また、20%尿素含有 O/W 型乳剤性軟膏の光アレルギー性試験の結果、光アレルギー性を認めなかった（モルモット）。

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（外箱又は500g容器の底面に記載）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### （1）薬局での取り扱いについて

本剤は金属と接触させた場合、着色することがある。ステンレスヘラを長時間、本剤と接触させたままで放置しないこと。

#### （2）薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

該当資料なし

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

<クリーム、ソフト軟膏>

20g×10、20g×50、50g×10（プラスチックチューブ）

500g（プラスチック容器）

<ローション>

20g×20、20g×50、50g×10（プラスチック容器）

## 7. 容器の材質

### <クリーム>

20g :

チューブ : ポリエチレン

キャップ : ポリプロピレン

50g :

チューブ : ポリエチレン

キャップ : ポリプロピレン

500g :

容器 : ポリエチレン

キャップ : ポリプロピレン

### <ソフト軟膏>

20g :

チューブ : ポリエチレン、エバール

キャップ : ポリエチレン

50g :

チューブ : ポリエチレン、エバール

キャップ : ポリプロピレン

500g :

容器 : ポリエチレン

キャップ : ポリプロピレン

パッキン : ポリエチレン

### <ローション>

20g、50g :

容器 : ポリエチレン

中栓 : ポリエチレン

キャップ : ポリプロピレン

## 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬 : パスタロンクリーム・ソフト軟膏 20%、ウレパールクリーム・ローション  
10%、ケラチナミンコーワ軟膏 20%

同 効 薬 : 、ヘパリン類似物質等

## 9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：<クリーム>2007年3月5日  
<ソフト軟膏>2007年1月25日  
<ローション>2007年5月10日  
承認番号：<クリーム>21900AMX00211  
<ソフト軟膏>21900AMX00035  
<ローション>21900AMX00928

11. 薬価基準収載年月日

<クリーム>2007年6月15日  
<ソフト軟膏>2007年6月15日  
<ローション>2007年12月21日

12. 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

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は厚生労働省告示第99号(平成14年3月18日付)による薬剤投与期間の影響を受けない。

16. 各種コード

販売名	HOT(9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト 電算コード
パスタロンクリーム10%	115668301	2669701N1052	620005284
パスタロンソフト軟膏10%	115669001	2669701M1073	620005286
パスタロンローション10%	115670601	2669701Q1059	620006479

17. 保険給付上の注意

なし

# X I . 文 献

## 1. 引用文献

- 1) Swanbeck, G. ; Acta Derm. Venereol., 48, 123 (1968)
- 2) 相川一男 他 : 応用薬理 13, 743 (1977)
- 3) 久木田淳 他 : 基礎と臨床 21, 4763 (1987)
- 4) 安田利顕 他 : 臨床評価 5, 103 (1977)
- 5) 安田利顕 他 : 臨床皮膚科 29, 55 (1975)
- 6) 堀 嘉昭 : 西日本皮膚 37, 860 (1975)
- 7) 本田光芳 他 : 新薬と臨床 24, 113 (1975)
- 8) 神田行雄 他 : 診療と新薬 12, 215 (1975)
- 9) 永島敬士 他 : 新薬と臨床 24, 257 (1975)
- 10) 松中成浩 他 : 皮膚 18, 414 (1976)
- 11) 長島正治 他 : 薬物療法 7, 1739 (1974)
- 12) 星 健二 : 新薬と臨床 24, 1974 (1975)
- 13) 島崎 匡 : 新薬と臨床 24, 1977 (1975)
- 14) 栗原誠一 : 社内資料
- 15) 社内資料
- 16) 社内資料
- 17) 社内資料
- 18) 堀 嘉昭 他 : 臨床皮膚科 30, 821 (1976)
- 19) 厚生省 : 医薬品副作用情報 No. 52 (1981)
- 20) 社内資料
- 21) 佐藤信治 他 ; 応用薬理 13, 749 (1977)
- 22) 船井建三 他 ; 薬理と治療 3, 1242 (1975)
- 23) 船井建三 他 ; 薬理と治療 3, 1441 (1975)

## 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

Calmurid (スウェーデン、オーストラリア、他)

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## XⅢ. 備考

その他の関連資料

該当資料なし