

** 2019年 4月改訂 (第 8 版、販売会社変更に伴う改訂)
* 2013年 5月改訂 (組成・性状の変更)

日本標準商品分類番号
872699

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示

承認番号	14200AZZ00590000
薬価収載	1976年 9月
販売開始	1967年 9月
再評価結果	1979年 2月

尋常性白斑治療剤

オクソラレン[®]軟膏0.3%

OXSORALEN[®] OINTMENT 0.3%

メトキサレン製剤

【警告】

PUVA 療法により皮膚癌が発生したとの報告がある。

【禁忌 (次の患者には投与しないこと)】

1. 皮膚癌又はその既往歴のある患者 [皮膚癌が増悪又は再発するおそれがある。]
2. ポルフィリン症、紅斑性狼瘡、色素性乾皮症、多形性日光皮膚炎等の光線過敏症を伴う疾患のある患者 [光毒性反応が増強される。]

*【組成・性状】

販売名	オクソラレン軟膏 0.3 %	
成分・含量	1g 中 日局 メトキサレン 3mg	
添加物	軽質流動パラフィン 白色ワセリン サラシミツロウ 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リン酸ナトリウム ポリオキシエチレンセチルエーテル ラウロマクロゴール ポリオキシエチレンステアリルエーテル	
販売名	識別コード	剤形
オクソラレン軟膏 0.3 %	TAISHO 131	白色の W/O 型軟膏

【効能・効果】

尋常性白斑

【用法・用量】

白斑部位にのみ適量を塗布し、1～2時間後に日光浴あるいは人工紫外線の照射を行う。

通常、同一白斑部位においては、週1～3回程度の治療施行が望ましい。限局性の白斑には外用療法が望ましい。

用法・用量に関連する使用上の注意

1. 紫外線を照射する場合、照射源及び個人差に応じて至適量を個々に把握する必要がある。その目安としては、照射した翌日の治療白斑部位が軽度ピンク色に発赤し、持続する程度が適当である。
2. 特に最初の照射量は、皮膚炎を防止する上からも、最少紅斑量以下から開始することが望ましく、一応の目安として、日光浴の場合は5分より始め、人工紫外線照射の場合は、光源より20～30 cmの距離から1分より始

め、以後白斑部位の皮膚症状により漸増・漸減して至適量を把握し、照射すること。

3. 本剤は360 nmをピークとする波長に高い活性を有するので、主として360 nm付近の波長を有する Black-light の照射が望ましい。

【使用上の注意】

1. 慎重投与 (次の患者には慎重に投与すること)

薬剤性光線過敏症及び光線過敏症の既往歴のある患者 [光毒性反応が増強されるおそれがある。]

2. 重要な基本的注意

(1) 紫外線照射後そのまま放置しておくこと過度の皮膚炎症状を起こすおそれがあるので、エタノール綿又は石ケン等で洗い流すか、入浴してよく洗い流すこと。

また、必要に応じて、直接日光に当たらないよう注意させること。

(2) PUVA 療法により皮膚癌が発生したとの報告があるので、治療前には患者によく説明し、PUVA 療法施行後は患者の皮膚の状態に注意すること。また、紫外線照射の蓄積により皮膚癌の発生頻度が高まるとの報告があるので、長期にわたり漫然と治療しないこと。

3. 相互作用

本剤は、代謝酵素肝チトクローム P450 (CYP) 2A6 の阻害作用を有することから、本酵素で代謝される他の薬剤の血中濃度を上昇させるおそれがある。〔「薬物動態」の項参照〕併用注意 (併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
光線過敏症を起こすことが知られている薬剤：ピリドンカルボン酸系薬剤、テトラサイクリン系薬剤、サルファ剤、タール製剤、チアジド系薬剤、ポルフィリン系薬剤、フェノチアジン系薬剤等	光線過敏症が発現するおそれがある。	本剤は光感受性を高める作用があるので、左記薬剤との併用又は食品の摂取により光感受性が増強されるおそれがある。
フロクマリンを含有する食物：セロリ、ライム、ニンジン、パセリ、イチジク、アメリカボウフウ、カラシ等		
CYP2A6 によって代謝される薬剤：レトロゾール、塩酸ファドロゾール水和物、ピロカルピン塩酸塩等	左記薬剤の作用を増強させるおそれがある。	本剤は、CYP2A6 を阻害することにより、左記薬剤の血中濃度を上昇させるおそれがある。

4. 副作用

総症例 205 例中 41 例 (20.00 %) 54 件 (26.34 %) の副作用が認められた。その主なものは発赤 19 件、水疱 15 件であった。[再評価終了時]

	5～10%未満	5%未満
皮膚	発赤、水疱 ^{注)}	皮膚炎、そう痒、潮紅、落屑、腫脹 ^{注)} 、痂皮

注)：紫外線の過剰照射によりあらわれることがある。このような場合には治療を中止すること。なお、治癒後に治療を再開する場合には、照射量を減ずること。

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているため治療方法に留意すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、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まわると判断される場合にのみ投与すること。

7. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。

8. 適用上の注意

塗布時：指先等患部以外の部位に付着した場合は、エタノール綿又は石ケン等で洗い流すこと。

9. その他

乾癬のある患者に使用した場合、皮膚癌が発現し易くなるおそれがある。

【薬物動態】

代謝・排泄^{1)～3)}

(参考) 動物による成績：

ラット(雄、Wistar系)の1%³H-メトキサレン(0.5 mg/kg)塗布による経皮吸収は良好であり、尿糞への排泄は塗布後24時間以内に尿中へ22.0%、糞中へ6.1%が排泄された。

ヒト肝ミクロソームを用いた *in vitro* 試験の結果、メトキサレンはCYP1A1、1A2、2A6等の肝代謝酵素で代謝されることが示された。また、CYP2A6を阻害することが報告されている。

【臨床成績】

再評価時の臨床試験の成績は以下の通りである。

疾患名	改善率(%)【改善以上】
尋常性白斑	60.9 (145/238)

【薬効薬理】

光感受性増強作用^{4)～6)}

メトキサレンは皮膚の光線感受性を増強させる作用を有し、特に長波長側の紫外線(320～400 nm)に対する感受性を増す。メトキサレンを投与した患者に紫外線を照射すると、皮膚の角質層が肥厚し、炎症反応が見られ、露光部にメラニンが沈着する。白斑患者の色素沈着や色素過剰沈着が起こる機序はま

だわかっていないが、皮膚の白斑部位に存在する少数のメラニン細胞を活性化し、メラニン形成細胞の分裂を起こさせる。毛嚢周辺部や上皮内の色素の増加は、(1)機能しているメラノサイトの数の増加及びおそらくは活性化、(2)メラノソームの合成促進、(3)チロシンをドーパに転換するチロシナーゼの活性増加、(4)メラノサイトの肥大及び樹状突起の枝分かれの増加、が単一に又は組み合せて起こるものと考えられている。

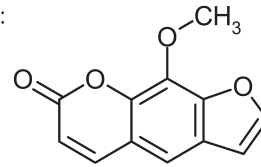
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：メトキサレン(methoxsalen)(JAN)

化学名：9-Methoxy-7H-furo[3,2-g]chromen-7-one

略称：8-MOP

構造式：



分子式：C₁₂H₈O₄

分子量：216.19

性状：白色～微黄色の結晶又は結晶性の粉末で、におい及び味はない。クロロホルムに溶けやすく、メタノール、エタノール(95)又はジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

融点：145～149℃

【包装】

10g×10

【主要文献】

- 1) 野津隆司ほか：応用薬理, **18** (3), 489-496 (1979)
- 2) 社内資料(代謝に関与する肝チトクロームP450に関する資料)
- 3) Koenigs, L. L. et al.: Drug Metab. Dispos., **25** (12), 1407-1415 (1997)
- 4) Pathak, M. A. et al.: J. Invest. Dermatol. **48** (3), 103-118 (1967)
- 5) Becker, S. W.: J. Am. Med. Ass. **173** (13), 1483-1485 (1960)
- 6) Mosher, D. B., et al.: Vitiligo; Etiology, Pathogenesis, Diagnosis, and Treatment. *In* Update: Dermatology in General Medicine, ed. by Fitzpatrick T. B. et al. p.205-225 New York: McGraw-Hill Book Company (1983)

**【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。

大正製薬株式会社 メディカルインフォメーションセンター
〒170-8633 東京都豊島区高田3-24-1
電話 0120-591-818



製造販売
大正製薬株式会社
東京都豊島区高田3-24-1