

医薬品インタビューフォーム

5%サリチル酸ワセリン軟膏東豊

10%サリチル酸ワセリン軟膏東豊

5% Salicylic Acid Ointment

10% Salicylic Acid Ointment

日本標準商品分類番号	872652
薬効分類	寄生性皮膚疾患剤
作成年月日	1986年8月18日
改訂年月日	2021年7月14日
改訂理由	使用上の注意（妊婦、産婦、授乳婦等への投与）改訂による

東豊薬品株式会社

東京都葛飾区西新小岩4-15-3

[I] 医薬品の名称に関する項目

1. 商品名 [和名] : 5%サリチル酸ワセリン軟膏東豊
10%サリチル酸ワセリン軟膏東豊

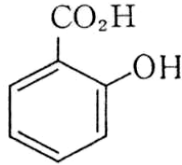
[洋名] : 5% Salicylic Acid Ointment
10% Salicylic Acid Ointment

2. 一般名 [和名] : (日局) サリチル酸
[洋名] : (J P) Salicylic Acid

3. ラテン名 : ACIDUM SALICYLICUM

4. 化学名 : o-Hydroxybenzoic acid

5. 化学構造式 :



6. 分子式 : $C_7H_6O_3$

7. 分子量 : 138.12

8. 起 源

1823年 Leroux はヤナギ *salix* の樹皮からサリシン (salicin) の結晶を得た。1839年 Piria はサリシンの研究を進め、サリシンがサリチルアルコールのグリコシドであることを見出し、サリチルアルデヒドをアルカリ処理してサリチル酸を得ている。これより以前 1833年に Pagenstecher はシモツケ属 *Spiraerulmaria* の花からサリチルアルデヒドを単離している。1840年 Löwing 及び Weidmann は *Spiraea ulmaria* の花から、又ブドウ酒からサリチル酸を抽出し、1843年 A. Cahours は *Gaultheria procumbens* の揮発油 (冬緑油) の主成分がサリチル酸メチルであることを知り、これを水酸化アルカリでけん化し、サリチル酸を製造した。それ以後 H. Kolbe のフェノールからの合成法が工業的に完成するまでは植物界の資源に依存していた。1852年 A. Cahours、B. W. Geland はアントラニル酸を亜硝酸で処理し本品を得ている。1859年 H. Kolbe が金属ナトリウムの存在下石炭酸に二酸化炭素を反応させる合成法を発明したが当時は品質が悪くまた収率も低かった。その後鋭意改良に努め 1874年 R. Schmitt は工業的製造を完成した。R. B. Barkley はフェノールと炭素数 5~20 の脂肪族アルコールを触媒とし、無水の状態でフェノールのアルカリ塩を 120°C 以上に加熱しながら二酸化炭素を反応させて、サリチル酸を得る方法を発表している。

[II] 原薬の理化学的性質に関する事項

1. 規 格 日局による。

本品を乾燥したものは定量するとき、サリチル酸 ($C_7H_6O_3$) 99.5~101.0%を含む。

性 状 : 本品は白色の結晶又は結晶性の粉末で、僅かに酸味があり、刺激性である。

本品はエタノール (95) 又はアセトンに溶けやすく、水に溶けにくい。

確認試験 : (1) 本品の水溶液 (1→500) はサリチル酸塩の定性反応 (1) 及び (3) を呈する。

(2) 本品のエタノール (95) 溶液 (3→200000) につき、紫外可視吸光度測定法により吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

- (3) 本品につき、赤外吸収スペクトル測定法の臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

融 点 : 158~161℃

- 純度試験 : (1) 塩化物 本品 5.0 g に水 90mL を加え、加熱して溶かし、冷後、水を加えて 100mL とし、ろ過する。初めのろ液 20mL を除き、次のろ液 30mL をとり、希硝酸 6mL 及び水を加えて 50mL とする。これを検液とし、試験を行う。比較液には 0.01mol/L 塩酸 0.35mL を加える (0.008%以下)。
- (2) 硫酸塩 (1) のろ液 20mL に希塩酸 1mL 及び水を加えて 50mL とする。これを検液とし、試験を行う。比較液には 0.005mol/L 硫酸 0.40mL を加える (0.019%以下)。
- (3) 重金属 本品 2.0g をアセトン 25mL に溶かし、水酸化ナトリウム試液 4mL、希酢酸 2mL 及び水を加えて 50mL とする。これを検液とし、試験を行う。比較液は鉛標準液 2.0mL にアセトン 25mL、希酢酸 2mL 及び水を加えて 50mL とする (10ppm 以下)。
- (4) 類縁物質 本品 0.50g を移動相に溶かして正確に 100mL とし、試料溶液とする。別にフェノール 10mg、4-ヒドロキシイソフタル酸 25mg 及びパラオキシ安息香酸 50mg をそれぞれ正確にとり移動相に溶かして正確に 100mL とする。この液 1 mL を正確に量り、移動相を加えて正確に 100mL とし、標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液 10 μ L ずつを正確にとり、次の条件で液体クロマトグラフィーにより試験を行う。それぞれの液の各々のピーク面積を自動積分法により測定するとき、試料溶液のパラオキシ安息香酸、4-ヒドロキシイソフタル酸及びフェノールのピーク面積は、標準溶液のパラオキシ安息香酸、4-ヒドロキシイソフタル酸及びフェノールのピーク面積より大きくない。また、試料溶液のサリチル酸及び上記以外のピークの面積は標準溶液の 4-ヒドロキシイソフタル酸のピーク面積より大きくなく、試料溶液のサリチル酸以外のピークの合計面積は標準溶液のパラオキシ安息香酸のピーク面積の 2 倍より大きくない。

試験条件

検出器 : 紫外吸光光度計 (測定波長 : 270nm)

カラム : 内径 4.6mm、長さ 15cm のステンレス管に 5 μ m の液体クロマトグラフィー用オクタデシルシリル化シリカゲルを充てんする。

移動相 : 水/メタノール/酢酸 (100) 混液 (60 : 40 : 1)

流量 : サリチル酸の保持時間が約 17 分になるように調整する。

面積測定範囲 : 溶媒のピークの後からサリチル酸の保持時間の約 2 倍の範囲システムの適合性

検出の確認 : 標準溶液 2mL を正確に量り、移動相を加えて正確に 10mL とする。

この液 10 μ L から得たパラオキシ安息香酸、4-ヒドロキシイソフタル酸及びフェノールのピーク面積が、標準溶液のパラオキシ安息香酸、4-ヒドロキシイソフタル酸及びフェノールのピーク面積の 14~26% になることを確認する。

システムの性能 : フェノール 10mg、4-ヒドロキシイソフタル酸 25 mg 及びパラオキシ安息香酸 50mg を移動相 100mL に溶かす。この液 1 mL を量り、移動相を加えて 10mL とする。この液 10 μ L につき、上記の条件で操作するとき、パ

ラオキシ安息香酸、4-ヒドロキシイソフタル酸及びフェノールの順に溶出し、4-ヒドロキシイソフタル酸とフェノールの分離度は4以上である。
システムの再現性：標準溶液 10 μ Lにつき、上記の条件で試験を6回繰り返すとき、パラオキシ安息香酸、4-ヒドロキシイソフタル酸及びフェノールのピーク面積の相対標準偏差はそれぞれ2.0%以下である。

乾燥減量：0.5%以下（2g、シリカゲル、3時間）

強熱残分：0.1%以下（1g）

定量法：本品を乾燥し、その約0.5gを精密に量り、中和エタノール25mLに溶かし、0.1mol/L水酸化ナトリウム液で滴定する。（指示薬：フェノールフタレイン試液3滴）

貯法：密閉容器

2. 配合が好ましくない薬剤

ヨウ素、鉄塩、酸化剤（配合変化）

[Ⅲ] 製剤に関する事項

1. 剤型

軟膏剤

2. 組成

	5%	10%
サリチル酸	5g	10g
白色ワセリン	95g	90g
全量	100g	100g

3. 規格

性状：本品は白色～微黄色である。

確認試験：サリチル酸

本品1gに熱湯25mLを加え、水浴上でしばしば攪拌しながら5分間加熱し、水で濡らしたろ紙でろ過する。ろ液5mLに薄めたアンモニア水(1→5)を加え中性とする。その液に希塩化鉄(III)試液を5～6滴加えるとき、液は赤色を呈し、希塩酸を滴下していくとき液の色は初め紫色に変わり、次に消える。

定量法：サリチル酸

本品をサリチル酸約0.5gに相当する量を精密に量り、中和エタノール80mLを加えて水浴上で加温し注意して溶かし、0.01mol/L水酸化ナトリウム試液で滴定する。（指示薬：フェノールフタレイン試液1mL）

0.01mol/L水酸化ナトリウム試液1mL=13.813mg $C_7H_6O_3$

貯法：気密容器、室温保存

[Ⅳ] 薬理に関する事項

1. 薬効薬理

サリチル酸は微生物（白癬菌類など）に対して抗菌性があり、その防腐力はフェノールに匹敵する。また、角質軟化作用もある。

2. 作用機序

サリチル酸は角質を剥離する作用が強く、角質層に多く存在する白癬菌と共に脱落させることにより抗菌作用を示す。

3. 吸収、分布、代謝、排泄

経皮吸収は、毛嚢—脂線を介して表皮・真皮全層に分布、特に角質層に多く5時間後にピークに達する。サリチル酸は吸収後、50～80%は血漿蛋白と結合し、代謝物はSalicylic Acid、Gentisic Acid、Salicylate Glucuronide、Salicyl Phenolic Glucuronideで、未変化体との尿中排泄比率は、尿のPHにより変わる。

4. 毒性

急性毒性：LD₅₀ マウス、背部皮下注、400mg/Kg

亜急性毒性：ラットに15mg/Kg 背部皮下注、30mg/Kg 腹腔内注、60mg/Kg 背部皮下注、60mg/Kg 腹腔内注を隔日投与したとき、平均生存日数はそれぞれ340日、155日、170日、77日で、死亡1週間前より食欲減退、衰弱が顕著だった。剖検では肝、腎、肺、脾、精巣、卵巣に異常を認めた。

[V] 治療に関する事項

1. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤に対して過敏症の既往歴のある患者

2. 効能・効果

乾癬、白癬（頭部浅在性白癬、小水疱性斑状白癬、汗疱状白癬、頑癬）、癩風、紅色粧糠疹、紅色陰癬、角化症（尋常性魚鱗癬、先天性魚鱗癬、毛孔性苔癬、先天性手掌足底角化症（腫）、ダリエー病、遠山連圈状粧糠疹）、湿疹（角化を伴う）、口囲皮膚炎、掌蹠膿疱症、ヘブラ粧糠疹、アトピー性皮膚炎、痤瘡、癬、腋臭症、多汗症、その他角化性の皮膚疾患

3. 用法・用量

成人1日1～2回塗布する。

4. 使用上の注意

(1) 重要な基本的事項

患部が化膿しているなど湿潤、びらんが著しい場合には、あらかじめ適切な処置を行った後使用すること。

(2) 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

その他の副作用

	頻 度 不 明
過敏症 ^{注)}	過敏症状
皮 膚 ^{注)}	発赤、紅斑
長期・大量使用	内服、注射等全身的投与の場合と同様な副作用があらわれることがある。

注) 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。

(3) 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ので注意して投与すること。

(4) 妊婦・産婦・授乳婦等への投与

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のみ使用すること。

シクロオキシゲナーゼ阻害剤（経口剤、坐剤）を妊婦に使用し、胎児の腎機能障害及び尿量減少、それに伴う羊水過少症が起きたとの報告がある。また、経口投与による動物実験で催奇形作用が報告されている。

(5) 小児等への投与

小児等では副作用が発現し易いので慎重に使用すること。

(6) 適用上の注意

- 1) 長期間使用していても症状の改善が認められない場合には、改めて診断し適切な治療を行うことが望ましい。
- 2) 広範囲の病巣に使用した場合には、副作用があらわれやすいので注意して使用すること。
- 3) 眼科用には使用しないこと。

4. 取扱い上の注意

高温下に長時間放置した場合、成分の一部を分離することがある。分離がみられた場合には使用しないこと。

[VI] 管理に関する事項

1. 規制区分 普通薬
2. 使用期限 製造の翌月から5年
3. 貯蔵方法 気密容器、室温保存
4. 製造販売元 東豊薬品株式会社
5. 発売元 吉田製薬株式会社
6. 包装 500 g

- 7. 薬価基準収載年月日 1968年12月19日
- 8. 承認年月日 1968年10月31日
- 9. 販売開始年月日 1969年1月5日