

痔疾用剤

劇薬

ネリザ坐剤

NERIZA Suppo.

ジフルコルトロン吉草酸エステル・リドカイン痔疾用坐剤

貯法：室温保存

使用期限：外箱に表示


注意：【取扱い上の注意】の項参照

承認番号	22200AMX00064
薬価収載	2010年5月
販売開始	2010年5月

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

- (1) 局所に結核性、化膿性又は梅毒性感染症、ウイルス性疾患のある患者〔症状を悪化させることがある。〕
- (2) 局所に真菌症（カンジダ症、白癬等）のある患者〔症状を悪化させることがある。〕
- (3) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (4) ジフルコルトロン吉草酸エステル、リドカインに対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

成分・含量 (1個中)	ジフルコルトロン吉草酸エステル……………0.2mg リドカイン……………40mg	
添加物	軽質無水ケイ酸、ハードファット	
性状	白色～微黄色の坐剤	
外形	質量	溶融温度
	1.45g	32～36℃

【効能又は効果】

痔核に伴う症状（出血、疼痛、腫脹）の緩解

【用法及び用量】

通常、成人には1回1個を1日2回肛門内に挿入する。

【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）
他のリドカイン製剤が併用投与される患者〔リドカインの血中濃度が上昇するおそれがある。〕
2. 重要な基本的注意
(1) 本剤での治療は対症療法であるため、概ね1週間を目処として使用し、その後の継続投与については、臨床効果及び副作用の程度を考慮しながら慎重に行うこと。
(2) 局所に感染症又は真菌症がある場合には、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、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。

3. 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ため、発現頻度は不明である。

その他の副作用

下記の副作用があらわれることがあるので、このような場合には使用を中止するなど適切な処置を行うこと。

種類／頻度	頻度不明
皮膚の感染症	皮膚及び陰部の真菌症（カンジダ症、白癬等）、ウイルス性及び細菌性感染症
過敏症	そう痒感、皮膚刺激感、下痢
下垂体・副腎皮質系機能	大量又は長期使用による下垂体・副腎皮質系機能の抑制
長期連用	長期連用による全身投与の場合と同様な症状
消化器	鼓腸放屁

4. 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、患者の状態を十分に観察しながら使用すること。

5. 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、大量又は長期にわたる使用を避けること。〔妊婦に対する安全性は確立していない。〕

6. 小児等への使用

- (1) 乳児・小児に対する安全性は確立していない。
- (2) ステロイド剤の大量又は長期の使用により発育障害をきたすという報告がある。

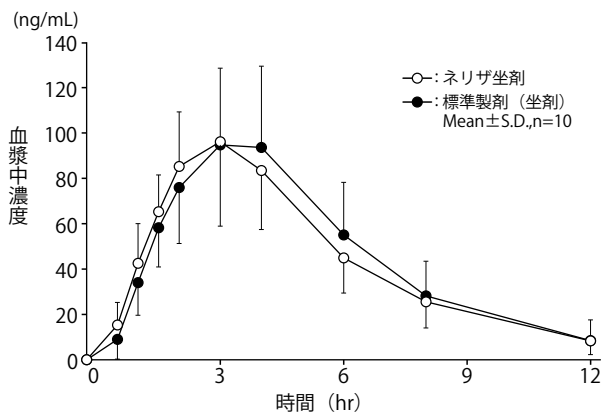
7. 適用上の注意

本剤は直腸投与にのみ使用するよう指導すること。

【薬物動態】

生物学的同等性試験

ネリザ坐剤と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1個（ジフルコルトロン吉草酸エステルとして0.2mg、リドカインとして40mg）健康成人男子に絶食時単回肛門内投与してリドカインの血漿中濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両製剤の生物学的同等性が確認された¹⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
ネリザ坐剤	529.87±156.19	100.72±26.96	2.95±0.76	2.30±0.57
標準製剤 (坐剤)	553.99±204.79	101.27±29.91	3.05±0.83	2.25±0.76

(Mean ± S.D., n=10)

血漿中濃度並びにAUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

【薬効薬理】

本剤は下記の薬効薬理試験により、標準製剤との生物学的同等性が確認されている。

抗炎症作用

クロトン油混合液誘発痔疾モデル(ラット)、擦過刺激痔疾モデル(ラット)に対する抗炎症効果を肛門・直腸部湿重量を指標として実施した試験において、本剤及び標準製剤は炎症を有意に抑制し、両製剤間に有意差は認められなかった^{2),3)}。

【有効成分に関する理化学的知見】

(1) ジフルコルトロン吉草酸エステル

一般名：ジフルコルトロン吉草酸エステル
(Diflucortolone Valerate)

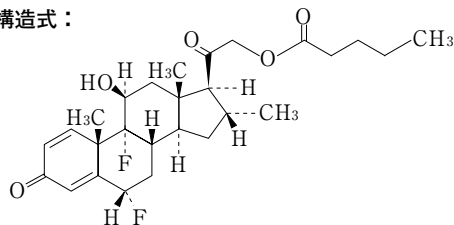
※ 化学名：6 α , 9-Difluoro-11 β , 21-dihydroxy-16 α -methylpregna-1,4-diene-3, 20-dione 21-pentanoate

分子式：C₂₇H₃₆F₂O₅

分子量：478.57

融点：200~204℃

※ 化学構造式：



※ 性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

メタノール又はエタノール (99.5) にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

(2) リドカイン

一般名：リドカイン (Lidocaine)

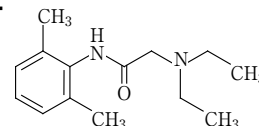
化学名：2-Diethylamino-N-(2,6-dimethylphenyl)acetamide

分子式：C₁₄H₂₂N₂O

分子量：234.34

融点：66~69℃

化学構造式：



性状：白色~微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

メタノール又はエタノール (95) に極めて溶けやすく、酢酸 (100) 又はジエチルエーテルに溶けやすく、水にほとんど溶けない。希塩酸に溶ける。

【取扱い上の注意】

1. 高温になると硬度が低下し挿入しにくいことがあるので、その場合には被包のまま坐剤の先端を下に向け冷水等で冷し固くしてから使用すること。
2. 小児の手のとどかない所に保管するよう指導すること。
3. 安定性試験
最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、ネリザ坐剤は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された⁴⁾。

【包装】

28個 (7個×4シート)、140個 (7個×20シート)

【主要文献及び文献請求先】

主要文献


- 1) ジェイドルフ製薬(株)社内資料：生物学的同等性試験
- 2) ジェイドルフ製薬(株)社内資料：クロトン油混合液誘発痔疾モデル(ラット)における薬力学的同等性試験
- 3) ジェイドルフ製薬(株)社内資料：擦過刺激誘発性痔疾モデル(ラット)における薬力学的同等性試験
- 4) ジェイドルフ製薬(株)社内資料：安定性試験

※※ 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。

ジェイドルフ製薬株式会社 安全性情報部
〒570-0081 大阪府守口市市日吉町2丁目5番15号
TEL：06-7507-2533 FAX：06-7507-2529

製造販売

 ジェイドルフ製薬株式会社
滋賀県甲賀市土山町北土山2739