

貯 法：室温保存
 使用期限：包装箱、直接の容器に表示。
 使用期限を過ぎた製品は使用しないこと。

吸入式鼻過敏症治療剤

処方箋医薬品^{注)}

ベクロメタゾン点鼻液50 μ g「杏林」

BECLOMETASONE Nasal Solution

(ベクロメタゾンプロピオン酸エステル点鼻液)

承認番号	30200AMX00702000
薬価収載	2020年12月
販売開始	2008年12月

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- 有効な抗菌剤の存在しない感染症、全身の真菌症の患者
[症状を増悪するおそれがある。]
- 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者

【原則禁忌(次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)】

結核性疾患の患者[症状を増悪するおそれがある。]

【組成・性状】

販売名	ベクロメタゾン点鼻液50 μ g「杏林」	
1瓶中の質量	8.5g	
日局ベクロメ タゾンプロピ オン酸エステ ル含有量	1g中	1mg
	1回噴射中	0.05mg
添加物	プロピレングリコール、グリセリン、ポリソルベート80、ベンザルコニウム塩化物、結晶セルロース・カルメロースナトリウム	
剤形	定量噴射式懸濁剤	
性状	白色～灰白色の不透明な懸濁液	

【効能・効果】

アレルギー性鼻炎・血管運動性鼻炎

【用法・用量】

擤鼻後十分の呼吸を行わせ、吸気の際に本剤を1側鼻孔より1回噴霧し、この際他側の鼻孔は指で閉鎖する。次いで他側鼻孔に同様の操作を行う。

成人は、通常1回上記1操作の吸入(ベクロメタゾンプロピオン酸エステルとして100 μ g)を、1日4回鼻腔内に噴霧吸入する。小児は、通常1回上記1操作の吸入(ベクロメタゾンプロピオン酸エステルとして100 μ g)を、1日2回鼻腔内に噴霧吸入する。なお、年齢・体重・症状により適宜増減するが、1日の最大投与量は、成人では16吸入、小児では8吸入を限度とする。

また、症状の緩解がみられた場合は、その後の経過を観察しながら減量する。

【使用上の注意】

- 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)
 - 感染症の患者[症状を増悪するおそれがある。]
 - 反復性鼻出血の患者[出血を増悪するおそれがある。]
 - 高血圧の患者[血圧上昇を起こすおそれがある。]
 - 糖尿病の患者[症状を増悪するおそれがある。]
- 重要な基本的注意
 - 喘息発作重積状態又は喘息の急激な悪化状態のときには原則として本剤は使用しないこと。
 - 重症な肥厚性鼻炎や鼻茸の患者では、本剤の鼻腔内での作用を確実にするため、これらの症状がある程度減少するよう他の療法を併用するとよい。

- 本剤の投与期間中に鼻症状の悪化がみられた場合には、抗ヒスタミン剤あるいは、全身性ステロイド剤を短期間併用し、症状の軽減に合わせて併用薬剤を徐々に減量すること。
- 本剤には持続効果が認められるので、特に**通年性の患者**において長期に使用する場合は、症状の改善状態が持続するようであれば、本剤の減量又は休薬につとめること。
- 全身性ステロイド剤の減量**は本剤の吸入開始後症状の安定をみて徐々に進行。減量にあたっては一般のステロイド剤の減量法に準ずる。
- 長期又は大量の全身性ステロイド療法**を受けている患者では**副腎皮質機能不全**が考えられるので、全身性ステロイド剤の減量中並びに離脱後も**副腎皮質機能検査**を行い、外傷、手術、重症感染症等の侵襲には十分に注意を払うこと。また、必要があれば一時的に全身性ステロイド剤の増量を行うこと。
- 全身性ステロイド剤の減量並びに離脱**に伴って、気管支喘息、ときに湿疹、蕁麻疹、眩暈、動悸、倦怠感、顔のほてり、結膜炎等の症状が発現・増悪することがある。(このような症状があらわれた場合には適切な処置を行うこと)

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。

(1) 重大な副作用(頻度不明)

眼：外国において、眼圧亢進、緑内障が報告されている。このような症状があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

分類	副作用(頻度不明)
過敏症 ^{注1)}	蕁麻疹等の発疹、紅斑、そう痒、浮腫
鼻腔	鼻症状(刺激感、そう痒感、乾燥感、不快感) ^{注2)} 、くしゃみ発作、鼻出血 ^{注2)} 、感染 ^{注2)} 、異臭感、嗅覚障害
口腔並びに呼吸器	咽喉頭症状(刺激感、異物感)、感染 ^{注2)}
消化器	食欲不振、悪心、嘔吐、下痢
循環器	高血圧
精神神経系	頭痛、めまい
その他	気管支喘息の発現・増悪、鼻中隔穿孔 ^{注3)}

注1) 投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

注2) 吸入回数を減少させるか、吸入を中止すること。

注3) 鼻内噴霧用コルチコステロイド剤使用後に、鼻中隔穿孔が認められたとの報告がある。

4. 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、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

5. 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婦人には、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。[本剤は動物実験(ラット)で催奇形作用が報告されている。]

6. 小児等への投与

- (1)本剤はステロイド剤であることを考慮し、非ステロイド系薬剤によって諸症状の緩解が得られない場合に使用すること。
- (2)長期、大量使用により発育障害を来すおそれがある。使用にあたっては、使用法を正しく指導し、経過の観察を十分に行うこと。
- (3)低出生体重児、新生児、乳児又は5才以下の幼児に対する安全性は確立していないので、慎重に投与すること。

7. 過量投与

過量投与により、下垂体・副腎皮質系機能抑制があらわれることがある。この抑制が長期にわたった場合、副腎皮質ステロイド剤を全身投与した場合と同様な症状があらわれることがある。このような場合には、全身性ステロイド療法を中止する手順で本剤を徐々に減量すること。

8. その他の注意

レセルピン系製剤、 α -メチルドパ製剤等の降圧剤には、副作用として鼻閉がみられることがある。このような降圧剤服用中のアレルギー性鼻炎又は血管運動性鼻炎の患者に、本剤を投与すると、鼻閉症状に対する本剤の効果が隠蔽されるおそれがあるので、臨床的観察を十分に行いながら投与すること。

【薬効薬理】

以下のように、1. 抗鼻炎作用及び2. 抗鼻閉作用を指標とした薬効薬理試験を実施し、生物学的同等性を検討した結果、ベクロメタゾン点鼻液50 μ g「杏林」と標準製剤(ベクロメタゾンプロピオン酸エステル吸入剤)は生物学的に同等であると判断された。¹⁾

1. 抗鼻炎作用

抗原卵白アルブミンで感作した雄性ラットに色素(Pontamine Sky Blue 6B)を静脈注射後、鼻腔内へ抗原液を灌流し、その灌流による鼻粘膜表面での抗原抗体反応に基づく鼻汁中への漏出色素量及びライソゾーム酵素活性を指標として、ベクロメタゾン点鼻液50 μ g「杏林」及び標準製剤(ベクロメタゾンプロピオン酸エステル吸入剤)のプラセボに対するアレルギー性鼻炎抑制効果を比較検討した。なお、被験薬は、抗原液灌流の前後に各1回1噴霧させた。

その結果、ベクロメタゾン点鼻液50 μ g「杏林」及び標準製剤ともにプラセボに対して明らかなアレルギー性鼻炎抑制効果を示し、かつ、両剤の抑制効果の間に有意差を認めなかった。

2. 抗鼻閉作用

抗原卵白アルブミンウサギ血清で感作した雄性モルモットの鼻腔内に抗原液を滴下し、抗原抗体反応に基づく鼻閉によるインピーダンス変化を指標とし、ベクロメタゾン点鼻液50 μ g「杏林」及び標準製剤(ベクロメタゾンプロピオン酸エステル吸入剤)のプラセボに対する鼻閉抑制効果を比較検討した。なお、被験薬は、抗原液滴下の前後に各1回左右鼻腔内に1噴霧させた。

その結果、ベクロメタゾン点鼻液50 μ g「杏林」及び標準製剤ともにプラセボに対して明らかな鼻閉抑制効果を示し、かつ、両剤の抑制効果の間に有意差を認めなかった。

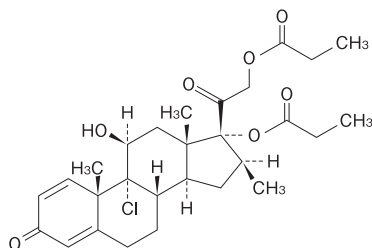
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ベクロメタゾンプロピオン酸エステル
(Beclometasone Dipropionate)

分子式：C₂₈H₃₇ClO₇

分子量：521.04

構造式：



化学名：9-Chloro-11 β , 17, 21-trihydroxy-16 β -methylpregna-1, 4-diene-3, 20-dione 17, 21-dipropanoate

性状：白色～微黄色の粉末である。

メタノールにやや溶けやすく、エタノール(95)又は1, 4-ジオキサンにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

融点：約208 $^{\circ}$ C(分解)。

結晶多形が認められる。

【取扱い上の注意】

1. 患者には添付の携帯袋を渡し、使用方法を指導すること。
2. 吸入前に容器をよくふること。ただし強くふりすぎないこと。
3. 初回使用時のみ空打ちを行うこと。
4. 噴霧口を針やピンなどで突かないこと。
5. 季節性の疾患に対しては、好発期を考えて、その直前から始めるのが理想的で、抗原との接触がなくなるまで続けることが望ましい。
6. 安定性試験²⁾
最終包装製品を用いた加速試験(40 \pm 1 $^{\circ}$ C、相対湿度75 \pm 5%、6ヵ月)の結果、ベクロメタゾン点鼻液50 μ g「杏林」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。

【包装】

8. 5g \times 10瓶

【主要文献】

- 1)キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ベクロメタゾン点鼻液50 μ g「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料
- 2)キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ベクロメタゾン点鼻液50 μ g「杏林」の安定性試験に関する資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料は下記にご請求下さい。

キョーリンリメディオ株式会社 学術部
〒920-0017 金沢市諸江町下丁287番地1
TEL 0120-960189
FAX 0120-189099

販売元

杏林製薬株式会社

東京都千代田区神田駿河台四丁目6番地

製造販売元

キョーリンリメディオ株式会社

富山県南砺市井波885番地