

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2018(2019年更新版)に準拠して作成

痔疾治療剤

ジフルコルトロン吉草酸エステル・リドカイン配合剤

ネリザ坐剤

NERIZA SUPPOSITORIES

剤形	直腸用坐剤
製剤の規制区分	劇薬
規格・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
一般名	和名：ジフルコルトロン吉草酸エステル／リドカイン (JAN) 洋名：Diflucortolone Valerate / Lidocaine (JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	製造販売承認年月日：2010年1月15日 薬価基準収載年月日：2010年5月28日 発売年月日：2010年5月28日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：ジェイドルフ製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ジェイドルフ製薬株式会社 学術部 くすり相談窓口 TEL：06-7507-2532 FAX：06-7507-2528 (受付時間：9時～17時30分(土、日、祝日、当社休業日を除く)) 医療関係者向けホームページ https://www.j-dolph.co.jp/

本IFは2024年3月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページにて確認してください。

専用アプリ「添文ナビ®」でGS1バーコードを読み取ることにより、最新の電子添文等を閲覧できます。



(01)04987328420139

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

—日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IF と略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、「IF記載要領2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは

は各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯…………… 1
2. 製品の治療学的特性…………… 1
3. 製品の製剤学的特性…………… 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性…………… 1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項…………… 1
6. RMP の概要…………… 1

II. 名称に関する項目

1. 販売名…………… 2
2. 一般名…………… 2
3. 構造式又は示性式…………… 2
4. 分子式及び分子量…………… 2
5. 化学名(命名法)…………… 2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号…………… 2

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質…………… 3
2. 有効成分の各種条件下における安定性…………… 3
3. 有効成分の確認試験法、定量法…………… 3

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形…………… 4
2. 製剤の組成…………… 4
3. 添付溶解液の組成及び容量…………… 4
4. 力価…………… 5
5. 混入する可能性のある夾雑物…………… 5
6. 製剤の各種条件下における安定性…………… 5
7. 調製法及び溶解後の安定性…………… 5
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)…………… 5
9. 溶出性…………… 5
10. 容器・包装…………… 5
11. 別途提供される資材類…………… 6
12. その他…………… 6

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果…………… 7
2. 効能又は効果に関連する注意…………… 7
3. 用法及び用量…………… 7
4. 用法及び用量に関連する注意…………… 7
5. 臨床成績…………… 7

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…………… 10
2. 薬理作用…………… 10

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移…………… 11

2. 薬物速度論的パラメータ…………… 11
3. 母集団(ポピュレーション)解析…………… 12
4. 吸収…………… 12
5. 分布…………… 12
6. 代謝…………… 12
7. 排泄…………… 12
8. トランスポーターに関する情報…………… 13
9. 透析等による除去率…………… 13
10. 特定の背景を有する患者…………… 13
11. その他…………… 13

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…………… 14
2. 禁忌内容とその理由…………… 14
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由…………… 14
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由…………… 14
5. 重要な基本的注意とその理由…………… 14
6. 特定の背景を有する患者に関する注意…………… 14
7. 相互作用…………… 15
8. 副作用…………… 15
9. 臨床検査結果に及ぼす影響…………… 16
10. 過量投与…………… 16
11. 適用上の注意…………… 16
12. その他の注意…………… 16

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験…………… 17
2. 毒性試験…………… 17

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分…………… 18
2. 有効期間…………… 18
3. 包装状態での貯法…………… 18
4. 取扱い上の注意…………… 18
5. 患者向け資材…………… 18
6. 同一成分・同効薬…………… 18
7. 国際誕生年月日…………… 18
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日…………… 18
9. 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…………… 18
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容…………… 18
11. 再審査期間…………… 19
12. 投与期間制限に関する情報…………… 19
13. 各種コード…………… 19
14. 保険給付上の注意…………… 19

XI. 文献

1. 引用文献 20
2. その他の参考文献 20

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況 21
2. 海外における臨床支援情報 21

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を
行うにあたっての参考情報 22
2. その他の関連資料 22

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ジフルコルトロン吉草酸エステル・リドカイン配合剤は痔疾用治療剤であり、本邦では1966年から製造販売されている。

ジェイドルフ製薬株式会社が後発医薬品として、ネリザ軟膏および坐剤の開発を企画し、医薬発第481号（平成11年4月8日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2010年1月に承認を得て、2010年5月より発売した。

2. 製品の治療学的特性

- ・ 本剤はジフルコルトロン吉草酸エステル、リドカインが配合された痔疾用外用剤（軟膏、坐剤）である。
- ・ 痔核に伴う症状（出血、疼痛、腫脹）の緩解の効能又は効果を有する。（「V. 1. 効能又は効果」の項参照）
- ・ 主な副作用はそう痒感、皮膚刺激感等（0.1～1%未満）がある。（「VIII. 8. 副作用」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

- ・ 2g入りチューブは1回使い切りの製剤である。
- ・ いずれも1シート7個入りである（ウィークリーシート包装）。

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

(2024年3月時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ネリザ軟膏
ネリザ坐剤

(2) 洋名

NERIZA OINTMENT
NERIZA SUPPOSITORIES

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

ジフルコルトロン吉草酸エステル／リドカイン (JAN)

(2) 洋名(命名法)

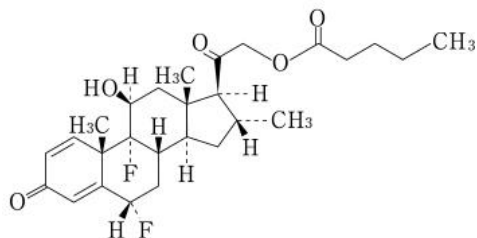
Diflucortolone Valerate／Lidocaine (JAN)

(3) ステム(stem)

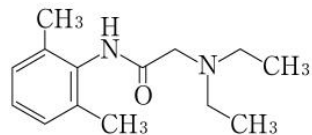
ジフルコルトロン吉草酸エステル：ステロイド医薬品：-olone
リドカイン：局所麻酔薬：-caine

3. 構造式又は示性式

ジフルコルトロン吉草酸エステル



リドカイン



4. 分子式及び分子量

ジフルコルトロン吉草酸エステル： $C_{27}H_{36}F_2O = 478.57$

リドカイン： $C_{14}H_{22}N_2O = 234.34$

5. 化学名(命名法)

ジフルコルトロン吉草酸エステル：

6 α , 9-Difluoro-11 β , 21-dihydroxy-16 α -methylpregna-1, 4-diene-3, 20-dione
21-pentanoate (IUPAC)

リドカイン：2-Diethylamino-*N*-(2, 6-dimethylphenyl)acetamide (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

別名：吉草酸ジフルコルトロン

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

ジフルコルトロン吉草酸エステル：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

リドカイン：白色～微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

ジフルコルトロン吉草酸エステル：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。

リドカイン：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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

ジフルコルトロン吉草酸エステル：200～204℃（融点）

リドカイン：66～69℃（融点）

(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

ジフルコルトロン吉草酸エステル：旋光度 $[\alpha]_D^{20} = +110 \sim +115^\circ$ （乾燥物に換算したもの0.1g、エタノール（99.5）、10mL、100mm）

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

ジフルコルトロン吉草酸エステル：日局「ジフルコルトロン吉草酸エステル」による

リドカイン：日局「リドカイン」による

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別


販売名	ネリザ坐剤
剤形の区別	直腸用坐剤

(2) 製剤の外観及び性状

ネリザ軟膏

性状	白色～帯黄白色のクリーム状の軟膏
----	------------------

ネリザ坐剤

色・性状	白色～微黄色の坐剤	
外形	質量	熔融温度
	1.45g	32～36℃

(3) 識別コード

なし

(4) 製剤の物性

ネリザ坐剤

熔融温度：32～36℃（日局一般試験法・融点測定法による）

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

販売名	ネリザ坐剤
有効成分	(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
添加剤	軽質無水ケイ酸、ハードファット

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

(1) ネリザ軟膏

加速試験 (35℃、相対湿度 75%、8 ヶ月) ¹⁾

	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験	35℃、相対湿度75%	8 ヶ月	ポリエチレンチューブ	変化なし

試験項目：性状、確認試験、定量

ネリザ坐剤

加速試験 (40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月) ²⁾

	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験	40℃、相対湿度75%	6 ヶ月	ポリ塩化ビニル製 コンテナ	変化なし

試験項目：性状、確認試験、質量偏差試験、溶融温度試験、定量

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)

該当しない

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

(2) 包装

ネリザ軟膏：

チューブ：2g×14 [7 個×2]

2g×70 [7 個×10]

2g×140 [7 個×20]

2g×350 [7 個×50]

ネリザ坐剤：28 個 [7 個×4]

140 個 [7 個×20]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ネリザ軟膏

[容器] チューブ：ポリエチレン

キャップ：ポリエチレン

[ピローフィルム]：ポリエチレン

ネリザ坐剤

[容器] コンテナ：ポリ塩化ビニル

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果
痔核に伴う症状（出血、疼痛、腫脹）の緩解

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能又は効果に関連する注意
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. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

ネリザ軟膏

6. 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。

ネリザ坐剤

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意
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。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理効果

該当しない

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 無有効性検証試験

[軟膏]

17.1.1 国内第Ⅱ相臨床試験

痔核及び裂肛患者を対象にジフルコルトロン吉草酸エステル 0.2mg・リドカイン 40mg (以下、DFV0.2mg・LID40mg) 軟膏を1日2回、適量を2週間連続投与した用量確認試験の結果は以下のとおりである³⁾。

全般改善度における改善率(改善以上)は82.4%(42/51例)であった。副作用の発現はなかった。

17.1.2 国内第Ⅲ相比較臨床試験

痔核及び裂肛患者を対象にDFV0.2mg・LID40mg軟膏2gチューブ及びDFV0.2mg・LID40mg坐剤をそれぞれ1回1個、1日2回、2週間連続投与した群間比較試験の結果は以下のとおりである⁴⁾。

全般改善度における改善率(改善以上)は、DFV0.2mg・LID40mg軟膏投与群で75.0%(75/100例)で、DFV0.2mg・LID40mg坐剤投与群で74.7%(71/95例)であった。

副作用発現頻度は2.8%(3/109例)であった。発現した副作用はかゆみ、軟便化、蕁麻疹が各1例であった。

[坐剤]

17.1.1 国内後期第Ⅱ相臨床試験

内痔核及び内外痔核患者を対象にジフルコルトロン吉草酸エステル0.2mg・リドカイン40mg坐剤(以下、DFV0.2mg・LID40mg坐剤)、ジフルコルトロン吉草酸エステル倍量坐剤、リドカイン坐剤及びプラセボ坐剤をそれぞれ1回1個、1日2回、2週間連続投与した二重盲検比較試験の結果は以下のとおりである²⁾。

全般改善度における改善率(改善以上)は、DFV0.2mg・LID40mg坐剤投与群69.0%(40/58例)、ジフルコルトロン吉草酸エステル倍量坐剤投与群45.5%(25/55例)、リドカイン坐剤投与群52.9%(27/51例)、プラセボ坐剤投与群60.7%(34/56例)であった。

副作用発現頻度はDFV0.2mg・LID40mg坐剤投与群で1.5%(1/67例)であった。発現した副作用は下痢1例であった。

17.1.2 国内追加第Ⅱ相臨床試験

内痔核及び内外痔核患者を対象にDFV0.2mg・LID40mg坐剤及びジフルコルトロン吉草酸エステル半量坐剤をそれぞれ1回1個、1日2回、2週間連続投与した二重盲検比較試験の結果は以下のとおりである⁶⁾。

全般改善度における改善率(改善以上)は、DFV0.2mg・LID40mg坐剤投与群で69.5%(73/105例)、ジフルコルトロン吉草酸エステル半量坐剤投与群で61.5%(67/109例)であった。

副作用発現頻度はDFV0.2mg・LID40mg坐剤投与群で1.9%(2/107例)であった。発現した副作用は痒感、頭痛・微熱が各1例であった。

17.1.3 国内第Ⅲ相比較臨床試験

内痔核及び内外痔核及び裂肛患者を対象にDFV0.2mg・LID40mg坐剤及びカプロン酸ヒドロコルチゾン・塩酸ジブカイン・ヘキサクロロフェン・ウンデシル酸クレミゾール坐薬をそれぞれ1回1個、1日2回、2週間連続投与した二重盲検比較試験の結果は以下のとおりである⁷⁾。

全般改善度における改善率(改善以上)は、DFV0.2mg・LID40mg坐剤投与群で67.4%(87/129例)、カプロン酸ヒドロコルチゾン・塩酸ジブカイン・ヘキサクロロフェン・ウンデシル酸クレミゾール坐薬投与群で61.7%(82/133例)であった。

副作用発現頻度はDFV0.2mg・LID40mg坐剤投与群で2.9%(4/140例)であった。発現した副作用は腹部膨満感、薬疹、かゆみ、刺激感が各1例であった。

17.1.4 国内第Ⅲ相比較臨床試験

内痔核及び内外痔核患者を対象にDFV0.2mg・LID40mg坐剤及びトリベノシド・リドカイン坐剤をそれぞれ1回1個、1日2回、2週間連続投与した群間比較試験の結果は以下のとおりである⁸⁾。

全般改善度における改善率(改善以上)は、DFV0.2mg・LID40mg坐剤投与群で65.0%(67/103例)、トリベノシド・リドカイン坐剤投与群で64.0%(64/100例)であった。

DFV0.2mg・LID40mg坐剤投与群で副作用の発現はなかった。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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(一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

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

ジフルコルトロン吉草酸エステル：フルオシノニド、ベタメタゾン吉草酸エステル、ヒドロコルチゾン

リドカイン：プロカイン塩酸塩、ジブカイン塩酸塩、ブピバカイン塩酸塩

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

作用部位：直腸、肛門

作用機序：

18.1.1 ジフルコルトロン吉草酸エステル

合成副腎皮質ホルモンで、糖質コルチコイドと同じ機序により抗炎症作用及び免疫抑制作用を発現する。糖質コルチコイドの抗炎症作用の機序は多岐にわたるが、結局は起炎物質の生合成抑制と炎症細胞の遊走抑制による⁹⁾。

18.1.2 リドカイン

神経細胞膜の Na⁺チャネルを抑制することによって神経の活動電位発生を抑制するという局所麻酔薬共通の作用により、知覚神経の求心性伝導を抑制する¹⁰⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 抗炎症作用

DFV0.2mg・LID40mg 軟膏（及び坐剤）は、クロトン油誘発痔疾モデル（ラット）、擦過刺激痔疾モデル（ラット）のいずれにおいても、ヒドロコルチゾンカプロン酸エステルを含有する痔疾用剤と同等ないしはより強力な抗炎症作用を示した。また、ヒドロコルチゾン含有痔疾用剤及び副腎皮質ホルモンを含有しない痔疾用剤に比し抗炎症作用が強力であった¹¹⁾。

18.3 鎮痛作用

DFV0.2mg・LID40mg 軟膏（及び坐剤）は、カラゲニン・カオリン足蹠浮腫（ラット）において、疼痛に対しリドカインによる速効性の鎮痛効果とジフルコルトロン吉草酸エステルによる炎症痛の経時的な軽減が認められた¹¹⁾。

ネリザ軟膏

18.4 生物学的同等性試験

18.1.1 抗炎症作用

ネリザ軟膏及びネリプロクト軟膏をラットクロトン油混合液誘発痔疾モデル、ラット機械刺激誘発性痔疾モデルに対して単回塗布した後に、肛門・直腸部湿重量により抗炎症作用を評価した。この試験において、両剤ともいずれのモデルにおいても抗炎症作用を示し、生物学的に同等と判断された¹²⁾。

18.1.2 鎮痛作用

ネリザ軟膏及びネリプロクト軟膏をラット急性組織損傷性疼痛モデルに対して単回塗布した後に、肛門括約筋収縮反応により鎮痛作用を評価した。この試験において、両剤とも鎮痛作用を示し、生物学的に同等と判断された¹³⁾。

ネリザ坐剤

18.4 生物学的同等性試験

抗炎症作用

ネリザ坐剤及びネリプロクト坐剤をラットクロトン油混合液誘発痔疾モデル、ラット機械刺激誘発性痔疾モデルに対して単回塗布した後に、肛門・直腸部湿重量により抗炎症作用を評価した。この試験において、両剤ともいずれのモデルにおいても抗炎症作用を示し、生物学的に同等と判断された¹²⁾。

(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

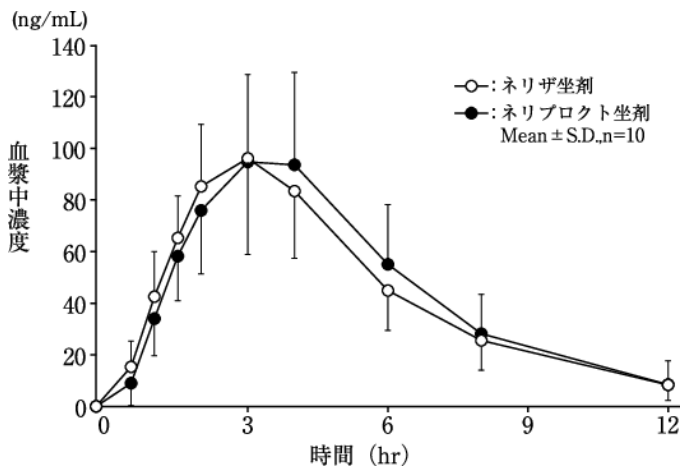
1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

ネリザ坐剤

生物学的同等性試験

ネリザ坐剤とネリプロクト坐剤を、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¹³⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (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
ネリプロクト坐剤	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、Cmax 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。

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

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) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団 (ポピュレーション) 解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 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

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 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 (CYP 等) の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

該当資料なし

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

2.1 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。]

2.2 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。]

2.3 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.4 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

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

設定されていない

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9. 1. 1 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) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9. 5 妊婦

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にのみ投与すること。また、大量又は長期にわたる使用を避けること。

(6) 授乳婦

設定されていない

(7) 小児等

9.7小児等

9.7.1 小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.7.2 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。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

患者の状態を十分に観察しながら使用すること。一般に副作用があらわれやすい。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

(1) 副作用の概要

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常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。

(2) 重大な副作用と初期症状

設定されていない

(3) その他の副作用

ネリザ軟膏

11.2 その他の副作用		
	0.1～1%未満	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	発疹
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

11.2 その他の副作用		
	0.1～1%未満	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	

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

ネリザ軟膏

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

眼科用として使用しないこと。

ネリザ坐剤

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

本剤は直腸投与にのみ使用するよう指導すること。

14.2 薬剤投与時の注意

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。[20.2 参照]

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製剤：劇薬

有効成分：ジフルコルトロン吉草酸エステル・・・毒薬、リドカイン・・・劇薬

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存（1～30℃）

4. 取扱い上の注意

ネリザ軟膏

20. 取扱い上の注意

小児の手のとどかない所に保管するよう指導すること。

ネリザ坐剤

20. 取扱い上の注意

20.1 小児の手のとどかない所に保管するよう指導すること。

20.2 高温を避けて保存すること。[14.2 参照]

20.3 坐剤の先端が下に向く様に箱のマークに従い保存すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし

くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

同 効 薬：プロクトセディル軟膏・坐薬、強力ポステリザン（軟膏）、ボラザG軟膏・坐剤

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

	ネリザ坐剤
製造販売承認年月日	2010年1月15日
承認番号	22200AMX00064
薬価基準収載年月日	2010年5月28日
販売開始年月日	2010年5月28日

9. 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

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投与期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

	ネリザ坐剤
厚生労働省薬価基準収載 医薬品コード	2559814J1062
個別医薬品コード (YJコード)	2559814J1062
HOT番号	119854601
レセプト電算コード	621985401

14. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 社内資料：ネリザ軟膏安定性試験
- 2) 社内資料：ネリザ坐剤安定性試験
- 3) 衣笠昭 他：薬理と治療. 1989 ; 2 (3 15) : 5999-6005
- 4) 衣笠昭 他：薬理と治療. 1989 ; 1 (7 12) : 5953-5965
- 5) 衣笠昭 他：薬理と治療. 1989 ; 1 (7 11) : 5565-5580
- 6) 衣笠昭 他：薬理と治療. 1992 ; 20 (2) : 683-694
- 7) 衣笠昭 他：薬理と治療. 1989 ; 1 (7 11) : 5581-5597
- 8) 衣笠昭 他：薬理と治療. 1989 ; 1 (7 12) : 5935-5951
- 9) 第十八改正日本薬局方解説書. 東京：廣川書店；2021. C2329-2333
- 10) 第十八改正日本薬局方解説書. 東京：廣川書店；2021. C6065-6069
- 11) 西木克侑 他：日薬理誌. 1988 ; 92 : 227-240
- 12) 社内資料：薬力学的試験（抗炎症作用）
- 13) 社内資料：薬力学的試験（鎮痛作用）
- 14) 社内資料：生物学的同等性試験

2. その他の参考文献

X II . 参考資料

1. 主な外国での発売状況

外国では発売されていない。

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XⅢ. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

該当資料なし