

貯 法：室温保存  
使用期限：外箱等に表示の使用期限内に使用すること

	28噴霧用	56噴霧用
承認番号	22100AMX01642000	22100AMX00335000
薬価収載	2009年9月	2009年5月
販売開始	2009年9月	2009年5月

定量噴霧式鼻過敏症治療剤

フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 $\mu$ g 「日医工」 28噴霧用  
フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 $\mu$ g 「日医工」 56噴霧用

Fluticasone Propionate

フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液

【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

【組成・性状】

販売名	フルチカゾンプロピオン酸 エステル点鼻液50 $\mu$ g 「日医工」28噴霧用	フルチカゾンプロピオン酸 エステル点鼻液50 $\mu$ g 「日医工」56噴霧用
1 瓶中 有効成分・含量	フルチカゾンプロピオン酸エステル 2.04mg/4mL (1回噴霧中50 $\mu$ g)	
1 瓶中 添加物	セルロース、カルメロースナトリウム、ブドウ糖、ベンザルコニウム塩化物、フェニルエチルアルコール、ポリソルベート80、pH調節剤	
剤形・性状	定量噴霧式の点鼻液であり、噴霧するとき、微細な霧状となる。 内容物は白色の懸濁液で、特異なおいがある。	
pH	5.0~7.0	

【効能・効果】

アレルギー性鼻炎、血管運動性鼻炎

【用法・用量】

成人は、通常1回各鼻腔に1噴霧（フルチカゾンプロピオン酸エステルとして50 $\mu$ g）を1日2回投与する。なお、症状により適宜増減するが、1日の最大投与量は、8噴霧を限度とする。

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

本剤の十分な臨床効果を得るためには継続的に使用すること。

【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）

- 鼻咽感染症患者〔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〕

2. 重要な基本的注意

- 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、症状の軽減にあ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、とく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。
- 季節性の疾患に対しては、その好発期を考慮し初期治療を開始し、抗原との接触がなくなるまで続けることが望ましい。
- 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行う。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、けん怠感、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）。

- \*\* (8) 全身性ステロイド剤と比較し可能性は低いが、点鼻ステロイド剤の投与により全身性の作用（クッシング症候群、クッシング様症状、副腎皮質機能抑制、小児の成長遅延、骨密度の低下、白内障、緑内障、中心性漿液性網脈絡膜症を含む）が発現する可能性がある。特に長期間、大量投与の場合には定期的に検査を行い、全身性の作用が認められた場合には適切な処置を行うこと。

3. 相互作用

本剤は、主として肝チトクロームP-450 3A4（CYP3A4）で代謝される。

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
CYP3A4阻害作用を有する薬剤 リトナビル等	副腎皮質ステロイド剤を全身投与した場合と同様の症状があらわれる可能性がある。 特に、リトナビルとフルチカゾンプロピオン酸エステル製剤の併用により、クッシング症候群、副腎皮質機能抑制等が報告されているので、リトナビルとの併用は治療上の有益性がこれらの症状発現の危険性を上回ると判断される場合に限り	CYP3A4による代謝が阻害されることにより、本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。 リトナビルは強いCYP3A4阻害作用を有し、リトナビルとフルチカゾンプロピオン酸エステル製剤を併用した臨床薬理試験において、血中フルチカゾンプロピオン酸エステル濃度の大幅な上昇、また血中コルチゾール値の著しい低下が認められている。

4. 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）

アナフィラキシー

アナフィラキシー（呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等）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本剤の投与を中止し、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。

	頻度不明
過敏症 <sup>(注)</sup>	発疹、浮腫
** 鼻 腔	鼻症状（刺激感、疼痛、乾燥感）、鼻出血、不快臭、鼻中隔穿孔、鼻潰瘍

	頻度不明
口腔並びに呼吸器	咽喉頭症状（刺激感、乾燥感）、不快な味
精神神経系	頭痛、振戦、睡眠障害
その他	眼圧上昇

注) このような場合には投与を中止すること。

#### 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ので、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

#### 6. 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〔本薬は皮下投与による動物実験（ラット、ウサギ）で副腎皮質ステロイド剤に共通した奇形発生、胎児の発育抑制がみられ、これらの所見はウサギにおいて低い用量で出現することが報告されている〕。

#### 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

鼻腔内噴霧用のみ使用すること。

#### 9. その他の注意

レセルピン系製剤、 $\alpha$ -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】

#### 生物学的同等性試験

##### 1. フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 $\mu$ g「日医工」28噴霧用

下記の試験の結果、フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 $\mu$ g「日医工」28噴霧用と標準製剤（点鼻液、2.04mg/4mL）との生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

##### (1) IgE関与鼻粘膜血管透過性亢進抑制作用

抗DNP-As血清による受身感作ラットに色素を尾静脈内投与し、本剤もしくは標準製剤を2回鼻腔内噴霧後に抗原液を灌流し、鼻吻から採取した灌流液中の累積色素漏出量を算出した。（n=10）

##### (2) IgG関与鼻腔抵抗上昇抑制作用

Ovalbuminによる能動感作モルモットに本剤もしくは標準製剤を2回鼻腔内噴霧し、抗原液鼻腔内投与後の鼻腔内圧を測定した。（n=10）

##### 2. フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 $\mu$ g「日医工」56噴霧用

下記の試験結果より、フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 $\mu$ g「日医工」56噴霧用と標準製剤は生物学的に同等であると判断された。<sup>2)</sup>

##### (1) 鼻汁

感作モルモット（1群12匹）の抗原誘発鼻汁分泌亢進モデルにおける鼻粘膜血管透過性に対する作用を検討した。

##### (2) 鼻炎

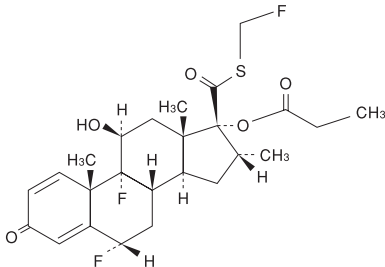
感作モルモット（1群22匹）の遅発性鼻炎反応モデルにおける鼻腔抵抗及び鼻腔洗浄液中細胞数の増加に対する作用を検討した。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：フルチカゾンプロピオン酸エステル（Fluticasone Propionate）

化学名：S-Fluoromethyl 6 $\alpha$ , 9 $\alpha$ -difluoro-11 $\beta$ -hydroxy-16 $\alpha$ -methyl-3-oxo-17 $\alpha$ -propionyloxyandrost-1, 4-diene-17 $\beta$ -carbothioate

構造式：



分子式：C<sub>25</sub>H<sub>31</sub>F<sub>3</sub>O<sub>5</sub>S

分子量：500.57

性状：白色の微細な粉末である。

ジメチルスルホキシドに溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けにくく、メタノール又はエタノール（99.5）に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

### 【取扱い上の注意】

- 定められた用法・用量を厳重に守るよう、患者に指示すること。
- 患者には添付の携帯袋及び鼻用定量噴霧器の使用説明書を渡し、使用方法を指導すること。
- 用時振盪すること。
- 安定性試験

本品につき加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）を行った結果、フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 $\mu$ g「日医工」28噴霧用及びフルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 $\mu$ g「日医工」56噴霧用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。<sup>3)</sup>

### 【包装】

フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 $\mu$ g「日医工」28噴霧用

4 mL×10瓶

フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 $\mu$ g「日医工」56噴霧用

8 mL×6瓶

### 【主要文献】

- 日医工株式会社 社内資料：生物学的同等性試験（28噴霧用）
- 日医工株式会社 社内資料：生物学的同等性試験（56噴霧用）
- 日医工株式会社 社内資料：安定性試験

### 【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

日医工株式会社 お客様サポートセンター

〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21

☎ (0120) 517-215

Fax (076) 442-8948