

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 2008 に準拠して作成

痔疾用剤

ネリコルト[®] 軟膏
ネリコルト[®] 坐剤

NERICOLT[®]

剤形	軟膏剤・坐剤
製剤の規制区分	劇薬
規格・含量	軟膏:1g中 日局ジフルコルトロン吉草酸エステル 0.1mg、日局 リドカイン 20mg 含有 坐剤:1個中 日局ジフルコルトロン吉草酸エステル 0.2mg、日局 リドカイン 40mg 含有
一般名	和名:ジフルコルトロン吉草酸エステル(JAN) リドカイン(JAN) 洋名:Diflucortolone Valerate (JAN) 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: 2003年3月12日 薬価基準収載年月日: 2003年7月4日 発売年月日: 2003年7月4日
開発・製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	販売元: テバ製薬株式会社 製造販売元: 大正薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	テバ製薬株式会社 DIセンター TEL :0120-923-093 FAX :052-459-2853 受付時間 :9:00~17:00(土・日・祝日を除く) 医療関係者向けホームページ http://www.teva-seiyaku.com/ForMedical/

本IFは2012年4月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

IF 利用の手引きの概要

— 日本病院薬剤師会 —

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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな IF 記載要領が策定された。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式】

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

【IF の作成】

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2008」は、平成 21 年 4 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2008」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2008 年 9 月)

目次

I 概要に関する項目	1	10. 製剤中の有効成分の確認試験法	9
1. 開発の経緯	1	11. 製剤中の有効成分の定量法	9
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	12. 力 価	9
II 名称に関する項目	2	13. 混入する可能性のある夾雑物	9
1. 販売名	2	14. 治療上注意が必要な容器に関する情報	9
(1)和名	2	15. 刺激性	9
(2)洋名	2	16. その他	9
(3)名称の由来	2	V 治療に関する項目	10
2. 一般名	2	1. 効能又は効果	10
(1)和名(命名法)	2	2. 用法及び用量	10
(2)洋名(命名法)	2	3. 臨床成績	10
(3)ステム	2	(1)臨床データパッケージ	10
3. 構造式又は示性式	2	(2)臨床効果	10
4. 分子式及び分子量	2	(3)臨床薬理試験：忍容性試験	10
5. 化学名(命名法)	3	(4)探索的試験：用量反応探索試験	10
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	(5)検証的試験	10
7. CAS 登録番号	3	1) 無作為化並行用量反応試験	10
III 有効成分に関する項目	4	2) 比較試験	10
1. 物理化学的性質	4	3) 安全性試験	10
(1)外観・性状	4	4) 患者・病態別試験	10
(2)溶解性	4	(6)治療的使用	10
(3)吸湿性	4	1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)	10
(4)融点(分解点)、沸点、凝固点	4	・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)	10
(5)酸塩基解離定数	4	2) 承認条件として実施予定の内容又は	10
(6)分配係数	4	実施した試験の概要	10
(7)その他の主な示性値	4	VI 薬効薬理に関する項目	11
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	11
3. 有効成分の確認試験法	5	2. 薬理作用	11
4. 有効成分の定量法	5	(1)作用部位・作用機序	11
IV 製剤に関する項目	6	(2)薬効を裏付ける試験成績	11
1. 剤 形	6	(3)作用発現時間・持続時間	13
(1)投与経路	6	VII 薬物動態に関する項目	14
(2)剤形の区別、規格及び性状	6	1. 血中濃度の推移・測定法	14
(3)製剤の物性	6	(1)治療上有効な血中濃度	14
(4)識別コード	6	(2)最高血中濃度到達時間	14
(5)pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等	6	(3)臨床試験で確認された血中濃度	14
(6)無菌の有無	6	(4)中毒域	14
2. 製剤の組成	6	(5)食事・併用薬の影響	14
(1)有効成分(活性成分)の含量	6	(6)母集団(ポピュレーション)解析により判明した	14
(2)添加物	6	薬物体内動態変動要因	14
(3)添付溶解液の組成及び容量	7	2. 薬物速度論的パラメータ	14
3. 用時溶解して使用する製剤の調製法	7	(1)コンパートメントモデル	14
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	7	(2)吸収速度定数	14
5. 製剤の各種条件下における安定性	7	(3)バイオアベイラビリティ	14
6. 溶解後の安定性	8	(4)消失速度定数	14
7. 他剤との配合変化(物理化学的变化)	9	(5)クリアランス	14
8. 溶出性	9	(6)分布容積	14
9. 生物学的試験法	9	(7)血漿蛋白結合率	14

3. 吸収	14	IX 非臨床試験に関する項目	19		
4. 分布	14		1. 薬理試験	19	
(1)血液-脳関門通過性	15		(1)薬効薬理試験	19	
(2)血液-胎盤関門通過性	15		(2)副次的薬理試験	19	
(3)乳汁への移行性	15		(3)安全性薬理試験	19	
(4)髄液への移行性	15		(4)その他の薬理試験	19	
(5)その他の組織への移行性	15		2. 毒性試験	19	
5. 代謝	15		(1)単回投与毒性試験	19	
(1)代謝部位及び代謝経路	15		(2)反復投与毒性試験	19	
(2)代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種	15		(3)生殖発生毒性試験	19	
(3)初回通過効果の有無及びその割合	15		(4)その他の特殊毒性	19	
(4)代謝物の活性の有無及びその比率	15		X 管理的事項に関する項目	20	
(5)活性代謝物の速度論的パラメータ	15			1. 規制区分	20
6. 排泄	15			2. 有効期間又は使用期限	20
(1)排泄部位及び経路	15			3. 貯法・保存条件	20
(2)排泄率	15			4. 薬剤取扱い上の注意点	20
(3)排泄速度	15			(1)薬局での取り扱いについて	20
7. 透析等による除去率	15	(2)薬剤交付時の注意		20	
VIII 安全性(使用上の注意等)に関する項目	16	(患者等に留意すべき必須事項等)		20	
	1. 警告内容とその理由	16		5. 承認条件等	20
	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	16		6. 包装	20
	3. 効能又は効果に関連する			7. 容器の材質	20
	使用上の注意とその理由	16		8. 同一成分・同効薬	20
	4. 用法及び用量に関連する			9. 国際誕生年月日	20
	使用上の注意とその理由	16		10. 製造販売承認年月日及び承認番号	21
	5. 慎重投与内容とその理由	16		11. 薬価基準収載年月日	21
	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	16		12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の	
	7. 相互作用	16		年月日及びその内容	21
	(1)併用禁忌とその理由	16	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日		
	(2)併用注意とその理由	16	及びその内容	21	
	8. 副作用	16	14. 再審査期間	21	
	(1)副作用の概要	16	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	21	
	(2)重大な副作用と初期症状	17	16. 各種コード	21	
	(3)その他の副作用	17	17. 保険給付上の注意	21	
(4)項目別副作用発現頻度及び		XI 文献	22		
臨床検査値異常一覧	17		1. 引用文献	22	
(5)基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等		2. その他の参考文献	22		
背景別の副作用発現頻度	17	XII 参考資料	22		
(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法	17		1. 主な外国での発売状況	22	
9. 高齢者への投与	17	2. 海外における臨床支援情報	22		
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	17	XIII 備考	22		
11. 小児等への投与	17		その他の関連資料	22	
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	18				
13. 過量投与	18				
14. 適用上の注意	18				
15. その他の注意	18				
16. その他	18				

I 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ネリコルト軟膏・ネリコルト坐剤は、合成フッ素副腎皮質ステロイドの1つで抗炎症薬であるジフルコルトロン吉草酸エステルと、局所麻酔作用を有するリドカインを配合した痔疾用剤である。

ネリコルト軟膏・ネリコルト坐剤は、後発品医薬品として大正薬品工業が開発し 2003 年 3 月に承認され、同年 7 月販売するに至った。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1) 痔核に伴う症状(出血、疼痛、腫脹)の緩解に適応を有している。

(「V 1. 効能又は効果」の項参照)

2) ウィークリーシート包装である。

3) 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のでいずれも頻度は不明であるが、副作用として皮膚および陰部の真菌症、ウイルス性及び細菌性感染症、そう痒感、皮膚刺激感、下痢等があらわれることがある。

(「VIII 8. 副作用」の項参照)

II 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ネリコルト軟膏

ネリコルト坐剤

(2) 洋名

NERICOLT

(3) 名称の由来

特記すべき由来はない。

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(JAN)

リドカイン(JAN)

(2) 洋名(命名法)

Diflucortolone Valerate (JAN)

Lidocaine (JAN)

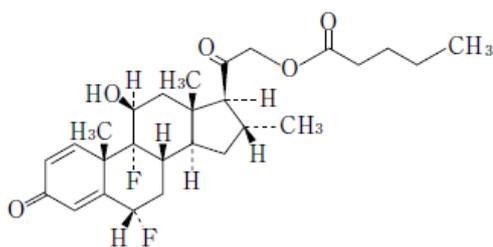
(3) ステム

-olone: プレドニゾロン誘導体以外の副腎皮質ホルモン

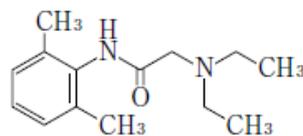
-caine: 局所麻酔薬

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

分子式: $C_{27}H_{36}F_2O_5$

分子量: 478.57

リドカイン

分子式: $C_{14}H_{22}N_2O$

分子量: 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

リドカイン

2-Diethylamino-*N*-(2,6-dimethylphenyl) acetamide

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号:DFV(ジフルコルトロン吉草酸エステル)、LDC(リドカイン)

別名:吉草酸ジフルコルトロン

7. CAS 登録番号

2607-06-9(ジフルコルトロン)

59198-70-8(ジフルコルトロン吉草酸エステル)

137-58-6(リドカイン)

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

融点:200～204℃

リドカイン

融点:66～69℃

(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¹⁾

ジフルコルトロン吉草酸エステル

旋光度

$[\alpha]_D^{20}$: +110～+115° (乾燥物に換算したものの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

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」確認試験法による

- 1) フッ化物の定性反応
- 2) 紫外可視吸光度測定法(吸収スペクトル)
- 3) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)

リドカイン

日局「リドカイン」確認試験法による

- 1) 紫外可視吸光度測定法(吸収スペクトル)
- 2) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)

4. 有効成分の定量法

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」定量法による

液体クロマトグラフィー

リドカイン

日局「リドカイン」定量法による

過塩素酸滴定法

IV 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 投与経路

軟膏:直腸

坐剤:直腸

(2) 剤形の区別、規格及び性状

販売名	ネリコルト軟膏	ネリコルト坐剤
性状	白色～帯黄白色のクリーム状の軟膏	白色～微黄色の坐剤
外形	——	
融点	——	32～36℃
質量	——	約 1.8g

(3) 製剤の物性

該当資料なし

(4) 識別コード

坐剤:TYK367

(5) pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

該当しない

(6) 無菌の有無

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量

ネリコルト軟膏:1g 中に日局ジフルコルトロン吉草酸エステル 0.1mg 及び日局 リドカイン 20mg を含有する。

ネリコルト坐剤:1個中に日局ジフルコルトロン吉草酸エステル0.2mg及び日局 リドカイン40mgを含有する。

(2) 添加物

ネリコルト軟膏:サラシミツロウ、流動パラフィン、ワセリン、ペンタエリスリチルクエン酸高級脂肪酸エステル、ミツロウ、ノニオン乳化剤、pH調整剤

ネリコルト坐剤:ハードファット

(3) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

3. 用時溶解して使用する製剤の調製法

該当しない

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性

加速試験

最終包装製品を用いた加速試験(35℃、相対湿度 75%、8 ヶ月)の結果、ネリコルト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。

試験結果

ネリコルト軟膏²⁾ 温度:35±1℃、湿度:75±5%RH

試験項目	試験規格	保存期間								
		製造直後		2 ヶ月後		5 ヶ月後		8 ヶ月後		
性状 (外観)	白色～帯黄白色のクリーム状の軟膏である	帯黄白色のクリーム状の軟膏であった		帯黄白色のクリーム状の軟膏であった		帯黄白色のクリーム状の軟膏であった		帯黄白色のクリーム状の軟膏であった		
		同上		同上		同上		同上		
		同上		同上		同上		同上		
確認試験	(1) 呈色反応	(ジフルコルトロン吉草酸エステル) 液は青緑色を呈する	液は青緑色を呈した		液は青緑色を呈した		液は青緑色を呈した		液は青緑色を呈した	
			同上		同上		同上		同上	
			同上		同上		同上		同上	
	(2) 呈色反応	(リドカイン) 上澄液は青紫色を呈する	/		/		/		上澄液は青紫色を呈した	
									同上	
									同上	
	(3) 薄層クロマト グラフイー	試料と標準のスポットのRf値は等しい	吉草酸ジフルコルトロン	リドカイン	吉草酸ジフルコルトロン	リドカイン	吉草酸ジフルコルトロン	リドカイン	吉草酸ジフルコルトロン	リドカイン
			0.89	0.83	0.92	0.86	0.91	0.85	0.94	0.87
			0.88	0.82	0.92	0.85	0.91	0.84	0.94	0.87
			0.88	0.82	0.92	0.86	0.91	0.84	0.94	0.88
定量	(ジフルコルトロン吉草酸エステル) 93 ~ 107% (%)	100.5		99.4		98.5		98.4		
		100.4		99.6		98.3		98.6		
		99.8		99.2		98.2		98.5		

	(リドカイン)	101.4	100.0	99.0	98.9
	93 ~ 107%	100.8	100.6	99.2	99.0
	(%)	99.7	100.4	99.0	98.4

ネリコルト坐剤³⁾ 温度:35±1℃、湿度:75±5%RH

試験項目	試験規格	保存期間								
		製造直後		2ヵ月後		5ヵ月後		8ヵ月後		
性状 (外観)	白色～微黄色 の坐剤である	白色の坐剤であつた		白色の坐剤であつた		白色の坐剤であつた		白色の坐剤であつた		
		同上		同上		同上		同上		
		同上		同上		同上		同上		
確認試験	(1) 呈色反応	(ジフルコルトロン 吉草酸エステル) 液は青緑色を 呈する	液は青緑色を呈した		液は青緑色を呈した		液は青緑色を呈した		液は青緑色を呈した	
			同上		同上		同上		同上	
			同上		同上		同上		同上	
	(2) 呈色反応	(リドカイン) 上澄液は青紫色を呈する	/		/		/		上澄液は青紫色を呈した	
			/		/		/		同上	
			/		/		/		同上	
	(3) 薄層クロマトグ ラフィー	試料と標準の スポットの Rf 値は等しい	吉草酸 ジフルコ ルトロン	リドカ イン	吉草酸 ジフルコ ルトロン	リドカ イン	吉草酸 ジフルコ ルトロン	リドカ イン	吉草酸 ジフルコ ルトロン	リドカ イン
			0.60	0.54	0.61	0.54	0.59	0.52	0.60	0.53
			0.60	0.54	0.61	0.54	0.59	0.52	0.60	0.53
			0.60	0.54	0.61	0.54	0.59	0.52	0.60	0.53
	溶解温度試験	32 ~ 36℃ (℃)	35.0		34.9		34.9		34.8	
			35.0		34.9		35.0		34.7	
34.9			35.0		34.9		34.8			
定量	(ジフルコルトロン 吉草酸エステル) 93 ~ 107%	101.1		101.8		99.4		98.9		
		101.2		100.3		100.0		98.5		
		100.9		100.3		99.4		98.7		
	(リドカイン) 93 ~ 107% (%)	100.3		100.6		98.8		98.4		
		100.5		99.5		99.0		98.3		
		99.6		99.8		99.3		98.1		

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当資料なし

8. 溶出性

該当しない

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

- 1) 呈色反応(ジフルコルトロン吉草酸エステル及びリドカイン)
- 2) 薄層クロマトグラフィー(ジフルコルトロン吉草酸エステル及びリドカイン)

11. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

12. 力 価

該当しない

13. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

14. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当資料なし

15. 刺激性

該当資料なし

16. その他

特になし

V 治療に関する項目

1. 効能又は効果

痔核に伴う症状(出血、疼痛、腫脹)の緩解

2. 用法及び用量

ネリコルト軟膏:通常、成人には1日2回適量を肛門内に注入する。

ネリコルト坐剤:通常、成人には1回1個を1日2回肛門内に挿入する。

3. 臨床成績

該当資料なし

(1) 臨床データパッケージ(2009年4月以降承認品目)

(2) 臨床効果

(3) 臨床薬理試験: 忍容性試験

(4) 探索的試験: 用量反応探索試験

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

2) 比較試験

3) 安全性試験

4) 患者・病態別試験

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

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、プピバカイン塩酸塩

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序¹⁾

作用部位:直腸・肛門

作用機序:

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。

リドカイン:一次感覚神経の無髄神経線維、細い有髄神経線維の Na⁺チャネル内の特異的結合部位に結合してイオンの細胞内への流入を阻止し、活動電位の発生を抑制することにより局所麻酔作用を発現する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

動物における薬効比較試験

○抗炎症作用

クローン油誘発痔疾モデル⁴⁾

ラットを用いたクローン油誘発痔疾モデルにおいて、ネリコルト軟膏・坐剤並びに標準製剤は150mg/animalの肛門内投与により炎症を有意に抑制したが、両群間に有意差は認められず生物学的に同等であることが確認された。なお、炎症の程度は、クローン油混合起炎剤を綿棒に浸透させ、ラット肛門内に挿入して起炎し、浮腫の進展に伴い直腸肛門部の重量が増加することを利用して算出した直腸肛門係数を指標とした。

薬物	投与量 (mg/animal)	体重(g)	直腸肛門管部の 湿重量(g)	RAC*
コントロール		262.8±2.7	0.309±0.010	1.18±0.04
ネリコルト軟膏	150	262.8±2.6	0.210±0.006	0.80±0.03
標準製剤	150	262.2±2.2	0.202±0.008	0.77±0.04

平均値±S.E. (n=10)

薬物	投与量 (mg/animal)	体重(g)	直腸肛門管部の 湿重量(g)	RAC*
コントロール		280.0±3.1	0.325±0.010	1.16±0.04
ネリコルト坐剤	150	280.3±3.0	0.231±0.011	0.83±0.04
標準製剤	150	279.7±2.8	0.221±0.012	0.79±0.04

平均値±S.E. (n=10)

*直腸肛門係数(RAC) = 直腸肛門管部の湿重量(g) / 体重(g) × 1000

機械刺激誘発性痔疾モデル⁵⁾

ラットを用いた機械刺激誘発性痔疾モデルにおいて、ネリコルト軟膏・坐剤並びに標準製剤は肛門・直腸重量増加に対する抗炎症作用を示したが、両群間に有意差は認められず生物学的に同等であることが確認された。

処置群	肛門一直腸部湿重量(mg/g 体重) (平均値±S.D.)
ネリコルト軟膏基剤群	1.50±0.30
ネリコルト軟膏群	1.10±0.30
標準製剤群	1.10±0.20

処置群	肛門一直腸部湿重量(mg/g 体重) (平均値±S.D.)
ネリコルト坐剤基剤群	1.30±0.20
ネリコルト坐剤群	0.90±0.20
標準製剤群	1.00±0.20

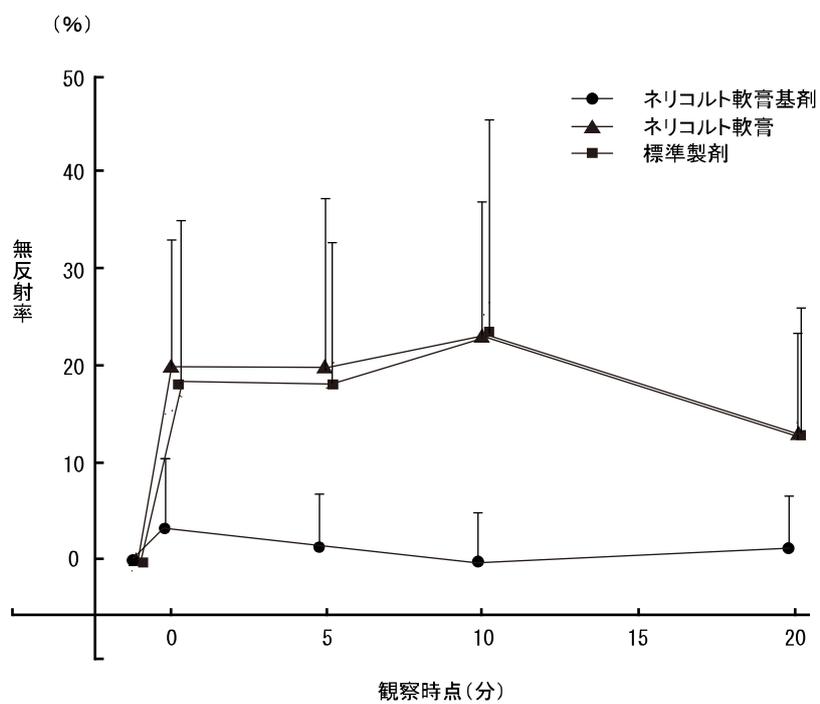
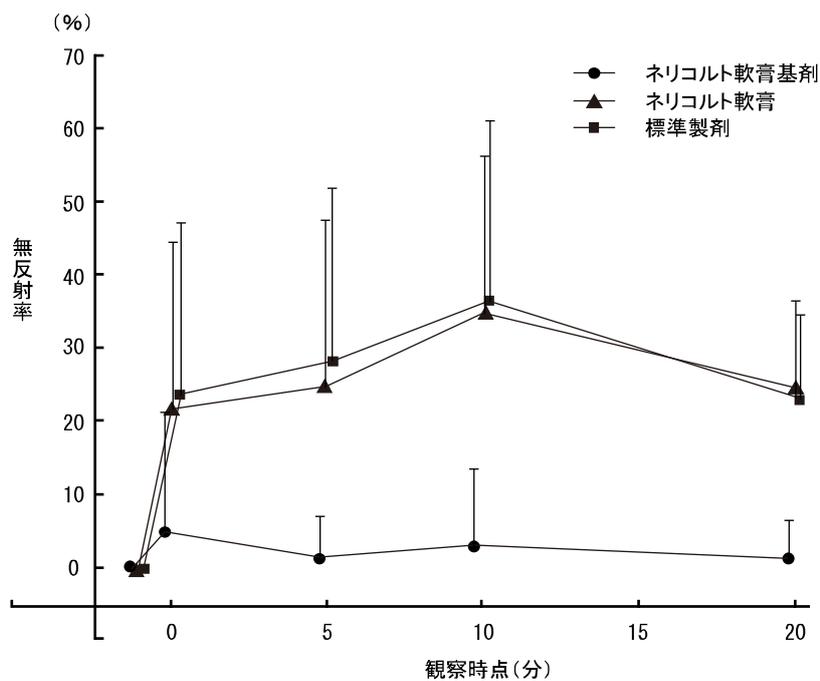
○鎮痛作用

急性組織損傷性疼痛モデル⁶⁾

ラットを用いた急性組織損傷性疼痛モデルにおいて、ネリコルト軟膏・坐剤並びに標準製剤は肛門括約筋の収縮反射反応を有意に抑制したが、両群間に有意差は認められず生物学的に同等であることが確認された。

群	観察時点 / 無反射率(%)				
	薬剤塗布前	0分目	5分目	10分目	20分目
ネリコルト軟膏基剤	0.0±0.0	5.0±15.8	1.7± 5.3	3.3±10.5	1.7± 5.3
ネリコルト軟膏	0.0±0.0	21.7±22.3	25.0±22.6	35.0±21.5	25.0±11.8
標準製剤	0.0±0.0	23.3±23.8	28.3±23.6	36.7±24.6	23.3±11.6

群	観察時点 / 無反射率(%)				
	薬剤塗布前	0分目	5分目	10分目	20分目
ネリコルト坐剤基剤	0.0±0.0	3.3± 7.0	1.7± 5.3	0.0± 0.0	1.7± 5.3
ネリコルト坐剤	0.0±0.0	20.0±13.1	20.0±17.2	23.3±14.0	13.4±10.5
標準製剤	0.0±0.0	18.3±16.6	18.3±14.6	23.3±22.5	13.3±13.1



(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・測定法

該当資料なし

- (1) 治療上有効な血中濃度
- (2) 最高血中濃度到達時間
- (3) 臨床試験で確認された血中濃度
- (4) 中毒域
- (5) 食事・併用薬の影響
- (6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因

2. 薬物速度論的パラメータ

該当資料なし

- (1) コンパートメントモデル
- (2) 吸収速度定数
- (3) バイオアベイラビリティ
- (4) 消失速度定数
- (5) クリアランス
- (6) 分布容積
- (7) 血漿蛋白結合率

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

該当資料なし

- (1) 血液—脳関門通過性
- (2) 血液—胎盤関門通過性
- (3) 乳汁への移行性
- (4) 髄液への移行性
- (5) その他の組織への移行性

5. 代謝

該当資料なし

- (1) 代謝部位及び代謝経路
- (2) 代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種
- (3) 初回通過効果の有無及びその割合
- (4) 代謝物の活性の有無及びその比率
- (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

6. 排泄

該当資料なし

- (1) 排泄部位及び経路
- (2) 排泄率
- (3) 排泄速度

7. 透析等による除去率

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

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

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

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。]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (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、またはこれらとの併用を考慮すること

7. 相互作用

該当しない

(1) 併用禁忌とその理由

(2) 併用注意とその理由

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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。

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。

	頻度不明
皮膚の感染症	皮膚および陰部の真菌症(カンジダ症、白癬等)、ウイルス性および細菌性感染症
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

* 軟膏のみ

(2) 重大な副作用と初期症状

該当しない

(3) その他の副作用

該当しない

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) 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には投与しないこと。
- 3) 副作用 過敏症に記載あり

9. 高齢者への投与

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。

10. 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。]

11. 小児等への投与

- (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。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

ネリコルト軟膏：眼科用として使用しないこと。

ネリコルト坐剤：本剤は直腸投与にのみ使用するよう指導すること。

15. その他の注意

該当しない

16. その他

特になし

Ⅸ 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

該当資料なし

- (1) 薬効薬理試験(「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照)
- (2) 副次的薬理試験
- (3) 安全性薬理試験
- (4) その他の薬理試験

2. 毒性試験

該当資料なし

- (1) 単回投与毒性試験
- (2) 反復投与毒性試験
- (3) 生殖発生毒性試験
- (4) その他の特殊毒性

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. 有効期間又は使用期限

使用期限:3年(安定性試験結果に基づく)

3. 貯法・保存条件

高温を避けて保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

特になし

(2) 薬剤交付時の注意(患者等に留意すべき必須事項等)

「Ⅷ 14.適用上の注意」の項参照

5. 承認条件等

特になし

6. 包装

ネリコルト軟膏:2g×14、2g×140

ネリコルト坐剤:28個、140個

7. 容器の材質

ネリコルト軟膏	チューブ・キャップ	ポリエチレン
	ピロー	セロハンポリエチレン複合フィルム
ネリコルト坐剤	コンテナ	ポリ塩化ビニル
	ピロー	ポリエチレンラミネートアルミニウムフィルム

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬:ネリプロクト軟膏・坐剤(バイエル薬品)

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

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日:2003年3月12日

承認番号 ネリコルト軟膏:21500AMZ00216

 ネリコルト坐剤:21500AMZ00217

11. 薬価基準収載年月日

2003年7月4日

12. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT 番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード (YJコード)	レセプト電算コード
ネリコルト軟膏	115578504	2559814M1034	620000391
ネリコルト坐剤	115577804	2559814J1038	620000390

17. 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。

XI 文 献

1. 引用文献

- 1) 第十五改正 日本薬局方 第二追補解説書 (2009)
- 2) 大正薬品工業(株) 社内資料：加速試験(軟膏)
- 3) 大正薬品工業(株) 社内資料：加速試験(坐剤)
- 4) 大正薬品工業(株) 社内資料：薬効比較試験 (クロトン油誘発痔疾モデル)
- 5) 大正薬品工業(株) 社内資料：薬効比較試験 (機械刺激誘発性痔疾モデル)
- 6) 大正薬品工業(株) 社内資料：薬効比較試験 (急性組織損傷性疼痛モデル)

2. その他の参考文献

特になし

XII 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII 備 考

その他の関連資料

該当資料なし