

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

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

フルチカゾン点鼻液25 μ g小児用「杏林」56噴霧用FLUTICASONE Nasal Solution 25 μ g for Pediatric

剤形	定量噴霧式点鼻液
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1mL中 フルチカゾンプロピオン酸エステル0.51mg 1回噴霧中 フルチカゾンプロピオン酸エステル25 μ g
一般名	和名：フルチカゾンプロピオン酸エステル（JAN） 洋名：Fluticasone Propionate（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2012年2月23日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2013年6月21日（販売名変更による） 販売開始年月日：2008年7月4日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：キョーリンリメディオ株式会社 販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	キョーリンリメディオ株式会社 学術部 TEL：0120-960189 FAX：0120-189099 受付時間：8時～22時（日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.med.kyorin-rmd.com/

本 IF は 2024 年 1 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で確認してください。



(01)14987060305685

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（<http://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・表現には薬機法の広告規則や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、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I F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、I Fを活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	9. 透析等による除去率	13
1. 開発の経緯	1	10. 特定の背景を有する患者	13
2. 製品の治療学的特性	1	11. その他	13
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	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	14
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1. 警告内容とその理由	14
6. RMP の概要	1	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
II. 名称に関する項目	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	14
1. 販売名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	14
2. 一般名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	14
3. 構造式又は示性式	2	7. 相互作用	15
4. 分子式及び分子量	2	8. 副作用	16
5. 化学名(命名法)又は本質	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	10. 過量投与	17
		11. 適用上の注意	17
III. 有効成分に関する項目	3	12. その他の注意	17
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	IX. 非臨床試験に関する項目	18
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 薬理試験	18
		2. 毒性試験	18
IV. 製剤に関する項目	4		
1. 剤形	4	X. 管理的事項に関する項目	19
2. 製剤の組成	4	1. 規制区分	19
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	2. 有効期間	19
4. 力価	4	3. 包装状態での貯法	19
5. 混入する可能性のある夾雑物	4	4. 取扱い上の注意	19
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	5. 患者向け資料	19
7. 調製法及び溶解後の安定性	6	6. 同一成分・同効薬	19
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6	7. 国際誕生年月日	19
9. 溶出性	6	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	19
10. 容器・包装	6	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	20
11. 別途提供される資料類	7	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	20
12. その他	7	11. 再審査期間	20
		12. 投薬期間制限に関する情報	20
V. 治療に関する項目	8	13. 各種コード	20
1. 効能又は効果	8	14. 保険給付上の注意	20
2. 効能又は効果に関連する注意	8		
3. 用法及び用量	8	XI. 文献	21
4. 用法及び用量に関連する注意	8	1. 引用文献	21
5. 臨床成績	8	2. その他の参考文献	21
VI. 薬効薬理に関する項目	10	XII. 参考資料	22
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	10	1. 主な外国での発売状況	22
2. 薬理作用	10	2. 海外における臨床支援情報	22
VII. 薬物動態に関する項目	12	XIII. 備考	23
1. 血中濃度の推移	12	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	23
2. 薬物速度論的パラメータ	12	2. その他の関連資料	23
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	13		
7. 排泄	13		
8. トランスポーターに関する情報	13		

略語表

略語	略語内容
CYP	チトクロム P450
ED ₅₀	50%有効量
S. E.	標準誤差

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、後発医薬品として薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を行い承認申請し、2008 年 3 月に承認を取得、2008 年 7 月に「フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液 25 μ g 小児用「PH」56 噴霧用」として薬価収載した。

その後、2013 年 6 月に「フルチカゾン点鼻液 25 μ g 小児用「杏林」56 噴霧用」に名称変更した。

2. 製品の治療学的特性

- 本剤は定量噴霧式鼻過敏症治療剤であり、アレルギー性鼻炎、血管運動性鼻炎の効能又は効果を有している。
(「V. 1. 効能又は効果」の項参照)

- 重大な副作用として、アナフィラキシーがある。(「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

1 日 2 回投与の鼻噴霧用ステロイド薬（香料無添加）である。

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

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

フルチカゾン点鼻液 25 μ g 小児用「杏林」56噴霧用

(2) 洋名

FLUTICASONE Nasal Solution 25 μ g for Pediatric “KYORIN” 56 sprays

(3) 名称の由来

「一般的名称」+「剤形」+「含量」+「屋号」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成17年9月22日薬食審査発第0922001号)に基づく〕

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

フルチカゾンプロピオン酸エステル (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

Fluticasone Propionate (JAN)

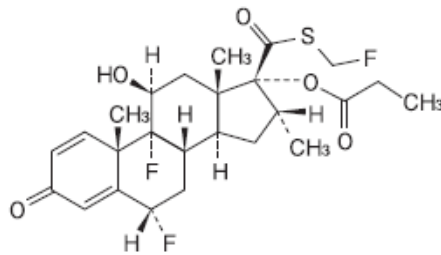
Fluticasone (INN)

(3) ステム

不明

3. 構造式又は示性式

化学構造式：



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₅H₃₁F₃O₅S

分子量：500.57

5. 化学名 (命名法) 又は本質

化学名：*S*-Fluoromethyl 6 α ,9 α -difluoro-11 β -hydroxy-16 α -methyl-3-oxo-17 α -propionyloxyandrost-1,4-diene-17 β -carbothioate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の微細な粉末である。

(2) 溶解性

ジメチルスルホキシドに溶解やすく、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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(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

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$: : +32 ~ +36° (乾燥後、0.25g、ジクロロメタン、50mL、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

● 確認試験法

(1) 呈色反応

(2) 沈殿反応

(3) 赤外吸収スペクトル測定法（ペースト法）

● 定量法

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

点鼻剤

(2) 製剤の外観及び性状

剤形・性状	白色の懸濁液の点鼻液
pH	5.0~7.0

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

販売名	フルチカゾン点鼻液 25 μ g 小児用「杏林」56 噴霧用
有効成分	1mL 中 フルチカゾンプロピオン酸エステル 0.51mg 1回噴霧中 フルチカゾンプロピオン酸エステル 25 μ g
添加剤	濃グリセリン、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、エデト酸ナトリウム水和物、pH 調節剤

(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) 加速試験¹⁾

[保存条件]

40°C±1°C、75%RH±5%RH

[試験検体]

ポリエチレン製の容器、ポリプロピレン製のフード、紙箱

[試験項目及び規格]

試験項目		規 格
性状		本品は、定量噴霧式の点鼻液であり、噴霧するとき、微細な霧状になる。本品の内容物は、白色の懸濁液である。
pH		5.0～7.0
比重		0.98～1.04
内容物質量		本品10個をとり、個々の内容物の質量を求めるとき、平均値は6.5～7.5gである。
1回噴霧量		本品10個をとり、各容器について得られた1回噴霧質量の平均値は、0.042g～0.058gである。
定量法	(1)4mL中の含量	表示量の90.0～110.0%
	(2)1回噴霧中の含量	表示量の80.0～125.0%

[結果]

正立状態

試験項目	開始時	1ヵ月	3ヵ月	6ヵ月
性状	適	適	適	適
pH [*]	6.38	6.38	6.36	6.36
比重 [*]	1.01	1.01	1.01	1.00
内容物質量	適	適	適	適
1回噴霧質量	適	適	適	適
4mL中の含量 [*]	99.6%	98.4%	98.2%	99.3%
1回噴霧中の含量 [*]	105.4%	103.2%	101.4%	99.4%

※1ロット n=3 の3ロットの平均値

横倒し状態

試験項目	開始時	1ヵ月	3ヵ月	6ヵ月
性状	適	適	適	適
pH [*]	6.38	6.37	6.39	6.35
比重 [*]	1.01	1.01	1.01	1.01
内容物質量	適	適	適	適
1回噴霧質量	適	適	適	適
4mL中の含量 [*]	99.6%	99.3%	98.2%	100.1%
1回噴霧中の含量 [*]	105.4%	104.6%	101.4%	100.9%

※1ロット n=3 の3ロットの平均値

2) 長期保存試験²⁾

[保存条件]

25°C±2°C、60%RH±5%RH

[試験検体]

ポリエチレン製の容器、ポリプロピレン製のフード、紙箱

[試験項目及び規格]

試験項目	規 格	
性状	本品は、定量噴霧式の点鼻液であり、噴霧するとき、微細な霧状になる。本品の内容物は、白色の懸濁液である。	
確認試験	(1) 呈色反応：液は暗赤色を呈する。 (2) 沈殿反応：黒色の沈殿を生じる。	
pH	5.0～7.0	
比重	0.98～1.04	
内容物質質量	本品10個をとり、個々の内容物の質量を求めるとき、平均値は6.5～7.5gである。	
1回噴霧量	本品10個をとり、各容器について得られた1回噴霧質量の平均値は、0.042g～0.058gである。	
定量法	(1) 4mL中の含量	表示量の90.0～110.0%
	(2) 1回噴霧中の含量	表示量の80.0～125.0%

[結果]

試験項目	開始時	0.5年	1年	1.5年	2年	3年
性状	適	適	適	適	適	適
pH*	6.50	6.47	6.47	6.44	6.47	6.46
比重*	1.01	1.01	1.01	1.01	1.01	1.01
内容物質質量	適	適	適	適	適	適
1回噴霧質量	適	適	適	適	適	適
4mL中の含量*	99.3%	99.2%	97.9%	99.2%	99.8%	100.5%
1回噴霧中の含量**	98.5～ 113.2%	99.6～ 113.0%	93.4～ 111.2%	98.7～ 114.0%	91.2～ 118.3%	89.2～ 113.0%

※1 ロット n=3 の3ロットの平均値

※※3ロットの最小値～最大値

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（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

4mL×5 (点鼻液 5 本が収められた紙箱に、使用説明書 5 枚と携帯袋 5 枚が同梱されている。)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

容器本体：ポリエチレン

ポンプ：ポリプロピレン、ポリエチレン、金属

キャップ：ポリプロピレン

ラベル：ポリエチレンテレフタレート

箱：紙

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

- アレルギー性鼻炎
- 血管運動性鼻炎

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

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。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6.用法及び用量

小児には、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25 μ 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。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

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。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

17.臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内第Ⅲ相試験

小児の通年性アレルギー性鼻炎患者 50 例に対し、フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液 1 回各鼻腔 25 μ g 1 日 2 回を 2 週間投与した非盲検群間比較試験において、有効性解析対象症例 45 例のくしゃみ、鼻汁、鼻閉の合計症状スコアの平均値（標準偏差）は、5.33（1.29）から 2.62（1.39）に低下し、症状別の改善度は中等度改善以上でそれぞれ 74.4%（くしゃみ）、83.7%（鼻汁）、64.4%（鼻閉）であった^{注 1)}。また、25 例に対し、フルチカゾンプロピオン酸エステル点鼻液投与前後における朝（8：00 から 10：00）の血中コルチゾールを測定した結果、低下は認められなかった³⁾。

安全性解析対象症例 50 例における副作用発現頻度は、8.0%（4/50 例）であり、その内訳は鼻汁膿性化傾向 2.0%（1/50 例）、血中コルチゾール減少（規定時間外採血）6.0%（3/50 例）であった。[9.7.2 参照]

注 1) くしゃみ、鼻汁、鼻閉の各症状の程度を「鼻アレルギー診療ガイドライン（通年性鼻炎と花粉症）改訂第 3 版」に従いスコア化した。症状別の改善度は投与前後の症状スコアから患者の重症度を算出し、注 2) の基準に従い判定した。

注 2) 鼻症状と鼻所見の改善度を「鼻アレルギー（含む花粉症）の診断と治療（アレルギー疾患治療ガイドライン）」に従い判定した。

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

グルココルチコイド：フルチカゾンフランカルボン酸エステル、ベクロメタゾンプロピオン酸エステル、モメタゾンフランカルボン酸エステル等

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

フルチカゾンプロピオン酸エステルは合成副腎皮質ステロイドであり、グルココルチコイド受容体を刺激することにより、抗炎症作用、アレルギー性鼻炎抑制作用及び抗アレルギー作用を示す^{4)~7)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 抗炎症作用

18.2.1 ヒト皮膚血管収縮作用

フルチカゾンプロピオン酸エステルは、McKenzie らの方法による健康成人皮膚における血管収縮試験（皮膚蒼白度を指標）において、ベクロメタゾンプロピオン酸エステルの約 1.9 倍、ベタメタゾン吉草酸エステルの約 2.6 倍、フルオシノロンアセトニドの約 9.5 倍の血管収縮作用を示した⁵⁾。

18.2.2 カラゲニン浮腫抑制作用

ラットにおけるカラゲニン足蹠浮腫抑制作用の強さは、局所投与でフルチカゾンプロピオン酸エステル>ベタメタゾン吉草酸エステル=ベクロメタゾンプロピオン酸エステルの順である⁶⁾。

18.3 アレルギー性鼻炎抑制作用

18.3.1 ラットアレルギー性鼻炎モデルにおいて、全身投与（皮下）あるいは局所投与により鼻粘膜血管透過性亢進反応を用量依存的に抑制する⁶⁾。全身投与による抑制作用の強さは ED₅₀ の比較においてフルチカゾンプロピオン酸エステル>ベクロメタゾンプロピオン酸エステル>ベタメタゾン吉草酸エステルの順である⁶⁾。

18.3.2 スギ花粉症患者に対し、好発期直前から 200 μg/日を鼻腔内投与した場合、鼻粘膜粘液上皮層中の好塩基性細胞数及び好酸球数の増加を抑制し、ヒスタミン含有量の減少傾向が認められた⁷⁾。

18.4 抗アレルギー作用

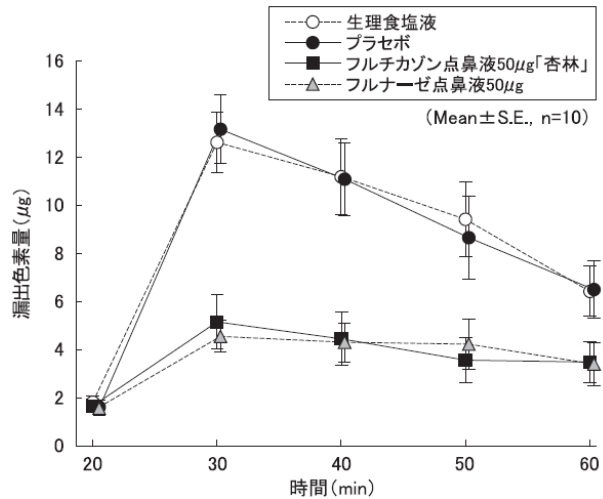
ラットにおける 48 時間 PCA 反応に対し、皮下投与で用量依存的に抑制する⁶⁾。抑制作用の強さは、フルチカゾンプロピオン酸エステル>ベタメタゾン吉草酸エステル>クロモグリク酸ナトリウムの順である⁶⁾。また、picryl chloride 誘発マウス耳浮腫法による遅延型アレルギー反応に対し、皮下投与で用量依存的に抑制し、その強さは ED₅₀ の比較において、フルチカゾンプロピオン酸エステル=ベクロメタゾンプロピオン酸エステル>ベタメタゾン吉草酸エステルの順である⁶⁾。

18.5 生物学的同等性試験

18.5.1 抗原誘発鼻粘膜血管透過性亢進に対する抑制作用（ラット）

ラットの実験的アレルギー性鼻炎モデルにおいて、鼻腔局所投与により抗原誘発鼻粘膜血管透過性亢進に対する抑制作用をプラセボ及びフルナーゼ点鼻液 50 μg と比較検討した。抑制効果の指標としては、鼻腔から流出する液を採取して、抗原誘発後 60 分間の漏出色素量を測定し検討を行った。

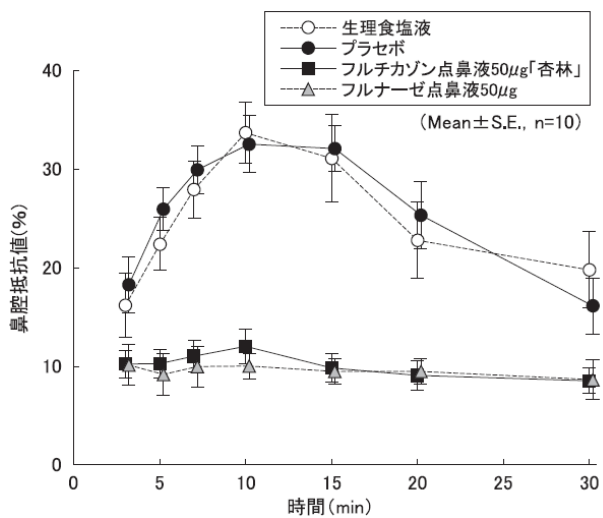
フルチカゾン点鼻液 50 μg 「杏林」群及びフルナーゼ点鼻液 50 μg 群は、誘発後 30 及び 40 分では、プラセボ群との間に有意差が認められ、漏出色素量増加に対する抑制効果が確認された。また、フルチカゾン点鼻液 50 μg 「杏林」群とフルナーゼ点鼻液 50 μg 群を比較した結果、有意差は認められず、両製剤の薬理的同等性が確認された⁸⁾。



18.5.2 抗原誘発鼻腔抵抗増加に対する抑制作用（モルモット）

モルモットの実験的アレルギー性鼻炎モデルにおいて、鼻腔局所投与により抗原誘発鼻腔抵抗増加に対する抑制作用をプラセボ及びフルナーゼ点鼻液 50 μg と比較検討した。通気溢出量の上昇を鼻腔抵抗上昇反応として測定し、抗原誘発後 30 分までの鼻腔抵抗値を比較検討した。

誘発後 5、7、10、15 及び 20 分では、フルチカゾン点鼻液 50 μg 「杏林」及びフルナーゼ点鼻液 50 μg 群ともに、プラセボ群との間に有意差が認められ、鼻腔抵抗増加の抑制効果が確認された。また、フルチカゾン点鼻液 50 μg 「杏林」群とフルナーゼ点鼻液 50 μg 群を比較した結果、有意差は認められず、両製剤の薬理学的同等性が確認された⁸⁾。



(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
該当資料なし
- (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) 解析方法
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
「Ⅷ. 6. (5) 妊婦」の項参照
- (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

16.4 代謝

フルチカゾンプロピオン酸エステルは CYP3A4 によって代謝を受ける⁹⁾。[10. 参照]

健康成人における経口投与時の血中主要代謝物は、17β-カルボン酸体であり、尿中では 17β-カルボン酸体及びそのグルクロン酸抱合体、糞中では未吸収による未変化体及び 17β-カルボン酸体である（外国人データ）。

- (2) 代謝に關与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率
「Ⅷ. 6. (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照
- (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 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〕

2.2 本剤の成分に対して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

8.重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 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。

8.2 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。

8.3 全身性ステロイド剤の減量は本剤の投与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。

8.4 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ので、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。

8.5 全身性ステロイド剤と比較し可能性は低いですが、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。

〈アレルギー性鼻炎〉

8.6 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。

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 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 鼻咽喉感染症（有効な抗菌剤の存在しない感染症、全身の真菌症を除く）の患者
症状を増悪するおそれがある。

9.1.2 反復性鼻出血の患者

出血を増悪するおそれがある。

9.1.3 重症な肥厚性鼻炎や鼻茸の患者

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。

9.1.4 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

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。これらの患者では副腎皮質機能不全となっていることが考えられる。[13.1 参照]

(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。本薬は皮下投与による動物実験（ラット¹⁰⁾、ウサギ¹¹⁾）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。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

(7) 小児等

9.7 小児等

9.7.1 長期間投与する場合には身長等の経過の観察を十分行うこと。また使用にあたっては、使用法を正しく指導すること。全身性ステロイド剤と比較し可能性は低いですが、点鼻ステロイド剤を特に長期間、大量に投与する場合に成長遅延をきたすおそれがある。

9.7.2 低出生体重児、新生児、乳児又は5歳未満の幼児を対象とした臨床試験は実施していない。[17.1.1 参照]

(8) 高齢者

設定されていない

7. 相互作用

10.相互作用

本剤は、主としてCYP3A4で代謝される⁹⁾。[16.4 参照]

(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

10.2 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ること。	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。

8. 副作用

11.副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

アナフィラキシー（頻度不明）

アナフィラキシー（呼吸困難、全身潮紅、血管性浮腫、蕁麻疹等）があらわれることがある。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.4%未満	頻度不明
過敏症		発疹、浮腫
鼻腔	鼻出血、不快臭	鼻症状（刺激感、疼痛、乾燥感）、鼻中隔穿孔、鼻潰瘍
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

発現頻度には使用成績調査の結果を含む。

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

13. 過量投与

13.1 症状

過量投与により副腎皮質機能抑制がみられることがある。[9.1.4 参照]

13.2 処置

患者の症状を観察しながら徐々に減量するなど適切な処置を行うこと。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 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。

- (1) 鼻腔内噴霧用にのみ使用すること。
- (2) 用時振盪すること。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

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。

(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」の項参照
- (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：フルチカゾン点鼻液 25 μ g 小児用「杏林」56 噴霧用 該当しない
有効成分：フルチカゾンプロピオン酸エステル 毒薬

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

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：

(使用説明書) フルチカゾン点鼻液 25 μ g 小児用「杏林」の使い方

(キョーリンリメディオ株式会社 医療関係者向けサイト <https://www.med.kyorin-rmd.com/> に掲載)

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：フルチカゾン点鼻液 50 μ g「杏林」28 噴霧用/56 噴霧用、フルナーゼ点鼻液 50 μ g28 噴霧用/56 噴霧用、小児用フルナーゼ点鼻液 25 μ g56 噴霧用

同 効 薬：フルチカゾンフランカルボン酸エステル、ベクロメタゾンプロピオン酸エステル、モメタゾンフランカルボン酸エステル、デキサメタゾンシペシル酸エステル

7. 国際誕生年月日

1990年 3月 8日

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

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
(旧販売名 ^注) フルチカゾンプロピオン酸 エステル点鼻液 25 μ g 小児 用「PH」56 噴霧用	2008年 3月 14日	22000AMX01363000	2008年 7月 4日	2008年 7月 4日
フルチカゾン点鼻液 25 μ g 小児用「杏林」56 噴霧用	2012年 2月 23日	22400AMX00623000	2013年 6月 21日	

注：経過措置期限 2014年 3月 31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、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
フルチカゾン点鼻液 25 μ g 小児用「杏林」 56 噴霧用	1329707Q2099	1329707Q2099	118534803	621853403

14. 保険給付上の注意

後発医薬品として承認された医薬品であっても、先発医薬品と薬価が同額又は高いものについては、診療報酬における加算等の算定対象とならない後発医薬品

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
フルチカゾン点鼻液 25 μ g 小児用「杏林」56 噴霧用の安定性試験に関する資料（加速試験）
- 2) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
フルチカゾン点鼻液 25 μ g 小児用「杏林」56 噴霧用の安定性試験に関する資料（長期保存試験）
- 3) 大久保公裕ほか：耳鼻咽喉科展望. 2002 ; 45 : 503-516
- 4) 田中千賀子ほか編：NEW 薬理学. 改訂第 7 版, 南江堂, 2017 : 508-512
- 5) Phillipps GH : Respir Med. 1990 ; 84 (Suppl. A) : 19-23
- 6) 藤原 肇ほか：基礎と臨床. 1992 ; 26 : 1271-1295
- 7) 大西正樹ほか：アレルギー. 1993 ; 42 : 228-235
- 8) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
フルチカゾン点鼻液 25 μ g 小児用「杏林」56 噴霧用の生物学的同等性試験に関する資料
- 9) Meibohm B, et al. : Rev Contemp Pharmacother. 1998 ; 9 : 535-549
- 10) 新保幸太郎ほか：薬理と治療. 1992 ; 20 : 1597-1632
- 11) 江崎洋志ほか：薬理と治療. 1992 ; 20 : 1643-1656

2. その他の参考文献

該当資料なし

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

XII. 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