

鼻過敏症治療剤

ベクロメタゾンプロピオン酸エステル点鼻液

ベクロメタゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 μ g「VTRS」

BECLOMETASONE Dipropionate Nasal Solution

日本標準商品分類番号

871329

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

承認番号	22700AMX00712
販売開始	1996年7月

2. 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

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	ベクロメタゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 μ g「VTRS」
有効成分	1瓶（7.5g）中 日局 ベクロメタゾンプロピオン酸エステル 9.375mg 1回噴霧中 日局 ベクロメタゾンプロピオン酸エステル 50 μ g
添加剤	カルボキシビニルポリマー、プロピレングリコール、ポリソルベート80、ベンザルコニウム塩化物液、pH調節剤

3.2 製剤の性状

性状	白色～微黄白色の粘稠性の液である。
pH	5.2～7.2

4. 効能又は効果

アレルギー性鼻炎、血管運動性鼻炎

6. 用法及び用量

擤鼻後十分の呼吸を行わせ、吸気の際に本剤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。次いで他側の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。

8. 重要な基本的注意

- 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、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。
- 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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

- 9.1.1 結核性疾患又は感染症（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
出血を増強するおそれがある。
- 9.1.3 高血圧の患者
血圧上昇を起こすおそれがある。

9.1.4 糖尿病の患者

症状を増悪するおそれがある。

9.1.5 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。

9.1.6 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。

9.1.7 喘息発作重積状態又は喘息の急激な悪化状態の患者

原則として本剤は使用しないこと。

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。動物実験で催奇形作用が報告されている。

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。

9.7 小児等

- 9.7.1 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。
- 9.7.2 使用に当たっては、使用法を正しく指導し、経過の観察を十分行うこと。長期、大量使用により発育障害をきたすおそれがある。
- 9.7.3 低出生体重児、新生児、乳児又は5才以下の幼児を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら投与期間に注意するなど慎重に投与すること。一般に生理機能が低下している。

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 眼圧亢進、緑内障（頻度不明）

11.2 その他の副作用

	頻度不明
過敏症	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 、くしゃみ発作、鼻出血 ^注 、感染 ^注 、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
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）吸入回数を減少させるか、吸入を中止すること。

13. 過量投与

13.1 症状

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。

13.2 処置

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。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 使用前

- (1) 患者には添付の携帯袋及び使用説明書（鼻用定量噴霧器の使用方法）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。

14.1.2 使用時

- (1) 初回使用時のみ空打ちを行うこと。
- (2) 噴霧口を針やピンなどで突かないこと。

15. その他の注意

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。

16. 薬物動態

16.3 分布

16.3.1 鼻腔内分布・付着滞留性

³Hで標識した主薬ベクロメタゾンプロピオン酸エステル及び付着性基剤ヒドロキシプロピルセルロースを含むベクロメタゾンプロピオン酸エステル点鼻剤を用いて、鼻腔内分布及び付着滞留性を検討し、以下の結果を得た。

- ・麻酔ウサギの鼻腔内に投与したとき、投与5分後には鼻腔前部の前鼻甲介に主として分布し、120分後には鼻腔内全域に分布した¹⁾。
- ・麻酔ウサギの鼻腔内に投与したとき、5分、120分、240分後の投与量に対する放射能残存率は、76.4%、41.0%、12.7%であった²⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

本剤は、鼻粘膜に付着滞留し、主薬ベクロメタゾンプロピオン酸エステルにより抗炎症作用及び誘発反応防御作用を示す²⁻⁴⁾。

18.2 抗炎症作用

ベクロメタゾンプロピオン酸エステルは、ヒト皮膚における血管収縮試験においてトリアムシノロンアセトニドの5倍、デキサメタゾンの約600倍の局所抗炎症作用を示した³⁾。

18.3 誘発反応防御作用

通年性鼻アレルギー成人患者を対象としたハウスダスト抗原による定量的鼻粘膜誘発試験を行い、ベクロメタゾンプロピオン酸エステル3 μ g/日、25 μ g/日、50 μ g/日及び100 μ g/日の1週間連続投与における鼻呼吸抵抗の変化を検討したところ、主薬ベクロメタゾンプロピオン酸エステルの投与量が増えるほど、抗原に対する鼻粘膜の感受性及び反応性が共に低下し、鼻粘膜誘発による鼻呼吸抵抗を防御的に抑制した。また、この抑制効果は臨床症状である鼻症状（くしゃみ、鼻汁、鼻閉）の改善効果と一致した⁴⁾。

18.4 生物学的同等性試験

18.4.1 抗鼻炎作用

ベクロメタゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 μ g「VTRS」とアルデシンミニ鼻用をラット実験的アレルギー性鼻炎モデルに点鼻投与し、鼻汁中漏出色素量及び鼻汁中漏出ライソゾーム酵素活性に対する抑制効果を指標として試験したところ、両剤ともコントロール群と比較して有意に抑制し、両剤間に有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が推測された⁵⁾。

18.4.2 抗鼻閉作用

ベクロメタゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 μ g「VTRS」とアルデシンミニ鼻用を受動感作モルモットに点鼻投与し、鼻閉に対する抑制効果を指標として試験したところ、両剤ともコントロール群と比較して有意に抑制し、両剤間に有意な差は認められず、両剤の生物学的同等性が推測された⁵⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

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

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

3,20-dione 17,21-dipropanoate

分子式：C₂₈H₃₇ClO₇

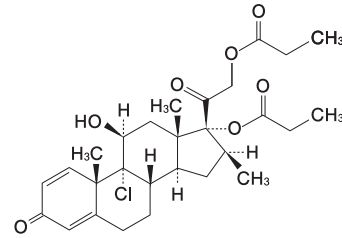
分子量：521.04

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（99.5）にやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

結晶多形が認められる。

化学構造式：



融点：約208℃（分解）

22. 包装

7.5g×10瓶

23. 主要文献

- 1) 山本勝ほか：基礎と臨床。1984；18（9）：4364-4371
- 2) 山本勝ほか：基礎と臨床。1984；18（9）：4359-4363
- 3) Bodor N, et al. : J Med Chem. 1983；26（3）：318-328
- 4) 臼井信郎ほか：耳鼻咽喉科展望。1984；27（補4）：486-498
- 5) 社内資料：生物学的同等性試験（ベクロメタゾンプロピオン酸エステル点鼻液50 μ g「VTRS」）

**24. 文献請求先及び問い合わせ先

ヴィアトリス製薬合同会社 メディカルインフォメーション部
〒106-0041 東京都港区麻布台一丁目3番1号
フリーダイヤル 0120-419-043

**26. 製造販売業者等

**26.1 製造販売元

ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社
東京都港区麻布台一丁目3番1号

**26.2 販売元

ヴィアトリス製薬合同会社
東京都港区麻布台一丁目3番1号