

痔疾用剤

ネイサート®坐剤

Neisat® Supp.

* 劇薬

貯法: 室温保存(1~30℃)

使用期限: 3年(外箱に記載)

注意: 【取扱上の注意】の項参照(ジフルコルトロン吉草酸エステル・リドカイン配合剤)

承認番号	21500AMZ00153000
薬価収載	2003年7月
販売開始	2003年7月


【禁忌(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

【組成・性状】

ネイサート坐剤は、1個中に日本薬局方ジフルコルトロン吉草酸エステル0.2mg、日本薬局方リドカイン40mg、添加物として、軽質無水ケイ酸及びハードファットを含有する、白色~微黄色の坐剤である。

溶解温度: 32~36℃

大きさ	外形	重量
長さ 29mm 直径 9mm		1.45g

【効能・効果】

痔核に伴う症状(出血、疼痛、腫脹)の緩解

【用法・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。

【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)
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. 重要な基本的注意
(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、又はこれらとの併用を考慮すること。
3. 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。
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	痒痒感、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

4. 高齢者への使用

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。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への使用

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。〕

6. 小児等への使用

- (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来すという報告がある。

7. 適用上の注意

本剤は直腸投与にのみ使用するよう指導すること。

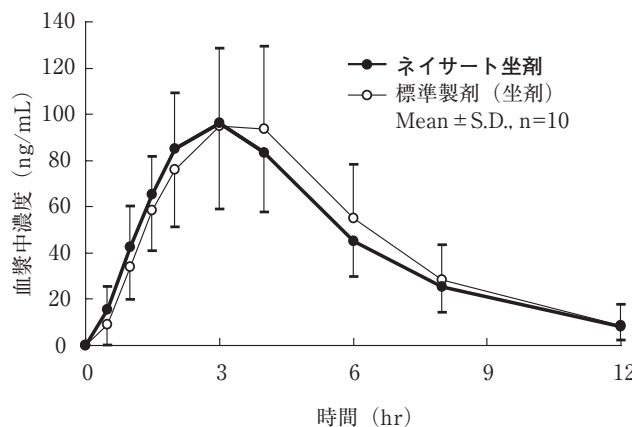
【薬物動態】

生物学的同等性試験¹⁾

ネイサート坐剤と標準製剤を、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)~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。

	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)
ネイサート坐剤	529.87±156.19	100.72±26.96	2.95±0.76	2.30±0.57
標準製剤 (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。

【薬効薬理】

抗炎症作用¹⁾

本剤は、クロトン油混合起炎剤誘発痔疾モデル(ラット)及び擦過刺激痔疾モデル(ラット)において、基剤投与に比べ有意に炎症を抑制した。

【有効成分に関する理化学的知見】

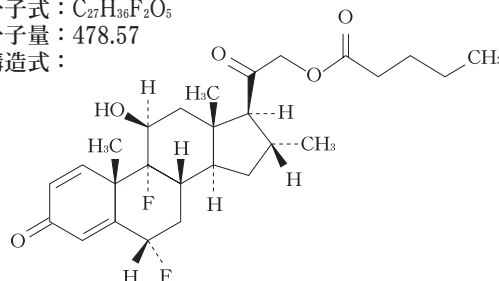
1. ジフルコルトロン吉草酸エステル(Diflucortolone Valerate)

** 化学名: 6α,9-Difluoro-11β,21-dihydroxy-16α-methylpregna-1,4-diene-3,20-dione 21-pentanoate

分子式: C₂₇H₃₆F₂O₅

分子量: 478.57

** 構造式:



** 性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末である。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。

融点：200～204℃

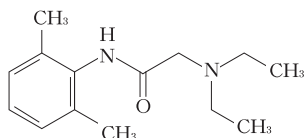
2. リドカイン (Lidocaine)

化学名：2-Diethylamino-*N*-(2,6-dimethylphenyl)acetamide

分子式：C₁₄H₂₂N₂O

分子量：234.34

構造式：



性状：本品は白色～微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。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。

本品は希塩酸に溶ける。

融点：66～69℃

【取扱い上の注意】

1. 取扱い上の注意

小児の手のとどかない所に保管すること。

2. 安定性試験²⁾

ネイサート坐剤は、最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、室温保存において3年間安定であることが推測された。また、最終包装製品を用いた長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における3年間の安定性が確認された。

【包装】

ネイサート坐剤 28個 42個 140個

【主要文献】

- 1) 日新製薬株式会社 社内資料：生物学的同等性に関する資料
- 2) 日新製薬株式会社 社内資料：安定性に関する資料

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

* 日新製薬株式会社 安全管理部
〒994-0069 山形県天童市清池東二丁目3番1号
TEL 023-655-2131 FAX 023-655-3419
E-mail: d-info@yg-nissin.co.jp

製造販売元



日新製薬株式会社

山形県天童市清池東二丁目3番1号