

** 2010年11月改訂(第8版)
* 2010年6月改訂

痔疾用剤

日本標準商品分類番号 872559

貯法：高温を避けて保存
使用期限：外箱等に表示

劇薬

ネリプロクト®軟膏

(ジフルコルトロン吉草酸エステル・
リドカイン痔疾用軟膏)

承認番号	20500AMY00206
薬価収載	1993年8月
販売開始	1993年9月
再審査結果	2002年9月



Neriproct® Ointment

D5

■ 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

販売名	ネリプロクト軟膏
成分・含量	1g中、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含有
添加物	白色ワセリン、流動パラフィン、クエン酸ジステアрил・ヤシ油脂肪酸ペンタエリトリトール、ソルビタンセスキオレイン酸エステル、サラシミツロウ、ステアリン酸アルミニウム、pH調整剤
色・性状	白色～帯黄白色のクリーム状の軟膏

■ 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日2回適量を肛門内に注入する。

■ 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

総症例2,612例中、13例(0.50%)に副作用が認められた。副作用は、痒痒(症)・肛門痒痒症3件(0.11%)、刺激感、下痢、蕁麻疹、出血各1件(0.04%)等であった。臨床検査値異常は認められなかった。(再審査終了時)

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。

	0.1～1%未満	0.1%未満	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

	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	痒痒感	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	

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

妊婦に対する安全性は確立していないので、妊婦又は妊娠している可能性のある女性に対し、大量又は長期にわたる使用を避けること。

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きたすという報告がある。

7. 適用上の注意

眼科用として使用しないこと。

■ 薬物動態

〈参考〉

吸収・分布・排泄

ラットにジフルコルトロン吉草酸エステル0.01mg/kg、リドカイン2.0mg/kgの配合剤として直腸内に3時間挿入するとき、48時間以内にジフルコルトロン吉草酸エステルは投与量の17%が血液に吸収され、その約70%が糞中に排泄された。また、直腸組織に投与3時間まで約2%と高濃度に分布していた。リドカインは投与量の約70%が吸収され、その85%が5時間以内に排泄されており、主要排泄経路は経腎排泄であった¹⁾。

■ 臨床成績

総計208例の痔核患者を対象に比較試験²⁾と一般臨床試験を行ったところ、本剤の痔核に対する有効率(改善以上)は77.4%であった。疾患別の有効率は次のとおりであった。

疾患名	改善以上(%)	やや改善以上(%)
内痔核	72.5(95/131)	92.4(121/131)
内外痔核	78.8(41/52)	94.2(49/52)
外痔核	100(25/25)	100(25/25)

■ 薬効薬理

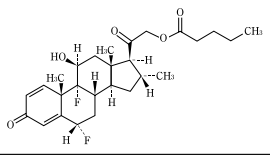
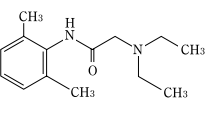
1. 抗炎症作用

本剤は、クロトン油誘発痔疾モデル(ラット)、擦過刺激痔疾モデル(ラット)のいずれにおいても、ヒドロコルチゾンカプロン酸エステルを含有する痔疾用剤と同等ないしはより強力な抗炎症作用を示した。また、ヒドロコルチゾン含有痔疾用剤及び副腎皮質ホルモンを含有しない痔疾用剤に比し抗炎症作用が強力であった³⁾。

2. 鎮痛作用

本剤は、カラゲニン・カオリン足腫(ラット)において、疼痛に対しリドカインによる速効性の鎮痛効果とジフルコルトロン吉草酸エステルによる炎症痛の経時的な軽減が認められた³⁾。

■ 有効成分に関する理化学的知見

	ジフルコルトロン吉草酸エステル	リドカイン
構造式		
一般名(JAN)	ジフルコルトロン吉草酸エステル (Diflucortolone Valerate)	リドカイン (Lidocaine)
化学名	6 α ,9-Difluoro-11 β ,21-dihydroxy-16 α -methylpregna-1,4-diene-3,20-dione 21-pentanoate	2-Diethylamino-N-(2,6-dimethylphenyl)acetamide
分子式	C ₂₇ H ₃₆ F ₂ O ₅	C ₁₄ H ₂₂ N ₂ O
分子量	478.57	234.34
融点	200~204℃	66~69℃
性状	本品は白色の結晶又は結晶性の粉末である。 本品は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。	本品は白色~微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。 本品は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。

■ 取扱い上の注意

小児の手のとどかない所に保管するよう指導すること。

■ 包装

軟膏

* 2 g × 14, 2 g × 140, 2 g × 350
10 g × 10

■ 主要文献

- 1) 東 治喜他：バイエル薬品社内資料[薬物動態(ラット)] (1986)
- 2) 衣笠 昭他：薬理と治療 17(12)：5953(1989)
- 3) 西木克侑他：日薬理誌 92：227(1988)

■ 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。

バイエル薬品株式会社・メディカルインフォメーション
〒530-0001 大阪市北区梅田二丁目4番9号

■ バイエル医療用医薬品のお問い合わせ先

バイエル薬品株式会社・くすり相談 ☎ 0120-106-398

製造販売元(輸入) **バイエル薬品株式会社**
大阪市北区梅田二丁目4番9号