

一般用医薬品と同じ有効成分を含む医療用医薬品の添付文書

有効成分	医療用医薬品の例 販売名（製造販売業者）
オキシメタゾリン塩酸塩	ナシビン点鼻・点眼液 0.05% （佐藤製薬株式会社）
クロトリマゾール	エンペシド錠 100mg （バイエル薬品株式会社）

点鼻・点眼用局所血管収縮剤

ナシビン®点鼻・点眼液0.05%

Nasivin® Nasal, Ophthalmic Solution 0.05%

貯法：室温保存
 使用期限：5年（外箱、ラベルに表示の使用期限内に使用すること）

※オキシメタゾリン塩酸塩液

承認番号	22000AMX01865000
薬価収載	2008年12月
販売開始	2007年8月
再評価結果	1977年10月

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

—耳鼻科用剤—

1. 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者
2. 2歳未満の幼児・乳児〔全身症状が起こりやすい。〕
3. モノアミン酸化酵素阻害剤を投与中の患者〔急激な血圧上昇を起こすおそれがある。〕

—眼科用剤—

1. 閉塞隅角緑内障の患者〔血管収縮剤は閉塞隅角緑内障の場合には眼圧上昇のおそれがある。〕
2. モノアミン酸化酵素阻害剤を投与中の患者〔急激な血圧上昇を起こすおそれがある。〕

※※【組成・性状】

販売名	ナシビン点鼻・点眼液0.05%
成分 (1mL中)	有効成分・含有量 オキシメタゾリン塩酸塩 0.5mg
	添加物 ベンザルコニウム塩化物、ホウ酸、 ホウ砂
剤形	液剤（褐色瓶）
色・形状	無色澄明液

【効能・効果】

- 耳鼻科用：上気道の諸疾患の充血・うっ血
- 眼科用：表在性充血（原因療法と併用）

【用法・用量】

- 耳鼻科用：通常、成人1回2～3滴を1日1～4回点鼻する。
 なお、年齢、症状により適宜増減する。
 眼科用：通常、成人1回1～2滴を1日1～4回点眼する。
 なお、年齢、症状により適宜増減する。

【使用上の注意】

—耳鼻科用剤—

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
 - (1) 冠動脈疾患のある患者〔血管を収縮して冠動脈疾患を悪化させるおそれがある。〕
 - (2) 高血圧症の患者〔末梢血管を収縮して血圧を上昇させるおそれがある。〕
 - (3) 甲状腺機能亢進症の患者〔甲状腺機能亢進症の患者は交感神経が興奮状態にあることが多い。〕
 - (4) 糖尿病の患者〔肝臓のグリコーゲンを分解して血糖を上昇させる作用がある。〕

2. 重要な基本的注意

連用又は頻回使用により反応性の低下や局所粘膜の二次充血を起こすことがあるので、急性充血期に限って使用するか又は適切な休薬期間をおいて使用すること。

3. 相互作用

併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
モノアミン酸化酵素阻害剤	急激な血圧上昇を起こすおそれがある。	両剤共に血圧上昇作用があるため、相加的に作用が増強すると考えられている。

4. 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ため、頻度は不明である。（再審査対象外）
 以下のような副作用が認められた場合には、減量・休薬など適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症 ^{注1)}	過敏症状
精神神経系	神経過敏、頭痛、めまい、不眠症等
循環器	心悸亢進等
消化器	悪心・嘔吐等
鼻	熱感、刺激痛、乾燥感、反応性充血、鼻漏、くしゃみ等
長期使用	反応性の低下等

注1) 副作用があらわれた場合には使用を中止すること。

5. 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使用すること。〔妊婦に対する安全性は確立していない。〕

6. 小児等への投与

- (1) 過量投与により、発汗、徐脈、昏睡等の全身症状があらわれやすいので、使用しないことが望ましい。
- (2) やむを得ず使用する場合には、使用法を正しく指導し、経過の観察を十分に行うこと。

7. 適用上の注意

投与時：粘膜、創傷面又は炎症部位に長期連用又は大量使用しないこと。〔ホウ酸及びホウ砂を含有しているため、これらによる急性中毒が起こることがある。〕

—眼科用剤—

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 冠動脈疾患のある患者〔血管を収縮して冠動脈疾患を悪化させるおそれがある。〕
- (2) 高血圧症の患者〔末梢血管を収縮して血圧を上昇させるおそれがある。〕
- (3) 甲状腺機能亢進症の患者〔甲状腺機能亢進症の患者は交感神経が興奮状態にあることが多い。〕
- (4) 糖尿病の患者〔肝臓のグリコーゲンを分解して血糖を上昇させる作用がある。〕
- (5) 眼圧上昇素因のある患者〔眼圧上昇のおそれがある。〕

2. 重要な基本的注意

連用又は頻回使用により反応性の低下や局所粘膜の二次充血を起こすことがあるので、急性充血期に限って使用するか又は適切な休薬期間をおいて使用すること。

3. 相互作用

併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
モノアミン酸化酵素阻害剤	急激な血圧上昇を起こすおそれがある。	両剤共に血圧上昇作用があるため、相加的に作用が増強すると考えられている。

4. 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ため、頻度は不明である。（再審査対象外）

以下のような副作用が認められた場合には、減量・休薬など適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症 ^{注2)}	過敏症状
精神神経系	頭痛、めまい、不眠症等
循環器	心悸亢進等
眼	熱感、乾燥感、痒痒感、反応性充血等

注2) 副作用があらわれた場合には使用を中止すること。

5. 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使用すること。[妊婦に対する安全性は確立していない。]

6. 小児等への投与

小児に使用する場合には、全身投与の場合と同様の副作用が起こりやすいので使用法を正しく指導し、経過の観察を十分に行うこと。

【薬効薬理】

1. 薬理作用

- (1) カエルの摘出後肢¹⁾、ウサギの耳介血管標本^{1,2)}、イヌの後肢血管灌流³⁾等の実験で、持続性の末梢血管収縮作用を有することが報告されている。
- (2) 麻酔ラット³⁾及び麻酔イヌ⁴⁾の鼻腔内投与時の鼻腔内圧測定で、持続性の鼻腔内圧低下作用が認められ、鼻粘膜下の末梢血管収縮作用を有することが報告されている。
- (3) ヒト正常粘膜にイミダゾリン液を点眼して発生した粘膜充血に対し、持続性の充血抑制効果を有することが報告されている⁵⁾。
- (4) 慢性副鼻腔炎等の鼻閉塞を訴える患者における鼻閉の消失は投与直後から数分以内に認められ、6～8時間持続した⁶⁾。また、各種眼疾患患者における結膜充血の改善も投与後数分後よりあらわれ、4～8時間持続した⁷⁾。

2. 作用機序

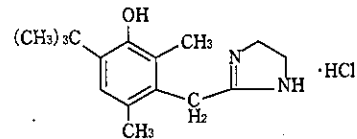
本剤の鼻粘膜ならびに粘膜の充血抑制作用の機序は交感神経 α 受容体を特異的に直接刺激することにより生じる末梢血管収縮作用に基づく^{8,9)}。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：Oxymetazoline Hydrochloride (JAN)

化学名：2-[4'-*tert*-Butyl-2', 6'-dimethyl-3'-hydroxybenzyl]-2-imidazoline hydrochloride

構造式：



分子式：C₁₆H₂₄N₂O · HCl

分子量：296.84

性状：本品は白色の結晶又は結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。

本品は胃酸に極めて溶けやすく、水、氷酢酸又はエタノールに溶けやすく、無水酢酸、エーテル又はクロロホルムにほとんど溶けない。

本品の水溶液（1→100）のpHは4.0～6.5である。

【包装】

500mL

※【主要文献】

- 1) Hotovy, R. et al. : *Arzneim.-Forsch.*, 11 : 1016(1961)
- 2) 佐藤製薬株式会社 社内資料；Nasivinの薬理作用
- 3) Salem, H. et al. : *Arch. Otolaryng.*, 96 : 524(1972)
- 4) Loux, J. J. : *Arch. Int. Pharmacodyn.*, 183 : 28(1970)
- 5) 佐藤製薬株式会社 社内資料；ナシビン(点眼貧血剤)の使用経験
- 6) 佐藤製薬株式会社 社内資料；血管収縮剤ナシビンの使用成績
- 7) 佐藤製薬株式会社 社内資料；新局所血管収縮剤 Nasivinの使用経験
- 8) Aviado, D. M. Jr. : *Sympathomimetic Drugs*, : 345(1970)
- 9) Mujic, M. et al. : *Arch. Int. Pharmacodyn.*, 155(2) : 432(1965)

【文献請求先】

主要文献（社内資料含む）は下記にご請求ください。

佐藤製薬株式会社 医薬事業部

〒107-0051 東京都港区元赤坂1丁目5番27号

TEL 03-5412-7817

FAX 03-3796-6560

製造販売元 **佐藤製薬株式会社**
東京都港区元赤坂1丁目5番27号

提携先 メルク KGaA社 ダルムシュタット,ドイツ

**2013年9月改訂(第6版)
*2010年7月改訂

抗真菌剤

エンペシド[®]錠100mg

(クロトリマゾール錠)

日本標準商品分類番号	872529
承認番号	22100AMX00738
薬価収載	2009年9月
販売開始	1976年1月

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示



Empecid[®]

D1

■ 禁忌(次の患者には使用しないこと)
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

■ 組成・性状

販売名	エンペシド錠100mg
成分・含量	1錠中、日局クロトリマゾール100mg含有
添加物	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、アルファ化デンプン、アジピン酸、炭酸水素ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸、ポリソルベート80、軽質無水ケイ酸
色・剤形	白色の発泡性の錠錠
外形(識別コード)	
長径(mm)	24.7
短径(mm)	10.2
厚さ(mm)	6.5
重さ(mg)	1,700

■ 効能・効果

カンジダに起因する陰炎及び外陰陰炎

■ 用法・用量

1日1回1錠を、陰深部に挿入する。一般に6日間継続使用するが、必要に応じ使用期間を延長する。

■ 使用上の注意

1. 副作用

承認時及び承認時以降の調査症例5,771例中64例(1.11%)に副作用が認められ、主な副作用は、熱感(0.73%)、刺激感(0.23%)、痒痒(0.12%)、発赤(0.12%)、疼痛(0.10%)等である。(承認時~1978年9月までの集計)

以下のような副作用があらわれた場合には使用を中止すること。

*		0.1~5%未満	頻度不明*
**	陰	局所の熱感、刺激感、痒痒、発赤・紅斑、疼痛	
*	皮膚		発疹

※：自発報告につき頻度不明

2. 妊婦、産婦、授乳婦等への使用

妊婦(3ヵ月以内)又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ使用すること。[妊娠中の使用に関する安全性は確立していない。]

3. 適用上の注意

陰にのみ使用し、経口投与しないこと。

■ 薬物動態

吸 収¹⁾

健康成人、患者に1日1回1錠(100mg)を7日間経陰投与し、投与中及び投与終了後7日目に血中濃度を測定した場合、いずれの時点においても測定限界(0.006µg/mL)以下である。

■ 臨床成績

二重盲検比較試験を含めて、総計852例について実施された臨床試験の概要は次のとおりである^{2,3)}。

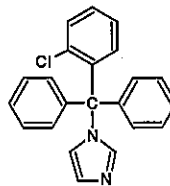
カンジダに起因する陰炎では533例中472例88.6%、外陰陰炎では239例中211例88.3%の有効率を示している。また二重盲検比較試験によって本剤の有用性が認められている。

■ 薬効薬理

1. クロトリマゾールはCandida属、Torulopsis属の陰真菌症の病原真菌に優れた抗真菌作用を有する^{4,5)}。
2. クロトリマゾールは真菌細胞の細胞膜、核膜等の膜系構造のリン脂質分子に特異的親和性を持って結合し、その透過性を変化させ、抗真菌作用を示す^{6,7)}。

■ 有効成分に関する理化学的知見

構造式：



一般名：クロトリマゾール(Clotrimazole) JAN
(Clotrimazole INN)

化学名：1-[(2-Chlorophenyl)(diphenyl)methyl]-1H-imidazole

分子式：C₂₂H₁₇ClN₂

分子量：344.84

融 点：142~145℃

性 状：本品は白色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。

本品はジクロロメタン又は酢酸(100)に溶けやすく、N,N-ジメチルホルムアミド、メタノール又はエタノール(95)にやや溶けやすく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

■ 包 装

錠錠 100mg 120錠(6錠×20)

■ 主要文献

- 1) 渡辺晴夫他：基礎と臨床，8(5)，304(1974)
- 2) 瀬戸俊之他：産婦人科の世界，30(3)，89(1978)
- 3) 金尾昌明他：産婦人科の世界，30(1)，81(1978)
- 4) Plempel, M. et al. : *Arzneim.-Forsch.*, 22(8)，1280(1972)
- 5) 高田道夫他：産婦人科の世界，25(3)，105(1973)
- 6) 岩田和夫他：日本細菌学雑誌，28(6)，513(1973)
- 7) 山口英世他：日本細菌学雑誌，29(2)，379(1974)

■ 文献請求先

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 **バイエル薬品株式会社**
大阪市北区梅田二丁目4番9号