

医薬品インタビューフォーム

点鼻用局所血管収縮剤

プリビナ[®]液 0.05%
Privina[®] Solution 0.05%

ナファゾリン硝酸塩点鼻液

剤形	液剤（点鼻用）
規格・含量	1mL中にナファゾリン硝酸塩（日局）0.5mgを含有
一般名	和名：ナファゾリン硝酸塩 洋名：Naphazoline nitrate
開発・製造・ 輸入・発売・ 販売会社名	製造販売元：日新製薬株式会社
担当者の連絡先 電話番号	
薬価基準収載・ 発売年月日	薬価基準収載年月日：2006年12月8日 発売年月日：1953年4月8日

®：登録商標

本IFは2018年1月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

整理番号

--	--	--	--	--	--	--	--	--	--

ご自由にご利用下さい

目次

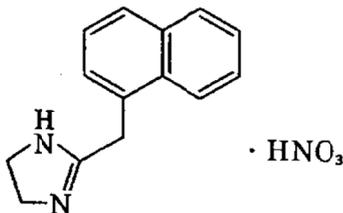
I. 概要に関する項目	1	V-1 効能・効果	5
I-1 開発の経緯	1	V-2 用法・用量	5
I-2 製品の特徴及び有用性、類似薬との比較	1	①用量	5
I-3 主な外国での発売状況	1	②用法	5
		③極量	5
II. 名称に関する項目	2	※ ④最大使用投与量・投与期間	5
II-1 商品名	2	※ ⑤小児用量	5
①和名	2	※ ⑥高齢者用量	5
②洋名	2	※ ⑦臓器障害時の投与量	5
③名称の由来	2	※ ⑧透析時の補正投与量	5
II-2 一般名	2	※ ⑨特殊患者群に対する注意	5
①和名(命名法)	2	※ ⑩特別な投与方法	5
②洋名(命名法)	2	V-3 臨床適用	5
II-3 構造式又は示性式	2	①臨床効果	5
II-4 分子式及び分子量	2	※ ②従来使用されている薬物との比較臨床試験データ	5
II-5 化学名、命名法	2	※ V-4 その他の薬理作用	5
II-6 慣用名、別名、略号、記号番号	2	V-5 治療的特徴	5
II-7 CAS登録番号	2		
III. 原薬の性状に関する項目	3	VI. 使用上の注意に関する項目	6
III-1 原薬の規制区分	3	VI-1 警告とその理由	6
III-2 起源	3	VI-2 一般的注意とその理由及び処置方法	6
III-3 物理化学的性質	3	VI-3 禁忌とその理由	6
①外観・性状	3	VI-4 慎重投与とその理由	7
②溶解性	3	VI-5 副作用	7
③吸湿性	3	①項目別副作用出現率及び臨床検査値異常	7
④融点(分解点)、沸点、凝固点	3	②背景別副作用出現率	7
⑤酸塩基解離定数	3	③副作用発生原因及び処置方法	7
⑥分配係数	3	④日本で見られていない外国での副作用報告及びその出典	7
⑦その他の主な示性値	3	VI-6 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	7
III-4 原薬の安定性	3	VI-7 妊娠又は妊婦への使用に関する注意	7
III-5 原薬の確認試験法	3	VI-8 授乳婦への使用に関する注意	8
III-6 原薬の純度試験法	3	VI-9 高齢者への使用に関する注意	8
III-7 構造上関連のある化合物又は化合物群	3	VI-10 新生児、未熟児、乳児、小児への使用に関する注意	8
IV. 製剤に関する項目	4	VI-11 相互作用	8
IV-1 剤形	4	①併用療法時の注意	8
①投与経路	4	②食物、嗜好品による影響	8
②剤形の区別、規格及び性状	4	VI-12 臨床検査値への影響	8
③製剤の物性	4	VI-13 適用上の注意	8
④識別コード	4	VI-14 薬剤交付時の注意事項	8
⑤無菌の有無	4	VI-15 過量投与時	9
IV-2 製剤上の特徴	4	VI-16 その他	9
IV-3 製剤の組成	4	VII. 薬効薬理に関する項目	10
①原薬(活性成分)の含量	4	VII-1 薬理的に関連のある化合物又は化合物群	10
②保存剤、賦形剤、安定性、溶媒、溶解補助剤、基剤等	4	VII-2 薬理作用	10
③添付溶解液の組成及び内容量	4	①作用部位・作用機序	10
IV-4 製剤の安定性	4	②効力を裏付ける試験成績	10
IV-5 他剤との配合変化	4	VII-3 薬理学的特徴	10
IV-6 製剤中の原薬確認試験	4		
IV-7 製剤中の原薬定量法	4	VIII. 体内薬物動態に関する項目	11
IV-8 力価	4	VIII-1 血中濃度の推移、測定法	11
IV-9 容器の材質	4	①治療上有効な血中濃度	11
IV-10 その他	4	②最高血中濃度到達時間	11
V. 治療に関する項目	5	③通常用量での血中濃度	11

④中毒症状を発現する血中濃度	11	IX- 1 一般薬理	13
VIII- 2 薬物速度論的パラメータ	11	IX- 2 毒性	13
①吸収速度定数	11	①急性毒性	13
②消失速度定数	11	②亜急性毒性	13
③分布容積	11	③慢性毒性	13
④血漿蛋白結合率	11	④生殖試験	13
⑤クリアランス	11	⑤その他の特殊毒性	13
⑥バイオアベイラビリティ	11	IX- 3 動物での体内動態	13
VIII- 3 作用発現時間	11	①吸収	13
VIII- 4 作用持続時間	11	②分布	13
VIII- 5 吸収	11	③代謝	13
VIII- 6 分布	11	④排泄	13
①血液-脳関門通過性	11	⑤その他	13
②血液-胎盤関門通過性	11		
③母乳中への移行性	11	X. 取扱い上の注意、包装、承認等に関する項目	14
④髄液への移行性	11	X- 1 有効期間・使用期限	14
⑤その他の組織への移行性	11	X- 2 貯法・保存条件	14
VIII- 7 代謝	11	X- 3 薬剤取扱い上の注意点	14
①代謝部位及び代謝経路	11	X- 4 包装	14
②初回通過効果の有無及びその割合	11	X- 5 同一成分・同効薬	14
③代謝物の活性の有無	11	X- 6 製造・輸入承認年月日・承認番号	14
④活性代謝物の速度論的パラメータ	12	X- 7 薬価基準収載年月日	14
VIII- 8 排泄	12	X- 8 再審査期間の年数	14
①排泄部位	12	X- 9 長期投与の可否	14
②排泄率	12	X-10 厚生労働省薬価基準収載の医薬品コード	14
③排泄速度	12		
VIII- 9 透析等による除去率	12	XI. 文献	15
①腹膜透析	12	XI- 1 引用文献	15
②血液透析	12	XI- 2 参考文献	15
③直接血液灌流	12	XI- 3 文献請求先	15
IX. 非臨床試験に関する項目	13	XII. 末尾	15

I. 概要に関する項目

- | | |
|-------------------------|---|
| I-1. 開発の経緯 | <p>ブリピナ液0.05%はスイス・チバガイギー研究所（現ノバルティス）で開発されたナファゾリン硝酸塩を含有する液剤である。チバガイギー研究所のイミダゾリン誘導体の研究から、ベンゼン核をナフチル核およびインドール核に置換させると昇圧作用が現れることを見だし、これらの化合物の一つである2-(1-Naphthylmethyl)-2-imidazoline mononitrateが強力な血管収縮作用を有していることが、1941年MeierとMuellerによって立証され、充血除去剤として1941年ドイツで初めて発売された。国内では上気道諸疾患の充血・うっ血の除去および上気道粘膜の表面麻酔時における局所麻酔剤の効力持続時間の延長を目的として1953年4月に発売され今日に至っているが、医療事故防止に係る販売名に関する一般原則に従って販売名称変更の申請を行い、2006年12月に新しい販売名が承認・薬価収載された。なお、日本薬局方には1961年の第7改正より収載されている。</p> <p>2018年1月にグラクソ・スミスクライン・コンシューマー・ヘルスケア・ジャパン(株)から日新製薬(株)に製造販売承認が承継された。</p> |
| I-2. 製品の特徴及び有用性、類似薬との比較 | <p>血管平滑筋のα-アドレナリン受容体に直接作用して血管を収縮させ、充血除去を目的に点鼻用及び点眼用がある。</p> |
| I-3. 主な外国での発売状況 | <p>Privin：ドイツ、オーストリア
Privina：アルゼンチン、ブラジル
Privine：アメリカ（ナファゾリン塩酸塩）</p> |

II. 名称に関する項目

II-1. 商品名	
① 和名	和名：プリビナ [®] 液 0.05%
② 洋名	洋名：Privina [®] Solution 0.05%
③ 名称の由来	
II-2. 一般名	
① 和名（命名法）	和名：ナファゾリン硝酸塩（JAN）
② 洋名（命名法）	洋名：Naphazoline nitrate（INN）
II-3. 構造式又は示性式	
II-4. 分子式及び分子量	分子式：C ₁₄ H ₁₄ N ₂ ·HNO ₃ 分子量：273.29
II-5. 化学名、命名法	2-(1-Naphthylmethyl)-2-imidazoline mononitrate（IUPAC 命名法による）
II-6. 慣用名、別名、略号、記号番号	
II-7. CAS 登録番号	5144 - 52 - 5

Ⅲ. 原薬の性状に関する項目

Ⅲ-1.	原薬の規制区分	
Ⅲ-2.	起源	MiescherとUrechにより合成され、1941年MeierとMuellerによって血管収縮作用が立証された。
Ⅲ-3.	物理化学的性質	
	① 外観・性状	白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。
	② 溶解性	酢酸（100）に溶けやすく、エタノール（95）にやや溶けやすく、水にやや溶けにくく、無水酢酸に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。
	③ 吸湿性	資料なし
	④ 融点（分解点）、沸点、凝固点	167～170℃
	⑤ 酸塩基解離定数	10.5（水）（滴定法）
	⑥ 分配係数	資料なし
	⑦ その他の主な示性式	pH5.0～7.0（水溶液：1→100）
Ⅲ-4.	原薬の安定性	熱、光及び空気に安定である。
Ⅲ-5.	原薬の確認試験法	第 15 改正日本薬局方（2006 年）の「ナファゾリン硝酸塩」の項目にある確認試験法に準じる。 (1) 本品の水溶液（1→100）10mL に臭素試液 5mL を加えて煮沸するとき、液は濃紫色を呈する。 (2) 本品の水溶液（1→100）20mL に水酸化ナトリウム試液 5mL を加え、ジエチルエーテル 25mL ずつで 2 回抽出する。ジエチルエーテル抽出液を合わせ、空気を送りながら蒸発乾固する。残留物を 80℃で 1 時間乾燥するとき、その融点は 117～120℃である。 (3) 本品の水溶液（1→20）は硝酸塩の定性反応を呈する。
Ⅲ-6.	原薬の純度試験法	第 15 改正日本薬局方（2006 年）の「ナファゾリン硝酸塩」の項目にある純度試験、定量法に準じる。 (1) 溶 状：本品 0.5g を水 50mL に溶かすとき、液は無色澄明である (2) 重金属：日局重金属試験法第 2 法 (3) 定量法：本品を乾燥し、その約 0.4g を精密に量り、無水酢酸/酢酸（100）混液（4：1）50mL に溶かし、0.1mol/L 過塩素酸で滴定する。（指示薬：クリスタルバイオレット試液）
Ⅲ-7.	構造上関連のある化合物又は化合物群	なし

IV. 製剤に関する項目

IV-1. 剤形	<p>① 投与経路</p> <p>② 剤形の区別、規格及び性状</p> <p>③ 製剤の物性</p> <p>④ 識別コード</p> <p>⑤ 無菌の有無</p>	<p>点鼻</p> <p>液剤、無色澄明の等張な緩衝液</p> <p>pH4.5～4.9</p> <p>該当せず</p>																				
IV-2. 製剤上の特徴																						
IV-3. 製剤の組成	<p>① 原薬（活性成分）の含量</p> <p>② 保存剤、賦形剤、安定剤、溶媒、溶解補助剤、基剤等</p>	<p>1mL 中ナファゾリン硝酸塩（日局）0.5mg 含有</p> <p>塩化ナトリウム、リン酸第二水素ナトリウム、塩化ベンザルコニウム（日局）、乾燥炭酸ナトリウム</p>																				
IV-4. 製剤の安定性		<table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <thead> <tr> <th style="text-align: center;">試験</th> <th style="text-align: center;">保存条件</th> <th style="text-align: center;">包装形態</th> <th style="text-align: center;">保存期間</th> <th style="text-align: center;">結果</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td style="text-align: center;">長期保存試験</td> <td style="text-align: center;">室温</td> <td style="text-align: center;">褐色ガラス瓶</td> <td style="text-align: center;">60 ヶ月</td> <td style="text-align: center;">変化がみられず安定であった</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;">温度</td> <td style="text-align: center;">30℃</td> <td style="text-align: center;">褐色ガラス瓶</td> <td style="text-align: center;">6 ヶ月</td> <td style="text-align: center;">変化がみられず安定であった</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;">光</td> <td style="text-align: center;">800Lux・hr (蛍光灯)</td> <td style="text-align: center;">褐色ガラス瓶</td> <td style="text-align: center;">50 万 Lux</td> <td style="text-align: center;">変化がみられず安定であった</td> </tr> </tbody> </table> <p style="text-align: center;">試験項目：外観・性状、分解物、含量</p>	試験	保存条件	包装形態	保存期間	結果	長期保存試験	室温	褐色ガラス瓶	60 ヶ月	変化がみられず安定であった	温度	30℃	褐色ガラス瓶	6 ヶ月	変化がみられず安定であった	光	800Lux・hr (蛍光灯)	褐色ガラス瓶	50 万 Lux	変化がみられず安定であった
試験	保存条件	包装形態	保存期間	結果																		
長期保存試験	室温	褐色ガラス瓶	60 ヶ月	変化がみられず安定であった																		
温度	30℃	褐色ガラス瓶	6 ヶ月	変化がみられず安定であった																		
光	800Lux・hr (蛍光灯)	褐色ガラス瓶	50 万 Lux	変化がみられず安定であった																		
IV-5. 他剤との配合変化		配合不適なものとしてデカドロン注、リンデロン液の報告がある。																				
IV-6. 製剤中の原薬確認試験		Ⅲ-5. 原薬の確認試験法(1)を参照																				
IV-7. 製剤中の原薬定量法		波長 280nm 付近の極大波長における吸光度を測定して定量する。																				
IV-8. 力価		資料なし																				
IV-9. 容器の材質		<p>キャップシール：ポリ塩化ビニル</p> <p>キャップ：ポリプロピレン</p> <p>パッキン：ポリプロピレン、ポリエチレン</p> <p>ボトル：褐色ガラスびん</p>																				
IV-10. その他																						

V. 治療に関する項目

V-1. 効能・効果	上気道の諸疾患の充血・うっ血、上気道粘膜の表面麻酔時における局所麻酔剤の効力持続時間の延長
V-2. 用法・用量	
① 用量	通常、成人鼻腔内には1回2～4滴を1日数回、咽頭・喉頭には1回1～2mLを1日数回塗布又は噴霧する。なお、年齢、症状により適宜増減する。
② 用法	局所麻酔剤への添加には、局所麻酔剤1mLあたり0.05%液2～4滴の割合で添加する。
③ 極量	資料なし
※④ 最大使用投与量、投与期間	資料なし
※⑤ 小児用量	資料なし
※⑥ 高齢者用量	資料なし
※⑦ 臓器障害時の投与量	資料なし
※⑧ 透析時の補正投与量	資料なし
※⑨ 特殊患者群に対する注意	資料なし
※⑩ 特別な投与方法	特になし
V-3. 臨床適用	
① 臨床効果	アレルギー性鼻炎、血管運動性鼻炎、急性慢性鼻炎、急性慢性副鼻腔炎、咽頭、喉頭炎及び浮腫等に対し有効性が認められている。
※② 従来使用されている薬物との比較臨床試験データ	
※ V-4. その他の薬理作用	
V-5. 治療的特徴	

VI. 使用上の注意に関する項目

VI-1. 警告とその理由

なし

VI-2. 一般的注意とその理由
及び処置方法

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において使用すること。

(解説)

局所粘膜の充血除去のために本剤を使用していると、一般の局所血管収縮剤にみられる二次充血、鼻閉を起こすことがある。また、これが常用癖につながるおそれがあるので、定められた用法・用量を厳守するとともに長期連用は避けなければならない。

本剤の長期常用者では鼻粘膜の肥厚が認められたとの報告、また、ウサギの鼻粘膜に本剤を投与して、8日目から鼻粘膜の組織学的変化を認めたとの報告がある。

使用日数は疾患の種類や症状の程度により変わってくるが、本剤は3～5日以上続けて使用すべきでない、また3～14日間との報告がある。

本剤の連続投与中に生じた鼻粘膜の二次充血、腫脹は、たとえ長期常用者の場合であっても投与中止により7～10日間位で消失するといわれている。

VI-3. 禁忌とその理由

【禁忌（次の患者には使用しないこと）】

1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2. 2歳未満の乳・幼児〔本剤の作用が強くあらわれ、ショックを起こすことがある。〕
3. MAO阻害剤の投与を受けている患者〔併用により、急激な血圧上昇を起こすおそれがある。〕

(解説)

1. 記載どおり

2. 本剤の中毒症状は小児、特に乳幼児に出現しやすく、症状としては末梢血管の過収縮による循環不全と、中枢神経系、特に脳幹機能の抑制状態としてとらえることができ、末梢血管収縮、血圧上昇、軽度皮質刺激後の中枢抑制状態、呼吸浅表、低体温、頻脈後の徐脈等がみられ、多くは12時間以内に軽快する。

〔VI-15. 過量投与時の項参照〕

3. 本剤は α アドレナリン作動薬であり、動物実験で血圧上昇が認められている。MAO阻害剤の投与を受けている患者ではノルアドレナリンの蓄積が増大しているため、本剤を併用した場合、急激な血圧上昇を起こすおそれがある。

〔VI-11. 相互作用①併用療法時の注意の項参照〕

VI-4. 慎重投与とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に使用すること）

(1) 冠動脈疾患のある患者〔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〔血圧が上昇するおそれがある。〕
 (3) 甲状腺機能亢進症の患者〔本剤に対する感受性が高まるおそれがある。〕
 (4) 糖尿病の患者〔血糖値が上昇するおそれがある。〕
 (5) 交感神経作用薬による不眠、めまい等の既往のある患者〔本剤の作用が強くあらわれるおそれがある。〕

(解説)

- (1) 本剤はアドレナリン様作用として心臓刺激作用を有しているが、大量投与においては心臓抑制作用も認められるため、冠動脈疾患のある患者に対しては慎重に投与しなければならない。
- (2) 本剤は局所血管収縮薬であり、動物実験において血圧上昇作用が認められている。また、ヒトに0.5%塩酸ナファズリン液を点鼻した試験において、35例中13例に収縮期血圧の上昇が認められており、高血圧症の患者に対しては慎重な投与が望ましい。
- (3) 甲状腺機能亢進症では、ホルモンの過剰分泌が起こっており、甲状腺ホルモンはアドレナリンのレセプター部位における反応の感受性を高める。同様にαアドレナリン作動薬である本剤に対しても感受性が高まるおそれがある。
- (4) 本剤はアドレナリン様作用として血糖上昇作用（グリコーゲン分解促進および末梢組織でのグルコース取り込み減少に伴う）を有しているため、糖尿病患者に対しては慎重に投与しなければならない。
- (5) 本剤はαアドレナリン受容体に直接作用する交感神経作用薬である。他の交感神経作用薬に強く反応し、不眠、めまい等の徴候を呈したことがある患者では、本剤の作用が強くあらわれることがあるので注意が必要である。

VI-5. 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。

	頻度不明
過敏症 ^{注)}	過敏症状
精神神経系	眠気等の鎮静作用（特に小児）、神経過敏、頭痛、めまい、不眠症
循環器	血圧上昇
呼吸器	くしゃみ
胃腸	悪心・嘔吐
鼻	熱感、刺激痛、乾燥感、嗅覚消失、反応性充血、鼻漏
長期使用	顆粒球減少、反応性の低下

注) 症状があらわれた場合には使用を中止すること。

- ① 項目別副作用出現率及び臨床検査値異常
- ② 背景別副作用出現率
- ③ 副作用発生原因及び処置方法
- ④ 日本で見られていない外国での副作用報告及びその出典

資料なし
 資料なし
 資料なし
 資料なし

VI-6. 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「VI. 禁忌とその理由」の項を参照

VI-7. 妊娠又は妊婦への使用に関する注意

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。〔妊娠中の使用に関する安全性は確立していない。〕

(解説)

本剤の催奇形性については実験が行われておらず、妊婦、胎児に与える影響は確認されていない。従って、記載のとおり、有益性が危険性を上回る場合のみ使用すること。また、本剤は子宮筋の緊張を高める傾向があるため、妊婦に対して投与する場合には特に過量投与にならないよう注意が必要である。

VI-8. 授乳婦への使用に関する注意

VI-9. 高齢者への使用に関する注意

VI-10. 新生児、未熟児、乳児、小児への使用に関する注意

小児等への使用

- (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。

(解説)

- (1) 小児はナファゾリンに対する感受性が強く、過量投与した場合、中枢抑制作用、呼吸障害、昏睡等があらわれることがあるので、小児に対しては使用しないことが望ましい。〔VI-15. 過量投与時の項参照〕
- (2) 本剤は 2 歳未満の乳・幼児には使用禁忌とされているが、鼻閉が強く、哺乳困難、睡眠障害をきたす場合には、本剤を生理食塩水で 2~3 倍に希釈し、就寝前や授乳前 5~10 分間隔で 2 回、1 回 1~2 滴を点鼻するとの報告がある。希釈しないで直接使用した場合、吸収されて全身性の副作用を起こすおそれがある。〔VI-15. 過量投与時の項参照〕

VI-11. 相互作用

① 併用療法時の注意

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
MAO 阻害剤	急激な血圧上昇が起こるおそれがある。	本剤はアドレナリン作動薬であり、MAO 阻害剤の投与を受けている患者では、ノルアドレナリンの蓄積が増大しているため、併用した場合急激な血圧上昇が起こるおそれがある。

(解説)

本剤はαアドレナリン作動薬であり、動物実験で血圧上昇作用が認められている。

② 食物による影響

VI-12. 臨床検査値への影響

資料なし

VI-13. 適用上の注意

眼科用として使用しないこと。

(解説)

眼への刺激性が懸念されるため、眼科用として使用しないこと。眼粘膜に刺激のない pH 領域は pH4.8~8.5 であるため、プリビナ液 0.05% (pH4.5~4.9) を使用すると、眼の刺激、痛みを感じることもある。

VI-14. 薬剤交付時の注意事項

VI-15. 過量投与時

徴候、症状：主な全身作用として、血圧上昇と二次作用として臓器虚血がみられる。

幼・小児では顕著な鎮静があらわれ、迅速な処置が必要となる。幼・小児でみられる症状に次のようなものがある。

- 呼吸機能：呼吸数の低下又はチェーン・ストークス型の不規則呼吸、二次性肺水腫。
- 心血管系：頻脈、高血圧、反射性徐脈。重度の場合一過性の血圧上昇の後に低血圧及びショック。心律動障害、冠動脈収縮に伴う狭心症様症状。
- 中枢神経系：一過性興奮及び反射亢進、次いで体温低下や意識障害等の中枢神経系の抑制、瞳孔散大、一過性の神経過敏、頭痛、ねむけ、めまい。
- 皮膚・粘膜：四肢冷却、蒼白、発汗、悪寒。

処置：微温の等張食塩液で鼻腔内をくり返しすぎ、洗浄液を吐き出させる。患者の意識が障害されている場合や幼・小児では頭を下げた姿勢をとらせ、鼻をすぎ、同時に嚥下を避けるために鼻-咽頭腔の吸引を行う。

特別な処置法は知られていないが、その薬理作用から次のような処置法が考えられる。

- 呼吸不全：酸素供給、気管内挿管、人工呼吸。
- 高血圧：動脈及び中心静脈圧をモニターしながら α -ブロッカー（フェントラミンの点滴静注等）又は直接的血管拡張作用のある薬剤（ヒドララジン静注等）の投与。
- 低血圧：両下肢を挙上し、血漿増量剤を投与。血管作用薬が必要な場合、その効果をモニターし、用量を調節しながら投与。
- 心律動障害：不整脈の一般的処置法に準ずる。
- 痙攣、興奮性亢進状態：酸素供給、十分な換気、ジアゼパム又は短時間作用型バルビツール酸系の投与。抗痙攣剤が換気不全を悪化させることがあり、また興奮状態から突然中枢神経抑制状態に変わることがあるので注意すること。

(解説)

記載どおり

VI-16. その他

その他の注意

外国において類似化合物（塩酸キシロメタゾリン）による治療中、原因不明の突然死が報告されている。

(解説)

外国において以下の症例は報告されている（海外自発報告）。

<症例>

35歳、男性。経蝶形骨下垂体切除術10日後に塩酸キシロメタゾリン（Oritivine*）を3～4回スプレーした。30分後ベッドで死亡しているのが見つかった。剖検を行うも突然死の原因は不明であった。

*Oritivine（本邦未発売）

一般名：塩酸キシロメタゾリン

適応症：鼻うっ血、通年性又はアレルギー性鼻炎の症状の軽減（イギリス）

作用：顕著な交感神経 α 作用を有する交感神経作用薬で、鼻血管の収縮作用により鼻粘膜及び咽頭付近のうっ血を除去する。

VII. 薬効薬理に関する項目

VII-1.	薬理学的に関連のある化合物又は化合物群	塩酸テトラヒドロズリン、トラマゾリン塩酸塩など
VII-2.	薬理作用	
	① 作用部位・作用機序	(1) α アドレナリン刺激作用 ナファゾリンは血管平滑筋の α -アドレナリン受容体に直接作用して血管を収縮させる。 ¹⁾ (2) 末梢血管収縮作用 アドレナリンより強い末梢血管収縮作用を有し、作用持続時間も長い（ウサギ耳殻血管）。 ²⁾
	② 効力を裏付ける試験成績	
VII-3.	薬理学的特徴	

VIII. 体内薬物動態に関する項目

VIII-1.	血中濃度の推移と生物学的半減期	
	① 治療上有効な血中濃度	資料なし
	② 最高血中濃度到達時間	資料なし
	③ 通常用量での血中濃度	資料なし
	④ 中毒症状を発現する血中濃度	資料なし
VIII-2.	薬物速度論的パラメータ	
	① 吸収速度定数	資料なし
	② 消失速度定数	資料なし
	③ 分布容積	資料なし
	④ 血漿蛋白結合率	資料なし
	⑤ クリアランス	資料なし
	⑥ バイオアベラビリティ	資料なし
VIII-3.	作用発現時間	鼻閉塞を訴えるアレルギー性鼻炎の患者に 0.1%ナファゾリン硝酸塩を投与した場合、作用発現は投与直後から 15 分以内に認められ 3~4 時間持続する。 ³⁾ (外国データ) ときには 20 時間持続することもある。
VIII-4.	作用持続時間	VIII-3. 作用発現時間の項参照
VIII-5.	吸収	鼻粘膜
VIII-6.	分布	
	① 血液-脳関門通過性	資料なし
	② 血液-胎盤関門通過性	資料なし
	③ 母乳中への移行	資料なし
	④ 髄液への移行性	資料なし
	⑤ その他の組織への移行性	資料なし
VIII-7.	代謝	
	① 代謝部位及び代謝経路	ナファゾリンの代謝物についての研究なされていないが、ナファゾリンに類似した化学構造を有するトラゾリンではほとんどすべてが未変化のまま排泄されるので、ナファゾリンにおいても同様にほとんど未変化のまま排泄されることが考えられる。
	② 初回通過効果の有無及びその割合	資料なし
	③ 代謝物活性の有無	資料なし

④ 活性代謝物の速度論的 パラメータ	資料なし
VIII-8. 排泄	
① 排泄部位	VIII-7. ①代謝部位及び代謝経路の項参照
② 排泄率	資料なし
③ 排泄速度	資料なし
VIII-9. 透析等による除去率	
① 腹膜透析	資料なし
② 血液透析	資料なし
③ 直接血管灌流	資料なし

IX. 非臨床試験に関する項目

IX-1. 一般薬理

動物実験で、血圧上昇（イヌ、ウサギ、ラット等）、血流量減少（イヌ）、平滑筋緊張低下・運動抑制（摘出ウサギ腸管）、子宮運動興奮（モルモット摘出子宮）等がみられている。^{2) 4) 5)}

IX-2. 毒性

① 急性毒性

急性毒性 (LD₅₀, mg/kg)⁶⁾
ナファゾリン塩酸塩として

投与経路	動物		
	ウサギ	ラット	マウス
皮下注	0.95±0.15	385±39.6	170±13.8
静注	0.8±0.09	—	—

② 亜急性毒性

資料なし

③ 慢性毒性

資料なし

④ 生殖試験

資料なし

⑤ その他の特殊毒性

資料なし

IX-3. 動物での体内動態

① 吸収

ナファゾリンの血中濃度については、雄ウサギに 7mg/kg を腹腔内または静脈内に注射した後、時間をおいて採血したときの、ナファゾリンの血漿中濃度と赤血球への分布が調べられている。

- (1) 腹腔内注射：ナファゾリンの血漿レベルは 6 時間後まで 30~40 μg/dL にとどまり、正確に測定できるほど高くないが、赤血球への分布は時間とともに増加し、注射 6 時間後には 800 μg/dL にまで達する。⁷⁾
- (2) 静注：投薬後ナファゾリンの血漿レベルは急激に減少し、3 時間後には 50~60 μg/dL の濃度になる。赤血球への分布は腹腔内注射の場合と同様に時間とともに増加し、6 時間後には 300~400 μg/dL のレベルにまで上昇する。⁷⁾

② 分布

ウィスター系雄ラット (125-150g) にナファゾリン 10-20mg/kg を静注した結果、ナファゾリンは肝、腎および脾に多く局在し、心、脳および筋肉には少ない。ウサギにナファゾリン 7mg/kg を静注した場合もおなじ結果を得たが、脳内の値はウサギの方が高かった。⁷⁾

③ 代謝

④ 排泄

雌ウサギ (2-2.5kg) にナファゾリン 7mg/kg を静注し、一定時間ごと 48 時間にわたり、カテーテルで採尿して尿中のナファゾリン様物質を測定したところ、ナファゾリン様物質は静注 24 時間後に約 16%、48 時間後に約 38%排泄される。⁷⁾

⑤ その他

X. 取扱い上の注意、包装、承認等に関する項目

X-1.	有効期間・使用期限	<p>使用期限：5年</p> <p>包装に表示の使用期限内に使用すること</p> <p>使用期限内であっても、開封後はなるべく速やかに使用すること</p>
X-2.	貯法・保存条件	室温保存
X-3.	薬剤取扱い上の注意点	<p>調剤上の留意点</p> <p>本品を小分けする場合は、微生物の混入等汚染が起きないように注意し、一度小分けしたものは、本品容器に戻さないこと。また、汚染が起きたときは使用しないこと。</p>
X-4.	包装	500mL
X-5.	同一成分・同効薬	<p>同一成分薬：なし</p> <p>同 効 薬：塩酸テトラヒドロゾリン、トラマゾリン塩酸塩、オキシメタゾリン塩酸塩</p>
X-6.	製造・輸入承認年月日・承認番号	<p>承認年月日：2006年8月17日</p> <p>承認番号：21800AMX10771000</p> <p><参考（旧販売名）></p> <p>承認年月日：1960年11月24日</p> <p>承認番号：13528KUZ10352009</p>
X-7.	薬価基準収載年月日	<p>2006年12月8日</p> <p><参考（旧販売名）></p> <p>1953年8月1日</p>
X-8.	再審査期間の年数	該当しない
X-9.	長期投与の可否	厚生労働省告示第99号（2002年3月18日付）に基づき投薬期間に上限が設けられている医薬品に該当しない。
X-10.	厚生労働省薬価基準収載の医薬品コード	1324704Q1033

X I . 文 献

X I -1. 引用文献

- 1) MujićM. et al. : Arch. int. Pharmacodyn. 155(2), 432-449, 1965
- 2) Meier R. et al. : Schweiz. Med. Wochenschr. 71(17), 554-556, 1941
- 3) Von Fredenhagen H. : Schweiz. Med. Wochenschr. 74(11), 287-290, 1944
- 4) Autret AM. et al. : Eur. J. Pharmacol. 13, 208-217, 1971
- 5) 待井精一 : 大阪市大医学雑誌 4, 66-72, 1955
- 6) Warren MR. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther. 86, 284-286, 1946
- 7) 赤羽次郎ほか : 信州医学雑誌 5(4), 229-236, 1960

X I -2. 参考文献

X I -3. 文献請求先

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

X II . 末 尾

日本病院薬剤師会の I F 様式に基づいて作成