

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領 2018（2019年更新版）に準拠して作成

<p>合成副腎皮質ホルモン剤 ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム注射液 リノサル®注射液 2mg (0.4%) リノサル®注射液 4mg (0.4%) リノサル®注射液 20mg (0.4%) LINOLOSAL® INJECTION</p>
--

剤形	注射液																
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）																
規格・含量	リノサル注射液2mg（0.4%）： 1アンプル0.5mL中ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム2.63mg （ベタメタゾンとして2mg） リノサル注射液4mg（0.4%）： 1アンプル1mL中ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム5.26mg （ベタメタゾンとして4mg） リノサル注射液20mg（0.4%）： 1アンプル5mL中ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム26.3mg （ベタメタゾンとして20mg）																
一般名	和名：ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム（JAN） 洋名：Betamethasone Sodium Phosphate（JAN）																
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	<table border="1"><thead><tr><th></th><th>リノサル注射液 2mg (0.4%)</th><th>リノサル注射液 4mg (0.4%)</th><th>リノサル注射液 20mg (0.4%)</th></tr></thead><tbody><tr><td>製造販売承認年月日</td><td colspan="3">2006年2月14日（販売名変更による）</td></tr><tr><td>薬価基準収載年月日</td><td colspan="3">2006年6月9日（販売名変更による）</td></tr><tr><td>販売開始年月日</td><td colspan="2">1975年2月1日</td><td>1987年10月1日</td></tr></tbody></table>		リノサル注射液 2mg (0.4%)	リノサル注射液 4mg (0.4%)	リノサル注射液 20mg (0.4%)	製造販売承認年月日	2006年2月14日（販売名変更による）			薬価基準収載年月日	2006年6月9日（販売名変更による）			販売開始年月日	1975年2月1日		1987年10月1日
	リノサル注射液 2mg (0.4%)	リノサル注射液 4mg (0.4%)	リノサル注射液 20mg (0.4%)														
製造販売承認年月日	2006年2月14日（販売名変更による）																
薬価基準収載年月日	2006年6月9日（販売名変更による）																
販売開始年月日	1975年2月1日		1987年10月1日														
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：わかもと製薬株式会社																
医薬情報担当者の連絡先																	
問い合わせ窓口	わかもと製薬株式会社 メディカルインフォメーション TEL：03-3279-0379 FAX：03-3279-1272 医療関係者向けホームページ： https://www.wakamoto-pharm.co.jp/																

本IFは2023年8月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

IF利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I Fの利用にあたって

電子媒体のI Fは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってI Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、I Fの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I Fが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I Fの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I Fを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。I Fは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1	10. 特定の背景を有する患者	19
1. 開発の経緯	1	11. その他	19
2. 製品の治療学的特性	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	20
3. 製品の製剤学的特性	1	1. 警告内容とその理由	20
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	2. 禁忌内容とその理由	20
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	20
6. RMPの概要	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	20
II. 名称に関する項目	2	5. 重要な基本的注意とその理由	20
1. 販売名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	21
2. 一般名	2	7. 相互作用	22
3. 構造式又は示性式	2	8. 副作用	24
4. 分子式及び分子量	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	25
5. 化学名（命名法）又は本質	2	10. 過量投与	25
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	11. 適用上の注意	25
III. 有効成分に関する項目	3	12. その他の注意	25
1. 物理化学的性質	3	IX. 非臨床試験に関する項目	27
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	1. 薬理試験	27
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	2. 毒性試験	27
IV. 製剤に関する項目	4	X. 管理的事項に関する項目	28
1. 剤形	4	1. 規制区分	28
2. 製剤の組成	4	2. 有効期間	28
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	3. 包装状態での貯法	28
4. 力価	4	4. 取扱い上の注意	28
5. 混入する可能性のある夾雑物	4	5. 患者向け資材	28
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	6. 同一成分・同効薬	28
7. 調製法及び溶解後の安定性	5	7. 国際誕生年月日	28
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日	28
9. 溶出性	5	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等 の年月日及びその内容	29
10. 容器・包装	5	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	29
11. 別途提供される資材類	6	11. 再審査期間	31
12. その他	6	12. 投薬期間制限に関する情報	31
V. 治療に関する項目	7	13. 各種コード	31
1. 効能又は効果	7	14. 保険給付上の注意	31
2. 効能又は効果に関連する注意	12	XI. 文献	32
3. 用法及び用量	12	1. 引用文献	32
4. 用法及び用量に関連する注意	13	2. その他の参考文献	32
5. 臨床成績	13	XII. 参考資料	32
VI. 薬効薬理に関する項目	15	1. 主な外国での発売状況	32
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15	2. 海外における臨床支援情報	32
2. 薬理作用	15	XIII. 備考	32
VII. 薬物動態に関する項目	17	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たっての参考情報	32
1. 血中濃度の推移	17	2. その他の関連資料	32
2. 薬物速度論的パラメータ	17		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	17		
4. 吸収	18		
5. 分布	18		
6. 代謝	18		
7. 排泄	18		
8. トランスポーターに関する情報	18		
9. 透析等による除去率	18		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ベタメタゾンリン酸エステルナトリウムは、1958年にイギリスのGlaxo社で開発された合成副腎皮質ホルモンで、ベタメタゾンの21位の水酸基をリン酸エステルのナトリウム塩とし水溶化を図ったものである。本邦では1964年にリンデロン注（塩野義製薬）が発売され、当社は1973年に承認を得て、1975年に発売に至った。

その後再評価が実施され、1984年6月に医薬品再評価結果 その22（副腎皮質ホルモン剤（その1）、1990年12月に医薬品再評価結果平成2年度（その2）が通知された。

なお、リノロサル注射液は「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成12年9月19日付）に基づき、医療事故防止の観点から、製品名の変更（用量を記載）を行い、2006年2月に承認、2006年6月に薬価収載、2006年8月に現製品名での発売に至った。

2. 製品の治療学的特性

- (1) ベタメタゾンのミネラルコルチコイド作用はヒドロコルチゾンに比べ減弱されている。また生物学的半減期は長時間作用型に分類される。

(VI. 2. 薬理作用の項参照)

- (2) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、誘発感染症、感染症の増悪、続発性副腎皮質機能不全、糖尿病、消化管潰瘍、消化管穿孔、膵炎、精神変調、うつ状態、痙攣、骨粗鬆症、大腿骨及び上腕骨等の骨頭無菌性壊死、ミオパチー、緑内障、後嚢白内障、血栓症、喘息発作の増悪があらわれることがある。

(VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

該当しない

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料，最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル，参照先
RMP	無	—
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無	—
最適使用推進ガイドライン	無	—
保険適用上の留意事項通知	無	—

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

リノロサル注射液2mg (0.4%)
リノロサル注射液4mg (0.4%)
リノロサル注射液20mg (0.4%)

(2) 洋名

LINOLOSAL INJECTION 2mg (0.4%)
LINOLOSAL INJECTION 4mg (0.4%)
LINOLOSAL INJECTION 20mg (0.4%)

(3) 名称の由来

同一有効成分の自社製品（他剤形）のブランド名及び剤形名より命名した。

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム (JAN)

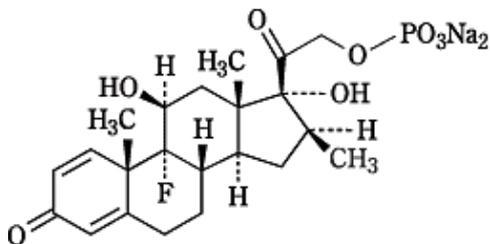
(2) 洋名(命名法)

Betamethasone Sodium Phosphate (JAN)

(3) ステム

プレドニン及びプレドニゾン誘導体：-methasone

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式: C₂₂H₂₈FN₂O₈P

分子量: 516.40

5. 化学名(命名法)又は本質

9-Fluoro-11β,17,21-trihydroxy-16β-methylpregna-1,4-diene-3,20-dione 21-(disodium phosphate)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～微黄白色の結晶性の粉末又は塊で、においはない。

(2) 溶解性

溶媒	日本薬局方の溶解度表記
水	溶けやすい
メタノール	やや溶けにくい
エタノール(95)	溶けにくい
ジエチルエーテル	ほとんど溶けない

(3) 吸湿性

吸湿性である。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約213℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$: +99～+105°（脱水物に換算したもの、0.1g、水、10mL、100mm）

pH : 本品0.10gを水20mLに溶かした液のpHは7.5～9.0である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

日本薬局方「ベタメタゾンリン酸エステルナトリウム」の確認試験法及び定量法による

確認試験法：

- (1) 本品を硫酸に溶かすとき、液は褐色を呈し、徐々に黒褐色に変わる。（Kober反応）
- (2) フッ化物の定性反応(2)
- (3) リン酸塩の定性反応(2)、ナトリウム塩の定性反応、リン酸塩の定性反応の(1)及び(3)
- (4) 赤外吸収スペクトル測定法

定量法：液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計（測定波長：254nm）

カラム：液体クロマトグラフィー用オクタデシルシリル化シリカゲル

移動相：テトラ-*n*-ブチルアンモニウム臭化物1.6g、リン酸水素二ナトリウム十二水和物3.2g及びリン酸二水素カリウム6.9gを水1000mLに溶かした液にメタノール1500mLを加える。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

注射剤

(2) 製剤の外観及び性状

無色澄明の水性注射剤

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

pH : 7.5~9.0

浸透圧比 : 0.8~1.3

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	リノロサル注射液 2mg (0.4%)	リノロサル注射液 4mg (0.4%)	リノロサル注射液 20mg (0.4%)
有効成分	1アンプル0.5mL中ベ タメタゾンリン酸エ ステルナトリウム 2.63mg (ベタメタゾン として2mg)	1アンプル1mL中ベ タメタゾンリン酸エ ステルナトリウム 5.26mg (ベタメタゾン として4mg)	1アンプル5mL中ベ タメタゾンリン酸エ ステルナトリウム 26.3mg (ベタメタゾン として20mg)
添加剤	塩化ナトリウム、リン酸水素ナトリウム水和物、リン酸二水素ナトリウム水和物、クエン酸ナトリウム水和物、pH調節剤		

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

(1) リノロサル注射液 2mg (0.4%)

試験の種類	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験 ¹⁾	25°C、60%RH	36 ヶ月	無色透明アンプル、遮光	規格内
加速試験 ²⁾	40±2°C	6 ヶ月	無色透明アンプル、箱入り (遮光)	規格内

試験項目：性状、確認試験、pH、浸透圧比、エンドトキシン試験、採取容量試験、不溶性異物試験、不溶性微粒子試験、無菌試験、含量

(2) リノロサル注射液 4mg (0.4%)

試験の種類	保存条件	保存期間	保存形態	結果
長期保存試験 ³⁾	25°C、60%RH	36 ヶ月	無色透明アンプル、遮光	規格内

試験項目：性状、確認試験、pH、浸透圧比、エンドトキシン試験、採取容量試験、不溶性異物試験、不溶性微粒子試験、無菌試験、含量

(3) リノロサル注射液 20mg (0.4%)

試験の種類	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験 ⁴⁾	40±2°C	6 ヶ月	無色透明アンプル、箱入り (遮光)	規格内

試験項目：性状、確認試験、pH、浸透圧比、エンドトキシン試験、採取容量試験、不溶性異物試験、不溶性微粒子試験、無菌試験、含量

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

(1) pH変動試験表

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
					←10mL					10mL→				
					4.2				8.3				12.3	

(2) 配合変化

社内資料：配合変化 参照 (<https://www.wakamoto-pharm.co.jp/medical/0047> or [0048](#) or [0049](#))

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

リノロサル注射液2mg (0.4%)

10アンプル [0.5mL×10]、50アンプル [0.5mL×50]

IV. 製剤に関する項目

リノロサル注射液4mg (0.4%)

10アンプル [1mL×10]、50アンプル [1mL×50]

リノロサル注射液20mg (0.4%)

10アンプル [5mL×10]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ガラスアンプル

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

※印の付されている投与法は、下記の場合にのみ用いること。

- ・ 静脈内注射及び点滴静脈内注射：経口投与不能時、緊急時及び筋肉内注射不適時
- ・ 筋肉内注射：経口投与不能時

効能又は効果	静脈内注射	点滴静脈内注射	筋肉内注射	その他の用法
○内科・小児科領域				
〈内分泌疾患〉				
慢性副腎皮質機能不全（原発性、続発性、下垂体性、医原性）			○	
急性副腎皮質機能不全（副腎クリーゼ）	○	○	○	
副腎性器症候群、亜急性甲状腺炎、甲状腺疾患に伴う悪性眼球突出			○※	
甲状腺中毒症〔甲状腺（中毒性）クリーゼ〕	○	○	○※	
〈リウマチ疾患〉				
関節リウマチ、若年性関節リウマチ（スチル病を含む）			○	関節腔内注射
リウマチ熱（リウマチ性心炎を含む）	○※	○※	○	
リウマチ性多発筋痛			○	
〈膠原病〉				
エリテマトーデス（全身性及び慢性円板状）、全身性血管炎（高安動脈炎、結節性多発動脈炎、顕微鏡的多発血管炎、多発血管炎性肉芽腫症を含む）、多発性筋炎（皮膚筋炎）	○※	○※	○	
強皮症			○※	
〈腎疾患〉				
ネフローゼ及びネフローゼ症候群	○※	○※	○※	
〈心疾患〉				
うっ血性心不全	○※	○※	○※	
〈アレルギー性疾患〉				
気管支喘息（但し、筋肉内注射は筋肉内注射以外の投与法では不適當な場合に限る）	○	○	○	ネブライザー
喘息性気管支炎（小児喘息性気管支炎を含む）			○※	ネブライザー
喘息発作重積状態、アナフィラキシーショック	○	○		
薬剤その他の化学物質によるアレルギー・中毒（薬疹、中毒疹を含む）	○※	○※	○※	
血清病	○	○	○※	
〈重症感染症〉				
重症感染症（化学療法と併用する）	○	○	○※	

V. 治療に関する項目

効能又は効果	静脈内注射	点滴静脈内注射	筋肉内注射	その他の用法
〈血液疾患〉				
溶血性貧血（免疫性又は免疫性機序の疑われるもの）、白血病（急性白血病、慢性骨髄性白血病の急性転化、慢性リンパ性白血病）（皮膚白血病を含む）、顆粒球減少症（本態性、続発性）、紫斑病（血小板減少性及び血小板非減少性）、再生不良性貧血、凝固因子の障害による出血性素因	○	○	○※	
白血病（急性白血病、慢性骨髄性白血病の急性転化、慢性リンパ性白血病）（皮膚白血病を含む）のうち髄膜白血病				脊髄腔内注入
〈消化器疾患〉				
限局性腸炎、潰瘍性大腸炎	○※	○※	○※	注腸
〈重症消耗性疾患〉				
重症消耗性疾患の全身状態の改善（癌末期、スプルーを含む）	○※	○※	○※	
〈肝疾患〉				
劇症肝炎（臨床的に重症とみなされるものを含む）	○	○	○※	
胆汁うっ滞型急性肝炎		○※	○※	
肝硬変（活動型、難治性腹水を伴うもの、胆汁うっ滞を伴うもの）			○※	
〈肺疾患〉				
びまん性間質性肺炎（肺線維症）（放射線肺臓炎を含む）	○※	○※		ネブライザー
〈結核性疾患〉				
結核性髄膜炎（抗結核剤と併用する）				脊髄腔内注入
結核性胸膜炎（抗結核剤と併用する）				胸腔内注入
〈神経疾患〉				
脳脊髄炎（脳炎、脊髄炎を含む）（但し、一次性脳炎の場合は頭蓋内圧亢進症状がみられ、かつ他剤で効果が不十分なときに短期間用いること）、重症筋無力症、多発性硬化症（視束脊髄炎を含む）	○	○	○※	脊髄腔内注入
末梢神経炎（ギランバレー症候群を含む）	○※	○※	○※	脊髄腔内注入
小舞踏病、顔面神経麻痺、脊髄蜘蛛膜炎			○※	

効能又は効果	静脈内注射	点滴静脈内注射	筋肉内注射	その他の用法
〈悪性腫瘍〉				
悪性リンパ腫（リンパ肉腫症、細網肉腫症、ホジキン病、皮膚細網症、菌状息肉症）及び類似疾患（近縁疾患）	○	○	○※	脊髄腔内注入
好酸性肉芽腫	○	○	○※	
乳癌の再発転移			○※	
〈その他の内科的疾患〉				
特発性低血糖症	○	○	○※	
原因不明の発熱			○※	
○外科領域				
副腎摘除	○	○	○	
臓器・組織移植、副腎皮質機能不全患者に対する外科的侵襲、蛇毒・昆虫毒（重症の虫さされを含む）			○※	
侵襲後肺水腫	○			ネブライザー
外科的ショック及び外科的ショック様状態、脳浮腫、輸血による副作用、気管支痙攣（術中）	○			
○整形外科領域				
強直性脊椎炎（リウマチ性脊椎炎）			○	
強直性脊椎炎（リウマチ性脊椎炎）に伴う四肢関節炎、変形性関節症（炎症症状がはっきり認められる場合）、外傷後関節炎、非感染性慢性関節炎、痛風性関節炎				関節腔内注射
関節周囲炎（非感染性のものに限る）、腱周囲炎（非感染性のものに限る）				軟組織内注射 腱鞘内注射 滑液嚢内注入
腱炎（非感染性のものに限る）				軟組織内注射 腱鞘内注射
腱鞘炎（非感染性のものに限る）				腱鞘内注射
滑液包炎（非感染性のものに限る）				滑液嚢内注入
椎間板ヘルニアにおける神経根炎（根性坐骨神経痛を含む）				硬膜外注射

V. 治療に関する項目

効能又は効果	静脈内注射	点滴静脈内注射	筋肉内注射	その他の用法
○産婦人科領域				
卵管閉塞症（不妊症）に対する通水療法				卵管腔内注入
卵管整形術後の癒着防止			○※	卵管腔内注入
副腎皮質機能障害による排卵障害			○※	
○泌尿器科領域				
前立腺癌（他の療法が無効な場合）、陰茎硬結			○※	
○皮膚科領域				
<p>☆印の付されている効能又は効果に対しては、外用剤を用いても効果が不十分な場合あるいは十分な効果を期待し得ないと推定される場合にのみ用いること。</p>				
<p>☆湿疹・皮膚炎群（急性湿疹、亜急性湿疹、慢性湿疹、接触皮膚炎、貨幣状湿疹、自家感作性皮膚炎、アトピー皮膚炎、乳・幼・小児湿疹、ビダール苔癬、その他の神経皮膚炎、脂漏性皮膚炎、進行性指掌角皮症、その他の手指の皮膚炎、陰部あるいは肛門湿疹、耳介及び外耳道の湿疹・皮膚炎、鼻前庭及び鼻翼周辺の湿疹・皮膚炎など）（但し、重症例以外は極力投与しないこと）、☆痒疹群（小児ストロフルス、蕁麻疹様苔癬、固定蕁麻疹を含む）（但し、重症例に限る。また、固定蕁麻疹は局注が望ましい）、☆類乾癬（重症例に限る）、☆掌蹠膿疱症（重症例に限る）、☆毛孔性紅色秕糠疹（重症例に限る）、成年性浮腫性硬化症、紅斑症 [☆多形滲出性紅斑（重症例に限る）、結節性紅斑]、レイノー病、先天性表皮水疱症、帯状疱疹（重症例に限る）、顔面播種状粟粒性狼瘡（重症例に限る）、潰瘍性慢性膿皮症、新生児スクレレーマ</p>			○※	
<p>蕁麻疹（慢性例を除く）（重症例に限る）、☆乾癬及び類症 [尋常性乾癬（重症例）、関節症性乾癬、乾癬性紅皮症、膿疱性乾癬、稽留性肢端皮膚炎、疱疹状膿痂疹、ライター症候群]、IgA血管炎（重症例に限る）、ウェーバークリスチャン病、粘膜皮膚眼症候群 [開口部びらん性外皮膚症、スチブンス・ジョンソン病、皮膚口内炎、フックス症候群、ベーチェット病（眼症状のない場合）、リップシュッツ急性陰門潰瘍]、天疱瘡群（尋常性天疱瘡、落葉状天疱瘡、Senear-Usher症候群、増殖性天疱瘡）、デューリング疱疹状皮膚炎（類天疱瘡、妊娠性疱疹を含む）、☆紅皮症（ヘブラ紅色秕糠疹を含む）</p>		○※	○※	

効能又は効果	静脈内注射	点滴静脈内注射	筋肉内注射	その他の用法
○眼科領域				
内眼・視神経・眼窩・眼筋の炎症性疾患の対症療法（ブドウ膜炎、網脈絡膜炎、網膜血管炎、視神経炎、眼窩炎性偽腫瘍、眼窩漏斗尖端部症候群、眼筋麻痺）	○*		○*	結膜下注射 球後注射 点眼
外眼部及び前眼部の炎症性疾患の対症療法で点眼が不適當又は不十分な場合（眼瞼炎、結膜炎、角膜炎、強膜炎、虹彩毛様体炎）	○*		○*	結膜下注射 球後注射
眼科領域の術後炎症	○*		○*	結膜下注射 点眼
○耳鼻咽喉科領域				
急性・慢性中耳炎	○*	○*	○*	中耳腔内注入
滲出性中耳炎・耳管狭窄炎	○*	○*	○*	中耳腔内注入 耳管内注入
メニエル病及びメニエル症候群、急性感音性難聴、口腔外科領域手術後の後療法	○	○	○	
血管運動（神経）性鼻炎、アレルギー性鼻炎、花粉症（枯草熱）			○	ネブライザー 鼻腔内注入 鼻甲介内注射
副鼻腔炎・鼻茸			○	ネブライザー 鼻腔内注入 副鼻腔内注入 鼻茸内注射
進行性壊疽性鼻炎	○	○	○	ネブライザー 鼻腔内注入 副鼻腔内注入 喉頭・気管注入
喉頭炎・喉頭浮腫	○	○	○	ネブライザー 喉頭・気管注入
喉頭ポリープ・結節	○*	○*	○*	ネブライザー 喉頭・気管注入
食道の炎症（腐蝕性食道炎、直達鏡使用後）及び食道拡張術後	○	○	○	ネブライザー 食道注入
耳鼻咽喉科領域の手術後の後療法	○	○	○	軟組織内注射 ネブライザー 鼻腔内注入 副鼻腔内注入 鼻甲介内注射 喉頭・気管注入 中耳腔内注入 食道注入
難治性口内炎及び舌炎（局所療法で治癒しないもの）				軟組織内注射
嗅覚障害	○*	○*	○*	ネブライザー 鼻腔内注入
急性・慢性（反復性）唾液腺炎	○*	○*	○*	唾液腺管内注入

V. 治療に関する項目

2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

下記用量は年齢、症状により適宜増減する。

〈静脈内注射〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 2～8mg を 3～6 時間毎に静脈内注射する。

〈点滴静脈内注射〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 2～10mg を 1 日 1～2 回点滴静脈内注射する。

〈筋肉内注射〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 2～8mg を 3～6 時間毎に筋肉内注射する。

〈関節腔内注射〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 1～5mg を関節腔内注射する。原則として投与間隔を 2 週間以上とすること。

〈軟組織内注射〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 1～5mg を軟組織内注射する。原則として投与間隔を 2 週間以上とすること。

〈腱鞘内注射〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 1～5mg を腱鞘内注射する。原則として投与間隔を 2 週間以上とすること。

〈滑液嚢内注入〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 1～5mg を滑液嚢内注入する。原則として投与間隔を 2 週間以上とすること。

〈硬膜外注射〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 2～10mg を硬膜外注射する。原則として投与間隔を 2 週間以上とすること。

〈脊髄腔内注入〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 1～5mg を週 1～3 回脊髄腔内注入する。

〈胸腔内注入〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 1～5mg を週 1～3 回胸腔内注入する。

〈卵管腔内注入〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.4～1mg を卵管腔内注入する。

〈注腸〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.4～6mg を直腸内注入する。

〈結膜下注射〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.4～2mg を結膜下注射する。その際の液量は 0.2～0.5mL とする。

〈球後注射〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.8～4mg を球後注射する。その際の液量は 0.5～1.0mL とする。

〈点眼〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.25～1mg/mL 溶液 1～2 滴を 1 日 3～8 回点眼する。

〈ネブライザー〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.1～2mg を 1 日 1～3 回ネブライザーで投与する。

〈鼻腔内注入〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.1～2mg を 1 日 1～3 回鼻腔内注入する。

〈副鼻腔内注入〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.1～2mg を 1 日 1～3 回副鼻腔内注入する。

〈鼻甲介内注射〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 1～5mg を鼻甲介内注射する。

〈鼻茸内注射〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 1～5mg を鼻茸内注射する。

〈喉頭・気管注入〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.1～2mg を 1 日 1～3 回喉頭あるいは気管注入する。

〈中耳腔内注入〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.1～2mg を 1 日 1～3 回中耳腔内注入する。

〈耳管内注入〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.1～2mg を 1 日 1～3 回耳管内注入する。

〈食道注入〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 1～2mg を食道注入する。

〈唾液腺管内注入〉

ベタメタゾンとして、通常成人 1 回 0.5～1mg を唾液腺管内注入する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意

〈眼科領域〉

7.1 本剤の投与により、重篤な副作用があらわれることがあるので、原則として、2週間以上の長期投与は避けること。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

コルチゾン、ヒドロコルチゾン、プレドニゾン、メチルプレドニゾン、トリアムシノロン、デキサメタゾン

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

ベタメタゾンリン酸エステルナトリウムは合成糖質副腎皮質ホルモンで、抗炎症作用、抗アレルギー作用、免疫抑制作用のほか、広範囲にわたる代謝作用を有する。

作用機序

ステロイドは細胞質に存在する熱ショック蛋白質、抑制蛋白質と複合体を形成したステロイド受容体に結合後核内に移行し、ステロイド反応性の遺伝子を活性化させ、その薬理作用を発揮すると考えられている。また、血管内皮細胞やリンパ球等の細胞膜の障害を抑制するような膜の安定性に関与する作用や、フォスホオリパーゼA₂と呼ばれる細胞膜リン脂質からロイコトリエンやプロスタグランジンなど種々の炎症惹起物質を誘導する重要な酵素の機能を抑える作用も知られている。

炎症制御機序としては、単量体のステロイドとその受容体が複合体を形成することで、NFκBやAP-1と呼ばれるサイトカイン産生の誘導や細胞接着分子の発現等を調節している細胞内転写因子の機能を抑制し、2量体の受容体と結合した場合は、リポコルチン等の誘導を介すると考えられている⁵⁾。一方、免疫抑制機序は多彩である。リンパ組織からTリンパ球の遊出を抑制すると共に、その増殖や活性化に係るIL-2の産生を抑制し、更にアポトーシスを促進すること等により血中Tリンパ球数を低下させ細胞性免疫を障害する。また、好中球の遊走能及び貪食能を障害すると共に、マクロファージの貪食・殺菌能障害、TNF-α、IL-1などの炎症性サイトカイン産生抑制及びリンパ球への抗原提示能障害により液性及び細胞性免疫に影響する。更に、血中Bリンパ球数を低下させ、長期間使用時には免疫グロブリン産生量を低下させる。これら以外にも、好酸球や好塩基球、肥満細胞等にも影響する⁶⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

- 1) カラゲニンによる足浮腫モデル（ラット）を用い、本剤又は生理食塩液を炎症惹起6時間前に投与したところ、生食群に比して足浮腫の発生を抑制した⁷⁾。
- 2) カラゲニンによる関節炎モデル（ウサギ）を用い、本剤又は生理食塩液を同時に投与したところ、生食群に比して関節腫の発生を抑制した⁷⁾。
- 3) カラゲニンによる胸膜炎（ラット）を用い、本剤又は生理食塩液を同時に投与したところ、生食群に比して浸出液量、総白血球数ともに抑制した⁷⁾。

VI. 薬効薬理に関する項目

[参考] 主な合成ステロイドの特徴⁸⁾

作用時間 分類		臨床的 対応量 (mg)	グルココ ルチコイ ド作用*	ミネラル コルチコ イド作用*	血漿中 半減期 (hr)	生物活性 の半減期 (hr)	HPA抑制量 (mg/day) **
短時間型	ヒドロコルチゾン	20	1	1	1.5	8~12	30
	コルチゾン酢酸エステル	25	0.8	0.8	1.5	8~12	37.5
	フルドロコルチゾン酢酸 エステル	-	10	125	7.2	8~12	-
中間型	プレドニゾン	5	4	0.8	2.75	12~36	7.5
	メチルプレドニゾン	4	5	0.5	3.0	12~36	6
	トリアムシノロン	4	5	0	4.2	24~48	6
長時間型	デキサメタゾン	0.75	25~30	0	5.0	36~54	0.75~1
	ベタメタゾン	0.75	25~50	0	5.0	36~54	0.75~1

*：グルココルチコイド作用は抗炎症作用、ミネラルコルチコイド作用はNa貯留効果を示す。

**：長期投与によりHPA [視床下部-下垂体-副腎系 (hypothalamic-pituitary-adrenocortical) 機能を抑制すると考えられる1日投与量

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

該当資料なし

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

健康成人8例にベタメタゾン8mgに相当するベタメタゾンリン酸エステルナトリウム注10.6mgを単回静脈内注射したとき、ベタメタゾンの $T_{1/2}$ は 335 ± 51 min、 $AUC_{0 \rightarrow \infty}$ は $46.3 \pm 8.6 \mu\text{g} \cdot \text{min/mL}$ であった⁹⁾ (測定法：HPLC) (平均値 \pm 標準偏差) (外国人データ)。

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当しない

(3) 消失速度定数

<参考>

ベタメタゾンリン酸エステルナトリウムとして静脈注射後、消失半減期6.5時間で消失するとある¹⁰⁾。

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

4. 吸収

該当しない

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

クモ膜下出血患者5例にベタメタゾン8mgに相当するベタメタゾンリン酸エステルナトリウム注を単回静脈内注射したとき、脳脊髄液中のベタメタゾン濃度は、投与1時間後では血中濃度の1/10～1/20、6時間後では1/2～1/3であった¹¹⁾（測定法：RIA）。

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

血漿蛋白結合率：64±6.0%⁹⁾（測定法：HPLC）（平均値±標準偏差、10例）（外国人データ）

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

ベタメタゾンの一部はC-6位が代謝され6β-水酸化体になる。その主な代謝酵素はCYP3A4である^{12),13)}。

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

健康成人8例にベタメタゾン8mgに相当するベタメタゾンリン酸エステルナトリウム注10.6mgを単回静脈内投与したとき、投与開始から24時間までの尿中にベタメタゾンとして投与量の4.8±1.4%が排泄された⁹⁾（測定法：HPLC）（平均値±標準偏差）（外国人データ）。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者又は部位には投与しないこと）

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 感染症のある関節腔内、滑液嚢内、腱鞘内又は腱周囲

[免疫機能抑制作用により、感染症が増悪することがある。]

2.3 動揺関節の関節腔内 [関節症状が増悪することがある。]

2.4 デスマプレシリン酢酸塩水和物（男性における夜間多尿による夜間頻尿）を投与中の患者 [10.1 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V.4. 用法及び用量に関する注意」の項 参照

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

8.1 本剤の投与により、誘発感染症、続発性副腎皮質機能不全、消化管潰瘍、糖尿病、精神障害等の重篤な副作用があらわれることがあるので、本剤の投与にあたっては次の注意が必要である。

8.1.1 投与に際しては、特に適応、症状を考慮し、他の治療法によって十分に治療効果が期待できる場合には、本剤を投与しないこと。また、局所的投与で十分な場合には、局所療法を行うこと。

8.1.2 投与中は副作用の発現に対し、常に十分な配慮と観察を行い、また、患者をストレスから避けるようにし、事故、手術等の場合には増量するなど適切な処置を行うこと。

8.1.3 特に、本剤投与中に水痘又は麻疹に感染すると、致命的な経過をたどることがあるので、次の注意が必要である。 [11.1.2 参照]

- ・本剤投与前に水痘又は麻疹の既往や予防接種の有無を確認すること。

- ・水痘又は麻疹の既往のない患者においては、水痘又は麻疹への感染を極力防ぐよう常に十分な配慮と観察を行うこと。感染が疑われる場合や感染した場合には、直ちに受診するよう指導し、適切な処置を講ずること。

- ・水痘又は麻疹の既往や予防接種を受けたことがある患者であっても、本剤投与中は、水痘又は麻疹を発症する可能性があるため留意すること。

8.1.4 連用後、投与を急に中止すると、ときに発熱、頭痛、食欲不振、脱力感、筋肉痛、関節痛、ショック等の離脱症状があらわれることがあるので、投与を中止する場合には、徐々に減量するなど慎重に行うこと。離脱症状があらわれた場合には、直ちに再投与又は増量すること。

8.2 本剤の長期あるいは大量投与中の患者、又は投与中止後6ヵ月以内の患者では、免疫機能が低下していることがあり、生ワクチンの接種により、ワクチン由来の感染を増強又は持続させるおそれがあるので、これらの患者には生ワクチンを接種しないこと。 [11.1.2 参照]

8.3 連用により眼圧亢進、緑内障、後嚢白内障を来すことがあるので、定期的に検査をすることが望ましい。 [9.1.1、11.1.8 参照]

8.4 褐色細胞腫の合併を認識していなかった状態でベタメタゾン製剤（注射剤）を投与した際に褐色細胞腫クリーゼを発現したとの報告がある。本剤投与後に著明な血圧上昇、頭痛、動悸等が認められた場合は、褐色細胞腫クリーゼの発現を考慮した上で適切な処置を行うこと。 [9.1.10 参照]

〈強皮症〉

- 8.5 強皮症患者における強皮症腎クリーゼの発現率は、副腎皮質ホルモン剤投与患者で高いとの報告がある。本剤を強皮症患者に投与する場合は、血圧及び腎機能を慎重にモニターし、強皮症腎クリーゼの徴候や症状の出現に注意すること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

- 9.1.1 以下の患者には治療上やむを得ないと判断される場合を除き投与しないこと。

(1) 有効な抗菌剤の存在しない感染症、全身の真菌症の患者

免疫機能抑制作用により、症状が増悪することがある。 [11.1.2 参照]

(2) 消化性潰瘍の患者

肉芽組織増殖抑制作用により、潰瘍治癒（組織修復）が障害されることがある。 [11.1.4 参照]

(3) 精神病の患者

大脳辺縁系の神経伝達物質に影響を与え、症状が増悪することがある。 [11.1.6 参照]

(4) 結核性疾患の患者

免疫機能抑制作用により、症状が増悪することがある。 [11.1.2 参照]

(5) 単純疱疹性角膜炎の患者

免疫機能抑制作用により、症状が増悪することがある。 [11.1.2 参照]

(6) 後嚢白内障の患者

症状が増悪することがある。 [8.3、11.1.8 参照]

(7) 緑内障の患者

眼圧の亢進により、緑内障が増悪することがある。 [8.3、11.1.8 参照]

(8) 高血圧症の患者

電解質代謝作用により、高血圧症が増悪することがある。

(9) 電解質異常のある患者

電解質代謝作用により、電解質異常が増悪することがある。

(10) 血栓症の患者

血液凝固促進作用により、症状が増悪することがある。 [11.1.9 参照]

(11) 最近行った内臓の手術創のある患者

創傷治癒（組織修復）が障害されることがある。

(12) 急性心筋梗塞を起こした患者

心破裂を起こしたとの報告がある。

(13) ウイルス性結膜・角膜疾患、結核性眼疾患、真菌性眼疾患及び急性化膿性眼疾患の患者に対する眼科的投与

免疫機能抑制作用により、症状が増悪することがある。 [11.1.2 参照]

9.1.2 感染症の患者（有効な抗菌剤の存在しない感染症、全身の真菌症を除く）

免疫機能抑制作用により、感染症が増悪するおそれがある。 [11.1.2 参照]

9.1.3 糖尿病の患者

糖新生作用等により血糖が上昇し、糖尿病が増悪するおそれがある。 [11.1.3 参照]

9.1.4 骨粗鬆症の患者

蛋白異化作用等により、骨粗鬆症が増悪するおそれがある。 [11.1.7 参照]

9.1.5 甲状腺機能低下のある患者

血中半減期が延長するとの報告があり、副作用があらわれるおそれがある。

9.1.6 脂肪肝の患者

脂肪分解・再分布作用により、肝臓への脂肪沈着が増大し、脂肪肝が増悪するおそれがある。

9.1.7 脂肪塞栓症の患者

大量投与により脂肪塞栓症が起こるとの報告があり、症状が増悪するおそれがある。

9.1.8 重症筋無力症の患者

使用当初、一時症状が増悪するおそれがある。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

9.1.9 B型肝炎ウイルスキャリアの患者又は既往感染者

B型肝炎ウイルスの増殖による肝炎があらわれることがある。本剤の投与期間中及び投与終了後は継続して肝機能検査値や肝炎ウイルスマーカーのモニタリングを行うなど、B型肝炎ウイルス増殖の徴候や症状の発現に注意すること。異常が認められた場合には、本剤の減量を考慮し、抗ウイルス剤を投与するなど適切な処置を行うこと。なお、投与開始前にHBs抗原陰性の患者において、B型肝炎ウイルスによる肝炎を発症した症例が報告されている。[11.1.2 参照]

9.1.10 褐色細胞腫又はパラガングリオーマのある患者及びその疑いのある患者

褐色細胞腫クリーゼがあらわれることがある。[8.4 参照]

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 腎不全の患者

薬物の排泄が遅延するため、体内蓄積による副作用があらわれるおそれがある。

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 肝硬変の患者

代謝酵素活性の低下等により、副作用があらわれやすい。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

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のみ投与すること。新生児に副腎不全を起こすことがある。また、血圧上昇、心筋壁の肥厚を起こすとの報告がある。動物試験（マウス、ラット）で催奇形作用が報告されている¹⁴⁾。

(6) 授乳婦

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。母乳中へ移行することがある。

(7) 小児等

9.7 小児等

9.7.1 観察を十分に行うこと。発育抑制があらわれることがある。

9.7.2 長期投与した場合、頭蓋内圧亢進症状があらわれることがある。

9.7.3 筋肉内注射はなるべく避けること。特に投与部位の組織の萎縮（陥没）を起こしやすい。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

長期投与した場合、感染症の誘発、糖尿病、骨粗鬆症、高血圧症、後嚢白内障、緑内障等の副作用があらわれやすい。

7. 相互作用

10. 相互作用

本剤は、主にCYP3A4で代謝される。

(1) 併用禁忌とその理由

10.1 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
デスモプレシン酢酸塩水和物 ミニリンメルト（男性における夜間多尿による夜間頻尿） [2.4 参照]	低ナトリウム血症が発現するおそれがある。	機序は不明である。

(2) 併用注意とその理由

10.2 併用注意（併用に注意すること）		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
バルビツール酸誘導体 フェノバルビタール フェントイン リファンピシン	本剤の作用が減弱することが報告されているので、併用する場合には用量に注意すること。	バルビツール酸誘導体、フェントイン、リファンピシンはCYPを誘導し、本剤の代謝が促進される。
サリチル酸誘導体 アスピリン、アスピリンダイアルミネート、サザピリン等	併用時に本剤を減量すると、サリチル酸中毒を起こすことが報告されているので、併用する場合には用量に注意すること。	本剤はサリチル酸誘導体の腎排泄と肝代謝を促進し、血清中のサリチル酸誘導体の濃度が低下する。
抗凝血剤 ワルファリンカリウム	抗凝血剤の作用を減弱させることが報告されているので、併用する場合には用量に注意すること。	本剤は血液凝固促進作用がある。
糖尿病用薬 ビグアナイド系薬剤 スルホニルウレア剤 速効型インスリン分泌促進剤 α -グルコシダーゼ阻害剤 チアゾリジン系薬剤 DPP-4阻害剤 GLP-1受容体作動薬 SGLT2阻害剤 インスリン製剤等	糖尿病用薬、インスリン製剤等の効果を減弱させることが報告されているので、併用する場合には用量に注意すること。	本剤は肝臓での糖新生を促進し、末梢組織での糖利用を抑制する。
利尿剤（カリウム保持性利尿剤を除く） フロセミド、アセタゾラミド、トリクロルメチアジド等	低カリウム血症があらわれることがあるので、併用する場合には用量に注意すること。	本剤は尿細管でのカリウム排泄促進作用がある。
シクロスポリン	他の副腎皮質ホルモン剤の大量投与で、シクロスポリンの血中濃度が上昇するとの報告があるので、併用する場合には用量に注意すること。	副腎皮質ホルモン剤はシクロスポリンの代謝を抑制する。
エリスロマイシン	本剤の作用が増強されるとの報告があるので、併用する場合には用量に注意すること。	本剤の代謝が抑制される。
非脱分極性筋弛緩剤 パンクロニウム臭化物、ベクロニウム臭化物	筋弛緩作用が減弱又は増強するとの報告があるので、併用する場合には用量に注意すること。	機序は不明である。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
リトドリン塩酸塩	併用により肺水腫があらわれ ることがある。	体内の水分貯留傾向が促進さ れる。
キノロン系抗菌剤 レボフロキサシン水和物、メシ ル酸ガレノキサシン水和物等	腱障害のリスクを増加させる との報告がある。これらの薬剤 との併用は、治療上の有益性が 危険性を上回る場合のみとす ること。	機序は不明である。

8. 副作用

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適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー（0.1%未満^{注1)}）

呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等の症状があらわれることがある。

11.1.2 誘発感染症、感染症の増悪（頻度不明）

B型肝炎ウイルスの増殖による肝炎があらわれることがある。

[8.1.3、8.2、9.1.1、9.1.2、9.1.9 参照]

11.1.3 続発性副腎皮質機能不全、糖尿病（頻度不明）

[9.1.3 参照]

11.1.4 消化管潰瘍、消化管穿孔（頻度不明）

[9.1.1 参照]

11.1.5 膵炎（頻度不明）

11.1.6 精神変調、うつ状態、痙攣（頻度不明）

[9.1.1 参照]

11.1.7 骨粗鬆症、大腿骨及び上腕骨等の骨頭無菌性壊死、ミオパチー（頻度不明）

[9.1.4 参照]

11.1.8 緑内障、後嚢白内障（頻度不明）

連用により眼圧亢進、緑内障、後嚢白内障を来すことがある。 [8.3、9.1.1 参照]

11.1.9 血栓症（頻度不明）

[9.1.1 参照]

11.1.10 喘息発作の増悪（頻度不明）

薬物、食物、添加物等に過敏な喘息患者には特に注意が必要である。

注1) 再評価結果を含む

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用	
	頻度不明
投与部位	関節の不安定化（関節腔内注射時） ^{注2)} 、疼痛・腫脹・圧痛の増悪（関節腔内注射時）、局所組織の萎縮による陥没（筋肉内注射時）
内分泌系	月経異常、クッシング症候群様症状
消化器	下痢、悪心・嘔吐、胃痛、胸やけ、腹部膨満感、口渇、食欲不振、食欲亢進
精神神経系	多幸症、不眠、頭痛、めまい
筋・骨格	筋肉痛、関節痛
脂質・蛋白質代謝	満月様顔貌、野牛肩、窒素負平衡、脂肪肝
体液・電解質	浮腫、血圧上昇、低カリウム性アルカローシス
眼	中心性漿液性網脈絡膜症等による網膜障害、眼球突出
血液	白血球増多
皮膚	発疹、ざ瘡、多毛、脱毛、色素沈着、皮下溢血、紫斑、線条、そう痒、発汗異常、顔面紅斑、脂肪織炎
その他	発熱、疲労感、ステロイド腎症、体重増加、精子数及びその運動性の増減、創傷治癒障害、皮膚・結合組織の菲薄化・脆弱化、しゃっくり

注2) この症状は投与直後に患部を強く動かすと起こりやすいとされているので、投与後は患者をしばらく安静にさせること。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

14.1.1 静脈内注射時

血管痛、静脈炎を起こすことがあるので、これを予防するため、注射部位、注射方法等について十分注意し、その注射速度はできるだけ遅くすること。

14.1.2 筋肉内注射時

下記の点に注意すること。

- ・筋肉内注射はやむを得ない場合にのみ、必要最小限に行うこと。同一部位への反復注射は行わないこと。特に小児等には注意すること。
- ・神経走行部位を避けること。
- ・注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は、直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。
- ・注射部位に疼痛、硬結をみることもある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 副腎皮質ホルモン剤を投与中の患者にワクチン（種痘等）を接種して神経障害、抗体反応の欠如が起きたとの報告がある。

15.1.2 プレドニゾロン経口剤の投与中に、腸管嚢胞様気腫症、縦隔気腫が発現したとの報告がある。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項 参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

LD50 (mg/kg)

動物種 (性)		投与経路	経口	静脈内
マウス	♂		1595	1605
	♀		1885	1725

※社内資料より

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製剤：処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
有効成分：該当しない

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

外箱開封後は、遮光して保存すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし
くすりのしおり：あり
その他の患者向け資材：なし

6. 同一成分・同効薬

先発医薬品名：リンデロン注2mg（0.4%）、リンデロン注4mg（0.4%）、リンデロン注20mg（0.4%）

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

リノロサル注射液2mg（0.4%）

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 リノロサル注射液 （規格：2mg）	1973年1月31日	（48AM）138	1974年3月1日	1975年2月1日
販売名変更 リノロサル注射液 2mg（0.4%）	2006年2月14日	21800AMX10324000	2006年6月9日	2006年6月9日

リノロサル注射液4mg（0.4%）

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 リノロサル注射液 （規格：4mg）	1973年1月31日	（48AM）138	1974年3月1日	1975年2月1日
販売名変更 リノロサル注射液 4mg（0.4%）	2006年2月14日	21800AMX10325000	2006年6月9日	2006年6月9日

リノロサル注射液20mg (0.4%)

履歴	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
旧販売名 リノロサル注射液 (規格：20mg)	1985年8月2日	(48AM) 138	1987年10月1日	1987年10月1日
販売名変更 リノロサル注射液 20mg (0.4%)	2006年2月14日	21800AMX10326000	2006年6月9日	2006年6月9日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

リノロサル注射液2mg (0.4%)、リノロサル注射液4mg (0.4%)

	内容
一部変更承認 (1984年7月16日)	『医薬品再評価結果その22 副腎皮質ホルモン剤 (その1) (1984年6月1日)』 に伴う変更：効能又は効果、用法及び用量の一部変更 「X. 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容」の項 参照
一部変更承認 (1991年2月4日)	『医薬品再評価結果平成2年度 (その2) (1990年12月19日)』に伴う変更：効 能又は効果の一部変更 「X. 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容」の項 参照

リノロサル注射液20mg (0.4%)

	内容
一部変更承認 (1991年2月4日)	医薬品再評価結果平成2年度 (その2) (1990年12月19日)に伴う変更 (効能又は効果) 「X. 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容」の項 参照

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

● 医薬品再評価結果その22 副腎皮質ホルモン剤 (その1)

再評価結果公表年月日：1984年6月1日

再評価結果内容：以下の再評価結果の通り。

各適応 (効能又は効果) に対する評価判定
<ul style="list-style-type: none"> ✓ 有効であることが実証されているもの 省略 (現行の効能又は効果の承認内) ✓ 有効であることが推定されるもの 省略 (現行の効能又は効果の承認内) ✓ 有効と判定する根拠がないもの 鎌状赤血球貧血、サルコイドーシス (但し、両側肺門リンパ節腫脹のみの場合を除く)、肺 結核 (粟粒結核、重症結核に限る) (抗結核剤と併用する)、結核性腹膜炎 (抗結核剤と併 用する)、結核性心臓炎 (抗結核剤と併用する)、放射線宿酔、血栓性静脈炎、汎発性結 合織炎、Rh不適合妊娠における感作、間質性膀胱炎、歯槽膿漏
意見
(1) 有用性 1) 注射剤の下記の適応については、有効性は認められるが、有効性と副作用とを対比した とき、有用性は認められない。 慢性肝炎 (活動型、急性再燃型、胆汁うっ滞型) (但し、一般的治療に反応せず肝機 能の著しい異常が持続するものに限る)、筋強直症

X. 管理的事項に関する項目

2) 下記の適応については、有効性は認められるが、他に適切な薬剤があるので、有用性は認められない。

恥骨骨炎

(2) 適応追加

下記の適応については、医療上の必要性及び有用性が認められるので追加すべきである。

下垂体抑制試験〔口〕、☆類乾癬（重症例に限る）〔口、☆筋〕☆扁平苔癬（重症例に限る）〔口〕、潰瘍性慢性膿皮症〔☆筋〕、口腔外科領域手術後の後療法〔静、点、筋〕、嗅覚障害〔口、☆静、☆点、☆筋、ネ、鼻〕、急性・慢性（反復性）唾液腺炎〔口、☆静、☆点、☆筋、唾〕

(3) 投与方法追加

下記の投与方法については、医療上の必要性及び有用性が認められるので追加すべきである。

1) 腱鞘内注射〔関節周囲炎、腱炎、腱鞘炎、腱周囲炎〕

ベタメタゾンとして、通常成人1回1～5 mgを腱鞘内注射する。原則として投与間隔を2週間以上とすること。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

2) 滑液嚢内注入〔関節周囲炎、腱周囲炎、滑液包炎〕

ベタメタゾンとして、通常成人1回1～5 mgを滑液嚢内注入する。原則として投与間隔を2週間以上とすること。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

3) 硬膜外注射〔椎間板ヘルニアにおける神経根炎〕

ベタメタゾンとして、通常成人1回2～10 mgを硬膜外注射する。原則として投与間隔を2週間以上とすること。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

4) 腹腔内注入〔手術後の腹膜癒着防止〕

ベタメタゾンとして、通常成人1回2 mgを腹腔内注入する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

5) 局所皮内注射〔陰茎硬結、☆湿疹・皮膚炎群、☆痒疹群、☆乾癬及び類症、☆円形脱毛症、☆早期ケロイド及びケロイド防止、耳鼻咽喉科領域の手術後の後療法〕

ベタメタゾンとして、通常成人1回0.05～0.1 mg宛1 mgまでを週1回局所皮内注射する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

6) 鼻腔内注入〔血管運動（神経）性鼻炎、アレルギー性鼻炎、花粉症、副鼻腔炎・鼻茸、進行性壊疽性鼻炎、耳鼻咽喉科領域の手術後の後療法、嗅覚障害〕

ベタメタゾンとして、通常成人1回0.1～2 mgを1日1～3回鼻腔内注入する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

7) 副鼻腔内注入〔副鼻腔炎・鼻茸、進行性壊疽性鼻炎、耳鼻咽喉科領域の手術後の後療法〕

ベタメタゾンとして、通常成人1回0.1～2 mgを1日1～3回副鼻腔内注入する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

8) 喉頭・気管注入〔進行性壊疽性鼻炎、喉頭炎・喉頭浮腫、喉頭ポリープ・結節、耳鼻咽喉科領域の手術後の後療法〕

ベタメタゾンとして、通常成人1回0.1～2 mgを1日1～3回喉頭あるいは気管注入する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

- 9) 中耳腔内注入〔急性・慢性中耳炎、滲出性中耳炎・耳管狭窄症、耳鼻咽喉科領域の手術後の後療法〕
ベタメタゾンとして、通常成人1回0.1～2 mgを1日1～3回中耳腔内注入する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。
- 10) 耳管内注入〔滲出性中耳炎・耳管狭窄症〕
ベタメタゾンとして、通常成人1回0.1～2 mgを1日1～3回耳管内注入する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。
- 11) 唾液腺管内注入〔急性・慢性（反復性）唾液腺炎〕
ベタメタゾンとして、通常成人1回0.5～1 mgを唾液腺管内注入する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

● 医薬品再評価結果平成2年度（その2）

再評価結果公表年月日：1990年12月19日

再評価結果内容：製造（輸入）承認事項の一部を変更すれば薬事法第14条第2項各号のいずれにも該当しない。

評価判定
効能・効果のうち「妊娠中毒症」については、提出された資料からは有効性が確認できなかったため削除。

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT（9桁）番号	レセプト電算処理 システム用コード
リノロサル注射液 2mg（0.4%）	2454404A1080	2454404A1080	105238101	620003829
リノロサル注射液 4mg（0.4%）	2454404A2087	2454404A2087	105243503	620003830
リノロサル注射液 20mg（0.4%）	2454404A3083	2454404A3083	105244201	620003831

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) わかもと製薬株式会社 社内資料 [リノロサル注射液 2mg (0.4%) 長期保存試験]
- 2) わかもと製薬株式会社 社内資料 [リノロサル注射液 2mg (0.4%) 加速試験]
- 3) わかもと製薬株式会社 社内資料 [リノロサル注射液 4mg (0.4%) 長期保存試験]
- 4) わかもと製薬株式会社 社内資料 [リノロサル注射液20mg (0.4%) 加速試験]
- 5) 片山一朗：アレルギー. 2006；55：1279-1283
- 6) 藤井 毅：一冊できわめるステロイド診療ガイド. 田中廣壽ら編. 文光堂, 2015；p160-164
- 7) わかもと製薬株式会社 社内資料 [薬効薬理に関する資料]
- 8) 清野敏一 他：薬剤ごとの違いがわかるステロイドの使い分け. 山本一彦ら編. 羊土社, 2010；p49
- 9) Petersen MC, et al. : Eur J Clin Pharmacol. 1983；25：643-650
- 10) 第十八改正日本薬局方解説書. 廣川書店, 2021；C5207-C5212
- 11) 楠 忠樹 他：脳神経外科. 1981；9：247-250
- 12) 千葉 寛：治療. 1994；76：2214-2220
- 13) 宮崎達男：ステロイドホルモン. 清水直容編. 中外医学社, 1988；p48-54
- 14) 長谷川靖彦 他：応用薬理. 1974；8：705-720

2. その他の参考文献

第十八改正日本薬局方解説書. 廣川書店, 2021

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

該当資料なし