

貯法：室温保存  
 使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること。  
 (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。)

## ソルファ®点鼻液 0.25%

「タケダ」

SOLFA® NASAL SOLUTION 0.25%

アンレキサノクス点鼻液

承認番号	薬価収載	販売開始
21800AMX10451	2006年12月	1988年6月
	再審査結果	1996年3月

## 【組成・性状】

1 容器中の有効成分	アンレキサノクス 0.25%水溶液 8 mL
性状	無色～微黄色澄明の液
pH	6.8～7.8

添加物：ポビドン、濃グリセリン、パラオキシ安息香酸プロピル、パラオキシ安息香酸ブチル、リン酸水素ナトリウム水和物、結晶リン酸二水素ナトリウム、pH調整剤

## 【効能・効果】

アレルギー性鼻炎

## 【用法・用量】

通常、成人には1日3～6回(起床時、日中約3時間毎に4回、就寝前)、1回各鼻腔に1噴霧(アンレキサノクスとして0.225mg)ずつ噴霧吸入する。

## 【使用上の注意】

## 1. 副作用

承認時までの調査では369例中16例(4.3%)に、市販後の使用成績調査(再審査終了時点)では6,121例中52例(0.8%)に副作用が認められている。

以下の副作用は上記の調査あるいは自発報告等で認められたものである。

	0.1～5%未満	0.1%未満
1) 鼻腔	鼻内刺激感、鼻内乾燥感、鼻出血	
2) 過敏症 <sup>注)</sup>	外鼻孔部等の接触皮膚炎	発疹
3) 消化器	悪心、胃痛	
4) その他	頭痛	

注) このような場合には投与を中止すること。

## 2. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1)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まわると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2)授乳中の婦人に投与する場合には授乳を避けさせること。[動物試験(ラット)で母乳中へ移行することが報告されている。]<sup>1)</sup>

## 3. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

## 4. 適用上の注意

(1)投与経路：鼻腔内噴霧用のみ使用すること。

(2)使用時：本剤に添付された「鼻用定量噴霧器の使い方」にしたがって正しく吸入するよう患者を指導すること。

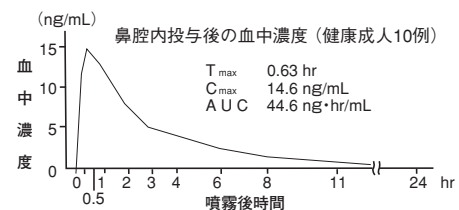
## 5. その他の注意

レセルピン系製剤、 $\alpha$ -メチルドパ製剤等の降圧剤には副作用として鼻閉がみられることがある。このような降圧剤服用中のアレルギー性鼻炎の患者に本剤を投与すると、鼻閉症状に対する本剤の効果が隠蔽されるおそれがあるので、臨床的観察を十分にしながら投与すること。

## 【薬物動態】

## 1. 血中濃度

健康成人(10例)に本剤を、1回各鼻腔に1噴霧(アンレキサノクスとして0.225mg)ずつ噴霧した時の血中濃度は図のとおりである。



## 2. 尿中排泄

健康成人(10例)に本剤を1回各鼻腔に1噴霧した場合、尿中にはアンレキサノクスの未変化体及び代謝物(水酸化体)が検出され、投与後24時間までの尿中排泄は、それぞれ平均8.4%及び24.8%で、それらの大部分は投与後11時間以内に排泄される。

## 【臨床成績】

アレルギー性鼻炎患者317例において、1日3回又は6回鼻腔内噴霧した比較対照試験を含む臨床試験での最終全般改善率は中等度改善以上で49.8%(158/317例)、軽度改善以上で84.9%(269/317例)である。なお、投与期間は大部分が8週以内である。また、比較対照試験において本剤の有用性が認められている。

## 【薬効薬理】

作用機序<sup>2-4)</sup>

## 1. ヒスタミン遊離抑制作用

ラット肥満細胞からのIgE関与のヒスタミン遊離(*in vitro*)を抑制する。本剤のヒスタミン遊離抑制作用は、主として細胞内c-AMP量増加作用に基づくことが示唆されている。

## 2. ロイコトリエン生成抑制作用

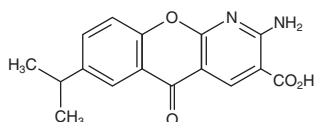
能動感作モルモット肺切片における抗原惹起のロイコトリエン生成(*in vitro*)、ラット腹腔マクロファージにおけるカルシウムイオノフォア刺激によるロイコトリエン生成(*in vitro*及び*in vivo*)をいずれも抑制する。

## 3. 抗ロイコトリエン作用

モルモット摘出肺、気管筋及び回腸標本で、ロイコトリエンD<sub>2</sub>惹起収縮反応(*in vitro*)を抑制する。

### \*【有効成分に関する理化学的知見】

化学構造式：



一般名：アンレキサノクス (Amlexanox)〔JAN〕

化学名：2-Amino-7-(1-methylethyl)-5-oxo-5H-[1]benzo-pyrano[2,3-b]pyridine-3-carboxylic acid

分子式：C<sub>16</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>

分子量：298.29

融 点：温度の上昇とともにわずかに黄色を帯びるが、320℃でも明確な融点及び分解点を示さない。

性 状：アンレキサノクスは白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。エタノール(99.5)に極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。薄めた水酸化ナトリウム試液(1→3)に溶ける。

### 【包 装】

8 mL・10容器

本剤は8 mL鼻用定量噴霧器で1日6回、1回各鼻腔に1噴霧ずつ噴霧すると5日分に相当する。

### 【主要文献】

- 1) 鳥井 洋 他：薬理と治療, **13**：4933, 1985.
- 2) Saijo T. et al.：Int. Arch. Allergy Appl. Immunol., **78**：43, 1985.
- 3) Makino H. et al.：ibid., **82**：66, 1987.
- 4) Saijo T. et al.：ibid., **79**：231, 1986.

### \*\*【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

武田薬品工業株式会社 医薬学術部 くすり相談室  
〒103-8668 東京都中央区日本橋二丁目12番10号  
フリーダイヤル 0120-566-587  
受付時間 9:00～17:30 (土日祝日・弊社休業日を除く)

製造販売元

**武田薬品工業株式会社**

〒540-8645 大阪市中央区道修町四丁目1番1号