

貯法：室温保存(「取扱い上の注意」の項参照)
使用期限：外箱に表示
注意：火気の近くで使用又は保存しないこと(イソプロパノール含有)。

経皮吸収型ステロイド剤

※劇薬、処方箋医薬品(注意—医師等の処方箋により使用すること)

ファルネゾンゲル 1.4%

Farnezone_®gel 1.4%

プレドニゾロンファルネシル酸エステルゲル剤

	ファルネゾンゲル1.4%
承認番号	21900AMX00152000
薬価収載	2007年6月
販売開始	1998年9月
※再審査結果	2009年6月

【禁忌(次の患者又は部位には使用しないこと)】

1. 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者
2. 感染症のある関節[感染関節あるいは塗布部皮膚感染が悪化するおそれがある。]
3. 潰瘍、熱傷、凍傷等の皮膚損傷のある部位[刺激性がある。また、皮膚の再生が抑制され、治癒が遅れるおそれがある。]

【組成・性状】

販売名	ファルネゾンゲル1.4%
成分・含量	1g中プレドニゾロンファルネシル酸エステル14mg
添加物	イソプロパノール、マクロゴール400、セバシン酸ジエチル、カルボキシビニルポリマー、ヒプロメロース、マクロゴール4000、オキシベンゾン、トリイソプロパノールアミン、精製水
性状	無色～微黄色透明のゼリー状軟膏で、特異なおいがある。
識別コード	TC266

【効能・効果】

※関節リウマチによる指、手、肘関節の腫脹・疼痛の緩解

【用法・用量】

通常、1日数回適量を患部に塗布する。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

- ※1. 指、手、肘以外の広範囲にわたる使用、1日塗布量として20gを超える大量使用を避けること。また、漫然とした長期使用は避け、使用が長期にわたる場合は皮膚症状に十分注意すること。
2. 腫脹・疼痛が再発し、本剤を再使用する場合には皮膚萎縮等、副作用の発現に注意すること。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

- (1)ステロイド外用剤による治療は原因療法ではなく対症療法であることに留意し、本剤の使用により、症状の改善がみられない場合又は症状の悪化をみる場合には使用を中止し、関節注入剤等の他の適切な治療に変更すること。また、重症度が高度な肘関節には特に本剤の効果の有無に注意し、漫然と使用を継続しないこと。
- (2)本剤を用いる場合には理学療法等、薬物療法以外の療法も考慮すること。また、患者の状態を十分観察し、副作用の発現に注意すること。
- (3)密封法(ODT)における安全性は確立していない(使用経験がない)。なお、他の副腎皮質ステロイド外用剤の使用上の注意には大量又は長期にわたる広範囲の密封法(ODT)等の使用により、副腎皮質ステロイド剤を全身投与した場合と同様の症状があらわれることがあるとの記載がある。

※2. 副作用

承認時¹⁻⁶⁾及び再審査終了時における副作用評価可能症例は3,721例であり、副作用発現率は3.7%(139例)であった。主な副作用は発赤0.6%、痒痒0.6%、皮膚のかぶれ0.6%、発疹0.5%、刺激感0.3%等であった。

(1)次の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には使用を中止すること。

※	0.1～5%未満	0.1%未満
	ステロイド皮膚(皮膚萎縮、潮紅)、皮膚の剥離、かぶれ、刺激感、発赤、発疹、痒痒	多毛、腫脹、熱感、疼痛

(2)次の副作用は他のステロイド外用剤で報告があるので注意すること。

- 1)皮膚の真菌性感染症(カンジダ症、白癬等)、細菌性感染症(伝染性膿痂疹、毛囊炎等)、ウイルス感染症があらわれることがある(密封法(ODT)の場合に起こりやすい)。このような症状があらわれた場合には適切な抗真菌剤、抗菌剤等を併用し、症状が速やかに改善しない場合には使用を中止すること。
- 2)大量又は長期にわたる広範囲の使用、密封法(ODT)により、下垂体・副腎皮質系機能の抑制あるいは後囊白内障、緑内障等をきたすことがある。

※3. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、指、手、肘以外の広範囲にわたる大量使用を避けること。また、漫然とした長期使用は避け、使用が長期にわたる場合は皮膚症状に十分注意すること。

4. 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指、手、肘以外の広範囲にわたる大量使用又は長期使用を避けること。[妊婦に対する安全性は確立していない。]
- (2)授乳婦に使用する場合には授乳を中止させること。[ラットの静脈内投与で乳汁中への移行が報告されている?]

※5. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。[低出生体重児、新生児、乳児、幼児は使用経験がない。小児は使用経験が少ない。]

6. 適用上の注意

- (1)使用部位：表皮が欠損している場合に使用するとしみることやヒリヒリ感を起こすことがある。
- (2)使用時：本剤に触れた手で眼、粘膜、外傷部位に触れないよう注意すること。

【薬物動態】

1. 血中濃度⁸⁾

健康成人男子の背部皮膚にプレドニゾロンファルネシル酸エステル32mg(分3)をゲルとして5日間連続塗擦した場合、血清中濃度は5日間以内にほぼ定常状態に達し、未変化体はほぼ100～200

pg/mL、プレドニゾン及びプレドニゾンは約50pg/mL前後の濃度を示した。

2. 関節液への移行⁶⁾

関節リウマチ患者等に本剤1回1~2gを1日3~4回で2~8週間連続塗擦し、血清及び関節液中濃度を測定し得た症例において両濃度を比較した結果、未変化体及びプレドニゾンともに関節液中濃度が高値を示した。

3. 代謝

プレドニゾンファルネシル酸エステルは投与後プレドニゾンとファルネシル酸に加水分解される。プレドニゾンはプレドニゾンに相互変換される。

4. 尿中排泄⁸⁾

健康成人男子の背部皮膚にプレドニゾンファルネシル酸エステル32mg(分3)をゲルとして5日間連続塗擦した場合、投与後7日間の累積尿中排泄率は0.0014%(プレドニゾン換算)であった。

【 臨 床 成 績 】

1. 臨床効果^{2~5)}

本剤の関節リウマチ(手指、手、肘関節)に対する評価可能症例数は297例で、改善率は46.1%であった。

疾患	改善率(中等度改善以上)
関節リウマチ	46.1%(137/297)

2. 比較試験^{3,4)}

関節リウマチの手指関節及び手・肘関節を対象とした群間比較試験の結果、本剤の有用性が認められた。

【 薬 効 薬 理 】

1. 抗炎症作用^{9,10)}

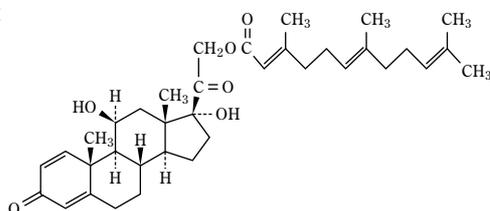
- (1)アジュバント関節炎(ラット)において、本剤の効果は局所的であり、塗布側の腫脹を著明に抑制した。
- (2)クロトン油肉芽嚢法(ラット)において、プレドニゾンファルネシル酸エステルは皮下あるいは経口投与に比べて肉芽嚢内に直接局所投与した場合に強い抗炎症作用を示した。

2. 作用機序^{11~13)}

- (1)本剤は炎症部位に経皮吸収された後に炎症細胞内で活性体プレドニゾンに変換されることにより局所特異的に抗炎症作用を発現するものと考えられた。
- (2)プレドニゾンファルネシル酸エステルは関節炎ウサギの滑膜組織への移行性が認められ(*in vivo*)、ヒト滑膜細胞においてプロスタグランジン産生を抑制した(*in vitro*)。また、好中球(ラット)及びリンパ球(ヒト、ラット)への取り込み量はプレドニゾンより高かった(*in vitro*)。

【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：プレドニゾンファルネシル酸エステル

(Prednisolone Farnesylate)

化学名：(+)-11 β ,17 α ,21-Trihydroxy-1,4-pregnadiene-3,20-dione

21-[(*E,E*)-3,7,11-trimethyl-2,6,10-dodecatrienoate]

分子式：C₃₆H₅₀O₆

分子量：578.78

融点：154~157℃

分配係数：オクタノール層にほぼ全て分配(オクタノール/水系溶媒, pH3~11)

性状：白色の結晶性の粉末で、わずかに特異なおいがある。ジクロロメタン、テトラヒドロフラン又は1,4-ジオキサンに溶けやすく、エタノール(99.5)にやや溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、ジエチルエーテルに溶けにくく、水にほとんど溶けない。

【 取 扱 い 上 の 注 意 】

1. 使用のつど、必ずキャップをきちんと閉めて保存すること。
2. 開封後は冷蔵庫等の5℃以下の場所に保存すると結晶が析出することがあるので、低温の場所を避けて保存すること。
3. アルコール類に溶けるおそれのあるもの(メガネのわく、塗装家具、革製品等)に、薬がつかないように注意すること。

【 包 装 】

チューブ包装：25g×10、50g×10

【主要文献及び文献請求先】

1. 主要文献

- 1) 水島 裕 他：薬理と治療, 21(3), 751(1993)
- 2) 水島 裕 他：薬理と治療, 21(3), 763(1993)
- 3) 水島 裕 他：炎症, 13(2), 169(1993)
- 4) 水島 裕 他：医学のあゆみ, 164(9), 667(1993)
- 5) 水島 裕：薬理と治療, 21(3), 783(1993)
- 6) 菅原幸子 他：新薬と臨牀, 42(3), 474(1993)
- 7) 江角凱夫 他：薬理と治療, 20(11), 4383(1992)
- 8) 丁 宗鉄 他：新薬と臨牀, 42(3), 488(1993)
- 9) 澤田克彦 他：薬理と治療, 20(10), 4075(1992)
- 10) 山口和政 他：薬理と治療, 20(10), 4067(1992)
- 11) 小室昌仁：ファルネシル酸プレドニゾン(PNF-21)の体内動態(第12報)関節炎ウサギにおける体内動態, 社内資料, 研究報告書No.120(1998)
- 12) 澤田克彦 他：ファルネシル酸プレドニゾン(PNF-21)のヒト滑膜細胞におけるプロスタグランジン産生に対する作用, 社内資料, 研究報告書No.121(1998)
- 13) 角尾浩幸 他：薬理と治療, 20(11), 4473(1992)

2. 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ください。

大鵬薬品工業株式会社

メディカルアフェアーズ本部 MA部 医薬品情報課

〒101-8444 東京都千代田区神田錦町1-27

TEL 0120-20-4527 FAX 03-3293-2451