

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

痔疾治療剤

ヒドロコルチゾン・フラジオマイシン配合剤

プロクトセディル坐薬

PROCTOSEDYL SUPPOSITORIES

剤形	坐剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1 個中：ヒドロコルチゾン 5 mg フラジオマイシン硫酸塩 7.1 mg(力価) ジブカイン塩酸塩 5 mg エスクロシド 10 mg
一般名	和名：ヒドロコルチゾン／フラジオマイシン硫酸塩／ジブカイン塩酸塩／エスクロシド（JAN） 洋名：Hydrocortisone／Fradiomycin Sulfate／Dibucaine Hydrochloride／Esculocide（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：1966 年 3 月 11 日 薬価基準収載年月日：1967 年 7 月 1 日 発売年月日：1966 年 4 月
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：ジェイドルフ製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ジェイドルフ製薬株式会社 学術部 くすり相談窓口 TEL：06-7507-2532 FAX：06-7507-2528 (受付時間：9 時～17 時 30 分(土、日、祝日、当社休業日を除く)) 医療関係者向けホームページ https://www.j-dolph.co.jp/

本 IF は 2025 年 4 月改訂の電子添文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にて確認してください。
専用アプリ「添文ナビ®」で GS1 バーコードを読み取ることにより、最新の電子添文等を閲覧できます。



(01)04987328420320

医薬品インタビューフォーム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

(<https://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、「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. IF の利用にあたって

電子媒体の IF 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 IF を作成・提供するが、

IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 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、IF 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、IF 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、IF 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

IF 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。IF 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 IF 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、IF 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. 開発の経緯…………… 1
2. 製品の治療学的特性…………… 1
3. 製品の製剤学的特性…………… 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性…………… 1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項…………… 1
6. RMP の概要…………… 1

II. 名称に関する項目

1. 販売名…………… 2
2. 一般名…………… 2
3. 構造式又は示性式…………… 2
4. 分子式及び分子量…………… 3
5. 化学名(命名法)…………… 3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号…………… 3

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質…………… 4
2. 有効成分の各種条件下における安定性…………… 5
3. 有効成分の確認試験法、定量法…………… 5

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形…………… 6
2. 製剤の組成…………… 6
3. 添付溶解液の組成及び容量…………… 6
4. 力価…………… 6
5. 混入する可能性のある夾雑物…………… 6
6. 製剤の各種条件下における安定性…………… 7
7. 調製法及び溶解後の安定性…………… 7
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)…………… 7
9. 溶出性…………… 7
10. 容器・包装…………… 7
11. 別途提供される資材類…………… 7
12. その他…………… 7

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果…………… 8
2. 効能又は効果に関連する注意…………… 8
3. 用法及び用量…………… 8
4. 用法及び用量に関連する注意…………… 8
5. 臨床成績…………… 8

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群…………… 10
2. 薬理作用…………… 10

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移…………… 12
2. 薬物速度論的パラメータ…………… 12
3. 母集団(ポピュレーション)解析…………… 13
4. 吸収…………… 13
5. 分布…………… 13
6. 代謝…………… 13
7. 排泄…………… 14
8. トランスポーターに関する情報…………… 14
9. 透析等による除去率…………… 14
10. 特定の背景を有する患者…………… 14
11. その他…………… 14

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…………… 15
2. 禁忌内容とその理由…………… 15
3. 効能又は効果に関連する注意とその理…………… 15
4. 用法及び用量に関連する注意とその理…………… 15
5. 重要な基本的注意とその理由…………… 15
6. 特定の背景を有する患者に関する注意…………… 15
7. 相互作用…………… 16
8. 副作用…………… 17
9. 臨床検査結果に及ぼす影響…………… 17
10. 過量投与…………… 17
11. 適用上の注意…………… 17
12. その他の注意…………… 17

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験…………… 18
2. 毒性試験…………… 18

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分…………… 20
2. 有効期間…………… 20
3. 包装状態での貯法…………… 20
4. 取扱い上の注意…………… 20
5. 患者向け資材…………… 20
6. 同一成分・同効薬…………… 20
7. 国際誕生年月日…………… 20
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…………… 20
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…………… 20
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容…………… 20
11. 再審査期間…………… 20

12. 投与期間制限に関する情報	21
13. 各種コード	21
14. 保険給付上の注意	21

XI. 文献

1. 引用文献	22
2. その他の参考文献	22

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	23
2. 海外における臨床支援情報	23

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	24
2. その他の関連資料	24

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

プロクトセディル坐薬は、1957年英国のルセルラボラトリー社（発売当時）より発売された痔疾治療剤である。
痔疾患時の治療剤は、痔核・裂肛の症状（出血、疼痛、腫脹、痒感）並びに細菌感染による前記症状の悪化、複雑化を、緩解させることが重要であり、本剤でのその作用は、発売以来確認されてきた。本邦においてもこれらの症状のうち、特に出血、疼痛、腫脹、痒感に対し、本剤は高い有効率を示している。
1966年3月に輸入承認を得て「プロクトセディル坐薬」を発売した。1981年8月に再評価結果が公示され、2025月4月にジェイドルフ製薬株式会社へ製造販売承認が承継された。

2. 製品の治療学的特性

- ・痔核、裂肛の症状に効果が期待できる4つの成分を含有した痔疾患治療剤である。
「VI. 2. (1) 作用部位・作用機序」の項参照
- ・主症状である出血に効果を示すエスクロシドを含有している。
「VI. 2. (2) 薬効を裏付ける試験成績」の項参照
- ・坐薬及び軟膏の再評価の結果、90.3%の有効率を示した（再評価結果）。
「V. 3. (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠」の項参照
- ・重大な副作用として大量又は長期にわたる使用により、下垂体・副腎皮質系機能の抑制をきたすことがある。
「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

- ・1シート7個入りである（ウィークリーシート包装）

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材、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	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

(2025 年 4 月時点)

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

1. 販売名

(1) 和名

プロクトセディル坐薬

(2) 洋名

PROCTOSEDYL SUPPOSITORIES

(3) 名称の由来

Proctosedyl の “Proct” は直腸肛門という意味に、“Sedyl” は鎮静を意味する “Sedation” に由来する。

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

ヒドロコルチゾン／フラジオマイシン硫酸塩／ジブカイン塩酸塩／エスクロシド (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

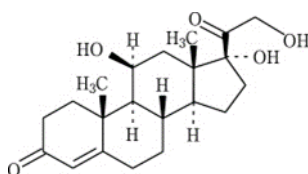
Hydrocortisone／Fradiomycin Sulfate /Dibucaine Hydrochloride /Esculoside (JAN)

(3) ステム (stem)

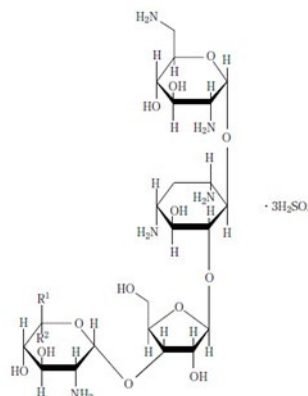
ヒドロコルチゾン	: プレドニゾロン誘導体を除く、副腎皮質ホルモン : cort
フラジオマイシン硫酸塩	: Streptomyces 属の産生する抗生物質 : -mycin
ジブカイン塩酸塩	: 局所麻酔薬 : -caine
エスクロシド	: 不明

3. 構造式又は示性式

ヒドロコルチゾン

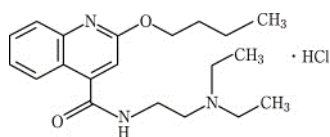


フラジオマイシン硫酸塩

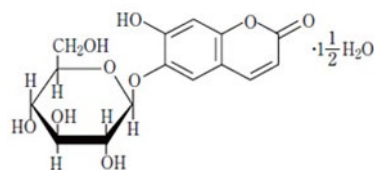


フラジオマイシンB硫酸塩 : R¹=H R²=CH₂NH₂
フラジオマイシンC硫酸塩 : R¹=CH₂NH₂ R²=H

ジブカイン塩酸塩



エスクロシド



4. 分子式及び分子量

ヒドロコルチゾン	: $C_{21}H_{30}O_5 = 362.46$
フラジオマイシン硫酸塩	: $C_{23}H_{46}N_6O_{13} \cdot 3H_2SO_4 = 908.88$
ジブカイン塩酸塩	: $C_{20}H_{29}N_3O_2 \cdot HCl = 379.92$
エスクロシド	: $C_{15}H_{16}O_9 \cdot 1\frac{1}{2}H_2O = 367.31$

5. 化学名(命名法)

ヒドロコルチゾン :

11 β , 17, 21-Trihydroxypregn-4-ene-3, 20-dione (IUPAC)

フラジオマイシン硫酸塩 :

フラジオマイシン B 硫酸塩

2, 6-Diamino-2, 6-dideoxy- α -D- glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-[2, 6-diamino-2, 6-dideoxy- β -L-idopyranosyl- (1 $\rightarrow$ 3) - β -D-ribofuranosyl- (1 $\rightarrow$ 5)] -2-deoxy-D-streptamine trisulfate (IUPAC)

フラジオマイシン C 硫酸塩

2, 6-Diamino-2, 6-dideoxy- α -D- glucopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-[2, 6-diamino-2, 6-dideoxy- α -D-glucopyranosyl- (1 $\rightarrow$ 3) - β -D-ribofuranosyl- (1 $\rightarrow$ 5)] -2-deoxy-D- streptamine trisulfate (IUPAC)

ジブカイン塩酸塩 :

2-Butyloxy-N - (2-diethylaminoethyl) -4- quinolinecarboxamide monohydrochloride (IUPAC)

エスクロシド :

6- (β -D-Glucopyranosyloxy) -7-hydroxy-2*H*-1-benzopyran-2-one sesquihydrate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

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

ヒドロコルチゾン	: 白色の結晶性の粉末で、においはない。
フラジオマイシン硫酸塩	: 白色～淡黄色の粉末である。
ジブカイン塩酸塩	: 白色の結晶又は結晶性の粉末である。
エスクロシド	: 白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。

(2) 溶解性

ヒドロコルチゾン	: メタノール、エタノール (95) 又は 1, 4-ジオキサンにやや溶けにくく、クロロホルムに溶けにくく、水又はジエチルエーテルに極めて溶けにくい。
フラジオマイシン硫酸塩	: 水に溶けやすく、エタノール (95) にほとんど溶けない。
ジブカイン塩酸塩	: 水、エタノール (95) 又は酢酸 (100) に極めて溶けやすく、無水酢酸に溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。
エスクロシド	: メタノール又はジオキサンにやや溶けにくく、水、エタノール又は氷酢酸に溶けにくく、エーテルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

ヒドロコルチゾン	: 該当資料なし
フラジオマイシン硫酸塩	: 吸湿性である
ジブカイン塩酸塩	: 吸湿性である
エスクロシド	: 該当資料なし

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

ヒドロコルチゾン	: 212～220℃ (分解)
フラジオマイシン硫酸塩	: 該当資料なし
ジブカイン塩酸塩	: 95～100℃ (融点)
エスクロシド	: 約 200℃ (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

1) 旋光度

ヒドロコルチゾン	: $[\alpha]_D^{25}$: +160~+170° (乾燥後、0.1g、エタノール (99.5)、10mL、100mm)
フラジオマイシン硫酸塩	: $[\alpha]_D^{20}$: +53.5~+59.0° (乾燥物に換算したもの1g、水、10mL、100mm)
ジブカイン塩酸塩	: 該当資料なし
エスクロシド	: $[\alpha]_D^{20}$: -84~-87° (脱水物に換算したもの0.2g、水／ジオキサン混液 (1:1)、20mL、100mm)

2) pH

ヒドロコルチゾン	: 該当資料なし
フラジオマイシン硫酸塩	: 5.0~7.5 (1.0gを水10mLに溶かした液)
ジブカイン塩酸塩	: 5.0~6.0 (1.0gを水50mLに溶かした液)
エスクロシド	: 該当資料なし

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

ヒドロコルチゾン	: 日局「ヒドロコルチゾン」による。
フラジオマイシン硫酸塩	: 日局「フラジオマイシン硫酸塩」による。
ジブカイン塩酸塩	: 日局「ジブカイン塩酸塩」による。
エスクロシド	: 局外規「エスクロシド」による。

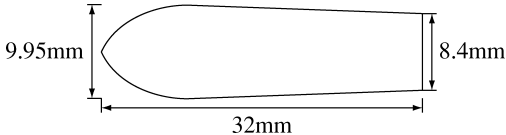
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

直腸内投与の坐剤

(2) 製剤の外観及び性状

外形・大きさ	色・剤形	質量 (g)
	黄白色 紡すい型 坐剤	1.84

(3) 識別コード

なし

(4) 製剤の物性

融解温度：35～37℃（日局一般試験法・融点測定法による）

(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

有効成分	添加剤
1 個中 ヒドロコルチゾン 5mg、フラジオマイシン硫酸塩 7.1mg（力価）、 ジブカイン塩酸塩 5mg、エスクロシド10mg	硬化油

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

本剤 1 個は、フラジオマイシン硫酸塩 7.1mg（力価）を有する。

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

表IV-1. 製剤の安定性

	保存条件	保存期間	保存形態	結 果
長期安定性試験	室 温	24ヶ月	コンテナシート	ヒドロコルチゾン、ジブカイン塩酸塩は経時的に含量低下が見られたが(規格範囲内)、その他には変化はなかった。

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)

該当しない

9. 溶出性

該当しない

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

(2) 包装

70 個 [7 個 (コンテナシート) ×10]

350 個 [7 個 (コンテナシート) ×50]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

コンテナシート：ポリ塩化ビニル、ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

痔核・裂肛の症状（出血、疼痛、腫脹、痒感）の緩解

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

6. 用法及び用量

通常成人 1 回 1 個を 1 日 1～3 回肛門内に挿入する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

痔核、裂肛、肛門周囲の湿疹・皮膚炎等を対象とする坐薬及び軟膏の再評価結果において、総症例642例における有効率（「有効」以上）は90.3%であった。

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理効果

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

(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

該当資料なし

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

該当資料なし

(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

糖質コルチコイド（ヒドロコルチゾン）

アミノグリコシド系抗生物質（フラジオマイシン硫酸塩）

局所麻酔剤キノリン誘導体（ジブカイン塩酸塩）

フラボノイド（エスクロシド）

注意：関連のある化合物の効能・効果は、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

作用部位：直腸、肛門

18.1 作用機序

痔疾患の症状（疼痛、炎症、そう痒、出血、腫脹、細菌感染等）に対し、各種有効成分が作用を発揮する。

ヒドロコルチゾン

糖質コルチコイドは、抗炎症作用及び抗アレルギー作用により、患部の炎症、毛細血管の拡張、浮腫、そう痒等の症状を消失又は軽減させる。

フラジオマイシン硫酸塩

グラム陽性菌、グラム陰性菌、抗酸菌、放射菌、レプトスピラに抗菌活性を示す。作用機序は他のアミノグリコシド系抗生物質と同様にたん白合成阻害であり、作用は殺菌的である。炎症、浮腫を起こした患部の二次感染を治療及び予防する。

ジブカイン塩酸塩

表面・伝達両麻酔剤で、局所疼痛及び排便時等の疼痛を和らげる。

エスクロシド

血管壁の強化及び毛細血管の透過性を低下させる作用を有することにより出血を防止する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 抗炎症作用（ヒドロコルチゾン、エスクロシド）

プロクトセディル坐薬（以下、プロクトセディル）の各成分を塗布又は直腸投与した Wistar 系雄性ラットに、起炎物質であるヒスタミンを皮内注射し、ヒスタミンの血管透過性抑制率を比較検討した。

その結果、血管透過性抑制効果は、ヒドロコルチゾン（0.5%配合）で明らかになり、更にプロクトセディル（全成分配合）で増強された。

また、同ラットにカラゲニンを足蹠皮下投与し、浮腫率を比較検討した。

その結果、足蹠浮腫発生に対し、ヒドロコルチゾン（0.5%配合）で抑制効果が認められ、更にその効果はエスクロシド（1%配合）又はプロクトセディル（全成分配合）で増強された¹⁾。

18.3 鎮痛作用（ジブカイン塩酸塩）

Hartley 系雌性モルモットの角膜にプロクトセディル各成分を塗布し、角膜反射消失を指標として局所麻酔作用を比較検討した。

その結果、ジブカイン塩酸塩（0.5%配合）で局所麻酔作用がみられ、その作用は他成分配合によっても変動をきたさないことが認められた¹⁾。

18.4 止血作用（エスクロシド）

プロクトセディル各成分を塗布した dd 系雌性マウスの尾を切断し、その止血までの時間（出血時間）に及ぼす軟膏局所塗布の影響をみた。

その結果、エスクロシド（1.0%配合）は対照と比較し、出血時間を有意に短縮した。

また、その効果は他成分配合により妨害的な影響を受けていないことが認められた¹⁾。

18.5 抗菌作用（フラジオマイシン硫酸塩）

精度管理用菌株 7 株及び臨床材料由来 70 株の計 77 株に対する MIC を測定し比較した。その結果、フラジオマイシン硫酸塩はグラム陽性菌及びグラム陰性桿菌のうち、*S. faecalis* と一部の耐性菌を除いては MIC 値は低く、これらの菌に対して抗菌作用が認められた²⁾。

(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

<参考>

坐剤における血中濃度

1) フラジオマイシン硫酸塩

痔疾患患者 5 名に対しプロクトセディル坐薬 1 個を直腸内に挿入し、挿入前、挿入後 15 分、30 分、1 時間、2 時間、4 時間及び 6 時間目に採取した各血清中に、フラジオマイシン硫酸塩は検出されなかった³⁾。

2) ヒドロコルチゾン

痔疾患患者 5 名に対しプロクトセディル坐薬 1 個を直腸内に挿入し、挿入前、挿入後 15 分、30 分、1 時間、2 時間、4 時間及び 6 時間目に採取した各血中のヒドロコルチゾン濃度を測定した。その結果、投与前値に比していずれも低値であり、試験時間内に有意な吸収はみられなかった⁴⁾。

(健常人の正常範囲：4.5～24 μ g/dL)

表VII-1. ヒドロコルチゾン血中濃度

投与前	投与後					
	15分	30分	1時間	2時間	4時間	6時間
15.0 $\pm$ 0.90	12.8 $\pm$ 0.67	12.2 $\pm$ 0.70	13.0 $\pm$ 1.35	12.1 $\pm$ 1.42	8.3 $\pm$ 0.47	9.7 $\pm$ 1.3

単位： μ g/dL

(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

(1) コンパートメントモデル

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(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

4. 吸収

該当資料なし

＜参考＞

坐剤における吸収

吸収部位：直腸（局所）

吸収率：フラジオマイシン硫酸塩は、局所から吸収されないか、あるいは吸収されてもごく微量で検出されない程度³⁾。

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

該当資料なし

(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

該当資料なし

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

該当資料なし

(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

該当資料なし

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 局所に結核性感染症又はウイルス性感染症のある患者〔感染症を悪化させるおそれがある。〕

2.2 局所に真菌症（カンジダ症、白癬等）のある患者〔真菌症を悪化させるおそれがある。〕

2.3 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者

2.4 ストレプトマイシン、カナマイシン、ゲンタマイシン、フラジオマイシン等のアミノグリコシド系抗生物質及びバシトラシン並びにヒドロコルチゾン、ジブカイン塩酸塩及びエスクロシドに対し過敏症の既往歴のある患者

2.5 デスモプレシン酢酸塩水和物（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〕

（解説）

1）本剤は副腎皮質ステロイドホルモンであるヒドロコルチゾンを含有しており、副腎皮質ステロイドホルモンのもつ免疫機能抑制作用により、感染症の症状を悪化させるおそれがある。

2）1）と同様。

3）本剤に対し過敏症や既往歴のある患者に投与すると、同じ副作用の反復やより重篤な副作用の発現につながるおそれがある。

4）本剤はアミノグリコシド系抗生物質であるフラジオマイシン硫酸塩を含有しており、類似するアミノグリコシド系抗生物質やバシトラシン（以前アミノグリコシド系に分類）の投与で過敏症や既往歴のある患者に本剤を投与すると、同じ副作用の反復やより重篤な副作用の発現につながるおそれがある。また、本剤の有効成分であるヒドロコルチゾン、ジブカイン塩酸塩及びエスクロシドに対し過敏症や既往歴のある患者に投与しても、同様のことが起こるおそれがある。

5）令和元年6月18日に製造販売承認されたデスモプレシン酢酸塩水和物 OD錠 25 μ g、同 OD錠 50 μ g（男性における夜間多尿による夜間頻尿）について、本剤を含む「副腎皮質ステロイド剤（注射剤、経口剤、吸入剤、注腸剤、坐剤）を投与中の患者」との併用により低ナトリウム血症が発現するおそれがあるとの理由で併用禁忌とされたことから、同剤に関する記載を追記した。

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

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 感作されるおそれがあるので、観察を十分に行い、感作されたことを示す兆候（そう痒、発赤、腫脹、丘疹、小水疱等）があらわれた場合には使用を中止すること。

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

設定されていない

(2) 腎機能障害患者
設定されていない

(3) 肝機能障害患者
設定されていない

(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にのみ投与すること。また、大量又は長期にわたる使用は避けること。

(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。

(7) 小児等

9.7 小児等

観察を十分に行うこと。ステロイド剤の大量又は長期の投与により、小児の発育障害をきたしたという報告がある。

(8) 高齢者
設定されていない

7. 相互作用

(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) [2.5 参照]	低ナトリウム血症が発現するおそれがある。	機序不明。

(解説)

「Ⅷ. 2. 禁忌内容とその理由」の項参照

(2) 併用注意とその理由

設定されていない

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(2) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 下垂体・副腎皮質系機能抑制（頻度不明）

大量又は長期にわたる使用により、下垂体・副腎皮質系機能の抑制をきたすことがある。

(3) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	頻度不明
皮膚及び陰部	真菌症（カンジダ症、白癬等）、ウイルス性疾患
過敏症	皮膚刺激感、そう痒等
長期連用	長期連用による全身投与の場合と同様な症状

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 薬剤交付時の注意

本剤が軟化して挿入が困難な場合には、被包のまま紡すい型の先端を下に向けて、冷水又は冷蔵庫に入れて硬化してから使用すること。[20. 参照]

<参考>

「X. 4. 取扱い上の注意」の項参照

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(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

急性毒性¹⁾

表IX-1. 急性毒性

動物種	投与経路	剤形	結果
Wistar系ラット	直腸内	坐剤	0.3gの私製坐剤（臨床用の1/6）1～3個の投与では、8時間の観察期間中特記すべき症状変化はなく、死亡例発現は認められなかった。

<参考>

エスクロシドのマウス、ラットにおける急性毒性⁵⁾

表IX-2

動物名	投与経路	LD ₅₀ (mg/kg)
マウス ラット	経口	>8,000
	腹注	>5,000
	静注	>3,000

(2) 反復投与毒性試験

坐剤のウサギ直腸内投与による亜急性毒性

雄性白色ウサギ（体重約1.8kg）に、本剤の臨床適用濃度、2.5倍濃度及び5倍濃度（体重換算投与量はヒトの臨床使用量の各々15、37.5、75倍）の私製坐剤を、1日1回直腸内に30日間投与し、血液学的検査、血清生化学的検査、病理組織学的検査を行った。

その結果、死亡、症状変化及び体重増加の抑制はみられなかったが、胸腺及び副腎の萎縮が2.5倍濃度投与群で認められ、5倍濃度投与群では、肝及び腎重量の増加、肝の脂肪変性が認められた⁶⁾。

(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

1. 規制区分

該当しない

2. 有効期間

使用期限：2 年

3. 包装状態での貯法

室温保存（30℃以下）

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

本剤は、通常固形の状態を保ち、挿入したとき体温で溶けて効果が発現するよう調製されている。保管は 30℃以下とし、夏季には、涼しい場所に保管すること。[14.1 参照]

「Ⅷ. 11. 適用上の注意」の項参照

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

同一成分薬：ヘモレックス軟膏

同 効 薬：ネリザ坐剤、ヘルミチン S 坐剤、ボラザ G 坐剤

7. 国際誕生年月日

1957 年

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

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
1966 年 3 月 11 日	14100AZY00126	1967 年 7 月 1 日	1966 年 4 月

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

1981 年 8 月 7 日

内容：再評価結果*により、現在の「効能又は効果」「用法及び用量」に変更した。

*第 18 次再評価結果公示薬務局長通知（昭和 56 年 8 月 7 日付薬発第 745 号）

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果公表年月日：1981 年 8 月 7 日

内容：再評価結果*により「効能又は効果」「用法及び用量」及び「使用上の注意」の改訂を行った。

*第 18 次再評価結果公示薬務局長通知（昭和 56 年 8 月 7 日付薬発第 745 号）

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、投与期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

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 番号	レセプト電算コード
2559805J1020	2559805J1020	105619803	662560007

14. 保険給付上の注意

該当しない

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 平松保造 他：基礎と臨床, 1977 ; 11 (8) : 2205-2211
- 2) 神木照雄 他：医学と薬学, 1980 ; 4 (1) : 77-79
- 3) 神木照雄 他：医学と薬学, 1980 ; 4 (1) : 76
- 4) 野本照子 他：医学と薬学, 1980 ; 4 (1) : 73-75
- 5) ジェイドルフ製薬株式会社：社内資料 (Esculin のマウス、ラットにおける急性毒性試験)
- 6) 藤村一 他：基礎と臨床, 1977 ; 11 (8) : 2197-2203

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II . 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

該当しない

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

該当資料なし

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

該当資料なし