

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

プロクトセディル®坐薬

PROCTOSEDYL® Suppositories

プロクトセディル®軟膏

PROCTOSEDYL® Ointment

剤形	坐剤、軟膏剤
製剤の規制区分	該当しない
規格・含量	1個又は1g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	該当しない
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・販売開始年月日	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 販売開始年月日 プロクトセディル®坐薬 :1966年 4月 プロクトセディル®軟膏 (15g):1966年 4月 プロクトセディル®軟膏 (2g):1987年 3月
製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元:EAファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	EAファーマ株式会社 くすり相談室 TEL:0120-917-719 医療関係者向けホームページ https://www.eapharma.co.jp/

本IFは2023年3月および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で確認してください。

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（<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、電子媒体を基本とし、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・表現には薬機法の広告規則や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、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	2. 製剤の組成.....	6
1. 開発の経緯.....	1	(1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤...	6
2. 製品の治療学的特性.....	1	(2) 電解質等の濃度.....	7
3. 製品の製剤学的特性.....	1	(3) 熱量.....	7
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	1	3. 添付溶解液の組成及び容量.....	7
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	1	4. 力価.....	7
(1) 承認条件.....	1	5. 混入する可能性のある夾雑物.....	7
(2) 流通・使用上の制限事項.....	1	6. 製剤の各種条件下における安定性.....	7
6. RMP の概要.....	1	7. 調整法および溶解後の安定性.....	7
II. 名称に関する項目	2	8. 他剤との配合変化(物理化学的变化).....	7
1. 販売名.....	2	9. 溶出性.....	7
(1) 和名.....	2	10. 容器・包装.....	8
(2) 洋名.....	2	(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な	
(3) 名称の由来.....	2	容器・包装に関する情報.....	8
2. 一般名.....	2	(2) 包装.....	8
(1) 和名(命名法).....	2	(3) 予備容量.....	8
(2) 洋名(命名法).....	2	(4) 容器の材質.....	8
(3) ステム.....	2	11. 別途提供される資材類.....	8
3. 構造式又は示性式.....	2	12. その他.....	8
4. 分子式及び分子量.....	2	V. 治療に関する項目	9
5. 化学名(命名法)又は本質.....	2	1. 効能又は効果.....	9
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	3	2. 効能又は効果に関連する注意.....	9
III. 有効成分に関する項目	4	3. 用法及び用量.....	9
1. 物理化学的性質.....	4	(1) 用法及び用量の解説.....	9
(1) 外観・性状.....	4	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠.....	9
(2) 溶解性.....	4	4. 用法及び用量に関連する注意.....	9
(3) 吸湿性.....	4	5. 臨床成績.....	9
(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点.....	4	(1) 臨床データパッケージ.....	9
(5) 酸塩基解離定数.....	4	(2) 臨床薬理試験.....	9
(6) 分配係数.....	4	(3) 用量反応探索試験.....	10
(7) その他の主な示性値.....	5	(4) 検証的試験.....	10
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	5	1) 有効性検証試験.....	10
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	5	2) 安全性試験.....	10
IV. 製剤に関する項目	6	(5) 患者・病態別試験.....	10
1. 剤形.....	6	(6) 治療的使用.....	10
(1) 剤形の区別.....	6	1) 使用成績調査(一般使用成績調査、特定	
(2) 製剤の外観及び性状.....	6	使用成績調査、使用成績比較調査)、製造	
(3) 識別コード.....	6	販売後データベース調査、製造販売後臨	
(4) 製剤の物性.....	6	床試験の内容.....	10
(5) その他.....	6	2) 承認条件として実施予定の内容又は実施	
		した試験の概要.....	10

(7) その他	10	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	16
VI. 薬効薬理に関する項目	11	1. 警告内容とその理由	16
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 ..	11	2. 禁忌内容とその理由	16
2. 薬理作用	11	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ..	16
(1) 作用部位・作用機序	11	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 ..	17
(2) 薬効を裏付ける試験成績	11	5. 重要な基本的注意とその理由	17
(3) 作用発現時間・持続時間	12	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	17
VII. 薬物動態に関する項目	13	(1) 合併症・既往歴等のある患者	17
1. 血中濃度の推移	13	(2) 腎機能障害患者	17
(1) 治療上有効な血中濃度	13	(3) 肝機能障害患者	17
(2) 臨床試験で確認された血中濃度	13	(4) 生殖能を有する者	17
(3) 中毒域	13	(5) 妊婦	17
(4) 食事・併用薬の影響	13	(6) 授乳婦	17
2. 薬物速度論的パラメータ	13	(7) 小児等	17
(1) 解析方法	13	(8) 高齢者	17
(2) 吸収速度定数	13	7. 相互作用	18
(3) 消失速度定数	14	(1) 併用禁忌とその理由	18
(4) クリアランス	14	(2) 併用注意とその理由	18
(5) 分布容積	14	8. 副作用	18
(6) その他	14	(1) 重大な副作用と初期症状	18
3. 母集団（ポピュレーション）解析	14	(2) その他の副作用	18
(1) 解析方法	14	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	18
(2) パラメータ変動要因	14	10. 過量投与	18
4. 吸収	14	11. 適用上の注意	19
5. 分布	14	12. その他の注意	19
(1) 血液－脳関門通過性	14	(1) 臨床使用に基づく情報	19
(2) 血液－胎盤関門通過性	14	(2) 非臨床試験に基づく情報	19
(3) 乳汁への移行性	14	IX. 非臨床試験に関する項目	20
(4) 髄液への移行性	15	1. 薬理試験	20
(5) その他の組織への移行性	15	(1) 薬効薬理試験	20
(6) 血漿蛋白結合率	15	(2) 安全性薬理試験	20
6. 代謝	15	(3) その他の薬理試験	20
(1) 代謝部位及び代謝経路	15	2. 毒性試験	20
(2) 代謝に関与する酵素(CYP 等)の分子種、	15	(1) 単回投与毒性試験	20
寄与率	15	(2) 反復投与毒性試験	20
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	15	(3) 遺伝毒性試験	21
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比	15	(4) がん原性試験	21
率	15	(5) 生殖発生毒性試験	21
7. 排泄	15	(6) 局所刺激性試験	21
8. トランスポーターに関する情報	15	(7) その他の特殊毒性	21
9. 透析等による除去率	15	X. 管理事項に関する項目	22
10. 特定の背景を有する患者	15	1. 規制区分	22
11. その他	15		

2. 有効期間	22	XI. 文献	24
3. 包装状態での貯法	22	1. 引用文献	24
4. 取扱い上の注意	22	2. その他の参考文献	24
5. 患者向け資材	22	XII. 参考資料	25
6. 同一成分・同効薬	22	1. 主な外国での発売状況	25
7. 国際誕生年月日	23	2. 海外における臨床支援情報	25
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	23	XIII. 備考	26
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	23	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	26
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	23	(1) 粉砕	26
11. 再審査期間	23	(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通 過性	26
12. 投薬期間制限に関する情報	23	2. その他の関連資料	26
13. 各種コード	23		
14. 保険給付上の注意	23		

略語表

略語	略語内容
ALT	alanine aminotransferase : アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	aspartate aminotransferase : アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
CYP	cytochrome P450 : チトクローム P450
LD ₅₀	median lethal dose : 50%致死量
MIC	minimal inhibitory concentration : 最小発育阻止濃度
RMP	risk management plan : リスク管理計画

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、プロクトセディル®軟膏は、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坐剤「プロクトセディル®坐薬」、軟膏「プロクトセディル®軟膏(15g入り)」の両剤形を発売した。1981年8月に再評価結果が公示され、現在に至っている。また、簡便性と衛生面の両面から1987年3月に「プロクトセディル®軟膏(2g入り)」を発売した。

2. 製品の治療学的特性

(1) 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

(2) 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

(3) 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

(4) 重大な副作用として坐薬、軟膏とも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) 使い分けし易いように、2つの剤形をもっている。

「IV.1.(1)剤形の区別」の項参照

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	「I. 6. RMP の概要」の項参照
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

(2023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

プロクトセディル®軟膏

(2) 洋名

PROCTSEDYL® Suppositories

PROCTSEDYL® Ointment

(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)

該当しない

(2) 洋名(命名法)

該当しない

(3) ステム

該当しない

3. 構造式又は示性式

表Ⅱ-1. 各成分の一般名、構造式又は示性式、分子式及び分子量、化学名を参照

4. 分子式及び分子量

表Ⅱ-1. 各成分の一般名、構造式又は示性式、分子式及び分子量、化学名を参照

5. 化学名(命名法)又は本質

表Ⅱ-1. 各成分の一般名、構造式又は示性式、分子式及び分子量、化学名を参照

表Ⅱ-1. 各成分の一般名、構造式又は示性式、分子式及び分子量、化学名

一般名	構造式又は示性式	分子式及び分子量	化学名
ヒドロコルチゾン Hydrocortisone		$C_{21}H_{30}O_5$ 362.46	11β,17,21-Trihydroxypregn-4-ene-3,20-dione
フラジオマイシン硫酸塩 Fradimycin Sulfate	 フラジオマイシン B硫酸塩: R ¹ =H R ² =CH ₂ NH ₂ フラジオマイシン C硫酸塩: R ¹ =CH ₂ NH ₂ R ² =H	$C_{23}H_{46}N_6O_{13} \cdot 3H_2SO_4$ 908.88	フラジオマイシンB硫酸塩 2,6-Diamino-2,6-dideoxy-α-D-glucopyranosyl-(1→4)-[2,6-diamino-2,6-dideoxy-β-L-ribofuranosyl-(1→3)-β-D-ribofuranosyl-(1→5)]-2-deoxy-D-streptamine trisulfate フラジオマイシンC硫酸塩 2,6-Diamino-2,6-dideoxy-α-D-glucopyranosyl-(1→4)-[2,6-diamino-2,6-dideoxy-α-D-glucopyranosyl-(1→3)-β-D-ribofuranosyl-(1→5)]-2-deoxy-D-streptamine trisulfate
ジブカイン塩酸塩 Dibucaine Hydrochloride		$C_{20}H_{29}N_3O_2 \cdot HCl$ 379.92	2-Butyloxy-N-(2-diethylaminoethyl)-4-quinolinecarboxamide monohydrochloride
エスクロシド Esculoside		$C_{15}H_{16}O_9 \cdot 1\frac{1}{2}H_2O$ 367.31	6-(β-D-Glucopyranosyloxy)-7-hydroxy-2H-1-benzopyran-2-one sesquihydrate

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

- 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

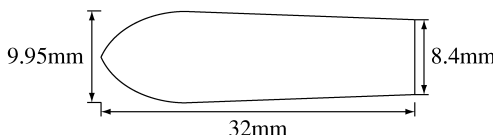
(1) 剤形の区別

『プロクトセディル®坐薬』:直腸内投与の坐剤

『プロクトセディル®軟膏』:直腸内投与の軟膏剤

(2) 製剤の外観及び性状

『プロクトセディル®坐薬』

外形・大きさ	色・剤形	質量(g)
	黄白色 紡すい型 坐剤	1.84

『プロクトセディル®軟膏』

剤形	色	特徴
軟膏	黄白色	においはないかわずかに特異なおいがある

(3) 識別コード

なし

(4) 製剤の物性

『プロクトセディル®坐薬』

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

販売名		有効成分	添加剤
プロクトセディル®坐薬	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	硬化油
プロクトセディル®軟膏	1g中	5mg、エスクロシド10mg	精製ラノリン、流動パラフィン、白色ワセリン

(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個又は1g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
プロクトセディル®坐薬	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。
プロクトセディル®軟膏	室 温	24ヶ月	15g: アルミチューブ	規格内
	室 温	24ヶ月	2g: ポリエチレンチューブ	規格内

7. 調整法および溶解後の安定性

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・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

『プロクトセディル®坐薬』

70個 [7個(コンテナシート) x10]

350個 [7個(コンテナシート) x50]

『プロクトセディル®軟膏』

70個 [2g(チューブ) x70]

350個 [2g(チューブ) x350]

20個 [15g(チューブ) (アダプター付) x20]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

『プロクトセディル®坐薬』

コンテナシート: ポリ塩化ビニル、ポリエチレン

『プロクトセディル®軟膏』

2g入りチューブ [容器]チューブ: ポリエチレン

キャップ: ポリエチレン

[外袋] : ポリプロピレン

15g入りチューブ [容器]チューブ: アルミ

キャップ: ポリエチレン

[アダプター] : ポリエチレン

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

『プロクトセディル®坐薬』

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

『プロクトセディル®軟膏』

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、肛門周囲の湿疹・皮膚炎

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

『プロクトセディル®坐薬』

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。

『プロクトセディル®軟膏』

6. 用法及び用量

通常1日1～3回適量を患部に塗布又は注入する。

(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

(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)

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

作用部位: 直腸及び肛門周囲

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發揮する。

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

1) 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®軟膏、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⁾。

2) 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⁾。

3) 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⁾。

4) 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) 解析方法

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、局部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

『プロクトセディル®坐薬』及び『プロクトセディル®軟膏』

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

(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。

『プロクトセディル®坐薬』

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

2.5 デスマ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)

- 5) 令和元年6月18日に製造販売承認されたデスマ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

『プロクトセディル®坐薬』

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
デスマ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

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。

(1) 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。

(2) 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

『プロクトセディル®坐薬』

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

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

『プロクトセディル®軟膏』

14. 適用上の注意

14.1 薬剤投与時の注意

眼科用として使用しないこと。

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
dd系マウス または Wistar系ラット	経口	軟膏剤	5、10及び20g/kgの投与量で死亡例発現は認められなかった。 7日後の剖検でも特記すべき変化は認めなかった。
	皮下	軟膏剤	5、10及び20g/kgを背部皮下に投与したが死亡例発現は認められなかった。 7日後の剖検でも、投与部位に軟膏の滞留が見られた以外に異常は認められなかった。
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

1) 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⁾。

2) 軟膏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1.7kg)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30、75、150倍)の軟膏を加温液状とし、1日1回直腸に30日間注入し、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、臨床適用濃度投与群では各検査項目において、投与による影響は観察されなかったが、2.5倍濃度投与群で胸腺萎縮及び副腎萎縮が認められ、5倍濃度投与群では体重増加の抑制、肝重量の増加が認められ、ビリルビン量、AST、ALT活性においても変動が認められた⁷⁾。

(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. 管理事項に関する項目

1. 規制区分

該当しない

2. 有効期間

有効期間:2年

3. 包装状態での貯法

『プロクトセディル®坐薬』:室温保存(30℃以下)

『プロクトセディル®軟膏』:室温保存

4. 取扱い上の注意

『プロクトセディル®坐薬』

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

患者向け医薬品ガイド:なし

くすりのしおり:有り

6. 同一成分・同効薬

『プロクトセディル®坐薬』

同一成分薬:なし

同効薬:「ネリプロクト坐剤」(レオファーマ株)

「ヘルミチンS坐剤」(長生堂製薬株=日本ジェネリック株)

「ポステリザンF坐薬」(マルホ株)

「ボラザG坐剤」(天藤製薬株=武田薬品工業株)

『プロクトセディル®軟膏』

同一成分薬:「ヘモレックス軟膏」(ジェイドルフ製薬株)

同効薬:「ヘモポリゾン軟膏」(ジェイドルフ製薬株)

「ネリプロクト軟膏」(レオファーマ株)

「強力ポステリザン(軟膏)」(マルホ株)

「ボラザG軟膏」(天藤製薬株=武田薬品工業株)

7. 国際誕生年月日

1957年(昭和32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

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
プロクトセディル®坐薬	1966年(昭和41年) 3月11日	14100AZY00126	1967年(昭和42年) 7月1日	1966年(昭和41年)4月
プロクトセディル®軟膏 (15g)		14100AZY00127		
プロクトセディル®軟膏 (2g)				1987年(昭和62年)3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(昭和56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(昭和56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、療担規則及び薬担規則並びに療担基準に基づき厚生労働大臣が定める掲示事項等(平成18年厚生労働省告示第107号)の一部を改正した平成20年厚生労働省告示第97号(平成20年3月19日付)の「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

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
プロクトセディル®坐薬	2559805J1020	2559805J1020	105619802	662560007
プロクトセディル®軟膏	2559806M1021	2559806M1021	105620402	662560008

14. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 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) EAファーマ株式会社: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
- 7) 平松保造 他:基礎と臨床, 1977; 11(8): 2191-2196

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

イギリス、デンマーク、フィンランド、スウェーデン、アイルランド、ノルウェー、カナダ、オーストラリア、韓国、台湾、香港、タイ、マレーシア、シンガポールなど35カ国で発売されている。

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

