

痔疾治療剤

ヒドロコルチゾン・フラジオマイシン配合剤

ヘモレックス軟膏

HAEMOLEX OINTMENT

貯法：室温保存
有効期間：2年

承認番号	16200EMZ01845
販売開始	1998年10月

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

3. 組成・性状

3.1 組成

有効成分	Ig 中
	ヒドロコルチゾン…………… 5.0mg
	フラジオマイシン硫酸塩…………… 7.1mg（力価）
	ジブカイン塩酸塩…………… 5.0mg
	エスクロシド…………… 10.0mg
* 添加剤	白色ワセリン（抗酸化剤としてBHTを含む）、 精製ラノリン、流動パラフィン

3.2 製剤の性状

性状	淡黄色の軟膏で、わずかに特有のにおいを有する
----	------------------------

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

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。

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。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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。

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。

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、小児の发育障害をきたしたという報告がある。

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。

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。

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

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。

18. 薬効薬理

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、各種有効成分が次の作用を発揮する。

- ・ヒドロコルチゾン
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、レプトスピラに対し、たん白合成阻害により、抗菌作用を示す。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。

18.2 抗炎症作用(ヒドロコルチゾン、エスクロシド)

Wistar 系雄性ラットによる実験で、0.5% 配合のヒドロコルチゾンの血管透過性の抑制作用及びカラゲニンによる足蹠浮腫発生に対する抑制作用がみられ、両作用はエスクロシドの配合により更に増強された¹⁾。

18.3 鎮痛作用(ジブカイン塩酸塩)

Hartley 系雌性モルモット左右角膜による実験で、0.5% 配合のジブカイン塩酸塩の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)

dd 系雌性マウス尾の切断面による実験で、1.0% 配合のエスクロシドは対照と比較し、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 を測定した。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 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⁾。

18.6 生物学的同等性試験

18.6.1 抗炎症作用

ヘモレックス軟膏及びプロクトセディル軟膏をヒスタミン誘発血管透過性亢進モデル、ラットカラゲニン足蹠浮腫モデルに対して単回塗布した後に、青染部位の面積、足蹠浮腫率により抗炎症作用を評価した。この試験において、両剤ともいずれのモデルにおいても抗炎症作用を示し、生物学的に同等と判断された³⁾。

18.6.2 鎮痛作用

ヘモレックス軟膏及びプロクトセディル軟膏をモルモットの角膜に対して単回塗布した後に、刺激毛で軽く刺激し角膜反射の有無を評価した。この試験において、両剤とも局所麻酔作用を示し、生物学的に同等と判断された⁴⁾。

18.6.3 止血作用

ヘモレックス軟膏及びプロクトセディル軟膏をマウスの尾部に対して単回塗布した後に、尾末端の切断による出血の止血までの時間を評価した。この試験において、両剤とも止血作用を示し、生物学的に同等と判断された⁵⁾。

18.6.4 抗菌作用

ヘモレックス軟膏及びプロクトセディル軟膏を大腸菌が接種された寒天・乳糖ブイヨン培地上に置き、形成した阻止円を評価した。この試験において、両剤とも抗菌作用を示し、生物学的に同等と判断された⁶⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

19.1 ヒドロコルチゾン

一般的名称：ヒドロコルチゾン (Hydrocortisone)

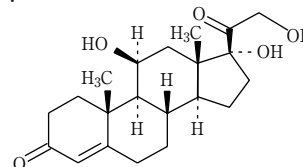
化学名：11 β , 17, 21-Trihydroxypregn-4-ene-3, 20-dione

分子式：C₂₁H₃₀O₅

分子量：362.46

性状：白色の結晶性の粉末で、においはない。メタノール、エタノール (95) 又は 1, 4-ジオキサラ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。

化学構造式：



19.2 フラジオマイシン硫酸塩

一般的名称：フラジオマイシン硫酸塩

(Fradiomycin Sulfate)

化学名：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

フラジオマイシン C 硫酸塩

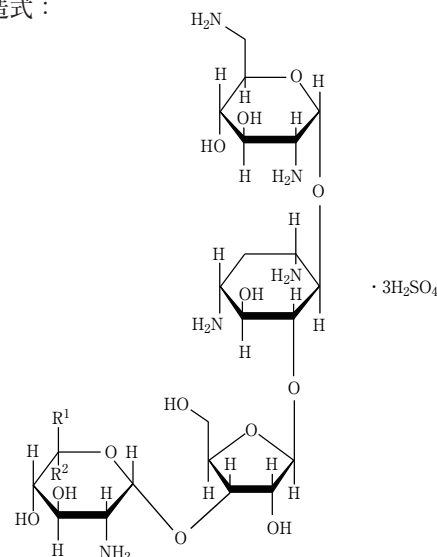
2, 6-Diamino-2, 6-dideoxy- α -D-glucopyranosyl-(1 \rightarrow 4)-[2, 6-diamino-2, 6-dideoxy- α -D-glucopyranosyl-(1 \rightarrow 3)- β -D-ribofuranosyl-(1 \rightarrow 5)]-2-deoxy-D-streptamine trisulfate

分子式：C₂₃H₄₆N₆O₁₃ · 3H₂SO₄

分子量：908.88

性状：白色～淡黄色の粉末である。水に溶けやすく、エタノール (95) にはほとんど溶けない。

化学構造式：



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

19.3 ジブカイン塩酸塩

一般的名称：ジブカイン塩酸塩

(Dibucaine Hydrochloride)

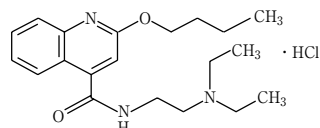
化学名：2-Butyloxy-N-(2-diethylaminoethyl)-4-quinolinecarboxamide monohydrochloride

分子式：C₂₀H₂₉N₃O₂ · HCl

分子量：379.92

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。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。吸湿性である。

化学構造式：



19.4 エスクロシド

一般的名称：エスクロシド (Esculoside)

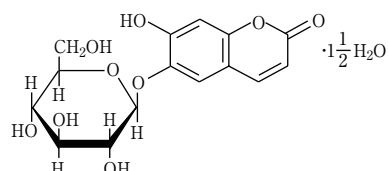
化学名：6-(β-D-Glucopyranosyloxy)-7-hydroxy-2H-1-benzopyran-2-one sesquihydrate

分子式：C₁₅H₁₆O₉ · 1 1/2 H₂O

分子量：367.31

性状：白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。メタノール又はジオキサンにやや溶けにくく、水、エタノール又は水酢酸に溶けにくく、エーテルにほとんど溶けない。

化学構造式：



22. 包装

チューブ：2g × 70 [7個 × 10]

2g × 350 [7個 × 50]

23. 主要文献

- 1) 平松保造 他：基礎と臨床. 1977 ; 11 (8) : 53-59
- 2) 神木照雄 他：医学と薬学. 1980 ; 4 (1) : 77-79
- 3) 社内資料：薬力学的試験（抗炎症作用）
- 4) 社内資料：薬力学的試験（鎮痛作用）
- 5) 社内資料：薬力学的試験（止血作用）
- 6) 社内資料：薬力学的試験（抗菌作用）

24. 文献請求先及び問い合わせ先

堀井薬品工業株式会社 安全性情報部

〒540-0038 大阪市中央区内淡路町1丁目2番6号

TEL : 06-6942-3487

FAX : 06-6942-1505

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

 **ジェイドルフ製薬株式会社**
滋賀県甲賀市土山町北土山2739

26.2 販売元

 **堀井薬品工業株式会社**
大阪市中央区内淡路町1丁目2番6号