

**2019年10月改訂（第5版）
*2016年4月改訂

貯 法：室温保存（30℃以下）
使用期限：製造後2年（外箱に表示の使
用期限内に使用すること）

痔疾治療剤

日本標準商品分類番号
8 7 2 5 5 9

プロクトセディル®坐薬

承認番号	14100AZY00126
薬価収載	1967年7月
発売開始	1966年4月
再評価結果	1981年8月

Proctosedyl® Suppository

D0078129

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

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. 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。〕
3. 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者
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

* * 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（「相互作用」の項参照）

【組成・性状】

1. 組成

本剤は1個中にヒドロコルチゾン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を含有する。添加物として硬化油を含有する。

2. 製剤の性状

外形・大きさ	色・剤形	重量 (g)
	黄白色 紡すい型 坐剤	1.84

【効能又は効果】

痔核・裂肛の症状（出血、疼痛、腫脹、痒感）の緩解

【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。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

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。

* * 2. 相互作用

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（ミニリンスルト）（男性における夜間多尿による夜間頻尿）	低ナトリウム血症が発現するおそれがある。	機序不明。

3. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。（再審査対象外）

(1) 重大な副作用

下垂体・副腎皮質系機能抑制…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ので注意すること。

(2) その他の副作用

	頻度不明
皮膚及び陰部 ^(注)	真菌症（カンジダ症、白癬等）、ウイルス性疾患
過敏症 ^(注)	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

注) このような症状があらわれた場合には使用を中止すること。

4. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、大量又は長期にわたる使用は避けること。

5. 小児等への投与

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ので、観察を十分に行う。

【臨床成績】

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。

【薬効薬理】

1. 抗炎症作用¹⁾（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。

2. 鎮痛作用¹⁾ (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。

3. 止血作用¹⁾ (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。

4. 抗菌作用²⁾ (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。

【薬物動態】

1. フラジオマイシン硫酸塩³⁾

痔疾患患者5名に対し本剤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。

2. ヒドロコルチゾン⁴⁾

痔疾患患者5名に対し本剤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のヒドロコルチゾン濃度を測定したが、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。

【有効成分に関する理化学的知見】

本剤は下記4成分を含む配合剤である。

(1)ヒドロコルチゾン

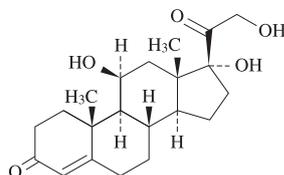
一般名：ヒドロコルチゾン (Hydrocortisone)

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

分子式：C₂₁H₃₀O₅

分子量：362.46

構造式：



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。

(2)フラジオマイシン硫酸塩

一般名：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→4)-[2,6-diamino-2,6-dideoxy-β-L-idopyranosyl-(1→3)-β-D-

ribofuranosyl-(1→5)]-2-deoxy-D-streptamine trisulfate

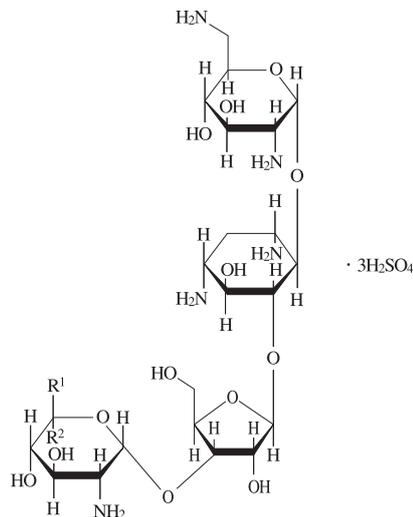
フラジオマイシンC硫酸塩

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

分子式：C₂₃H₄₆N₆O₁₃ · 3H₂SO₄

分子量：908.88

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

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。

(3)ジブカイン塩酸塩

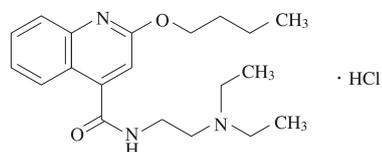
一般名：ジブカイン塩酸塩 (Dibucaine Hydrochloride)

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

分子式：C₂₀H₂₉N₃O₂ · HCl

分子量：379.92

構造式：



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。

(4)エスクロシド

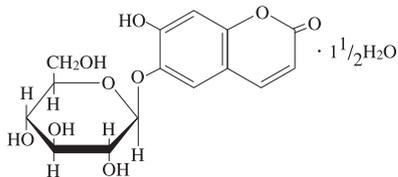
一般名：エスクロシド (Esculoside)

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

分子式：C₁₅H₁₆O₉ · 1½H₂O

分子量：367.31

構造式：



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、エタノール又は氷酢酸に溶けにくく、エーテルにほとんど溶けない。

【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ますので、保管は30℃以下とし、夏季には、涼しい場所に保管して下さい。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ご使用ください。

【包装】

70個、350個

【主要文献】

- 1) 平松保造 他：基礎と臨床, 11(8), 53, 1977
- 2) 神木照雄 他：医学と薬学, 4(1), 77, 1980
- 3) 神木照雄 他：医学と薬学, 4(1), 76, 1980
- 4) 野本照子 他：医学と薬学, 4(1), 73, 1980

*【文献請求先】

EAファーマ株式会社

くすり相談室

〒104-0042 東京都中央区入船二丁目1番1号

☎ 0120-917-719

* 製造販売元



EAファーマ株式会社
東京都中央区入船二丁目1番1号



