

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のI F記載要領(1998年9月)に準拠して作成

抗炎症・抗菌痔疾《外用》治療剤

ヘモレックス軟膏

HAEMOLEX ointment

剤形	軟膏剤
規格・含量	1g 中 ヒドロコルチゾン・・・・・・・・5.0mg ジブカイン塩酸塩・・・・・・・・5.0mg フラジオマイシン硫酸塩・・・・7.1mg(力価) エスクロシド・・・・・・・・10.0mg
一般名	ヒドロコルチゾン・フラジオマイシン配合剤
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 発売年月日	製造販売承認年月日：昭和62年5月29日 薬価基準収載年月日：昭和62年10月1日 発売年月日：昭和62年10月1日
開発・製造・輸入・ 発売・提携・販売会社	製造販売：ジェイドルフ製薬株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	

本I Fは2007年4月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

IF利用の手引きの概要

- 日本病院薬剤師会 -

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者(以下、MRと略す)等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和63年日本病院薬剤師会(以下、日病薬と略す)学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、IFと略す)として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成10年日病薬学術第3小委員会によって新たな位置付けとIF記載要領が策定された。

2. IFとは

IFは「医療用医薬品添付文書等の情報を補完し、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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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薬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。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。

3. IFの様式・作成・発行

規格はA4判、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載事項は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IFは日病薬が策定した「IF記載要領」に従って記載するが、本IF記載要領は、平成11年1月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価(臨床試験実施による)がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合にはIFが改訂・発行される。

4. IFの利用にあたって

IF策定の原点を踏まえ、MRへのインタビュー、自己調査のデータを加えてIFの内容を充実させ、IFの利用性を高めておく必要がある。

MRへのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update(医薬品安全対策情報)等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段にIF作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

目 次

．概要に関する項目.....	1
II．名称に関する項目.....	2
III．有効成分に関する項目.....	4
IV．製剤に関する項目.....	6
V．治療に関する項目.....	9
VI．薬効薬理に関する項目.....	10
VII．薬物動態に関する項目.....	11
VIII．安全性(使用上の注意等)に関する項目.....	13
IX．非臨床試験に関する項目.....	16
X．取扱い上の注意等に関する項目.....	17
XI．文献.....	19
XII．参考資料.....	19
XIII．備考.....	19

．概要に関する項目

1．開発の経緯

ヘモレックス軟膏は痔疾患の急性症状である疼痛、腫脹、出血に対し抗炎症作用をあらわすヒドロコルチゾンと痔疾患における疼痛、そう痒感に対し速効的な鎮痛・鎮痒作用をあらわすジブカイン塩酸塩と止血作用をあらわすエスクロシドと抗菌作用をあらわすフラジオマイシン硫酸塩を配合した痔疾用剤である。後発品として1987年5月に承認された。

2．製品の特徴および有用性

ヘモレックス軟膏は、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・皮膚炎の改善が期待できる痔疾用軟膏である。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ヘモレックス軟膏

(2) 洋名

HAEMOLEX ointment

(3) 名称の由来

特になし

2. 一般名

(1) 和名(命名法)

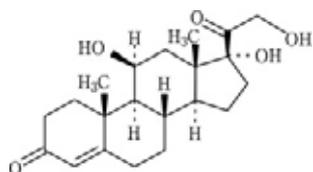
- 1) 日局 ヒドロコルチゾン
- 2) 日局 ジブカイン塩酸塩
- 3) 日局 フラジオマイシン硫酸塩
- 4) 局外規 エスクロシド

(2) 洋名(命名法)

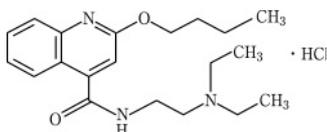
- 1) Hydrocortisone
- 2) Dibucaine Hydrochloride
- 3) Fradiomycin Sulfate
- 4) Esculoside

3. 構造式または示性式

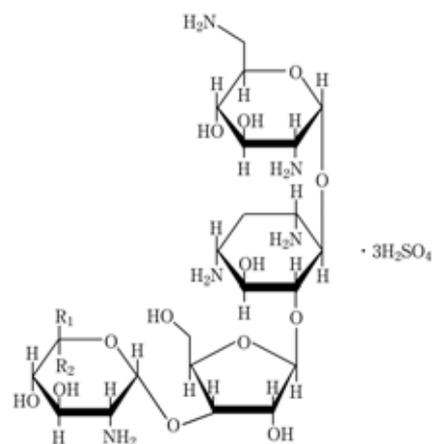
ヒドロコルチゾン



ジブカイン塩酸塩

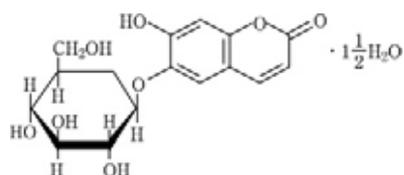


フラジオマイシン硫酸塩



フラジオマイシンB : $R_1=H$ $R_2=CH_2NH_2$
フラジオマイシンC : $R_1=CH_2NH_2$ $R_2=H$

エスクロシド



4. 分子式および分子量

ヒドロコルチゾン : $C_{21}H_{30}O_5 = 362.46$

ジブカイン塩酸塩 : $C_{20}H_{29}N_3O_2 \cdot HCl = 379.92$

フラジオマイシン硫酸塩 : $C_{23}H_{46}N_6O_{13} \cdot 3H_2SO_4 = 908.88$

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

ジブカイン塩酸塩 :

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

フラジオマイシン B 硫酸塩 :

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

エスクロシド :

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

なし

7. CAS登録番号

ヒドロコルチゾン : 50-23-7

ジブカイン塩酸塩 : 61-12-1

フラジオマイシン硫酸塩 : 1405-10-3

エスクロシド : 531-75-9 (Escloside anhydrous)

III . 有効成分に関する項目

1 . 有効成分の規制区分

なし（処方せん医薬品以外の医薬品）

2 . 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。

ジブカイン塩酸塩：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

フラジオマイシン硫酸塩：白色～淡黄色の粉末である。

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。

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。

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。

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(95)又は酢酸(100)に溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

ジブカイン塩酸塩：吸湿性あり

フラジオマイシン硫酸塩：吸湿性あり

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

ヒドロコルチゾン：212～220（分解）

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

ヒドロコルチゾン

比旋光度 $[\alpha]_D^{20} = +150 \sim +156^\circ$ (乾燥後0.1g、1,4-ジオキサン、100mL、100nm)

エスクロシド

比旋光度 $[\alpha]_D^{20} = -84 \sim -87^\circ$ (脱水物に換算したものの0.2g、水/ジオキサン混液(1:1)、20mL、100nm)

ジブカイン塩酸塩

pH = 5.0 ~ 6.0(1→50)

フラジオマイシン硫酸塩

pH = 5.0 ~ 7.5 (100mg/mL 溶液)

3. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

4. 有効成分の確認試験法

ヒドロコルチゾン：日局「ヒドロコルチゾン」による。

ジブカイン塩酸塩：日局「ジブカイン塩酸塩」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。

エスクロシド：局外規「エスクロシド」による。

5. 有効成分の定量法

ヒドロコルチゾン：日局「ヒドロコルチゾン」による。

ジブカイン塩酸塩：日局「ジブカイン塩酸塩」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。

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) 投与経路

直腸、経皮

(2) 剤形の区分、規格及び性状

区分：軟膏

性状：淡黄色の軟膏で、わずかに特有のにおいを有する

(3) 製剤の物性

展延性(毛細管遠心法；20)

軟膏を内径 0.7mm の毛細管に 1.5mm 入れ、2000rpm で 8 秒間遠心したとき、軟膏は 20mm 移動した。

稠性限界温度(細棒転倒法)

軟膏を 3mm の厚さで均等に延ばし、温度を徐々に上げたとき軟膏に立てた細棒の 50%が倒れたときの温度は 33.6 であった。

粘稠性(重量負荷法；25)

軟膏に底面の直径8mm、高さ50mmの円錐を埋め込み、円錐頂点に分銅を負荷し円錐が軟膏から抜け出るまでの時間を測定した時の仕事量は21.5g・sec・5cmであった。

(4) 識別コード

なし

(5) 無菌の有無

無菌製剤ではない

(6) 酸価、ヨウ素価等

該当しない

2．製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量

1 g 中

ヒドロコルチゾン・・・5.0mg

ジブカイン塩酸塩・・・5.0mg

フラジオマイシン硫酸塩・・・7.1mg(力価)

エスクロシド・・・10.0mg

(2) 添加物

白色ワセリン、精製ラノリン、流動パラフィン

3．用時溶解して使用する製剤の調製法

該当しない

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

5. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 長期保存試験

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温、30ヵ月）の結果、ヘモレックス軟膏は通常の市場流通下において2年間安定であることが確認された¹⁾。

6. 溶解後の安定性

該当しない

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

8. 混入する可能性のある夾雑物

該当しない

9. 溶出試験

該当しない

10. 生物学的試験法

該当しない

11. 製剤中の有効成分の確認試験法

(1) ヒドロコルチゾン

2,4-ジニトロフェニルヒドラジン試液による呈色反応

(2) ジブカイン塩酸塩

ドラージェンドルフ試液による呈色反応

(3) エスクロシド

紫外線による蛍光及びアンモニア試液による呈色反応

(4) フラジオマイシン硫酸塩

ニンヒドリン試液及びピリジンによる呈色反応

12. 製剤中の有効成分の定量法

(1) ヒドロコルチゾン

液体クロマトグラフィー

(2) ジブカイン塩酸塩

液体クロマトグラフィー

(3) エスクロシド

液体クロマトグラフィー

(4) フラジオマイシン硫酸塩

液体クロマトグラフィー

13. 力価

本剤1gは、日局フラジオマイシン硫酸塩7.1mg(力価)を有する。

14. 容器の材質

2g チューブ

キャップ・チューブ：ポリエチレン

20g チューブ

キャップ：ポリエチレン、チューブ：アルミ製

15. 刺激性

皮膚に対する刺激性は少ない。

16. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能または効果

- ・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. 用法および用量

通常1日1～3回適量を患部に塗布又は注入する。

3. 臨床成績

(1) 臨床効果

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験：忍容試験

該当資料なし

(3) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 無作為化平行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(5) 治療的使用

1) 使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容または実施した試験の概要

該当しない

VI．薬効薬理に関する項目

1．薬理的に関連ある化合物または化合物群

糖質コルチコイド、アミノグリコシド系抗生物質、局所麻酔剤、フラボノイド

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：本剤はヒドロコルチゾン（抗炎症作用・止痒作用）、ジブカイン塩酸塩（局所麻酔作用）、フラジオマイシン硫酸塩（抗菌作用）、エスクロシド（止血作用）の4成分の作用により「痔核」「裂肛」及び「肛門周囲の湿疹・皮膚炎」に対し効果を示す。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

抗炎症作用

ヘモレックス軟膏は0.1gをWistar系雄性ラットに塗布しておく、ヒスタミンの皮下注射による血管透過性を有意に抑制した。また、ヘモレックス軟膏は50mgをカラゲニン投与2時間前と1時間前に塗布すると、カラゲニン皮下投与によるラット足蹠浮腫を有意に抑制した²⁾。

止血作用

dd系雄性マウスの尾にヘモレックス軟膏50mgを塗布後直ちに尾末端を切断した時、ヘモレックス軟膏塗布群は対象群に比べ出血時間が有意に短かった²⁾。

抗菌作用

大腸菌を加えた寒天・乳糖ブイヨン培地の上にヘモレックス軟膏0.3gをつめたカップを置いて培養した時、ヘモレックス軟膏は大腸菌の増殖を阻止した²⁾。

局所麻酔作用

Hartley系雄性モルモットの角膜にヘモレックス軟膏0.1gを塗布した後、刺激毛で軽く刺激した時、ヘモレックス軟膏塗布80分後まで角膜反射を抑制した²⁾。

VII．薬物動態に関する項目

1．血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

該当資料なし

(3) 通常用量での血中濃度

該当資料なし

(4) 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

2．薬物速度論的パラメータ

(1) 吸収速度定数

該当資料なし

(2) バイオアベイラビリティ

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) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3．吸収

該当資料なし

4．分布

(1) 血液 - 脳関門通過性

該当資料なし

(2) 胎児への移行性

該当資料なし

(3) 乳汁中への移行性

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

5. 代謝

(1) 代謝部位および代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無およびその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無および比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位

該当資料なし

(2) 排泄率

該当資料なし

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

(1) 腹膜透析

該当資料なし

(2) 血液透析

該当資料なし

(3) 直接血液灌流

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

該当しない

2 . 禁忌内容とその理由

禁忌（次の患者には使用しないこと）

- | |
|---|
| <p>(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。]</p> <p>(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。]</p> <p>(3) 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者</p> <p>(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</p> |
|---|

3 . 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

特になし

4 . 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

特になし

5 . 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

特になし

6 . 重要な基本的項目とその理由および処置方法

重要な基本的注意

<p>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。</p>

7 . 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

該当しない

8. 副作用

(1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度に関する調査を実施していないため、発現頻度は不明である。

1) 重大な副作用と初期症状

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ので注意すること。

2) その他の副作用

種類 / 頻度	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。

(2) 項目別副作用発現頻度および臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(3) 基礎疾患、合併症、重症度および手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(4) 薬物アレルギーに対する注意および試験法

該当資料なし

9. 高齢者への投与

該当しない

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

11. 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。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

13. 過量投与

該当しない

14. 適用上および薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

投与部位

眼科用として使用しないこと。

15. その他の注意

特になし

16. その他

特になし

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 一般薬理

該当資料なし

2. 毒性

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 取扱い上の注意等に関する項目

1. 有効期間または使用期限

使用期限：2年（外箱に表示の使用期限内に使用すること）

2. 貯法・保存条件

貯法：室温保存

3. 薬剤取扱い上の注意点

特になし

4. 承認条件

特になし

5. 包装

20g×20

2g×70、2g×350

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：プロクトセディル軟膏（味の素ファルマ）

同効薬：ボラザG坐剤・軟膏（天藤-武田）、強力ポステリザン軟膏（マルホ）、ネリ
プロクト軟膏・坐剤（インテンディス）

7. 国際誕生年月日

該当しない

8. 製造・輸入承認年月日および承認番号

製造販売承認年月日：昭和62年5月29日

製造販売承認番号：16200EMZ01845

9. 薬価基準収載年月日

昭和62年10月1日

10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日およびその内容

該当しない

11. 再審査結果、再評価結果公表年月日およびその内容

該当しない

12．再審査期間

該当しない

13．厚生労働省薬価基準収載医薬品コード

2559806M1030

14．長期投与の可否

本剤は厚生労働省令第23号（平成14年3月8日付）および厚生労働省告示第99号（平成14年3月18日付）による薬剤投与期間の制限をうけない。

15．保険給付上の注意

特になし

XI．文献

1．引用文献

- 1) ジェイドルフ製薬(株)社内資料
- 2) ジェイドルフ製薬(株)社内資料

2．その他の参考文献

特になし

XII．参考資料

主な外国での発売状況

なし

XIII．備考

その他の関連資料

なし