



**2016年4月改訂(第6版)
*2008年5月改訂

痔 疾 用 剤

ボラザ® G 軟膏

BORRAZA®-G ointment
トリベノシド・リドカイン軟膏

日本標準商品分類番号	
872559	
承認番号	20600AMZ00943
薬価収載	1994年5月
販売開始	1994年8月
再審査結果	2002年9月

貯 法：室温保存
使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること。

【禁忌 (次の患者には使用しないこと)】

- (1)本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2)トリベノシド又はアニリド系局所麻酔剤 (リドカイン等) に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

1. 組成

本剤は、1容器 (2.4g) 中に次の成分を含有する。
トリベノシド ……………271.2mg
リドカイン …………… 54.2mg
添加物として白色ワセリン、中鎖脂肪酸トリグリセリド、ミツロウを含有する。

2. 製剤の性状

本剤は、白色～帯黄白色の軟膏で、においはないか又はわずかに特異なおいがある。

【効能・効果】

- ・痔核に伴う症状 (出血、疼痛、腫脹) の緩解
- ・裂肛に伴う症状 (出血、疼痛) の緩解、裂創上皮化の促進

【用法・用量】

内痔核には、通常1回1容器分 (注入量でトリベノシドとして200mg、リドカインとして40mg) を、1日2回朝夕肛門内に注入する。症状に応じて適宜回数を増減する。裂肛、外痔核には、通常適量を1日2回朝夕患部に塗布又は注入する。症状に応じて適宜回数を増減する。

【使用上の注意】

1. 慎重投与 (次の患者には慎重に使用すること)

- (1)他の薬剤や食物等に対する過敏症の既往歴のある患者 [発疹等の過敏症状発現率が高い傾向にある。]
- (2)気管支喘息、アレルギー性鼻炎等アレルギー疾患の患者及びそれらの既往歴のある患者 [発疹等の過敏症状発現率が高い傾向にある。]
- (3)他のトリベノシド製剤又はリドカイン製剤が併用される患者 [トリベノシド又はリドカインの血中濃度が上昇する。]
- (4)慢性関節リウマチの患者 [トリベノシドの経口投与による動物実験でアジュバント関節炎を増強させる傾向が報告されている。]
- (5)高齢者 (「高齢者への使用」の項参照)

2. 相互作用

併用注意 (併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
クマリン系抗凝血剤 (ワルファリン等)	クマリン系抗凝血剤の作用を増強することがあるので用量を調節するなど注意すること。	機序は不明であるが、ラットによるプロトロンビン時間を指標とした実験で、トリベノシドはクマリン系抗凝血剤ジクマロールの作用を増強するとの報告がある。

** 3. 副作用

再審査終了時、3,463例中26例 (0.75%) に副作用が認められている。その主なものは発疹、肛門そう痒等の皮膚症状22例 (0.64%)、局所の刺激感8例 (0.23%) 等である。以下の副作用は上記の調査あるいは自発報告等で認められたものである。

(1)重大な副作用

アナフィラキシー (頻度不明)：アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、顔面浮腫、蕁麻疹、呼吸困難等があらわれた場合には、直ちに使用を中止し、適切な処置を行うこと。

(2)その他の副作用

	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹、そう痒感、局所の刺激感		接触性皮膚炎
消化器		下痢	嘔気
循環器			動悸

注)：観察を十分に行い、このような場合には直ちに使用を中止すること。

4. 高齢者への使用

一般に高齢者では生理機能が低下しているので慎重に使用すること。

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への使用

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上まわると判断される場合にのみ使用すること。[妊娠中の使用に関する安全性は確立していない。]

6. 小児等への使用

小児等に対する安全性は確立していない (使用経験が少ない)。

7. 適用上の注意

眼科用として使用しないこと。

【薬物動態】

(参考)

¹⁴C-トリベノシド (28.25mg/kg) 及び ³H-リドカイン (5.65mg/kg) を含有する軟膏をラットに経皮及び直腸内投与したとき、

1. 吸収¹⁾

¹⁴Cの血漿中放射能のピークは、経皮投与では6時間後、直腸内投与では15分後にみられ、投与24時間までの吸収率はそれぞれ1.9%及び14.7%である。また、³Hの血漿中放射能のピークは、経皮投与では6時間後、直腸内投与では1時間後にみられ、投与24時間までの吸収率はそれぞれ14.0%及び78.4%である。

2. 分布¹⁾

¹⁴Cの組織中放射能のピークは、経皮投与では4時間後、直腸内投与では2時間後にみられ、投与部位における¹⁴Cの放射能は他の臓器に比べ著しく高く分布する。また、³Hの組織中放射能のピークは、経皮投与では4時間後、直腸内投与では30分後にみられ、投与部位における³Hの放射能は著しく高く分布する。

3. 代謝¹⁾

投与6時間後、投与部位における総¹⁴Cの放射能のうち、皮膚では79.8%、直腸では51.7%が未変化体である。また、投与部位における総³Hの放射能のほとんどが未変化体である。

4. 排泄¹⁾

投与168時間までの¹⁴Cの放射能の排泄率は、経皮投与では尿中に2.3%、糞中に2.9%、直腸内投与ではそれぞれ11.4%及び25.7%である。また、³Hの放射能の排泄率は、経皮投与では尿中に18.6%、糞中に3.9%、直腸内投与ではそれぞれ62.7%及び10.1%であり、吸収された³Hは主に尿中に排泄される。

【臨床成績】^{2)~8)}

痔核及び裂肛患者440例における非盲検比較対照試験及び一般臨床試験を含む臨床試験の概要は次の通りである。

疾患名	投与量	投与期間	改善以上例数 /症例数	改善率 (%)
内痔核	1回1容器分、 1日2回	2週間 (一部1週間、 3週間投与を 含む)	140/198	70.7
外痔核	1回適量、 1日2回		40/58	69.0
裂肛			150/184	81.5

なお、内痔核及び裂肛に対しては、非盲検比較対照試験において本剤の有用性が認められている。

【薬効薬理】

1. 抗浮腫作用⁹⁾

本剤を直腸内に投与することにより、トリベノシドはクロトン油混合液による直腸肛門部浮腫に対して抑制作用を示す(ラット)。

2. 創傷治癒促進作用¹⁰⁾

トリベノシドとリドカインを本剤と同一配合比(5:1)の軟膏状として塗布することにより、トリベノシドは背部皮膚に作成した創傷に対して治癒促進作用を示す(ラット)。

3. 循環障害改善作用¹¹⁾

トリベノシド溶液を直腸粘膜に投与することにより、トロンビンによる直腸粘膜血流量低下に対して抑制作用を示す(ラット)。

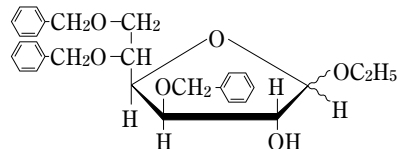
4. 表面麻酔作用¹²⁾

本剤を眼粘膜に塗布することにより、リドカインは角膜反射を指標とする方法において表面麻酔作用を示す(モルモット)。

【有効成分に関する理化学的知見】

<トリベノシド>

化学構造式：



一般名：トリベノシド (Tribenoside) [JAN]

化学名：Ethyl-3,5,6-tri-O-benzyl-D-glucofuranoside

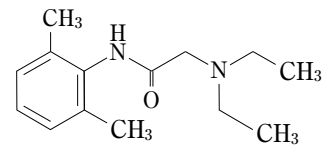
分子式：C₂₉H₃₄O₆

分子量：478.58

性状：トリベノシドは、無色～淡黄色の粘稠性のある液で、においはないか又はわずかに特異なおいがあり、味はない。メタノール、氷酢酸、エタノール、アセトン、酢酸エチル、エーテル又はクロロホルムと混和する。水にほとんど溶けない。

**<リドカイン>

化学構造式：



一般名：リドカイン (Lidocaine) [JAN] [日局]

化学名：2-Diethylamino-N-(2,6-dimethylphenyl)acetamide

分子式：C₁₄H₂₂N₂O

分子量：234.34

融点：66～69℃

性状：リドカインは、白色～微黄色の結晶又は結晶性の粉末である。メタノール又はエタノール(95)に極めて溶けやすく、酢酸(100)又はジエチルエーテルに溶けやすく、水にほとんど溶けない。希塩酸に溶ける。

【包装】

2.4g×35個

2.4g×140個

2.4g×350個

【主要文献】

- 1) 穴瀬一正 他：薬理と治療，22：2109，1994.
- 2) 黒川彰夫 他：新薬と臨床，40：1147，1991.
- 3) 黒川彰夫 他：新薬と臨床，40：1336，1991.
- 4) 衣笠 昭 他：新薬と臨床，40：1319，1991.
- 5) 衣笠 昭 他：新薬と臨床，40：1760，1991.
- 6) 磯本浩晴 他：新薬と臨床，40：1157，1991.
- 7) 高野正博 他：新薬と臨床，40：1327，1991.
- 8) 日高久光 他：基礎と臨床，25：2381，1991.
- 9) 吉田益美 他：基礎と臨床，27：2063，1993.
- 10) 藤村 一 他：薬理と治療，8：1855，1980.
- 11) 岩田圭司 他：応用薬理，46：299，1993.
- *12) 天藤製薬株式会社社内資料 (BG-356軟膏のモルモット角膜反射における表面麻酔作用)

**【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

天藤製薬株式会社 お客様相談係

〒560-0082 大阪府豊中市新千里東町一丁目5番3号

フリーダイヤル 0120-932-904

受付時間 9:00～17:00 (土、日、休、祝日を除く)

製造販売元 あまとう 天藤製薬株式会社

**〒560-0082 大阪府豊中市新千里東町一丁目5番3号

販売 武田薬品工業株式会社

〒540-8645 大阪市中央区道修町四丁目1番1号