



**2016年 4月改訂(第6版)
*2008年 5月改訂

痔核局所治療剤

日本標準商品分類番号
872559

ボラザ®G 坐剤

BORRAZA-G suppositories
トリベノシド・リドカイン坐剤

承認番号	15700AMZ01302
薬価収載	1983年 2月
販売開始	1983年 4月
再審査結果	1988年 3月

貯法：室温保存（1～30℃）。高温下で放置すると、高温のために坐剤が融けて型くずれすることがあるので注意すること。
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個（1.77g）中に次の成分を含有する。
トリベノシド ……………200mg
リドカイン …………… 40mg
添加物としてハードファットを含有する。

2. 製剤の性状

本剤は、白色～帯黄白色の紡すい形の坐剤で、わずかに特異なおいがある。

外形	融点	基剤	識別コード
	32～37℃	油脂性	⊕259G

【効能・効果】

内痔核に伴う症状の緩解

【用法・用量】

通常 1回 1個ずつ（トリベノシドとして200mg、リドカインとして40mg）、1日 2回朝夕肛門内に挿入する。
症状に応じて適宜増減する。

【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、11,453例中48例（0.42%）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27例（0.24%）、下痢等の消化器症状15例（0.13%）、局所の刺激感6例（0.05%）等である。¹⁾
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 ²⁾ 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. 適用上の注意

- (1)被包を取り除いたら直ちに使用すること。
- (2)室温が27℃以上になると、坐剤の硬度が低下し挿入しにくいことがあるので、その場合には冷水等で冷し固くしてから挿入すること。

【薬物動態】

(参考)

¹⁴C-トリベノシド（10mg/kg）を含有する坐剤をラットに直腸内投与したとき、

1. 吸収²⁾

血漿中放射能のピークは、投与1時間後にみられ、その値は同量経口投与した場合の約1/3であり、24時間後までの血中濃度曲線下面積は、経口投与の約60%である。

2. 分布²⁾

直腸肛門部組織中の1～24時間の平均放射能は、経口投与の場合に比べ約50倍高く分布する。

3. 代謝²⁾

直腸投与1時間後の直腸粘膜組織中では、放射能の約70%が未変化体である。

4. 排泄²⁾

直腸投与48時間までの放射能の排泄率は、尿中24.8%、糞中65.0%である。

【臨床成績】

内痔核患者702例における2種の二重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日2個 (1回1個、 1日2回)	大部分の症例で 2～4週間	449/702	64.0

なお、リドカイン坐剤を対照とした二重盲検比較対照試験³⁾及びトリベノシド経口剤を対照とした二重盲検比較対照試験⁴⁾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⁵⁾

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⁶⁾

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⁷⁾

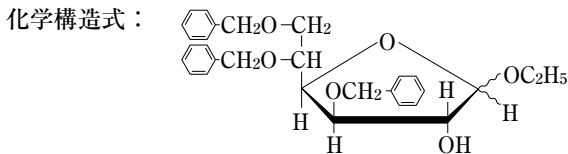
トリベノシド溶液を直腸粘膜に投与することにより、トロンピンによる直腸粘膜血流量低下に対して抑制作用を示す(ラット)。

4. 表面麻酔作用⁸⁾

トリベノシドとリドカインを本剤と同一配合比(5:1)の軟膏状として角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】

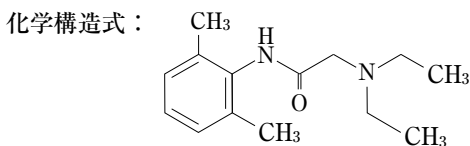
<トリベノシド>



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>



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】

50個(5個×10)

200個(5個×40)

350個(7個×50)

【主要文献】

- 1)厚生省薬務局安全課：医薬品副作用情報 No. 90：日本医事新報No. 3344, 121, 1988.
- 2)Iga, K. et al：International Journal of Pharmaceutics, 6：43, 1980.
- 3)松島善祝 他：薬理と治療, 9：2197, 1981.
- 4)端野博康 他：薬物療法, 14：173, 1981.
- 5)吉田益美 他：応用薬理, 45：459, 1993.
- 6)藤村 一 他：薬理と治療, 8：1855, 1980.
- 7)岩田圭司 他：応用薬理, 46：299, 1993.

**【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

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