

# 酸安定性・持続型マクロライド系抗生物質製剤

処方箋医薬品\*

日本薬局方 ロキシスロマイシン錠

## ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」

### ROXITHROMYCIN

日本標準商品分類番号
876149

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示

承認番号	22500AMX01918000
薬価収載	2014年6月
販売開始	2005年7月

※注意－医師等の処方箋により使用すること

#### 【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1) 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2) エルゴタミン(エルゴタミン酒石酸塩、ジヒドロエルゴタミンメシル酸塩)含有製剤を投与中の患者(「相互作用」の項参照)

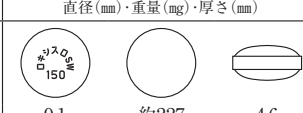
#### 【組成・性状】

##### ・組成

ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」は、1錠中に日局ロキシスロマイシン150mg(力価)を含有する。

添加物として、カルナウバロウ、カルメロースCa、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、デンブグリコール酸Na、トウモロコシデンプン、ヒプロメロース、ポビドン、マクロゴール6000を含有する。

##### ・製剤の性状

剤形	外形 直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)	性状
フィルムコーティング錠	 9.1      約2.27      4.6 [本体表示：ロキシスロ SW 150]	白色

#### 【効能・効果】

##### 〈適応菌種〉

本剤に感性的のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、モラクセラ(ブランハメラ)・カタラーリス、アクネ菌、肺炎マイコプラズマ(マイコプラズマ・ニューモニエ)

##### 〈適応症〉

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、ざ瘡(化膿性炎症を伴うもの)、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

##### ※ 〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

\*\* 咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、中耳炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」<sup>1)</sup>を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

#### 【用法・用量】

通常、成人にはロキシスロマイシンとして1日量300mg(力価)を2回に分割し、経口投与する。

##### ※ 〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

本剤の使用にあたっては、耐性菌の発現等を防ぐため、原則として感受性を確認し、疾病の治療上必要な最小限の期間の投与にとどめること。

#### 【使用上の注意】

##### 1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 1) 過敏症の既往歴のある患者
- 2) 肝障害のある患者〔血中濃度が持続するおそれがあるので、投与間隔をあけること。〕
- 3) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)
- 4) QT延長を起こすおそれのある患者(先天性QT延長症候群の患者、低カリウム血症等の電解質異常のある患者、QT延長を起こすことが知られている薬剤を投与中の患者)〔QT延長を起こすおそれがある。(「副作用」の項参照)〕

##### 2. 相互作用

###### 1) 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
エルゴタミン(エルゴタミン酒石酸塩、ジヒドロエルゴタミンメシル酸塩)を含有する製剤(クリアミン、ジヒデルゴット等)	エルゴタミンの作用を増強させ、四肢の虚血を起こすおそれがある。	肝薬物代謝酵素が阻害され、エルゴタミンの血中濃度が上昇し、エルゴタミンの末梢血管収縮作用が増強すると考えられる。

###### 2) 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
テオフィリン	テオフィリンの血中濃度が上昇し、中毒症状(悪心、嘔吐等)を起こすことがある。	肝薬物代謝酵素が阻害され、テオフィリン血中濃度が上昇すると考えられる。
ワルファリンカリウム	ワルファリンの作用を増強させ出血症状を起こすおそれがある。	肝薬物代謝酵素が阻害され、ワルファリン血中濃度が上昇すると考えられる。

##### 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。

###### 1) 重大な副作用(頻度不明)

- (1) **ショック、アナフィラキシー**：ショック、アナフィラキシーを起こすことがあるので、観察を十分に行い、不快感、口内異常感、眩暈、便意、耳鳴、発汗、喘鳴、呼吸困難、血管浮腫、全身の潮紅・蕁麻疹等の異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (2) **偽膜性大腸炎、出血性大腸炎**：偽膜性大腸炎、出血性大腸炎等の重篤な大腸炎があらわれることがある。腹痛、頻回の下痢、血便等があらわれた場合には、直ちに投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- (3) **間質性肺炎**：間質性肺炎(初期症状：発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常、好酸球増多等)があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には、投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。
- (4) **血小板減少症**：血小板減少症があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、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。

- (5) **肝機能障害、黄疸**：AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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し、適切な処置を行うこと。
- (6) **皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)**：皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、発熱、紅斑、痒痒感、眼充血、口内炎等の症状が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (7) **QT延長、心室頻拍(torsades de pointesを含む)**：QT延長、心室頻拍(torsades de pointesを含む)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は投与を中止し、適切な処置を行うこと。

## 2) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 <sup>注)</sup>	発熱、多形紅斑、発疹等
精神神経系	眠気、錯乱、頭痛、浮動性めまい、舌のしびれ感、しびれ
血液	好酸球増多、白血球減少
肝臓	胆汁うっ滞等の肝機能障害、AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P等の上昇
消化器	胸やけ、胃部不快感、腹痛、下痢、嘔吐、口渇、食欲不振、腹部膨満感等
* 感覚器	味覚異常、嗅覚異常、難聴、耳鳴、回転性めまい、視力障害、霧視
その他	全身倦怠感、脱力感、動悸、関節痛、鼻出血、月経異常、浮腫、菌交代症

注) 症状があらわ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。

## 4. 高齢者への投与

高齢者での薬物動態試験で、健康成人に比べ高い血中濃度が持続する傾向が認められているので、慎重に投与すること。

## 5. 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、治療上の有益性が危険性を上回ると判断された場合にのみ投与すること。  
〔動物実験(ラット)において臨床用量の約80倍で胎児の外表異常及び骨格異常の発現頻度が対照群に比べ高いとの報告がある。〕
- 授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には、授乳を中止させること。〔動物実験(ラット)で乳汁中へ移行することが認められている。〕

## 6. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

## 7. 適用上の注意

- 服用時**：健康成人において天然ケイ酸アルミニウムと併用した場合、本剤の吸収が低下したとの報告がある。
- 薬剤交付時**：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)

## 【薬物動態】

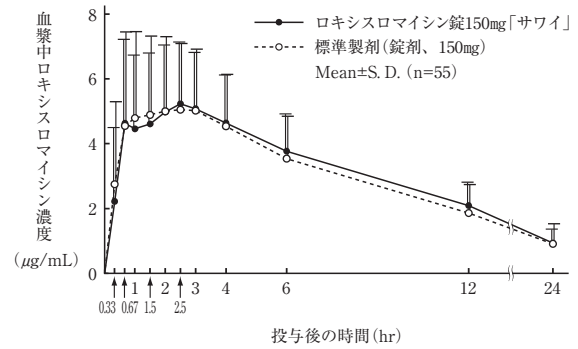
### 1. 生物学的同等性試験

ロキシシロマイシン錠150mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠[ロキシシロマイシンとして150mg(力価)]空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ロキシシロマイシン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C<sub>max</sub>)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>2)</sup>

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C <sub>max</sub> ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-24hr</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )
ロキシシロマイシン錠150mg「サワイ」	6.07 ± 1.97	2.0 ± 1.3	8.9 ± 1.9	61.79 ± 19.85
標準製剤(錠剤、150mg)	5.86 ± 2.08	1.9 ± 1.2	9.0 ± 2.3	58.90 ± 24.72

(Mean ± S.D.)



血漿中濃度ならびにAUC、C<sub>max</sub>等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

## 2. 溶出挙動

本製剤は、日本薬局方に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

## 【薬効薬理】

- ロキシシロマイシンはエリスロマイシンの誘導体であり、ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎マイコプラズマ(マイコプラズマ・ニューモニエ)、モラクセラ(ブランハメラ)・カタラーリス等に抗菌力を示す。
- 作用機序は他のマクロライド系抗生物質と同様に、細菌のリボソームにおけるタンパク合成を阻害し、静菌的に作用する。貪食細胞への移行にすぐれており、貪食細胞の食菌・殺菌作用を促進する。<sup>3)</sup>

## 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ロキシシロマイシン(Roxithromycin)

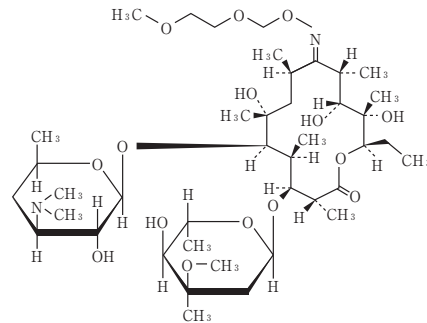
略号：RXM

化学名：(2R,3S,4S,5R,6R,8R,9E,10R,11R,12S,13R)-5-(3,4,6-*Trideoxy-3-dimethylamino-β-D-xylo-hexopyranosyloxy*)-3-(2,6-dideoxy-3-*C-methyl-3-O-methyl-α-L-ribo-hexopyranosyloxy*)-6,11,12-trihydroxy-9-(2-methoxyethoxy)methoxyimino-2,4,6,8,10,12-hexamethylpentadecan-13-olide

分子式：C<sub>41</sub>H<sub>76</sub>N<sub>2</sub>O<sub>15</sub>

分子量：837.05

構造式：



性状：ロキシシロマイシンは白色の結晶性の粉末である。エタノール(95)又はアセトンに溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、水にほとんど溶けない。

## 【取扱い上の注意】

### ・安定性試験

PTP包装したものをを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。<sup>4)</sup>

## 【包装】

PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

**【主要文献及び文献請求先】**

\*・**主要文献**

- 1)厚生労働省健康局結核感染症課編：抗微生物薬適正使用の手引き
- 2)沢井製薬(株)社内資料 [生物学的同等性試験]
- 3)第十七改正日本薬局方解説書，廣川書店，2016，C-5993.
- 4)沢井製薬(株)社内資料 [安定性試験]

・**文献請求先**〔主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい〕

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター  
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30  
TEL：0120-381-999 FAX：06-6394-7355

製造販売元  
**沢井製薬株式会社**  
大阪市淀川区宮原5丁目2-30

K11 A200805

