

貯法：室温保存

有効期間：3年

承認番号 22500AMX01242000

販売開始 2005年7月

酸安定性・持続型マクロライド系抗生剤

処方箋医薬品^{注)}

日本薬局方 ロキシシロマイシン錠

ロキシシロマイシン錠150mg 「日医工」

Roxithromycin Tablets

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者
2.2 エルゴタミン酒石酸塩・無水カフェイン・イソプロピルアンチピリン、ジヒドロエルゴタミンメシル酸塩を投与中の患者 [10.1 参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

| | |
|------|--|
| 販売名 | ロキシシロマイシン錠150mg 「日医工」 |
| 有効成分 | 1錠中 ロキシシロマイシン 150mg（力価） |
| 添加剤 | 低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、トウモロコシデンプン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、タルク、ヒプロメロース、プロピレングリコール、酸化チタン、その他3成分 |

3.2 製剤の性状

| | | |
|---------|-----------------------|--|
| 販売名 | ロキシシロマイシン錠150mg 「日医工」 | |
| 剤形 | フィルムコーティング錠 | |
| 色調 | 白色 | |
| 外形 | 表面 | |
| | 裏面 | |
| | 側面 | |
| 直径 (mm) | 9.1 | |
| 厚さ (mm) | 3.9 | |
| 質量 (mg) | 215 | |
| 本体コード | n723 | |
| 包装コード | @723 | |

4. 効能又は効果

○適応菌種

本剤に感性のブドウ球菌属、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

5. 効能又は効果に関連する注意

〈咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、中耳炎、副鼻腔炎〉

「抗微生物薬適正使用の手引き」¹⁾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。

6. 用法及び用量

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

8. 重要な基本的注意

- 8.1 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。
8.2 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うこと。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 過敏症の既往歴のある患者

9.1.2 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延長を起こすおそれがある。[10.2、11.1.7 参照]

9.3 肝機能障害患者

投与間隔をあけること。血中濃度が持続するおそれがある。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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倍で胎児の外表面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。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。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。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

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。[16.6.1 参照]

10. 相互作用

10.1 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 |
|--|---------------------------------|--|
| エルゴタミン酒石酸塩・無水カフェイン・イソプロピルアンチピリン（クリアミン） ジヒドロエルゴタミンメシル酸塩 [2.2 参照] | 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。 |

10.2 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。 |

| 薬剤名等 | 臨床症状・措置方法 | 機序・危険因子 |
|---|-------------------|--------------------------------------|
| QT延長を起こすことが知られている薬剤 クラスIA抗不整脈薬 キニジン ジソピラミド クラスIII抗不整脈薬 アミオダロン ソタロール 等 [9.1.2、11.1.7 参照] | QT延長を起こすおそれがある。 | これらの薬剤との併用により、本剤によるQT延長が助長されるおそれがある。 |
| ケイ酸アルミニウム | 本剤の効果が減弱するおそれがある。 | 本剤の消化管からの吸収が阻害されると考えられる。 |

11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー（頻度不明）

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。

11.1.2 偽膜性大腸炎、出血性大腸炎（頻度不明）

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。

11.1.3 間質性肺炎（頻度不明）

初期症状として発熱、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。

11.1.4 血小板減少症（頻度不明）

11.1.5 肝機能障害、黄疸（頻度不明）

AST、ALT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。

11.1.6 皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）（頻度不明）

発熱、紅斑、そう痒感、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。

11.1.7 QT延長、心室頻拍（torsade de pointesを含む）（頻度不明）

[9.1.2 参照]

11.2 その他の副作用

| | 0.1～5%未満 | 0.1%未満 | 頻度不明 |
|-------|-----------------|----------------------|--------------------------------|
| 過敏症 | 発疹等 | | 発熱、多形紅斑 |
| 精神神経系 | | 頭痛、浮動性めまい、舌のしびれ感、しびれ | 眠気、錯乱 |
| 血液 | 好酸球増多 | 白血球減少 | |
| 肝臓 | AST、ALT、ALP等の上昇 | | 胆汁うっ滞等の肝機能障害 |
| 消化器 | 胃部不快感、腹痛、下痢、嘔吐等 | 口渇、食欲不振、腹部膨満感 | 胸やけ |
| 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 | | 浮腫、菌交代症 | 全身倦怠感、脱力感、動悸、関節痛、鼻出血、月経異常 |

注）発現割合は使用成績調査結果を含む

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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に刺入し、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ある。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

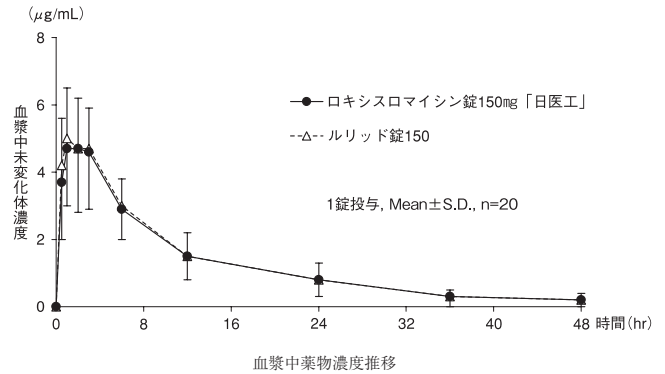
16.1.1 生物学的同等性試験

ロキシシロマイシン錠150mg「日医工」及びブリッド錠150を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ロキシシロマイシンとして150mg（力価））健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.8）～log（1.25）の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された²⁾。

薬物動態パラメータ

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|----------------------|--|-------------------------------------|--------------|--------------------------|
| | AUC ₀₋₄₈ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$) | Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$) | Tmax (hr) | t _{1/2} (hr) |
| ロキシシロマイシン錠150mg「日医工」 | 60.4±22.7 | 5.5±1.8 | 1.48±0.83 | 11.6±3.4 |
| ブリッド錠150 | 62.1±26.3 | 5.6±2.2 | 1.68±1.08 | 12.4±5.6 |

(1錠投与, Mean±S.D., n=20)



血漿中濃度並びにAUC、Cmax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。

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 高齢者

高齢者7例（平均78.6歳）にロキシシロマイシン150mg（力価）を経口投与した際³⁾、健康成人男子に比べ高い血中濃度推移、消失半減期の延長等がみられた³⁾。[9.8 参照]
注）本剤の承認された用量は「通常、成人にはロキシシロマイシンとして1日量300mg（力価）を2回に分割し、経口投与する」である。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

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、静的に作用する⁴⁾。

18.2 抗菌作用

抗菌スペクトルは、他のマクロライド系抗生物質と同様であり、ブドウ球菌属、レンサ球菌属、マイコプラズマ属、プランハメラ・カタラーリスなどに抗菌力を示す。貪食細胞への移行にすぐれており、貪食細胞の貪食・殺菌作用を促進する⁴⁾。

19. 有効成分に関する理化学的見聞

一般的名称：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-(3,4,6-三デオキシ-3-ジメチルアミノ-β-D-xylo-ヘキソピラノシロキシ)-3-(2,6-ジデオキシ-3-C-メチル-3-O-メチル-α-D-ribo-ヘキソピラノシロキシ)-6,11,12-三ヒドロキシ-9-(2-メトキシエトキシ)メトキシイミノ-2,4,6,8,10,12-ヘキサメチルペンタデカン-13-オリド

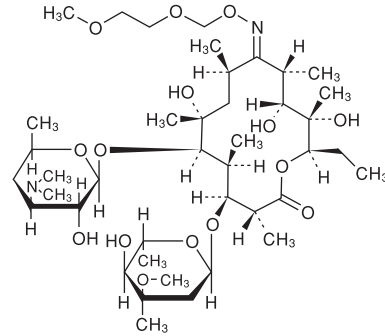
分子式：C₄₁H₇₆N₂O₁₅

分子量：837.05

性状：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。

化学構造式：



22. 包装

100錠 [10錠×10：PTP]

23. 主要文献

- 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
- 社内資料：生物学的同等性試験
- 稲松孝思 他：Chemotherapy. 1988；36（S4）：184-190
- 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店 2021；C6303-6308

24. 文献請求先及び問い合わせ先

日医工株式会社 お客様サポートセンター
〒930-8583 富山市総曲輪1丁目6番21
TEL (0120) 517-215
FAX (076) 442-8948

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元（輸入）

日医工ファーマ株式会社

富山市総曲輪1丁目6番21

