医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018(2019年更新版)に準拠して作成

マクロライド系抗生物質製剤

日本薬局方　エリスロマイシン腸溶錠

エリスロマイシン錠 200mg「サワイ」

ERYTHROMYCIN Tablets [SAWAI]

剤形	腸溶性フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品※ ※注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	１錠中日局エリスロマイシン200mg(力価)含有
一般名	和名：エリスロマイシン 洋名：Erythromycin
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2006年６月16日(販売名変更) 薬価基準収載年月日：2006年12月８日(販売名変更) 販売開始年月日：1981年９月１日
製造販売(輸入)・提携・販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社　医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト：https://med.sawai.co.jp/

本IFは2024年７月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。
最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム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

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書(以下、添付文書)がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第２小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第３小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

２．IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

３．IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。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、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「Ｖ．５．　臨床成績」や「XII.　参考資料」、「XIII.　備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

４．利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

（2020年４月改訂）

目次

Ⅰ．概要に関する項目 1
　１．開発の経緯 1
　２．製品の治療学的特性..... 1
　３．製品の製剤学的特性..... 1
　４．適正使用に関して周知すべき特性..... 1
　５．承認条件及び流通・使用上の制限事項..... 2
　６．ＲＭＰの概要 2

Ⅱ．名称に関する項目 3
　１．販売名 3
　２．一般名 3
　３．構造式又は示性式..... 3
　４．分子式及び分子量..... 3
　５．化学名(命名法)又は本質..... 4
　６．慣用名、別名、略号、記号番号..... 4

Ⅲ．有効成分に関する項目..... 5
　１．物理化学的性質..... 5
　２．有効成分の各種条件下における安定性..... 5
　３．有効成分の確認試験法、定量法..... 5

Ⅳ．製剤に関する項目 6
　１．剤形 6
　２．製剤の組成 6
　３．添付溶解液の組成及び容量..... 7
　４．力価 7
　５．混入する可能性のある夾雑物..... 7
　６．製剤の各種条件下における安定性..... 7
　７．調製法及び溶解後の安定性..... 8
　８．他剤との配合変化(物理化学的変化)..... 8
　９．溶出性 8
　10．容器・包装 8
　11．別途提供される資材類..... 8
　12．その他 9

Ⅴ．治療に関する項目 10
　１．効能又は効果 10
　２．効能又は効果に関連する注意..... 10
　３．用法及び用量 10
　４．用法及び用量に関連する注意..... 10
　５．臨床成績 10

Ⅵ．薬効薬理に関する項目..... 12
　１．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群..... 12
　２．薬理作用 12

Ⅶ．薬物動態に関する項目..... 14
　１．血中濃度の推移..... 14
　２．薬物速度論的パラメータ..... 15
　３．母集団(ポピュレーション)解析..... 16
　４．吸収 16
　５．分布 16
　６．代謝 16
　７．排泄 17
　８．トランスポーターに関する情報..... 17
　９．透析等による除去率..... 17
　10．特定の背景を有する患者..... 18
　11．その他 18

Ⅷ．安全性(使用上の注意等)に関する項目 19
　１．警告内容とその理由 19
　２．禁忌内容とその理由 19
　３．効能又は効果に関連する注意とその理由 19
　４．用法及び用量に関連する注意とその理由 19
　５．重要な基本的注意とその理由 19
　６．特定の背景を有する患者に関する注意 19
　７．相互作用 20
　８．副作用 24
　９．臨床検査結果に及ぼす影響 24
　10．過量投与 24
　11．適用上の注意 25
　12．その他の注意 25

Ⅸ．非臨床試験に関する項目 26
　１．薬理試験 26
　２．毒性試験 26

Ⅹ．管理的事項に関する項目 27
　１．規制区分 27
　２．有効期間 27
　３．包装状態での貯法 27
　４．取扱い上の注意 27
　５．患者向け資材 27
　６．同一成分・同効薬 27
　７．国際誕生年月日 27
　８．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日 27
　９．効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容 28
　10．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 28
　11．再審査期間 28
　12．投薬期間制限に関する情報 28
　13．各種コード 28
　14．保険給付上の注意 28

ⅩⅠ．文献 29
　１．引用文献 29
　２．その他の参考文献 29

ⅩⅡ．参考資料 30
　１．主な外国での発売状況 30
　２．海外における臨床支援情報 30

ⅩⅢ．備考 31
　１．調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報 31
　２．その他の関連資料 31

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

エリスロマイシン錠200mg「サワイ」は、日局エリスロマイシンを含有するマクロライド系抗生物質製剤である。

エリスロマイシンは、フィリピンのPanay島のIloiloの土壌から分離された放線菌*Streptomyces erythreus*の培養液中に産生され、1952年に発表されたマクロライド系抗生物質である。[1)]

本剤は、エリスロマイシン錠「サワイ」(旧販売名)として1980年４月に承認され、1981年９月に上市に至った。

1993年９月に再評価結果が公表され、効能・効果及び用法・用量が一部変更された。(Ⅴ．－３．参照)

2004年９月に再評価結果が公表され、効能・効果が一部変更された。(Ⅴ．－３.参照)

2006年12月に「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成17年９月22日 薬食審査発第0922001号)に基づき、『エリスロマイシン錠200mg「サワイ」』に販売名を変更した。

２．製品の治療学的特性

１)*Streptomyces erythreus*から単離された 14 員環系抗生物質である。[2)]

２)グラム陽性菌、グラム陰性球菌、マイコプラズマ、梅毒トレポネーマ、クラミジアに対して強く作用し、作用は静菌的であるが、高濃度では殺菌的に作用する場合がある。[1)](Ⅵ．－２．参照)

３)作用機序はタンパク質合成阻害であり、細菌の70S系リボソームの50Sサブユニットに結合し作用する。[1)](Ⅵ．－２.参照)

４)重大な副作用として、偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎、心室頻拍(Torsades de pointesを含む)、QT延長、ショック、アナフィラキシー、中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis：TEN)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens‐Johnson症候群)、急性腎障害(急性間質性腎炎)、肝機能障害や黄疸が報告されている(頻度不明)。(Ⅷ．－８.参照)

３．製品の製剤学的特性

１)エリスロマイシンを含有する腸溶性フィルムコーティング錠である。(Ⅳ．－１.参照)

２)識別性を考慮し、錠剤本体に成分名及び含量を印字している。(Ⅳ．－１.参照)

４．適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用ガイドライン等	有無
ＲＭＰ	無(Ⅰ．－６．参照)
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

５．承認条件及び流通・使用上の制限事項

1) 承認条件

該当しない

2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

６．RMPの概要

該当しない

Ⅱ．名称に関する項目

1．販売名

1）和名

エリスロマイシン錠200mg「サワイ」

2）洋名

ERYTHROMYCIN Tablets［SAWAI］

3）名称の由来

通知「平成17年９月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2．一般名

1）和名（命名法）

エリスロマイシン(JAN)

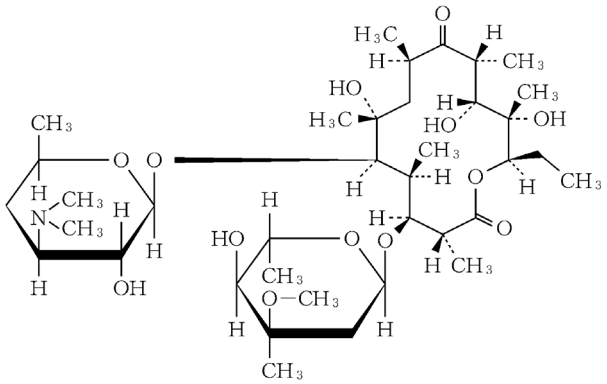
2）洋名（命名法）

Erythromycin（JAN、INN）

3）ステム（stem）

－mycin：*streptomyces*属の産生する抗生物質

3．構造式又は示性式



4．分子式及び分子量

分子式：$C_{37}H_{67}NO_{13}$

分子量：733.93

Ⅱ．名称に関する項目

５．化学名（命名法）又は本質

(2*R*, 3*S*, 4*S*, 5*R*, 6*R*, 8*R*, 10*R*, 11*R*, 12*S*, 13*R*)-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-2, 4, 6, 8, 10, 12-hexamethyl-9-oxopentadecan-13-olide

６．慣用名、別名、略号、記号番号

略号：EM

Ⅲ．有効成分に関する項目

１．物理化学的性質

1)外観・性状

白色～淡黄白色の粉末である。

2)溶解性

メタノール又はエタノール(95)に溶けやすく、水に極めて溶けにくい。
ジエチルエーテルにもやや溶けやすい。[1)]

[1)]

溶媒	本品１gを溶解するための溶媒量
メタノール	約３mL
エタノール(95)	約５mL

3)吸湿性

水分：10.0%以下(0.2g、容量滴定法、直接滴定)

4)融点(分解点)、沸点、凝固点

該当資料なし

5)酸塩基解離定数

pKa_1＝8.8[3)]

6)分配係数

該当資料なし

7)その他の主な示性値

旋光度〔α〕$^{20}_{D}$：－71～－78°（脱水物に換算したもの１g、エタノール(95)、50mL、100mm)[1)]

２．有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

３．有効成分の確認試験法、定量法

＜確認試験法＞

日局「エリスロマイシン」の確認試験に準ずる。

１)赤外吸収スペクトル測定法

２)薄層クロマトグラフィー

＜定量法＞

日局「エリスロマイシン」の定量法に準ずる。(円筒平板法)

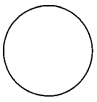
Ⅳ．製剤に関する項目

１．剤形

1）剤形の区別

腸溶性フィルムコーティング錠

2）製剤の外観及び性状

品　名	表 （直径mm）	裏 （重量mg）	側面 （厚さmm）	性　状
エリスロマイシン錠200mg 「サワイ」	 10.2	 約324	 5.1	橙　色

3）識別コード

表示部位：PTPシート

表示内容：SW-325

4）製剤の物性

製剤均一性：日局エリスロマイシン腸溶錠 製剤均一性の項により質量偏差試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局エリスロマイシン腸溶錠 崩壊性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

5）その他

該当しない

２．製剤の組成

1）有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

１錠中に日局エリスロマイシン200mg（力価）を含有する。

添加剤として、カルナウバロウ、カルメロースCa、グリセリン脂肪酸エステル、ケイ酸Al、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、サラシミツロウ、酸化チタン、ステアリン酸ポリオキシル、ステアリン酸Mg、ヒドロキシプロピルスターチ、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロースフタル酸エステル、マクロゴール6000、メタケイ酸アルミン酸Mg、流動パラフィン、黄色５号アルミニウムレーキを含有する。

2）電解質等の濃度

該当資料なし

3）熱量

該当資料なし

3．添付溶解液の組成及び容量

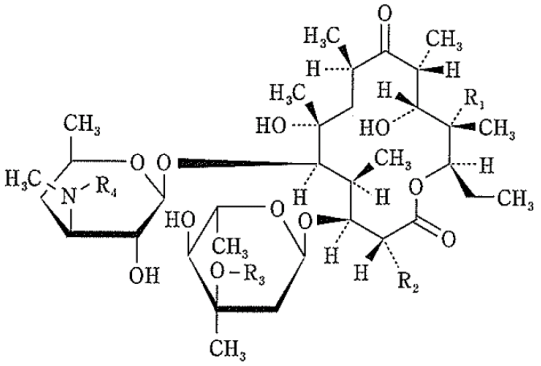
該当しない

4．力価

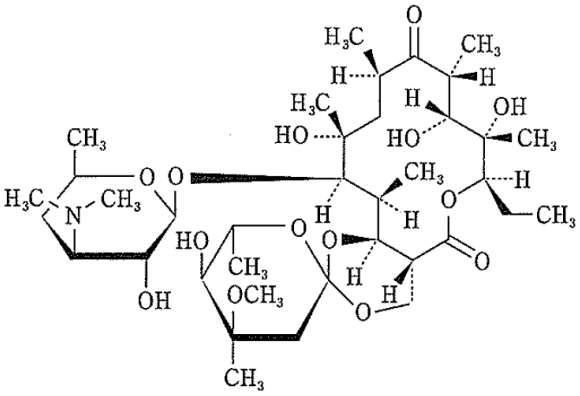
エリスロマイシン（$C_{37}H_{67}NO_{13}$）としての量を質量（力価）で示す。

5．混入する可能性のある夾雑物

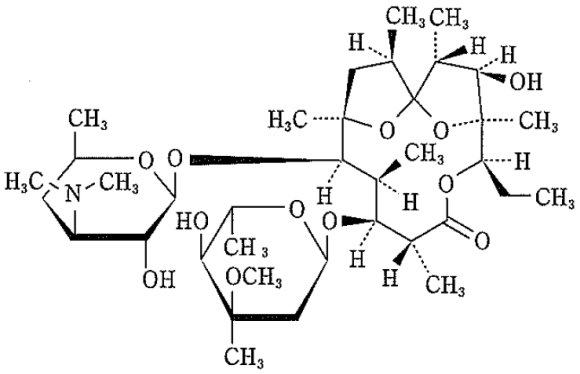
エリスロマイシンには主成分のA以外にB、C、E、F、デメチル体、アンヒドロ体など種々の類縁物質が含まれている。[1)]



	R_1	R_2	R_3	R_4
エリスロマイシンA	OH	CH_3	CH_3	CH_3
エリスロマイシンB	H	CH_3	CH_3	CH_3
エリスロマイシンC	OH	CH_3	H	CH_3
エリスロマイシンF	OH	OH	CH_3	CH_3
デメチルエリスロマイシンA	OH	H	CH_3	H



エリスロマイシンE



アンヒドロエリスロマイシンA

6．製剤の各種条件下における安定性

1）PTP包装品の安定性試験（長期保存試験）[4)]

エリスロマイシン錠200mg「サワイ」をPTP包装（ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔）した後、ピロー包装（アルミ袋）したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	室温・遮光 ３年
性状	橙色の腸溶性フィルムコーティング錠であった	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
力価試験※	102	98.7

※：表示力価に対する含有率（%）

2）無包装下の安定性試験[5)]

エリスロマイシン錠200mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、全ての条件下で力価低下が観察され、光の条件下で性状変化が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 （40℃３ヵ月）	湿度 （25℃75%RH ３ヵ月）	光 （総照射量 120万lx･hr）
性　　状	橙色の腸溶性フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	淡橙色に変色
硬度（ｋｇ）	19.0	18.1	14.4	18.0
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
力価試験※	100.0	96.1	93.8	96.3

日本病院薬剤師会編「錠剤･カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。　※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

7．調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8．他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

9．溶出性

該当資料なし

10．容器・包装

1）注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

2）包装

22．包装

PTP：100錠（10錠×10）

3）予備容量

該当しない

4）容器の材質

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

[ピロー]アルミラミネートフィルム

11．別途提供される資材類

該当しない

12．その他

該当資料なし

Ⅴ．治療に関する項目

1．効能又は効果

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、淋菌、髄膜炎菌、ジフテリア菌、赤痢菌、軟性下疳菌、百日咳菌、破傷風菌、ガス壊疽菌群、梅毒トレポネーマ、トラコーマクラミジア(クラミジア・トラコマティス)、マイコプラズマ属、赤痢アメーバ
〈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、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎(扁桃周囲炎を含む)、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、膿胸、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、尿道炎、淋菌感染症、軟性下疳、梅毒、性病性(鼠径)リンパ肉芽腫、感染性腸炎、子宮内感染、子宮付属器炎、涙嚢炎、麦粒腫、外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯冠周囲炎、猩紅熱、ジフテリア、百日咳、破傷風、ガス壊疽、アメーバ赤痢

2．効能又は効果に関連する注意

5. 効能又は効果に関連する注意
〈咽頭・喉頭炎、扁桃炎(扁桃周囲炎を含む)、急性気管支炎、感染性腸炎、中耳炎、副鼻腔炎〉
「抗微生物薬適正使用の手引き」[6)]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。

3．用法及び用量

1)用法及び用量の解説

6. 用法及び用量
通常、成人にはエリスロマイシンとして１日 800～1200mg(力価)を４～６回に分割経口投与する。
小児には１日体重１kg あたり 25～50mg(力価)を４～６回に分割経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、小児用量は成人量を上限とする。

2)用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4．用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5．臨床成績

1)臨床データパッケージ

該当しない

2)臨床薬理試験

該当資料なし

3)用量反応探索試験

該当資料なし

4)検証的試験

(1)有効性検証試験

該当資料なし

(2)安全性試験

該当資料なし

5)患者・病態別試験

該当資料なし

6)治療的使用

(1)使用成績調査(一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

(2)承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

7)その他

該当資料なし

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

マクロライド系抗生物質：

ジョサマイシン、クラリスロマイシン、ロキシスロマイシン、アジスロマイシン水和物等[7)]

2. 薬理作用

エリスロマイシンの薬理作用について以下のとおり報告されている。

1) 作用部位・作用機序

グラム陽性菌、グラム陰性球菌、マイコプラズマ、梅毒トレポネーマ、クラミジアに対して強く作用し、作用は静菌的であるが、高濃度では殺菌的に作用する場合がある。作用機作はタンパク質合成阻害であり、細菌の70S系リボソームの50Sサブユニットに結合し作用する。[1)]

2) 薬効を裏付ける試験成績

標準菌に対するMICと臨床分離菌に対するMIC_{80}、MIC_{60}（μg/mL）[6)]

感受性の高い菌	標準菌の MIC	臨床分離菌の MIC_{80}	臨床分離菌の MIC_{60}
Bacillus anthracis※	0.05		
Bordetella pertussis		0.05	0.025
Moraxella [B] catarrhalis※		0.5	0.5
Legionella pneumophila※	0.125～0.5	0.25	0.125
Micrococcus luteus※	0.10		
Streptococcus pneumoniae	0.012～0.05	0.013	0.013
Chlamydia psittaci※	0.25～0.5		
Chlamydia trachomatis	0.125～0.5		
Mycoplasma pneumoniae		0.01	0.005
中程度の感受性を示す菌			
Bacteroides fragilis※		6.25	0.78
Campylobacter※		1.56	0.78
Haemophilus influenzae※		3.13	1.56
Neisseria gonorrhoeae		3.13	1.56
Peptostreptococcus※		3.13	1.56
Staphylococcus aureus	0.05～0.10	12.5	0.2
Staphylococcus epidermidis	0.05	＞100	0.2
感受性の低い菌			
Citrobacter freundii※	25		
Escherichia coli※	6.25～50		
Klebsiella pneumoniae※	6.25～25		
Salmonella enteritidis※	50		
Salmonella paratyphi※	12.5		
Salmonella typhi※	50		
Streptococcus pyogenes	≦0.006～0.013	＞100	＞100

※：承認適応外菌種

感受性の無い菌	標準菌の MIC	臨床分離菌の MIC_{80}	臨床分離菌の MIC_{60}
Enterobacter aerogenes※	100		
Enterobacter cloacae※	＞100		
Enterococcus faecalis※	0.025	＞100	＞100
Enterococcus faecium※	0.05	＞100	＞100
Klebsiella oxytoca※	100		
Morganella moiganii※	100		
Proteus mirabilis※	＞100		
Proteus vulgaris※	＞100		
Providencia rettgeri※	100		
Pseudomonas aeruginosa※	＞100		
Serratia marcescens※	100		

※：承認適応外菌種

3)作用発現時間・持続時間

該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

エリスロマイシン製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

1. 血中濃度の推移

1)治療上有効な血中濃度

該当資料なし

2)臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

健康成人に、エリスロマイシン錠 300mg(力価)を経口投与したとき、血中濃度は２時間後に最高血中濃度 1.1μg/mL を示し、６時間後には 0.2μg/mL を示した[8)]。

＜生物学的同等性試験＞[9)]

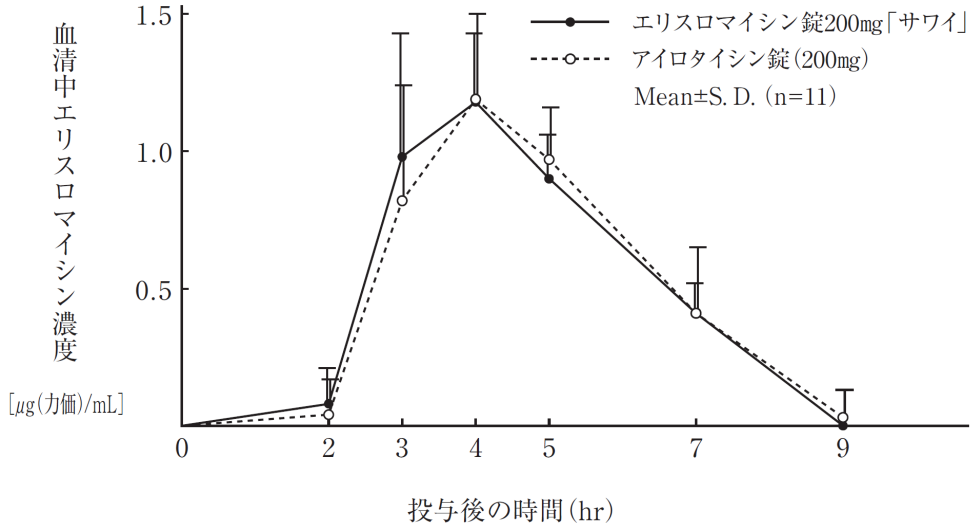
通知等	「医薬品の製造又は輸入の承認申請に際し添付すべき資料の取扱等について」：昭和55年５月30日 薬審第718号
採血時点	０、２、３、４、５、７、９hr
休薬期間	２週間
測定方法	円筒平板法
試験製剤	エリスロマイシン錠200mg「サワイ」
標準製剤	アイロタイシン錠(200mg)

エリスロマイシン錠200mg「サワイ」とアイロタイシン錠(200mg)を健康成人男子にそれぞれ２錠[エリスロマイシンとして400mg(力価)]空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血清中エリス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、Cmax)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。

各製剤２錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax [μg(力価)/mL]	Tmax (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	AUC_{0-9hr} [μg(力価)・hr/mL]
エリスロマイシン錠200mg「サワイ」	1.29±0.31	3.8±0.6	2.0±0.7	4.44±0.80
アイロタイシン錠(200mg)	1.27±0.28	3.7±0.6	2.8±1.6	4.36±1.10

(Mean±S.D.)



血清中濃度ならびに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。

3) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

Ⅷ．－７．参照

2．薬物速度論的パラメータ

1) 解析方法

該当資料なし

2) 吸収速度定数

該当資料なし

3) 消失速度定数

エリスロマイシン錠200mg「サワイ」を健康成人男子に２錠[エリスロマイシンとして400mg(力価)]空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数[9)]

0.377±0.108hr^{-1}

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)その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

1)解析方法

該当資料なし

2)パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

エリスロマイシン塩基は、上部小腸から不完全ではあるが、適当量が吸収される。[10)]

5. 分布

1)血液－脳関門通過性

エリスロマイシンの抗菌活性は、脳と脳脊髄液を除いて、基本的には全身で発揮される。[10)]

2)血液－胎盤関門通過性

胎盤を通過し、胎児血漿中の濃度は母体濃度の約５～20%に達した。[10)]

3)乳汁への移行性

ヒト母乳中へ移行することが報告されている。

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

> 16.3 分布
> 透析法にて測定された血清蛋白結合率は11%であった[11)](*in vitro*)。
> 経口投与後喀痰[12)]、肺気管支分泌液[10)]に移行が認められた(外国人データ[13)])。

＜参考＞動物を用いた生体内分布の検討で、組織親和性が高く肝、脾、腎、肺、心では血中濃度の５～８倍の組織内濃度が認められている。[1)]

6)血漿蛋白結合率

84%[1)]

6. 代謝

1)代謝部位及び代謝経路

主に肝で脱メチル化されて、des-*N*-methyl-erythromycinとして胆汁から排泄される。[1)]

2)代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

16.4 代謝
エリスロマイシンの肝代謝には、CYP3Aが関与するとされている[14),15)]。
イヌにおいて、エリスロマイシンは、肝臓で代謝を受け、脱メチル化されてデス-*N*-メチル-エリスロマイシンとなることが確認されている[16)]。

3)初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄
主に胆汁中へ排泄されるが、一部尿中にも排泄される。
胆のう炎患者(1例)に 200mg(力価)単回投与時の胆汁中濃度、尿中濃度の最高値は各々10.76μg/mL(投与8時間後)、32.68μg/mL(投与5時間後)であった[17)]。

8. トランスポーターに関する情報

本剤はP-糖蛋白阻害作用を有する。

9. 透析等による除去率

エリスロマイシンは腹膜透析、血液透析では除去されない。

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 肝機能障害患者

エリスロマイシン500mg(力価)[注1)]を肝障害患者及び健康成人に空腹時単回経口投与したとき、健康成人に比べて、肝障害患者はTmaxが短く、Cmaxも高値を示した[18)](外国人データ)。[9.3 参照]

注１） 本剤の承認された用法及び用量は「１日 800～1200mg(力価)を４～６回に分割経口投与する。」である。

エリスロマイシン500mg投与時の薬物動態パラメータ

対象	n	年齢(歳)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	AUC_{0-24hr} (μg･hr/mL)	$T_{1/2\alpha}$ (hr)	$T_{1/2\beta}$ (hr)
肝障害患者[注2)]	8	57.2	2.04	4.1	11.6[6]	1.6[4]	4.5[6]
健康成人	6	30.0	1.50	6.3	9.0	1.3[5]	6.6

注２） 肝機能検査値(mean)：GOT 67.3(U/L)、GPT 36.9(U/L)、直接ビリルビン 3.45 (mg/dL)、総ビリルビン 5.73(mg/dL)

(測定法：bioassay)(mean)

[]内は症例数

11. その他

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)
2.1 本剤の成分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、ピモジド、ロミタピドメシル酸塩、クリンダマイシン(注射剤、経口剤)、リンコマイシン塩酸塩水和物を投与中の患者[10.1 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

Ⅴ. -2. 参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

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 急性腎障害(急性間質性腎炎)があらわれることがあるので、定期的に検査を行うこと。[11.1.5 参照]

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

1)合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者
9.1.1 心疾患のある患者
QT延長、心室頻拍(Torsade de pointesを含む)を起こすことがある。[11.1.2 参照]

2)腎機能障害患者

設定されていない

3)肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者
血中濃度が上昇するおそれがある。[16.6.1 参照]

4) 生殖能を有する者

設定されていない

5) 妊婦

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る場合にのみ投与すること。

6) 授乳婦

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。ヒト母乳中へ移行することが報告されている。

7) 小児等

9.7 小児等

嘔吐等の症状に注意すること。新生児、乳児で、肥厚性幽門狭窄があらわれたとの報告がある。

8) 高齢者

9.8 高齢者

用量に留意するなど慎重に投与すること。一般に生理機能が低下している。

7. 相互作用

10. 相互作用

本剤はCYP3Aで代謝される。また、本剤はCYP3A、P-糖蛋白質を阻害する。

1) 併用禁忌とその理由

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]	四肢の虚血、血管攣縮等が報告されている。	本剤はCYP3Aと結合し、複合体を形成するため、これらの薬剤の代謝を抑制し、血中濃度が上昇することがある。
ピモジド [2.2 参照]	QT延長、心室性不整脈(Torsade de pointesを含む)等が発現するおそれがある。	
ロミタピドメシル酸塩 (ジャクスタピッド) [2.2 参照]	ロミタピドメシル酸塩の血中濃度が著しく上昇するおそれがある。	

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
クリンダマイシン(注射剤、経口剤) (ダラシンS注射液、ダラシンカプセル) リンコマイシン塩酸塩水和物 (リンコシン) [2.2参照]	併用してもこれらの薬剤の効果があらわれないと考えられる。	本剤の細菌のリボゾーム50S Subunitへの親和性がこれらの薬剤より高いと考えられる。

2)併用注意とその理由

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
ジソピラミド キニジン硫酸塩水和物	QT延長、心室性不整脈(Torsade de pointesを含む)等が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	本剤はCYP3Aと結合し、複合体を形成するため、これらの薬剤の代謝を抑制し、血中濃度が上昇することがある。
テオフィリン アミノフィリン水和物	悪心・嘔吐、不整脈、痙攣等が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	
シクロスポリン タクロリムス水和物	腎障害等が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	
ワルファリンカリウム	出血傾向、プロトロンビン時間延長等が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	
イリノテカン塩酸塩水和物	骨髄機能抑制、下痢等の副作用を増強するおそれがあるため、減量するなど慎重に投与すること。	
ビンカアルカロイド ビンブラスチン硫酸塩 ビノレルビン酒石酸塩等	好中球減少、筋肉痛等が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	
バルプロ酸ナトリウム	傾眠、運動失調等が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	
フェロジピン	降圧作用の増強が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	
ベラパミル塩酸塩	血圧低下、徐脈性不整脈、乳酸アシドーシス等が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	

<table>
<tr><th>薬剤名等</th><th>臨床症状・措置方法</th><th>機序・危険因子</th></tr>
<tr><td>ミダゾラム
トリアゾラム</td><td>鎮静作用の増強が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。</td><td rowspan="4">本剤はCYP3Aと結合し、複合体を形成するため、これらの薬剤の代謝を抑制し、血中濃度が上昇することがある。</td></tr>
<tr><td>カルバマゼピン</td><td>めまい、運動失調等が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。</td></tr>
<tr><td>コルヒチン</td><td>下痢、腹痛、発熱、筋肉痛、汎血球減少、呼吸困難等が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。</td></tr>
<tr><td>シンバスタチン
アトルバスタチンカルシウム水和物</td><td rowspan="2">シンバスタチン、アトルバスタチンカルシウム水和物との併用により、筋肉痛、脱力感、CK上昇、血中および尿中ミオグロビン上昇を特徴とし、急激な腎機能悪化を伴う横紋筋融解症があらわれたとの報告がある。</td></tr>
<tr><td>ピタバスタチンカルシウム水和物</td><td>本剤がピタバスタチンの肝臓への取り込みを阻害するためと考えられる。</td></tr>
<tr><td>ブロモクリプチンメシル酸塩
ドセタキセル水和物
パクリタキセル
セレギリン塩酸塩
シルデナフィルクエン酸塩
バルデナフィル塩酸塩水和物
タダラフィル
シロスタゾール</td><td>減量するなど慎重に投与すること。</td><td rowspan="3">本剤はCYP3Aと結合し、複合体を形成するため、これらの薬剤の代謝を抑制し、血中濃度が上昇することがある。</td></tr>
<tr><td>ブロナンセリン
クロザピン
ゾピクロン
アルプラゾラム
エプレレノン
エレトリプタン臭化水素酸塩
エベロリムス
サキナビルメシル酸塩</td><td>これらの薬剤の作用が増強するおそれがある。</td></tr>
<tr><td>ドンペリドン</td><td>ドンペリドンの血中濃度が上昇する。また、ドンペリドンとの併用により、QT延長が報告されている。</td></tr>
</table>

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
副腎皮質ホルモン剤 メチルプレドニゾロン等	これらの薬剤の消失半減期が延長するとの報告があるので、減量するなど慎重に投与すること。	本剤はこれらの薬剤の代謝を抑制することがある。
エバスチン	エバスチンの代謝物カレバスチンの血中濃度が上昇するとの報告がある。	
エドキサバントシル酸塩水和物	出血のリスクを増大させるおそれがある。併用する場合、エドキサバントシル酸塩水和物の用量は、エドキサバントシル酸塩水和物の電子添文を参照すること。	本剤がP-糖蛋白質を阻害し、エドキサバンの血中濃度を上昇させるためと考えられる。
ジゴキシン	ジゴキシンの作用増強による嘔気、嘔吐、不整脈等の中毒症状が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	本剤の腸内細菌叢への影響により、ジゴキシンの代謝が抑制される。
ザフィルルカスト	ザフィルルカストの血中濃度が低下するとの報告がある。	機序は不明である。
シメチジン	難聴が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	これらの薬剤のCYP3A阻害作用により、本剤の代謝が抑制され、血中濃度が上昇すると考えられる。
リトナビル	本剤のAUCが上昇することが予想される。	
クリンダマイシン(外用剤)	併用してもクリンダマイシンの効果があらわれないと考えられる。	本剤の細菌のリボゾーム50S Subunitへの親和性がクリンダマイシンより高いと考えられる。
リバーロキサバン	リバーロキサバンの血中濃度が上昇したとの報告がある。	本剤がCYP3A4及びP-糖蛋白質を阻害することによりリバーロキサバンのクリアランスが減少する。
フェキソフェナジン塩酸塩	フェキソフェナジンの血漿中濃度を上昇させるとの報告がある。	P-糖蛋白質の阻害によるフェキソフェナジンのクリアランスの低下及び吸収率の増加に起因するものと推定される。
CYP3A4誘導作用を有する薬剤 リファンピシン、リファブチン、フェニトイン、フェノバルビタール等 セイヨウオトギリソウ(St. John`s Wort, セント・ジョーンズ・ワート)含有食品	本剤の作用が減弱するおそれがある。	これらの薬剤のCYP3A誘導作用により、本剤の代謝を促進し、本剤の血中濃度を低下させる。

8. 副作用

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。

1)重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎(頻度不明)

腹痛、頻回の下痢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。

11.1.2 心室頻拍(Torsade de pointesを含む)、QT延長(いずれも頻度不明)

[9.1.1 参照]

11.1.3 ショック、アナフィラキシー(いずれも頻度不明)

呼吸困難、胸内苦悶、血圧低下等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.1.4 中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis : TEN)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)(いずれも頻度不明)

11.1.5 急性腎障害(急性間質性腎炎)(頻度不明)

[8.2 参照]

11.1.6 肝機能障害、黄疸(いずれも頻度不明)

AST、ALT、Al-Pの上昇等を伴う肝機能障害や黄疸があらわれることがある。

2)その他の副作用

11.2 その他の副作用

	頻度不明
過敏症	発疹、血管性浮腫
消化器	食欲不振、悪心・嘔吐、胃痛、下痢、鼓腸、胃部不快感、便秘、腹部痙攣
眼	視力低下、霧視

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

胃腸症状、過敏症等がみられる。また、可逆性の難聴、一過性かつ軽症の急性膵炎があらわれたとの報告がある。

13.2 処置

エリスロマイシンは腹膜透析、血液透析では除去されない。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 本剤は腸溶錠なので、噛まずに服用させること。

14.1.2 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ある。

12. その他の注意

1)臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

外国で重症筋無力症が悪化したとの報告がある。

2)非臨床試験に基づく情報

設定されていない

Ⅸ．非臨床試験に関する項目

エリスロマイシンの非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

1．薬理試験

1)薬効薬理試験

「Ⅵ．薬効薬理に関する項目」参照

2)安全性薬理試験

該当資料なし

3)その他の薬理試験

該当資料なし

2．毒性試験

1)単回投与毒性試験

LD_{50}(mg/kg)[19]

動物種	経口	皮下
マウス	2,927	1,849

2)反復投与毒性試験

該当資料なし

3)遺伝毒性試験

該当資料なし

4)がん原性試験

該当資料なし

5)生殖発生毒性試験

該当資料なし

6)局所刺激性試験

該当資料なし

7)その他の特殊毒性

該当資料なし

Ⅹ．管理的事項に関する項目

1．規制区分

	規制区分
製剤	処方箋医薬品※
有効成分	該当しない

※注意―医師等の処方箋により使用すること

2．有効期間

有効期間：３年

3．包装状態での貯法

室温保存

4．取扱い上の注意

Ⅷ．-11．参照

5．患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり

6．同一成分・同効薬

同一成分：なし

同効薬：マクロライド系抗生物質：ジョサマイシン、クラリスロマイシン、ロキシスロマイシン、アジスロマイシン水和物等[6)]

7．国際誕生年月日

該当しない

8．製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

●エリスロマイシン錠200mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2006年６月16日（販売名変更）、承認番号：21800AMX10439000

エリスロマイシン錠「サワイ」（旧販売名）

製造販売承認年月日：1980年４月４日、承認番号：（55EM）1105

９．効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

１）再評価結果公表年月日：1993年９月８日

再評価結果の内容：適応症のうち「髄膜炎、細菌性心内膜炎、敗血症」が削除された。また、用法・用量については、小児用量の上限が定められた。その他、効能・効果、用法・用量がより適切な表現に改められた。

２）再評価結果公表年月日：2004年９月30日

再評価結果の内容：適応菌種の追加整理が行われ、適応症が読み替えられた。また、適応症のうち「骨膜炎、胆のう胆管炎、トラコーマ」が削除された。

11．再審査期間

該当しない

12．投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13．各種コード

HOT番号	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード
111194101	6141002F2078	620004463

14．保険給付上の注意

特になし

XI．文献

１．引用文献

１）日本薬局方解説書編集委員会編, 第十八改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2021, C-1078－C-1085.
２）南山堂 医学大辞典，第19版，南山堂，2006，p.266.
３）The Merck Index 14th edition，2006，p.630-631.
４）沢井製薬(株) 社内資料[長期保存試験] エリスロマイシン錠200mg「サワイ」
５）沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] エリスロマイシン錠200mg「サワイ」
６）厚生労働省健康・生活衛生局感染症対策部感染症対策課編：抗微生物薬適正使用の手引き
７）薬剤分類情報閲覧システム＜https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/＞
(2022/11/17 アクセス)
８）日本薬局方　医薬品情報，じほう，2001，220-224
９）沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] エリスロマイシン錠 200mg「サワイ」
10)高折修二他監訳，グッドマン･ギルマン薬理書，第12版，廣川書店，2013，p.1974-1983.
11)黒田善雄，Chemotherapy，1958，６(６)，343-360
12)深谷一太他，Chemotherapy, 1970，18(３)，252-258
13)Bergogne-Bérézin，E. et al., Int. J. Clin. Pharmacol. Res., 1985，５(５)，341-344
14)Watkins，P. B. et al. , Proc. Natl. Acad. Sci.，1985，82(18) ，6310-6314
15)Brian, W. R. et al. , Biochemistry，1990，29，11280-11292
16)Wells, J. S. et al. ，Antibiot. Annu.，1955，1954/1955，291-294
17)小野一男，モダンテラピー，1953，６，８-13
18)Kroboth，P. D. et al. ，Antimicrob. Agents Chemother, 1982，21(１)，135-140
19)薬事研究会編，規制医薬品事典，第５版，じほう，1992，p.76-77.

２．その他の参考文献

XII．参考資料

１．主な外国での発売状況 ･･

２．海外における臨床支援情報･･

該当資料なし

XIII．備考

1．調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

1）粉砕

VIII．-11．参照

2）崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

【製剤上の注意】
本剤は有効成分が酸性下で失活するため、腸溶性フィルムコーティング錠となっている。崩壊懸濁、あるいは粉砕による経管投与法を用いる場合は、本剤の放出制御の特性が失われる。

上記の理由から、弊社では本剤において簡易懸濁法に関する試験データを取得しておりません。

2．その他の関連資料