

マクロライド系抗生物質製剤

処方箋医薬品*

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

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示
注意：腸溶錠なので、かまわずに使用すること

日本標準商品分類番号

876141

承認番号	21800AMX10439000
薬価収載	2006年12月
販売開始	1981年9月
再評価結果	2004年9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) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2) エルゴタミン含有製剤、ピモジド、アスナブレビルを投与中の患者(「相互作用」の項参照)

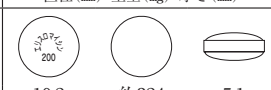
【組成・性状】

組成

エリスロマイシン錠200mg「サワイ」は、1錠中に日局エリスロマイシン200mg(力価)を含有する。

添加物として、カルナウパロウ、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、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。

製剤の性状

剤形	外形 直径(mm)・重量(mg)・厚さ(mm)	性状	識別コード
腸溶性フィルムコーティング錠	 10.2 約324 5.1	橙色	SW-325 (PTPに表示)

【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、淋菌、髄膜炎菌、ジフテリア菌、赤痢菌、軟性下痢菌、百日咳菌、破傷風菌、ガス壊疽菌群、梅毒トレポネマ、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、軟性下痢、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

【効能・効果に関連する使用上の注意】

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、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」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。

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。

【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) 肝機能障害のある患者(血中濃度が上昇するおそれがある。)
- 2) 心疾患のある患者(QT延長、心室頻拍(Torsades de pointesを含む))を起こすことがある。(「副作用」の項参照)

2. 相互作用

本剤は薬物代謝酵素CYP3Aで代謝される。また、CYP3Aと結合し、複合体を形成する。これにより、CYP3Aを阻害することから、CYP3Aで代謝される薬剤と併用したとき、併用薬剤の代謝を阻害し血中濃度を上昇させる可能性がある。また、本剤はP-糖蛋白阻害作用を有することから、P-糖蛋白質を介して排出される薬剤と併用したとき、併用薬剤の排出が阻害され血中濃度が上昇する可能性がある。

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)含有製剤(クリアミン、ジテルゴット等)	これらの薬剤の血中濃度が上昇し、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することがある。
ピモジド(オーラップ)	類薬クラリスロマイシンの併用により、ピモジドの血中濃度が上昇し、QT延長、心室性不整脈(Torsades de pointesを含む)等が報告されている。	
* アスナブレビル(スンベブラ)	アスナブレビルの血中濃度が上昇し、肝臓に関連した副作用が発現、重症化するおそれがある。	

【用法・用量】

通常、成人にはエリスロマイシンとして1日800~1,200mg(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

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	血中濃度上昇に伴うQT延長、心室性不整脈(Torsades 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することがある。
テオフィリン アミノフィリン水和物	テオフィリンの血中濃度上昇に伴う悪心・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	血中濃度上昇に伴う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	血中濃度上昇に伴う出血傾向、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	活性代謝物の血中濃度上昇に伴う骨髓機能抑制、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。	
ビンブラスチン硫酸塩	血中濃度上昇に伴う好中球減少、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	血中濃度上昇に伴う傾眠、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	血中濃度上昇に伴う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。	
ミダゾラム トリアゾラム	血中濃度上昇に伴う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。	
カルバマゼピン	血中濃度上昇に伴うめまい、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。	

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子	
コルヒチン	血中濃度上昇に伴う下痢、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。	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することがある。	
シンバスタチン アトルバスタチン カルシウム水和物	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがある。また、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(CPK)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。		
ビタバスタチンカルシウム	本剤がビ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。		
プロモクリプチン 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	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがあるので、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することがある。	
プロナンセリン	プロナンセリンの血中濃度が上昇し、作用が増強するおそれがある。		
エプレレノン	エプレレノンの血中濃度が上昇し、作用が増強するおそれがある。		
エレトリプタン臭 化水素酸塩	エレトリプタンの血中濃度が上昇し、作用が増強するおそれがある。		
エベロリムス	エベロリムスの血中濃度が上昇し、作用が増強するおそれがある。		
サキナビルメシル酸塩	サキナビルの血中濃度が上昇し、作用が増強するおそれがある。		
副腎皮質ホルモン剤 メチルプレドニゾン 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。		
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	エドキサバンの血中濃度を上昇させ、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添付文書を参照すること。		本剤はこれらの薬剤の代謝を抑制することがある。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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	本剤の血中濃度上昇に伴う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。	

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)偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎があらわれることがある。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。
- (2)心室頻拍(Torsades de pointesを含む)、QT延長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、適切な処置を行うこと。〔慎重投与〕の項参照)
- (3)ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、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。
- (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)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。
- (5)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し、適切な処置を行うこと。
- (6)AST(GOT)、ALT(GPT)、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。

2) その他の副作用

次のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症	発疹
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

4. 高齢者への投与

用量に留意するなど慎重に投与すること。〔一般に高齢者では生理機能が低下している。〕

5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 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る場合にのみ投与すること。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- 2) 本剤投与中は授乳を避けさせること。〔ヒト母乳中へ移行することが報告されている。〕

6. 小児等への投与

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ので、嘔吐等の症状に注意すること。

7. 過量投与

- 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睪炎があらわれたとの報告がある。
- 2) 処置：胃洗浄等により、未吸収の薬物を速やかに体外に排出させる。なお、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。

8. 適用上の注意

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)

9. その他の注意

- 1) 大量投与により、可逆性の難聴があらわれたとの報告がある。
- 2) 外国で重症筋無力症が悪化したとの報告がある。

【薬物動態】

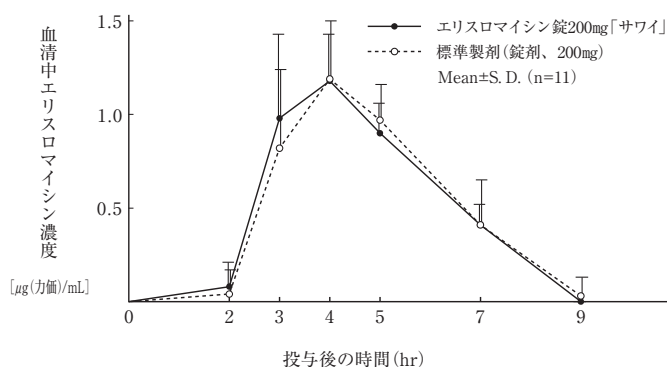
生物学的同等性試験

エリスロマイシン錠200mg〔サワイ〕と標準製剤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、C_{max})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。²⁾

各製剤2錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} [μg(力価)/mL]	T _{max} (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
標準製剤(錠剤、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、C_{max}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。

【薬効薬理】

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。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：エリスロマイシン(Erythromycin)

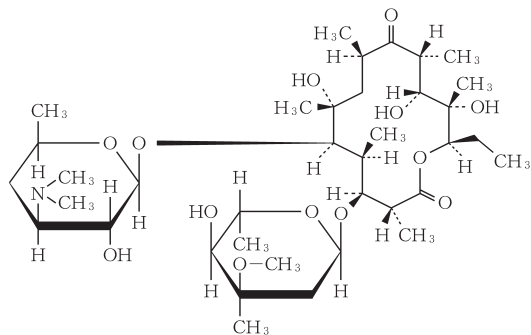
略号：EM

分子式：C₃₇H₆₇NO₁₃

化学名：(2R,3S,4S,5R,6R,8R,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-2,4,6,8,10,12-hexamethyl-9-oxopentadecan-13-olide

分子量：733.93

構造式：



性状：エリスロマイシンは白色～淡黄白色の粉末で、味は苦い。
N,N-ジメチルホルムアミドに極めて溶けやすく、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。

【取扱い上の注意】

- ・安定性試験
包装品を用いた長期保存試験(室温、3年間)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確認された。⁴⁾

【包 装】

PTP：100錠(10錠×10)

【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-1024.
- 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

K15 A180491