

*2019年3月改訂(第11版)

*2018年10月改訂

経口用セフェム系抗生物質製剤
日本薬局方 シロップ用セフロキサジン

処方箋医薬品^{注)}

オラスポア[®] 小児用ドライシロップ 10%

ORASPOR[®] Dry Syrup 10% for pediatric

承認番号	21900AMX01213000
薬価収載	2007年12月
販売開始	1984年3月
効能追加	1985年9月
再審査結果	1989年1月
再評価結果	2004年9月

貯法：防湿、室温保存
有効期間：2年(使用期限は外箱等に表示)
(使用期限内であっても、開封後はなるべく速やかに使用すること)
注意：取扱い上の注意の項参照

注)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)】**
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

* **【原則禁忌(次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)】**
セフェム系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

オラスポア小児用ドライシロップ10%	
成分・含量	1g中「日本薬局方」セフロキサジン水和物100mg(力価)
添加物	白糖、カルメロースナトリウム、結晶セルロース、フマル酸一ナトリウム、黄色5号、香料、プロピレングリコール、アラビアゴム、ゼラチン、デキストリン
性状	だいたい色の微細な粒子を含む粉末で、芳香を有し、味は甘い

【効能・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、大腸菌、クレブシエラ属、プロテウス・ミラビリス、インフルエンザ菌

〈適応症〉

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、麦粒腫、中耳炎、猩紅熱

* 〈効能・効果に関連する使用上の注意¹⁾〉

咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」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、幼小児には体重kg当りセフロキサジン水和物として1日30mg(力価)を3回に分割し、用時懸濁して経口投与する。

なお、症状に応じて適宜増減する。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

1. 高度の腎機能障害のある患者には、投与量・投与間隔の適切な調節をするなど慎重に投与すること(「1. 慎重投与」及び【薬物動態】の項参照)。
2. 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) ペニシリン系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者[類似の化学構造を有しており、交差過敏反応を起こすおそれがある。]
- (2) 本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー症状を起こしやすい体質を有する患者

(3) 高度の腎障害のある患者[血中濃度の上昇が認められるので、腎障害の程度に応じて用量並びに投与間隔を適宜調節すること(【薬物動態】の項参照)。]

(4) 高齢者(「4. 高齢者への投与」の項参照)

(5) 経口摂取の不良な患者又は非経口栄養の患者、全身状態の悪い患者[ビタミンK欠乏症状があらわれることがある。]

2. 重要な基本的注意

ショックがあらわれるおそれがあるので、十分な問診を行うこと。

3. 副作用

総症例13,048例中168例(1.3%)に202件の副作用が認められ、主な副作用は、下痢90件(0.7%)、発疹23件(0.2%)、好酸球増多15件(0.1%)、AST(GOT)上昇15件(0.1%)、ALT(GPT)上昇13件(0.1%)であった。(再審査終了時)

(1) 重大な副作用

以下のような副作用があらわれることがある。このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- 1) ショック(頻度不明)：初期症状として不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴、発汗等。
- 2) 血便を伴う重篤な大腸炎(偽膜性大腸炎等)(頻度不明)：症状として腹痛、頻回の下痢等。
- 3) 間質性肺炎、PIE症候群(頻度不明)：症状・検査所見として発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常、好酸球増多等。処置として副腎皮質ホルモン剤の投与等。

*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)(頻度不明)

(2) 重大な副作用(類薬)

他のセフェム系抗生物質で、以下のような副作用が報告されている。このような副作用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。

*1) 急性腎障害等の重篤な腎障害

2) 溶血性貧血

(3) その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹	蕁麻疹、発熱	紅斑、そう痒、リンパ腺腫脹、関節痛
血液	好酸球増多	顆粒球減少	貧血
肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)上昇	Al-P上昇	—
消化器	下痢	悪心、嘔吐、腹痛、食欲不振	便秘、胃部不快感
菌交代症	—	—	口内炎、カンジダ症
ビタミン欠乏症	—	—	ビタミンK欠乏症状(低プロトロンビン血症、出血傾向等)、ビタミンB群欠乏症状(舌炎、口内炎、食欲不振、神経炎等)
その他	—	顔面浮腫感、頭痛	舌炎、めまい

注)このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

4. 高齢者への投与

高齢者には、次の点に注意し、用量並びに投与間隔に留意するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

- (1) 高齢者では生理機能が低下していることが多く副作用が発現しやすい。
- (2) 高齢者ではビタミンK欠乏による出血傾向があらわれることがある。

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る場合のみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

6. 臨床検査結果に及ぼす影響

- (1) テステープ反応を除くベネディクト試薬、フェーリング試薬、クリニテストによる尿糖検査では、偽陽性を呈することがあるので注意すること。
- (2) 直接クームス試験陽性を呈することがあるので注意すること。

【薬物動態】

1. 血中濃度²⁾

肝・腎機能正常患児に10mg/kg又は20mg/kgを食前30分に1回経口投与後の血中濃度は図1のとおりで、用量依存性を示す。

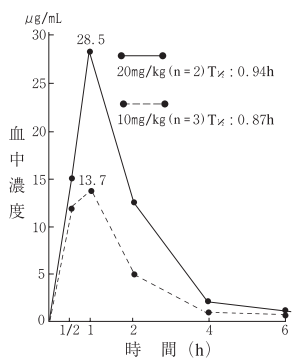


図1 血中濃度

2. 体液・組織内移行(成人：カプセル剤での成績)

喀痰、扁桃組織、涙液、耳漏等への移行が認められている。

3. 代謝³⁾

尿中には抗菌活性代謝物は認められていない。

4. 排泄⁴⁾

主として腎より未変化体として排泄され、小児に10mg/kg又は20mg/kgを食後1時間に1回経口投与後、6時間までの尿中排泄率は88.3～94.3%である。

5. 腎機能障害時の体内動態(成人：カプセル剤での成績)⁵⁾

腎機能障害患者に1回500mgを経口投与して得られた血中濃度は図2のとおりであり、腎機能の低下に伴い、血中濃度の上昇、半減期の延長及び尿中排泄率の低下が認められている。

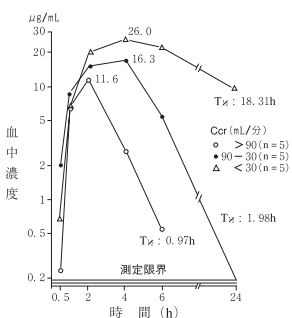


図2 腎機能障害度と血中濃度

【臨床成績】

一般臨床試験974例の疾患別臨床効果は下表のとおりである。1日投与量は30mg/kgを中心に分布し、投与期間は7日以内が多くを占める。

疾患別臨床効果

疾患名		有効率(%) (著効+有効/症例数)
皮膚科領域 感染症	表在性皮膚感染症	毛のう炎 100 (7/ 7) 膿痂疹 90.2 (185/205)
	深在性皮膚感染症	せつ 80.0 (28/ 35) 蜂窩織炎 50.0 (1/ 2)
		咽頭・喉頭炎 93.3 (98/105)
	呼吸器 感染症	扁桃炎 93.8 (195/208)
急性気管支炎、慢性呼吸器病変の二次感染 91.2 (62/ 68)		
膀胱炎 95.8 (46/ 48) 腎盂腎炎 97.4 (75/ 77)		
眼科領域 感染症	麦粒腫 88.9 (8/ 9)	
耳鼻科領域 感染症	中耳炎 76.9 (93/121)	
猩紅熱	97.8 (87/ 89)	
合計		90.9 (885/974)

【薬効薬理】

1. ブドウ球菌属等のグラム陽性菌及び大腸菌、クレブシエラ属、インフルエンザ菌等のグラム陰性菌に対して幅広い抗菌スペクトルを有している (*in vitro*)⁶⁾。
2. 作用は殺菌的で、殺菌作用はセファレキシンより強い。この強い殺菌作用は、殺菌・溶菌のメカニズムに関与しているといわれているペニシリン結合蛋白画分の1A及び1Bsに対する親和性が強いことによると考えられている (*in vitro*)⁷⁾。
3. 黄色ブドウ球菌、大腸菌、肺炎桿菌を感染菌としたマウス実験的感染症において、セファレキシンより数倍優れた治療効果を示す^{8,9)}。
4. セファレキシンより優れた増殖阻止効果が認められている (*in vitro*)¹⁰⁾。

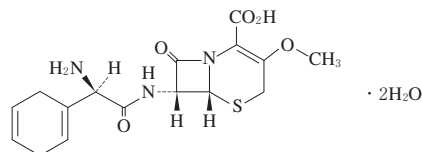
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：セフロキサジン水和物(Cefroxadine Hydrate)

略号：CXD

化学名：(6*R*, 7*R*)-7-[(2*R*)-2-Amino-2-cyclohexa-1,4-dienylacetyl-amino]-3-methoxy-8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylic acid dihydrate

構造式：



分子式：C₁₆H₁₉N₃O₅S·2H₂O

分子量：401.43

性状：微黄白色～淡黄色の結晶性の粒又は粉末である。ギ酸に極めて溶けやすく、水又はメタノールに溶けにくく、エタノール(95)に極めて溶けにくい。

0.001mol/L塩酸試液又は希酢酸に溶ける。

力価：力価はセフロキサジン(C₁₆H₁₉N₃O₅S)としての量を質量(力価)で示す。

セフロキサジン標準品(C₁₆H₁₉N₃O₅S·2H₂O)の1.099mgが1mg(力価)に対応する。

【取扱い上の注意】

調剤上の留意事項

1. 懸濁液に調製後

- (1) 使用時、十分に振り混ぜること。
- (2) やむを得ず保存を必要とする場合は、冷所に保存し、7日以内に使用すること。

2. 他剤配合時の注意

他剤との配合はできるだけ避けることが望ましいが、やむを得ず配合した場合には、冷所に保存し7日以内に使用すること。特に下記の品目と配合した場合には5日以内に使用すること。

S・M配合散、ビオフェルミン配合散、ボララミンシロップ0.04%

またアスピリンと配合し、液剤とした場合には、冷所に保存し、3日以内に使用すること。

【包 装】

100g(瓶)、120g(1g×120)

【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) 岩井直一 他：Jpn J Antibiot, **34**, 1663(1981)
 - 3) 中山一誠 他：Chemotherapy, **28**(S-3), 321(1980)
 - 4) 本廣 孝 他：Jpn J Antibiot, **34**, 1703(1981)
 - 5) 大川光央 他：Chemotherapy, **28**, 582(1980)
 - 6) 西野武志 他：Chemotherapy, **28**(S-3), 51(1980)
 - 7) 西野武志 他：Chemotherapy, **28**(S-3), 72(1980)
 - 8) 中谷林太郎 他：Chemotherapy, **28**(S-3), 27(1980)
 - 9) 安田賢児 他：Chemotherapy, **28**(S-3), 43(1980)
 - 10) Schneider, P. et al. : J Antibiot(Tokyo), **35**, 843(1982)

***【文献請求先】**

アルフレッサ ファーマ株式会社 製品情報部
〒540-8575 大阪市中央区石町二丁目2番9号
TEL 06-6941-0306 FAX 06-6943-8212

alfresa
製造販売元 アルフレッサ ファーマ株式会社
大阪市中央区石町二丁目2番9号

®登録商標