

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（1998年9月）に準拠して作成

抗生物質製剤
処方箋医薬品

リンコシン[®]カプセル 250mg
Lincocin[®] Capsules 250mg
リンコマイシン塩酸塩水和物カプセル

剤形	カプセル剤
規格・含量	1カプセル中、日局 リンコマイシン塩酸塩水和物 250mg（力価）含有
一般名	和名：リンコマイシン塩酸塩水和物（JAN） 洋名：Lincomycin Hydrochloride Hydrate（JAN）
製造・輸入承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造承認年月日： 2007年9月14日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日： 2007年12月21日 発売年月日： 2008年2月29日
開発・製造・輸入・発売・提携・販売会社名	製造販売：ファイザー株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	TEL： FAX：

本IFは2018年7月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

IF 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

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR と略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和 63 年日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成10年日病薬学術第 3 小委員会によって新たな位置付けとIF記載要領が策定された。

2. IF とは

IF は「医療用医薬品添付文書等の情報を補完し、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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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薬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。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。

3. IF の様式・作成・発行

規格は A4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IF は日病薬が策定した「IF 記載要領」に従って記載するが、本 IF 記載要領は、平成 11 年 1 月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF 記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合には IF が改訂・発行される。

4. IF の利用にあたって

IF 策定の原点を踏まえ、MR へのインタビュー、自己調査のデータを加えて IF の内容を充実させ、IF の利用性を高めておく必要がある。

MR へのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段に IF 作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

目次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の特徴及び有用性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名（命名法）	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3
7. CAS 登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
1. 有効成分の規制区分	4
2. 物理化学的性質	4
3. 有効成分の各種条件下における安定性	4
4. 有効成分の確認試験法	5
5. 有効成分の定量法	5
IV. 製剤に関する項目	6
1. 剤形	6
2. 製剤の組成	6
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6
4. 製剤の各種条件下における安定性	7
5. 調製法及び溶解後の安定性	7
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	7
7. 混入する可能性のある夾雑物	7
8. 溶出試験	7
9. 生物学的試験法	7
10. 製剤中の有効成分の確認試験法	7
11. 製剤中の有効成分の定量法	7
12. 力価	7
13. 容器の材質	7
14. その他	7
V. 治療に関する項目	8
1. 効能又は効果	8
2. 用法及び用量	8
3. 臨床成績	9
VI. 薬効薬理に関する項目	12
1. 薬理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	16
1. 血中濃度の推移・測定法	16
2. 薬物速度論的パラメータ	17
3. 吸収	17
4. 分布	18
5. 代謝	19
6. 排泄	19
7. 透析等による除去率	19
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	20
1. 警告内容とその理由	20
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	20
3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	20
4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	20
5. 慎重投与内容とその理由	21
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	21
7. 相互作用	22
8. 副作用	23
9. 高齢者への投与	24
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	25
11. 小児等への投与	25
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	25
13. 過量投与	25
14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）	25
15. その他の注意	25
16. その他	25
IX. 非臨床試験に関する項目	26
1. 一般薬理	26
2. 毒性	27
X. 取扱い上の注意等に関する項目	29
1. 有効期間又は使用期限	29
2. 貯法・保存条件	29
3. 薬剤取扱い上の注意点	29
4. 承認条件	29
5. 包装	29
6. 同一成分・同効薬	29
7. 国際誕生年月日	29
8. 製造・輸入承認年月日及び承認番号	29
9. 薬価基準収載年月日	30
10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	30
11. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	30
12. 再審査期間	30
13. 長期投与の可否	30
14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	30
15. 保険給付上の注意	30

XI. 文献	31
1. 引用文献	31
2. その他の参考文献	31
XII. 参考資料	32
主な外国での発売状況	32
XIII. 備考	33
その他の関連資料	33

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

リンコマイシンは米国ネブラスカ州、Lincoln の近くの土壌から分離された *Streptomyces* の一種、*Streptomyces lincolnensis var. lincoinesis* によって産生された抗生物質である。リンコマイシンは *in vitro* でブドウ球菌、連鎖球菌、肺炎球菌に対して抗菌力があること、本剤に対する耐性は徐々に出現すること、そして他の有用な抗生物質との間に交叉耐性がないことが研究により示された。

in vivo では、体液によって不活性化されず、動物の実験的感染症に対し有効であった。また、既知の抗生物質と比較し、独自の構造を持ち、感受性細菌の蛋白合成を阻害することによって作用を発現する。

2. 製品の特徴及び有用性

- (1) 抗菌作用：ブドウ球菌、連鎖球菌、肺炎球菌等のグラム陽性菌に対して強い抗菌作用を示す。
- (2) リンコマイシンの誘導体であるクリンダマイシンは抗菌力の増大、腸管からの吸収率の増大、及び動物における毒性の低下を示した。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

リンコシン[®]カプセル 250mg

(2) 洋名

Lincocin[®] Capsules 250mg

(3) 名称の由来

産生土壌のNebraska州、Lincolnに由来した抗生物質である。

2. 一般名

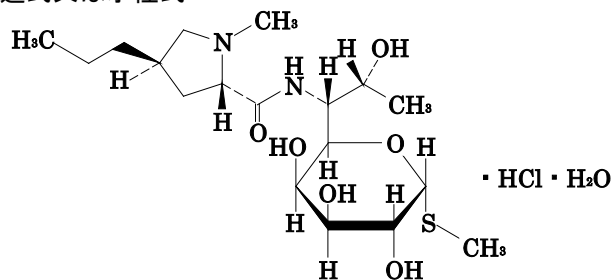
(1) 和名 (命名法)

リンコマイシン塩酸塩水和物 (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

Lincomycin Hydrochloride Hydrate (JAN)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : C₁₈H₃₄N₂O₆S · HCl · H₂O

分子量 : 461.01

5. 化学名（命名法）

(1) IUPAC 式

Methyl 6,8-dideoxy-6-[(2*S*,4*R*)-1-methyl-4-propylpyrrolidine-2-carboxamido]-1-thio-D-*erythro*- α -D-*galacto*-octopyranoside monohydrochloride monohydrate (IUPAC)

(2) Merck 式

Methyl 6,8-dideoxy-6-(1-methyl-trans-4-propyl-2-pyrrolidinecarboxamido)-1-thio-D-*erythro*-D-*galactooctopyranoside*, hydrochloride

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：LCM

7. CAS 登録番号

原体そのもの 154-21-2

HCl・H₂O 塩 7179-49-9

HCl 塩 859-18-7

III. 有効成分に関する項目

1. 有効成分の規制区分

処方箋医薬品

注意－医師等の処方箋により使用すること

2. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

水又はメタノールに溶けやすく、エタノール（95）にやや溶けにくく、アセトニトリルに極めて溶けにくい。

(3) 吸湿性

参考：本品は70℃で乾燥した結晶状態では最低6ヵ月は安定である。温度70℃で0.1N塩酸中におけるリンコマイシン塩酸塩水和物の半減期は約40時間である。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

145～147℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

pKa：7.6（free base）

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

比旋光度 $[\alpha]_D^{25}$: +137°

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$: +135～+150°（0.5g、水、25mL、100mm）

pH : 本品0.10gを水1mLに溶かした液のpHは3.0～5.5である

水分 : 3.0～6.0%（0.5g、容量滴定法、直接滴定）

浸透圧比 : 約5（生理食塩液対比）

3. 有効成分の各種条件下における安定性

本品は著しく安定で、乾燥状態では70℃に6ヵ月保存して力価の低下なく、300～1000 μ g/mLの水溶液は室温2年間又は37℃に1週間保存し、力価の低下なく、血清の添加の影響も認めない。

4. 有効成分の確認試験法

日局「リンコマイシン塩酸塩水和物」の確認試験による。

- (1) 本品につき、赤外吸収スペクトル測定法のペースト法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトル又はリンコマイシン塩酸塩標準品のスペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。
- (2) 本品の水溶液（1→100）は塩化物の定性反応を呈する。

5. 有効成分の定量法

日局「リンコマイシン塩酸塩水和物」の定量法による。

本品及びリンコマイシン塩酸塩標準品約 10mg（力価）に対する量を精密に量り、それぞれを移動相に溶かし、正確に 10mL とし、試料溶液及び標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液 20 μ L ずつを正確にとり、次の条件で液体クロマトグラフィーにより試験を行い、それぞれの液のリンコマイシンのピーク面積 A_T 及び A_S を測定する。

$$\text{リンコマイシン (C}_{18}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_6\text{S) の量} [\mu\text{g (力価)}] = W_S \times \frac{A_T}{A_S} \times 1000$$

W_S : リンコマイシン塩酸塩水和物標準品の秤取量 [mg (力価)]

試験条件

検出器：紫外吸光光度計（測定波長：210nm）

カラム：内径 4mm、長さ 25cm のステンレス管に 5 μ m の液体クロマトグラフィー用オクタシルシリル化シリカゲルを充てんする。

カラム温度：46°C 付近の一定温度

移動相：リン酸 13.5mL に水 1000mL を加え、アンモニア試液を加えて pH を 6.0 に調節する。
この液 780mL にアセトニトリル 150mL 及びメタノール 150mL を加える。

流量：リンコマイシンの保持時間が 9 分になるように調整する。

システム適合性

システムの性能：標準溶液 20 μ L につき、上記の条件で操作するとき、リンコマイシンのピークの理論段数及びシンメトリー係数は、それぞれ 4000 段以上、1.3 以下である。

システムの再現性：標準溶液 20 μ L につき、上記の条件で試験を 6 回繰り返すとき、リンコマイシンのピーク面積の相対標準偏差は 2.0% 以下である。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別及び性状

- 1) 区別：硬カプセル剤
- 2) 規格：1 カプセル中：日局 リンコマイシン塩酸塩水和物 250mg（力価）含有
- 3) 製剤の性状：

販売名	含有	外形	識別コード	色調等	重量
リンコシン カプセル 250mg	250mg (力価)	 1号カプセル	UPJOHN 336	頭部：濃青色 不透明 胴部：淡青色 不透明	513～519mg

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

リンコシンカプセル 250mg：カプセル頭部・胴部 UPJOHN336

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

(5) 酸価、ヨウ素価等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1 カプセル中：日局 リンコマイシン塩酸塩水和物 250mg（力価）含有

(2) 添加物

ステアリン酸マグネシウム、タルク、乳糖水和物

カプセル本体：亜硫酸水素ナトリウム、酸化チタン、ラウリル硫酸ナトリウム、青色 1 号、赤色 3 号

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

温度：25℃で保存した場合、24 ヶ月後の力価残存率は約 90%を示す。

温度：該当資料なし

光：該当資料なし

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

7. 混入する可能性のある夾雑物

特になし

8. 溶出試験

該当資料なし

9. 生物学的試験法

該当しない

10. 製剤中の有効成分の確認試験法

(1) 日局「赤外吸収スペクトル測定法（ペースト法）」による。

(2) 日局「定性反応」による。

11. 製剤中の有効成分の定量法

日局「リンコマイシン塩酸塩水和物」の定量法による。

12. 力価

力価は塩基の重量表示による。

13. 容器の材質

該当資料なし

14. 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

<適応菌種>

リンコマイシンに感性的のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、赤痢菌

<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、乳腺炎、骨髄炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、感染性腸炎、角膜炎（角膜潰瘍を含む）、中耳炎、副鼻腔炎、猩紅熱

【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、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。

2. 用法及び用量

リンコマイシン塩酸塩水和物として通常成人は、1日1.5～2g（力価）を3～4回に分割経口投与する。小児には1日体重1kgあたり20～30mg（力価）を3～4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。

【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。

3. 臨床成績

(1) 臨床効果

本項に示す成績は承認時の適応症・適応菌種に関するものであり、平成 16 年度の抗菌剤再評価結果を踏まえたものではありません。

《臨床成績》

臨床治験 1412 例、効果判定可能 1408 例中、1265 例に有効と判定された。

●有効率

浅在性化膿性疾病群有効率	383/410	(93.4%)
深在性化膿性疾病群有効率	76/99	(76.8%)
呼吸器感染症有効率	222/267	(83.2%)
総計	1265/1408	(90.1%)

疾患名	有効率 (有効例/総症例)	菌検出
		有効率 (有効例/総症例)
急性・亜急性細菌性心内膜炎	(1/2)	(1/1)
敗血症	76.9% (10/13)	(1/2)
〃 + 骨髄炎	(1/1)	(1/1)
〃 + 肺炎	(1/1)	(1/1)
細菌性心内膜炎 + P. D. A.	(1/1)	(1/1)
(a) 浅在性化膿性疾患群		
膿痂疹	(6/6)	(3/3)
フルンケル	96.1% (74/77)	93.2% (41/44)
カルブンケル	(7/7)	(4/4)
膿瘍	66.7% (12/18)	66.7% (10/15)
フレグモーネ	96.3% (26/27)	94.1% (16/17)
咽喉頭炎	87.3% (48/55)	97.6% (41/42)
扁桃炎	97.2% (105/108)	89.5% (51/57)
麦粒腫	(8/8)	(8/8)
アンギーナ	(3/3)	
瘰癧	93.3% (28/30)	89.5% (17/19)
癰腫症	85.7% (18/21)	(6/9)
面疔	(3/4)	(3/3)
眼瞼膿瘍	(3/3)	(3/3)
耳癰	95% (19/21)	92.3% (12/13)
扁桃周囲膿瘍	(2/2)	(2/2)
腺窩性アンギーナ	100% (16/16)	(9/9)
化膿性湿疹	(2/2)	(2/2)
丹毒	(3/3)	
(b) 深在性化膿性疾患群		
乳腺炎	92.3% (24/26)	(2/3)
リンパ節 (管) 炎	84.6% (22/26)	(5/5)
髄膜炎	87.1% (27/31)	(4/4)
関節炎	(3/5)	

疾患名	有効率	菌検出
	(有効例/総症例)	有効率 (有効例/総症例)
急・慢性気管支炎	73.3% (66/90)	71.9% (23/32)
気管支肺炎及び肺炎	93.9% (108/115)	98.2% (53/54)
気管支拡張症	(9/10)	(9/10)
肺化膿症 (肺膿瘍)	81.1% (30/37)	79.4% (27/34)
アンギーナ気管支炎	(5/5)	
膿胸	(3/9)	(2/6)
// + 気管支拡張症	(1/1)	(1/1)
胆嚢炎	(9/10)	(4/4)
胆道炎	(6/8)	(6/8)
虫垂炎	(1/1)	(1/1)
細菌性赤痢	91.3% (136/149)	91.3% (136/149)
腎盂腎炎	72.7% (8/11)	72.7% (8/11)
膀胱炎	93.8% (15/16)	93.3% (14/15)
子宮付属器炎	90.0% (18/20)	
産褥感染症	(5/5)	
髄膜炎	(1/1)	
猩紅熱	(10/10)	(10/10)
匍行性角膜潰瘍	(2/2)	
穿孔性角膜外傷	(4/4)	
中耳炎	88.4% (99/112)	84.1% (37/44)
副鼻腔炎	88.5% (23/26)	(3/4)
顎骨骨膜炎	(6/7)	(3/4)
智歯周囲炎	88.7% (55/62)	(1/1)
急性顎炎	98.1% (51/52)	
歯槽骨炎	97.7% (85/87)	
歯槽骨膜炎	95.5% (21/22)	
上顎洞炎	75.0% (15/20)	(4/4)

(2) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(3) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 無作為化平行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(5) 治療的使用

1) 使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験

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試験の概要

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

◇リンコマイシン系抗生物質

リンコマイシン塩酸塩水和物カプセル、リンコマイシン塩酸塩水和物注射液、クリンダマイシン塩酸塩カプセル、注射用クリンダマイシンリン酸エステル

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

1) 抗菌作用^{2) ~5)}

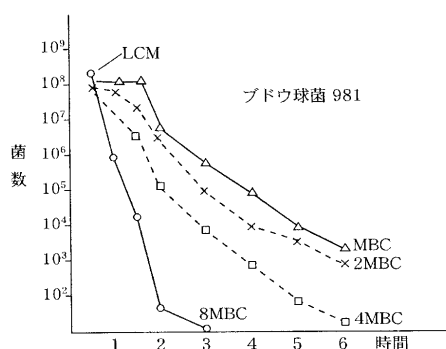
ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌等のグラム陽性菌、嫌気性菌であるペプトコッカス属及びバクテロイデス属に強い抗菌作用を示す。

2) 作用機序⁶⁾

細菌のリボゾーム 50S Subunit に作用し、ペプチド転移酵素反応を阻止し蛋白合成を阻害する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

◆リンコマイシンに対して、MIC $0.78 \mu\text{g/mL}$ の黄色ブドウ球菌を使用し MIC の 4 倍の濃度 $3.12 \mu\text{g/mL}$ で作用されると 99%以上黄色ブドウ球菌が死滅することを示している。^{2)、7)}



リンコマイシンの濃度をMBC、2MBC、4MBC、8MBCと増加させるとその殺菌力は強力に増加する。

1) 嫌気性球菌³⁾

Peptococcus, *Peptostreptococcus*, *Veillonella* のほとんどの細菌に、LCM は 0.19 μ g/mL 以下の MIC を示した。マクロライド系抗生物質と比較すると、2~8 倍強い抗菌力を示した。

菌 株	MIC (μ g/mL)					
	CLDM	LCM	LM	EM	JM	SPM
<i>Peptococcus prevotii</i> ATCC 9321	0.19	0.19	1.56	0.78	1.56	3.13
<i>Peptococcus aerogenes</i> ATCC 14963	0.19	0.19	0.78	0.78	0.78	6.25
<i>Peptococcus variabilis</i> 14955	0.39	0.78	3.13	6.25	6.25	6.25
<i>Peptococcus variabilis</i> PL-7	0.19	0.19	1.56	3.13	1.56	3.13
<i>Peptococcus anaerobius</i> B-40	100	0.19	100	100	6.25	100
<i>Peptococcus asaccharolyticus</i> Z-1003	0.19	0.19	3.13	3.13	0.78	6.25
<i>Peptostreptococcus anaerobius</i> B-38	0.19	0.19	1.56	0.78	1.56	0.78
<i>Peptostreptococcus putridus</i> PL-9-2	0.19	0.19	0.19	0.78	1.56	0.78
Group-1 NCTC 9803	0.19	0.19	1.56	1.56	1.56	0.19
Group-2 NCTC 9804	0.19	0.19	0.78	0.78	6.25	6.25
Group-7 NCTC 9808	0.19	0.19	3.13	0.78	1.56	6.25
Group-8 NCTC 9810	0.19	0.19	1.56	0.78	0.78	12.5
Group-9 NCTC 9811	0.19	0.19	0.39	0.39	0.19	0.19
<i>Veillonella parvula</i> ATCC 10790	0.19	0.19	12.5	3.13	12.5	100

LM : Leucomycin. EM : Erythromycin. JM : Josamycin. SPM : Spiramycin

2) 嫌気性グラム陰性桿菌³⁾

LCM は、マクロライド系抗生物質と同様に *Sphaerophorus* sp. H-17 には抗菌作用を示さないが、これを除く菌種には 12.5 μ g/mL 以下の MIC を示した。

菌 株	MIC (μ g/mL)					
	CLDM	LCM	LM	EM	JM	SPM
<i>Bacteroides fragilis</i> H-7	6.25	0.19	1.56	0.78	0.19	25
<i>Bacteroides fragilis</i> H-6	0.19	3.13	0.78	1.56	1.56	25
<i>Bacteroides convexus</i> H-10	0.19	6.25	0.78	1.56	0.78	12.5
<i>Bacteroides convexus</i> H-8	0.19	6.25	0.78	3.13	3.13	50
<i>Bacteroides thetaiotaomicron</i> H-5	0.39	6.25	0.78	3.13	0.19	6.25
<i>Bacteroides thetaiotaomicron</i> W-3	0.78	3.13	0.78	1.56	0.39	6.25
<i>Bacteroides distasonis</i> W-7	3.13	12.5	1.56	3.13	0.78	12.5
<i>Bacteroides distasonis</i> W-8	3.13	12.5	100	100	0.39	100
<i>Bacteroides vulgatus</i> W-5	0.19	3.13	0.19	0.78	0.19	3.13
<i>Sphaerophorus necrophorus</i> H-12	0.19	0.78	25	25	50	25
<i>Sphaerophorus</i> sp. H-17	100	100	100	100	100	100
<i>Sphaerophorus</i> sp. H-18	50	12.5	100	100	100	100

LM : Leucomycin. EM : Erythromycin. JM : Josamycin. SPM : Spiramycin

好気性菌の試験管内感受性値

	通常の最小発育阻止濃度 (μ g/mL)	
	LCM	CLDM
グラム陽性菌		
<i>Staphylococcus aureus</i>	0.2~3.1	0.04~0.4
<i>Staphylococcus epidermidis</i>	0.8~1.5	0.1~0.2
<i>Streptococcus pneumoniae</i>	0.01~0.5	0.01~0.06
<i>Streptococcus pyogenes</i>	0.04~0.5	0.02~0.2
<i>Streptococcus viridans</i>	0.02~0.5	0.01~0.06
<i>Streptococcus faecalis</i>	25~>100	12.5~>100
<i>Corynebacterium diphtherae</i>	0.4	\leq 0.2
<i>Nocardia</i>	3.1~>100	0.78~25
グラム陰性菌		
<i>Neisseria gonorrhoeae</i>	0.5~>100	0.01~6.3
<i>Neisseria meningitidis</i>	>50	5~25
<i>Haemophilus influenzae</i>	3~50	0.12~50
<i>Escherichia, Klebsiella,</i> <i>Enterobacter, Serratia,</i> <i>Proteus, Pseudomonas</i>	>100	25~>100
<i>Salmonella</i>	>100	12~25
<i>Shigella</i>	>100	25
グラム陰性非芽胞形成菌		
<i>Bacteroides fragilis</i>	\leq 0.1~25	\leq 0.1~3.1
<i>Bacteroides melaninogenicus</i>	\leq 0.1~0.4	\leq 0.1~0.2
<i>Fusobacterium</i>	\leq 0.1~6.2	\leq 0.1~1.6
グラム陽性非芽胞形成菌		
<i>Actinomyces</i>	0.03~1.0	0.03~0.25
<i>Bifidobacterium</i>	\leq 0.1~1.6	\leq 0.1
<i>Eubacterium</i>	\leq 0.1~3.1	\leq 0.1~0.8
<i>Propionibacterium</i>	\leq 0.1~1.6	\leq 0.1~0.2
芽胞形成菌		
<i>Clostridium perfringens</i>	\leq 0.1~12.5	\leq 0.1~3.1
<i>Clostridium species</i>	\leq 0.1~12.5	\leq 0.1~3.1
球菌		
<i>Peptococcus</i>	\leq 0.1~1.6	\leq 0.1~1.6
<i>Peptostreptococcus</i>	\leq 0.1~1.6	\leq 0.1~0.8
<i>Veillonella</i>	\leq 0.1~6.2	\leq 0.1

3) クロストリジウムに対する抗菌作用³⁾

LCMは *C. sticklandi* に 25 μ g/mL、*C. sporogenes* に 50 μ g/mL し、*C. perfringens*、*C. tetani*、*C. novyi*、*C. septicum* 等には 6.25 μ g/mL 以下の MIC を示した。

菌株	MIC (μ g/mL)					
	CLDM	LCM	LM	EM	JM	SPM
<i>Clostridium perfringens</i>	0.19	0.19	1.56	3.13	3.13	6.25
<i>Clostridium tetani</i>	0.19	0.19	0.19	0.78	0.19	1.56
<i>Clostridium septicum</i>	50	6.25	100	100	100	100
<i>Clostridium novyi</i>	0.19	0.19	0.19	0.78	0.19	1.56
<i>Clostridium sporogenes</i>	6.25	50	0.78	0.78	0.78	6.25
<i>Clostridium histolyticum</i>	0.19	0.19	0.19	0.78	0.19	0.78
<i>Clostridium bifermentans</i>	0.19	0.19	0.39	100	0.78	100
<i>Clostridium tetanomorphum</i>	0.19	0.19	0.19	0.39	0.19	3.13
<i>Clostridium butyricum</i>	1.56	1.56	1.56	100	1.56	100
<i>Clostridium cohlearium</i>	0.19	0.19	0.19	0.19	0.19	0.19
<i>Clostridium sticklandi</i>	50	25	0.78	0.39	0.78	0.78

LM : Leucomycin. EM : Erythromycin. JM : Josamycin. SPM : Spiramycin

4) マイコプラズマに対する抗菌力³⁾

Mycoplasma pneumoniae の保存株 2 株と新鮮分離株 11 株の CLDM 及び LCM に対する *in vitro* における MIC を他の薬剤 (Tetracycline、Streptomycin、Kanamycin、Erythromycin) と比較検討した。その結果、CLDM の MIC は、0.8~3.12 μ g/mL であり、LCM の 1.56~6.25 μ g/mL に比較し、2~4 倍の抗マイコプラズマ作用を示した。また、殺マイコプラズマ作用濃度 (MCC) を検討した成績では CLDM は約 2.8 μ g/mL で、Tetracycline よりも低濃度であり Streptomycin と同程度であった。LCM の MCC は約 5.6 μ g/mL で、CLDM の 2 倍の濃度であった。

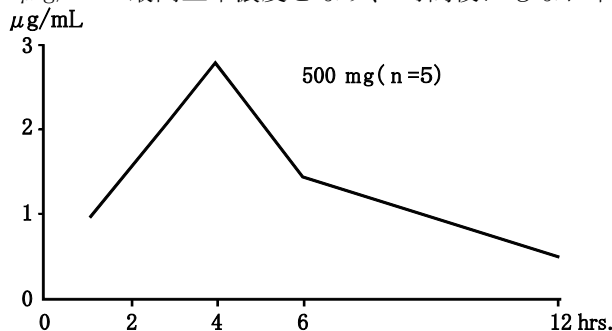
一方、CLDM、LCM とともに Erythromycin 耐性株に作用せず、あきらかな交叉耐性がみられた。次に MCC/MIC の比でみると CLDM では 2.2、LCM では 1.9 であり、抗マイコプラズマ作用の作用様式を考えると、この比の値の小さい Erythromycin (1.5)、Kanamycin (1.53) とともに殺マイコプラズマ的に作用すると考えられた。

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度⁷⁾

健康成人に 500mg (力価) を 1 回経口投与した時の血中濃度は下図のとおりである。内服 4 時間後には平均 2.82 μ g/mL の最高血中濃度となり、6 時間後にもなお平均 1.4 μ g/mL の血中濃度を示す。



(2) 最高血中濃度到達時間

4 時間

(3) 通常用量での血中濃度

●腎不全患者における検討

Lincomycin は同系の clindamycin とは異なり、高度腎不全患者では $T_{1/2}$ がかなり延長するので、腎機能に応じて使用法を調整する必要がある。Cr 10mL/min. 以下では 1 回常用量を 12~24 時間間隔で投与することが一般的である。

腎不全における化学療法剤の薬動学的特徴⁸⁾

化学療法剤	血中半減期 (時間)			HD除去率 (%)	HD後の追加調整量 (mg)
	正常	末期腎不全	HD		
erythromycin	1.5	5.0		0	0.0
lincomycin	4.5	12.0		0	0.0
clindamycin	3.0	2.9		0	0.0

HD : 血液透析

(4) 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 吸収速度定数

該当資料なし

(2) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

0.41～0.57L/kg

(6) 血漿蛋白結合率

93.6%

3. 吸収

本剤の消化管、筋肉内よりの吸収は良好である。経口投与時、20～35%が吸収される。

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

通過しない

(2) 胎児への移行性

通過しない

(3) 乳汁中への移行性⁹⁾

急性化膿性乳腺炎患者 2 例の Lincocin 500mg 内服 1、3、6 時間後の乳汁中移行量を測定した。第 1 例は 1～3 時間値 0.6～0.7 $\mu\text{g/mL}$ 、6 時間後に 1.2 $\mu\text{g/mL}$ でピークを示した。第 2 例では、1 時間値 3.2 $\mu\text{g/mL}$ でピークを示し、3～6 時間後に 1.4～0.7 $\mu\text{g/mL}$ と下降した。

(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⁵⁾

<参考>マウスにおけるデータ

体重 20g 前後の健常マウスに 50mg/kg 筋注後、1 時間、3 時間、6 時間に断頭し、虚血したのち、尾動脈から生理食塩水を灌流して、血液を洗浄し、肺、肝、腎、脾、脳、心、筋の各臓器を摘出して、その重量の 2～4 倍量の生理食塩水を加えてホモジナイズし、その上清を被検液とした。その成績は、表のとおり肺が最も高く（1 時間値 2.16 $\mu\text{g/g}$ ）、ついで腎、脾で、肝には比較的低濃度（1 時間値 1.32 $\mu\text{g/g}$ ）、さらに心、筋の順であった。脳では 1 時間後にも証明できず、6 時間後ではすべての臓器で証明できなかった。

臓器内濃度（マウス 50mg/kg 筋注 3 匹平均）

	1 時間 ($\mu\text{g/g}$)	3 時間 ($\mu\text{g/g}$)	6 時間 ($\mu\text{g/g}$)
肺	2.16	1.29	0
腎	1.90	0.70	0
脾	1.76	0.68	0
肝	1.32	0.80	0
心	1.15	0	0
筋	1.06	0	0
脳	0	0	0

胆汁中濃度⁵⁾

肝機能障害の認められなかった胆石症疾患 2 例に胆嚢摘出後、総胆管排液法を行い、術後 7 日直前に Lincocin 600mg 筋注し、排液管から胆汁を採取して測定した。その結果 30 分後にはすでに高濃度（16.0～11.3 $\mu\text{g/mL}$ ）の排泄がみられ、1 時間で最高値（19.0～11.7 $\mu\text{g/mL}$ ）に達し、その後 6 時間でもなお高い濃度（10.5～8.4 $\mu\text{g/mL}$ ）を示した。この成績は Lincocin は血中濃度より胆汁中濃度のほうが高い値を示した。

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

該当資料なし

(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比率

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位¹⁰⁾

本剤の排泄は経口投与後、主に胆汁に排泄され、尿中には 24 時間以内に 3～5%が排泄されるにすぎない。しかし、静脈内投与後は、約 15～50%が尿中に排泄される。

(2) 排泄率

成人に 500mg（力価）を経口投与した時の 7 時間までの尿中回収率は平均 8.9%である。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

(1) 腹膜透析

除去されない

(2) 血液透析

除去されない

(3) 直接血液灌流

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由

禁忌（次の患者には投与しないこと）
本剤の成分又はクリンダマイシンに対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

【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、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。

（解説）

国際的に脅威となる感染症対策の強化に関する基本計画（平成 28 年 2 月 9 日、国際的に脅威となる感染症対策関係閣僚会議）により策定された薬剤耐性（AMR）対策アクションプラン（2016-2020）に基づき、抗微生物薬の適正使用の推進を目的とした「抗微生物薬適正使用の手引き 第一版」¹⁾が厚生労働省健康局結核感染症課より平成 29 年 6 月 1 日に公表された。これを受け、本手引きに基づき、抗微生物薬の適正使用がなされるよう注意喚起することになった。

4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

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。

（解説）

厚生労働省薬務局安全課長通知薬案第 5 号（1993 年 1 月 19 日付）により記載した。厚生労働省が実施した抗生物質感受性状況調査により MRSA 等の分離頻度が高いことが認められ、抗生物質全般について改めて適正使用を図ることになった。

5. 慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 高齢者及び衰弱患者、大腸炎等の既往歴のある患者〔偽膜性大腸炎等の重篤な大腸炎があらわれるおそれがある（「重要な基本的注意」の項参照）。〕
- (2) 肝障害又は肝障害の既往歴のある患者〔胆汁排泄のため、消失半減期が延長するおそれがある。また、肝障害があらわれるおそれがある。〕
- (3) 腎障害のある患者〔腎排泄は本剤の主排泄経路ではないが、消失半減期が延長するおそれがある。〕
- (4) 気管支喘息、著明なアレルギーの既往歴のある患者〔重症の即時型アレルギー反応があらわれるおそれがある。〕
- (5) 食道通過障害のある患者〔食道に停留し、崩壊すると、食道潰瘍を起こすおそれがある。〕
- (6) 重症筋無力症の患者〔本剤は筋への直接作用により収縮を抑制するので、症状が悪化するおそれがある。〕

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

本剤の投与により、まれに発熱、腹痛、白血球増多、粘液・血液便を伴う激症下痢を主症状とする重篤な大腸炎で、内視鏡検査により偽膜斑等の形成をみる**偽膜性大腸炎**があらわれることがある。

発症後直ちに投与を中止しなければ電解質失調、低蛋白血症等に陥り、特に高齢者及び衰弱患者では予後不良となることがある。

したがって本剤の投与を考慮する場合には、次の注意が必要である。

- (1) 次の場合には投与しないことが望ましい。
 - 1) 軽微な感染症
 - 2) 他に有効な使用薬剤がある場合
- (2) 投与患者に対し、投与中又は投与後 2～3 週間までに腹痛、頻回な下痢があらわれた場合には服用を中止し、直ちに医師に通知するよう注意すること。また、症状が重篤な場合には輸液、バンコマイシンの経口投与等の適切な処置を行うこと。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

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
エリスロマイシン (エリスロシン等)	併用しても本剤の効果があ らわれないと考えられる。	細菌のリボゾーム 50S Subunitへの親和性が本剤 より高い。

(2) 併用注意とその理由

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
末梢性筋弛緩剤 塩化スキサメトニウム 塩化ツボクラリン等	筋弛緩作用が増強される。	本剤は神経筋遮断作用を有 する。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

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) 重大な副作用と初期症状

(1) 重大な副作用

- ① **ショック（頻度不明）**：ショックを起こすことがある。また、呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等のアナフィラキシーを伴うことがあるので、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、血圧の維持、体液の補充管理、気道の確保等の適切な処置を行うこと。
- ② **偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎（頻度不明）**：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し、輸液、バンコマイシンの経口投与等の適切な処置を行うこと。〔「重要な基本的注意」の項参照〕
- ③ **中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）（頻度不明）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）（頻度不明）、剝脱性皮膚炎（頻度不明）**：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）、剝脱性皮膚炎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。
- ④ **無顆粒球症（頻度不明）、再生不良性貧血（頻度不明）、汎血球減少症（頻度不明）、血小板減少性紫斑病（頻度不明）**：無顆粒球症、再生不良性貧血、汎血球減少症、血小板減少性紫斑病があらわれたとの報告があるので、血液検査等の観察を十分に行い、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。

(2) 重大な副作用（類薬）

間質性肺炎、PIE 症候群：類薬（クリンダマイシンリン酸エステル）で発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部 X 線異常、好酸球増多等を伴う間質性肺炎、PIE 症候群があらわれたとの報告があるので、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、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

2) その他の副作用

	頻度不明
消化器	下痢、軟便、食欲不振、悪心・嘔吐、腹痛、心窩部痛、口唇乾燥感、舌炎、肛門そう痒症
過敏症 <small>注1)</small>	発疹、そう痒、浮腫、血管神経性浮腫、血清病
血液 <small>注2)</small>	赤血球減少、白血球減少、顆粒球減少、好中球減少、血小板減少、好酸球増多
肝臓 <small>注3)</small>	黄疸、AST (GOT)、ALT (GPT) の上昇
腎臓 <small>注4)</small>	窒素血症、乏尿、蛋白尿
神経系	耳鳴、めまい
菌交代症 <small>注5)</small>	口内炎、カンジダ症
その他	膣炎、発熱、頭痛、倦怠感、小水疱性皮膚炎

注1：このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。
注2：血液検査等の観察を十分に行うこと。
注3：定期的に肝機能検査を行うなど観察を十分に行うこと。
注4：定期的に腎機能検査を行うなど観察を十分に行うこと。
注5：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。

(2) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(3) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

リンコマイシンは高分子に結合しているときでもその抗体が検出されなかった。
また、リンコマイシン特異性の抗体は誘導抗原処理ラット血清にも検出されなかった。

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないことが望ましい。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2) 授乳婦

授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること。[ヒト母乳中へ移行する。]

11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児に対する安全性は確立していないので、投与しないことが望ましい。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

薬剤交付時

(1) 水又は牛乳で服用させ、特に就寝直前の服用等には注意すること。[食道に停留し、崩壊すると、まれに食道潰瘍を起こすことがある。]

(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報告されている。]

15. その他の注意

該当資料なし

16. その他

該当資料なし

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 一般薬理⁶⁾

主として Gram 陽性菌に有効な新抗生物質 LCM の薬理作用について、摘出臓器（ガマ心臓、ウサギ腸管及び耳殻血管）並びにウサギ呼吸、血圧に対する作用を中心に実験を行い、上述のような成績を得た。

摘出心臓に対する作用では、 10^{-4} ($100 \mu\text{g/mL}$)、摘出腸管に対する作用では 10^{-5} ($10 \mu\text{g/mL}$)、血管に対する作用では 10^{-4} (1.0mg/mL) 及びそれ以下の濃度では殆ど影響を与えない。この全く影響を与えない薬物濃度が、その抗菌作用：最小有効濃度にくらべ 10～100 倍の高濃度である点並びに Mason らの言うように経口投与時の LD_{50} が $4,000\text{mg/kg}$ 以上である点と組み合わせ、LCM は薬理作用からも毒性が少ない抗生物質の 1 つと思考する。

次に、LCM 高濃度又は大量適用の際は、心臓運動の抑制、腸管運動の軽度亢進、並びに血管の拡張の諸作用を認めたが、いずれの作用も RINGER 液や TYRODE で洗浄すると速やかに消失した。従ってその作用は一過性又は可逆性のものと考えられる。また、その作用態度は心拍動数や筋緊張に影響を与えなかった。

一方、ウサギ呼吸、血圧に対し $0.1\sim 20.0\text{mg/kg}$ 適用の際、呼吸にはほとんど変化はみられない。これに対して血圧は 1.0mg/kg 適用の際、全く変化はないが、 5.0mg/kg 及びそれ以上の適用例では、薬物量にほぼ比例してやや持続性の下降を示した。このような作用は、Atropine（副交感神経末端遮断薬）、Hexamethonium（自律神経節遮断薬）の前処置並びに迷走神経切断によって、Atropine でやや拮抗されるほかは、ほとんど影響を受けなかった。このような諸事実から、LCM の高濃度及び大量適用の際の諸作用は、Acetylcholine の作用と類似するところが多い。すなわち、軽度ながら Cholinergic な作用を示すものと思推される。

次に、血圧下降作用が、Hexamethonium や迷走神経の切断によって消失し難い事実から、血圧下降作用は末梢血管の拡張に由来するのが一般的であり、しかも、筋麻痺作用と断定するには、摘出臓器（心臓、腸管）に対する作用態度からみて困難である。従って、Acetylcholine 様の降圧作用のある組織 Hormone、更に言葉をすすめると、peptide の作用に関係があるものと推測する次第である。以上の諸成績から、LCM は生体内で抗菌作用を示す濃度の数 10～数 100 倍の濃度においてさえも、ほとんど認むべき薬理作用のない優れた抗生物質であり、同じような抗菌像を有する penicillin G や Erythromycin の場合と同一傾向の成績を得た。なお、大量投与時には軽度ながら cholinergic な作用をもつが、血管拡張作用があきらかであり、降圧性の作用 Peptide にも作用するものと推測する。

2. 毒性

(1) 単回投与毒性試験

1) 急性毒性 LD₅₀ (mg/kg) ¹¹⁾

動物種	投与法	経口投与		皮下投与		筋 注		静 注	
	性別	雄	雌	雄	雌	雄	雌	雄	雌
ddN系マウス (mg/kg)		5000<		5000<		5000<		156.3	160.6
SD系ラット (mg/kg)		5000<		5000<		5000<		164.2	201.4

2) 亜急性毒性 ¹²⁾

動物	投与量	所 見
ラット	胃内注入 期間：30日間 30mg/kg投与群 100mg/kg投与群 300mg/kg投与群	300mg/kg以下でも毒性なく、中毒症状は観察されなかった。 雌ラット300mg/kg投与群以外は体重、食餌摂取量とも増加した。 血液像異常なし。
犬	期間：30日間 30mg/kg投与群 100mg/kg投与群 300mg/kg投与群 期間：3週間 500mg/kg又は 750mg/kg	臨床観察、血液像、器官機能値、尿所見、組織検査で異常を認めず。
ラット	期間：30日間 投与法：皮下注 15mg/kg (1mL) 投与群 30mg/kg (1mL) 投与群 60mg/kg (1mL) 投与群	体重、血液像に異常なく、注射部位の変化も対照と差がなかった。
犬	期間：28日間 投与法：筋注 15mg/kg (1mL) 投与群 30mg/kg (1mL) 投与群 60mg/kg (1mL) 投与群	体重変動、血液、尿所見、肝・腎機能及び組織学的検査は対照と差がなかった。

3) 慢性毒性 (最大安全量) ¹²⁾

動物	投与量	所見
ラット	胃内注入 期間：12ヵ月 30mg/kg投与群 100mg/kg投与群 300mg/kg投与群	下痢もなく、実験終了時の血液像、臓器重量、組織学的所見は対照ラットと差がなかった。
犬	1日3回分服 期間：6ヵ月 30mg/kg投与群 100mg/kg投与群 300mg/kg投与群	毎月の体重、ヘマトクリット、血色素、白血球数及び分布、血糖、血液尿素、BSP値、SGOT、SGPT値に異常を認めず。300mg/kgの大量投与2匹(1群4匹)の甲状腺はリンパ球が組織実質を置換していたが、甲状腺機能の変化は見られなかった。

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験 ¹²⁾

使用動物	投与量	投与方法	結 果
マウス 生後3~4ヵ月 ICR系 初妊	①3,000mg/kg (大量投与群) ②300mg/kg (少量投与群)	妊娠8日から 14日まで 毎日1回 経口投与	(1) 母体の 一般状態 (2) 胎仔の状態
	③600mg/kg (大量投与群) ④450mg/kg (中量投与群) ⑤300mg/kg (少量投与群)	妊娠8日から 14日まで 毎日1回 腹腔内投与	(3) 生後6週間 に至る発育 を観察した 結果
			①~⑤とも薬物の著明な影響は認められない。 ①~⑤とも死胚仔率、生仔の奇形率、平均体重、及び性別に関して平均体重、及び性別に関して薬物の影響は認められなかった。 生後22日における哺育率、生後42日における生存率、体重増加の状態感覚、運動性成熟及び胸腹部内臓の異常に関して薬物の影響を示す所見は認められなかった。

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 取扱い上の注意等に関する項目

1. 有効期間又は使用期限

4年（最終年月を外箱等に記載）

2. 貯法・保存条件

室温保存

3. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 処方箋医薬品

(2) 注意－医師等の処方箋により使用すること。

(3) 薬剤交付時の注意

食道に停留し、崩壊すると、まれに食道潰瘍を起こすことがあるので、水又は牛乳で服用させ、特に就寝直前の服用等には注意すること。

4. 承認条件

該当資料なし

5. 包装

リンコシンカプセル 250mg：100カプセル（PTP）

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：リンコシン注射液 300mg、600mg、1g、1.5g

同効薬：クリンダマイシン塩酸塩、クリンダマイシンリン酸エステル

7. 国際誕生年月日

1960年1月

8. 製造・輸入承認年月日及び承認番号

品名	製造・輸入承認年月日	承認番号
リンコシンカプセル 250mg (リンコシンカプセル： 2008年8月31日 経過措置期間終了)	2007年9月14日 (1965年4月28日)	21900AMX01452 ((40AM輸) 第202号)

() 内は旧販売名

9. 薬価基準収載年月日

2007年12月21日

10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当資料なし

11. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果通知日：2004年9月30日

12. 再審査期間

該当しない

13. 長期投与の可否

本剤は、厚生労働省告示第107号（平成18年3月6日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード

医薬品コード：6112003M1030

15. 保険給付上の注意

該当資料なし

XI. 文献

1. 引用文献

- 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 [L20180313010]
- 2) 中沢 昭三ほか：J Antibiot [B] 18 (2) : 56, 1965 [L20030602051]
- 3) 二宮 敬宇ほか：Jpn J Antibiot 26 (2) : 157, 1973 [L20030528003]
- 4) 松田 精治ほか：産科と婦人科 50 (5) : 1158, 1983 [L20030602053]
- 5) 石山 俊次ほか：J Antibiot [B] 18 (2) : 120, 1965 [L20030602088]
- 6) 荒谷 春恵ほか：J Antibiot [B] 18 (2) : 61, 1965 [L20030616361]
- 7) 奥山 宣夫ほか：J Antibiot [B] 18 (2) : 131, 1965 [L20030602043]
- 8) Keller, F. et al. : Nephron 30 : 220, 1982 [L49990007431]
- 9) 柴田 清人：J Antibiot [B] 18 (2) : 126, 1965 [L49990041932]
- 10) 清水 喜八郎ほか：J Antibiot [B] 18 (2) : 82, 1965 [L20030616410]
- 11) 社内資料 [L20050325003]
- 12) Gray, J. E. et al. : Toxicol Appl Pharmacol 6 (4) : 476, 1964 [L20030616485]

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

主な外国での発売状況

ベルギー、ボスニア・ヘルツェゴビナ、チリ、フランス、イタリア、モーリタニア、メキシコ、オマーン、ペルー、南アフリカ共和国、アラブ首長国連邦（2018年7月現在）

XIII. 備考

その他の関連資料

該当資料なし

文献請求先・製品情報お問い合わせ先

ファイザー株式会社 製品情報センター
〒151-8589 東京都渋谷区代々木 3-22-7
学術情報ダイヤル 0120-664-467
FAX 03-3379-3053

製造販売

ファイザー株式会社
〒151-8589 東京都渋谷区代々木 3-22-7

