



**2019年4月改訂(第12版) 1D
*2018年6月改訂

日本標準商品分類番号 87 6132

承認番号	坐剤125	16100EMZ01723000
	坐剤250	16100EMZ01724000
薬価収載		1986年8月
販売開始		1986年10月
再審査結果		1994年3月
再評価結果		2004年9月

処方箋医薬品^(注)

合成セファロスポリン製剤 エポセリン[®]坐剤 125 エポセリン[®]坐剤 250

EPOCELIN[®] Suppositories 125 / Suppositories 250

(セフチゾキシムナトリウム坐剤)

【貯法】
室温保存
「取扱い上の注意」の項参照
【使用期限】
2年間(外箱に表示の
期限内に使用すること)

****【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】

販売名	エポセリン坐剤125	エポセリン坐剤250
成分・含量 (1個中)	日局 セフチゾキシム ナトリウム125mg(力価)	日局 セフチゾキシム ナトリウム250mg(力価)
添加物	カプリン酸ナトリウム、ハードファット	
剤形・性状	白色～帯黄白色の 紡錘形坐剤	白色～帯黄白色の 紡錘形坐剤
外形		
重量(mg)	750	1250
識別コード	CH 1E	CH 2E

【効能・効果】

〈適応菌種〉

セフチゾキシムに感性のレンサ球菌属、肺炎球菌、大腸菌、シロバクテラ属、クレブシエラ属、エンテロバクテラ属、セラチア属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、プロピデンシア属、インフルエンザ菌、ペプトストレプトコッカス属、バクテロイデス属、プレボテラ・メラノジェニカ

〈適応症〉

急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎

***【効能・効果に関連する使用上の注意】**
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」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。

【用法・用量】

通常、小児に体重kg当りセフチゾキシムとして1日20～70mg(力価)を、3～4回に分けて肛門内に挿入する。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。
- 高度の腎障害のある患者では、血中濃度が持続するので、腎障害の程度に応じて投与量を減量し、投与の間隔をあけて使用すること。

【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)

- 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
- 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(〈用法・用量に関連する使用上の注意〉の項参照)

(4)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ので、観察を十分に行うこと。]

* 2. 重要な基本的注意

本剤によるショック、アナフィラキシーの発生を確実に予知できる方法がないので、事前に既往歴等について十分な問診を行うこと。なお、抗生物質等によるアレルギー歴は必ず確認すること。

3. 相互作用

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
ワルファリンカリウム	ワルファリンカリウムの作用が増強されるおそれがある。ただし、本剤に関する症例報告はない。	腸内細菌によるビタミンKの産生を抑制することがある。
利尿剤 フロセミド等	腎障害が増強されるおそれがある。	機序は明らかではないが、他のセフェム系抗生物質で、腎障害が増強されるとの報告がある。

* 4. 副作用

承認時及び市販後の調査における総症例数4,595例中本剤によるものとして224例(4.87%)に256件の副作用及び臨床検査値の変動が報告された。副作用は下痢・軟便150件(3.26%)が最も多く、その他には肛門部痛24件(0.52%)、腹痛15件(0.33%)等がみられた。また、主な臨床検査値の変動は、AST(GOT)上昇18件(0.39%)、ALT(GPT)上昇15件(0.33%)等であった。²⁾

(再審査結果通知:1994年3月)

(1) 重大な副作用

- ショック:ショック(0.1%未満)を起こすことがあるので、観察を十分に行い、不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴、発汗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。
- アナフィラキシー:アナフィラキシー(呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等)(0.1%未満)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。
- 血液障害:汎血球減少(0.1%未満)、無顆粒球症(0.1%未満、初期症状:発熱、咽頭痛、頭痛、倦怠感等)、溶血性貧血(0.1%未満、初期症状:発熱、ヘモグロビン尿、貧血症状等)、血小板減少(0.1%未満、初期症状:点状出血、紫斑等)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。
- 肝障害:黄疸(0.1%未満)、AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-Pの上昇(各0.1～5%未満)等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。

- 5)腎障害：急性腎障害等の重篤な腎障害（0.1%未満）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)大腸炎：偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎（0.1%未満）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、適切な処置を行うこと。
- 7)間質性肺炎、PIE症候群：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（各0.1%未満）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。

(2)重大な副作用（類薬）

皮膚障害：他のセフェム系抗生物質で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報告されているので、観察を十分に行い、発熱、頭痛、関節痛、皮膚や粘膜の紅斑・水疱、皮膚の緊張感・灼熱感・疼痛等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。

(3)その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{注)}	発疹、蕁麻疹、紅斑、そう痒、発熱	リンパ腺腫脹、しびれ
血液	顆粒球減少、好酸球増多	貧血
消化器	下痢、排便感、腹痛	悪心、嘔吐
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	投与局所の疼痛	投与局所のびらん、頭痛

注)発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

5.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。（使用経験が少ない。）

* 6.臨床検査結果に及ぼす影響

- テストテープ反応を除くベネディクト試薬、フェーリング試薬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。
- 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。

7.適用上の注意

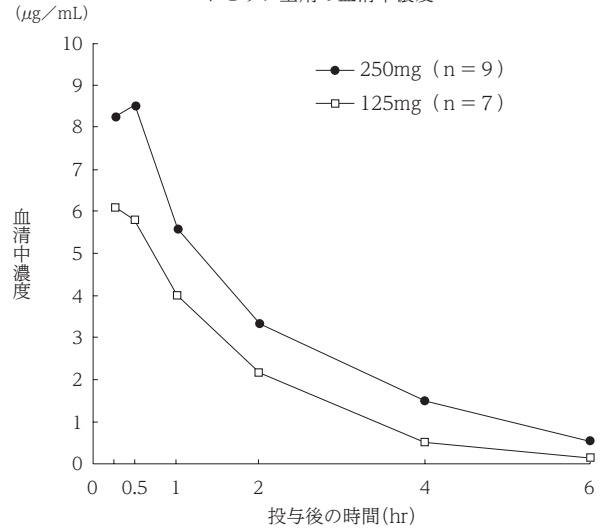
- 投与経路：本剤は直腸投与にのみ使用し、経口投与しないこと。
- 投与时：本剤はできるだけ排便後に用いること。

【薬物動態】

1.血清中濃度

患児に本剤125mg（平均11.1mg/kg）、250mg（平均15.8mg/kg）を直腸内に投与したとき、血清中濃度ピーク値はそれぞれ6.01 μ g/mL（投与15分後）、8.59 μ g/mL（投与30分後）を示した。また、血清中濃度半減期は1.21時間（125mg投与时）、1.33時間（250mg投与时）であった。³⁾

エポセリン坐剤の血清中濃度



2.組織内移行

患児に本剤250mg（平均10.4mg/kg）を直腸内投与したときの扁桃組織内濃度は2.73 μ g/g（投与30分後）であった。⁴⁾

3.尿中排泄

患児に本剤125mg（平均5.2mg/kg）、250mg（平均9.2mg/kg）を直腸内投与したときの尿中回収率（投与後6時間まで）は、それぞれ31.4%、32.2%であった。また、投与後2時間までの尿中濃度は270.8 μ g/mL（125mg投与时）、622.7 μ g/mL（250mg投与时）であった。⁵⁾

【臨床成績】

比較試験（肺炎）を含む総計321例の臨床試験の概要は以下のとおりであった。³⁾⁶⁾

1.呼吸器感染症

肺炎球菌、インフルエンザ菌等による気管支炎、肺炎に対する有効率はそれぞれ94.3%（50/53例）、96.1%（74/77例）であった。また、小児細菌性肺炎を対象としてセフトゾキシムナトリウム静注剤を対照薬にした比較試験で、本剤は静注剤と同等の有効性が確認された。

2.尿路感染症

大腸菌、クレブシエラ属等による尿路感染症（腎盂腎炎、膀胱炎）に対する有効率は92.2%（47/51例）であった。

【薬効薬理】

1.抗菌作用

(1)抗菌スペクトルはグラム陽性菌、グラム陰性菌の広範囲にわたっており、特にグラム陽性球菌ではレンサ球菌属、肺炎球菌、グラム陰性桿菌では大腸菌、クレブシエラ属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、プロビデンシア属、インフルエンザ菌等に対して強い抗菌力を示すほか、シトロバクター属、エンテロバクター属、セラチア属、ペプトストレプトコッカス属、バクテロイデス属及びプレポテラ・メラニノジェニカを含む嫌気性菌に対しても優れた抗菌力を示す。作用形式は殺菌的である。^{7)~10)}

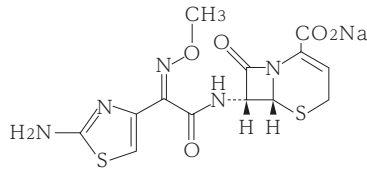
(2)各種細菌の産生する β -lactamaseに安定で、 β -lactamase産生菌にも優れた抗菌力を示す。⁷⁾¹¹⁾¹²⁾

2.作用機序

作用機序は細菌細胞壁の合成阻害であり、ペニシリン結合蛋白（PBP）の1bに最も強い親和性を有し、次いで1a、3である。また、グラム陰性菌の外膜透過性は良好である。^{13)~15)}

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：セフトゾキシムナトリウム (Ceftizoxime Sodium)
化学名：Monosodium(6R, 7R)-7-[(Z)-2-(2-aminothiazol-4-yl)-2-(methoxyimino)acetylamino]-8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylate
分子式：C₁₃H₁₂N₃NaO₅S₂
分子量：405.38
構造式：



性状：セフトゾキシムナトリウムは白色～淡黄色の結晶又は結晶性の粉末である。水に極めて溶けやすく、メタノールに溶けにくく、エタノール（95）にほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

- (1) 15℃以下で保存することが望ましい。
- (2) アルミ袋開封後は、光及び湿気により黄変することがあるため、冷暗所で保存することが望ましい。

【包装】

エポセリン坐剤125
20個
エポセリン坐剤250
20個

*【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) 厚生省薬務局：医薬品副作用情報別冊 平成5年度新医薬品等の副作用のまとめ, 1995
- 3) Jpn. J. Antibiot., **38**(10)1985 Ceftizoxime 坐剤特集 I より集計
- 4) 木下治二 他：Jpn. J. Antibiot., **38**(10)3070, 1985
- 5) 本廣 孝 他：Jpn. J. Antibiot., **38**(10)3013, 1985
- 6) 藤井良知 他：Jpn. J. Antibiot., **39**(5)1279, 1986
- 7) 渡辺邦友 他：日本化学療法学会雑誌, **28**(S-5)50, 1980
- 8) 西野武志 他：日本化学療法学会雑誌, **28**(S-5)58, 1980
- 9) 上田 泰 他：日本化学療法学会雑誌, **28**(S-5)247, 1980
- 10) 西田 実 他：日本化学療法学会雑誌, **28**(S-5)83, 1980
- 11) 三橋 進：日本化学療法学会雑誌, **28**(S-5)1, 1980
- 12) 横田 健 他：日本化学療法学会雑誌, **28**(S-5)38, 1980
- 13) 高乗 仁 他：日本化学療法学会雑誌, **28**(6)848, 1980
- 14) 横田 健 他：日本化学療法学会雑誌, **28**(S-5)44, 1980
- 15) Takata, N. et al. : Antimicrob. Agents Chemother., **19**(3)397, 1981

【文献請求先】


日本ジェネリック株式会社 お客様相談室
〒100-6739 東京都千代田区丸の内一丁目9番1号
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172

®登録商標

販売元

 **日本ジェネリック株式会社**
東京都千代田区丸の内一丁目9番1号

製造販売元

 **長生堂製薬株式会社**
徳島市国府町府中92番地