

## 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

経口用セフェム系製剤

日本薬局方セフジニルカプセル

セフゾン<sup>®</sup>カプセル50mgセフゾン<sup>®</sup>カプセル100mgCefzon<sup>®</sup> Capsules 50mg・100mg

剤形	硬カプセル剤
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	カプセル50mg：1カプセル中に日局セフジニル50mg(力価)を含有する。 カプセル100mg：1カプセル中に日局セフジニル100mg(力価)を含有する。
一般名	和名：セフジニル(JAN) 洋名：Cefdinir(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：1991年10月4日 薬価基準収載年月日：1991年11月29日 販売開始年月日：1991年12月10日
製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売：LTLファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	LTLファーマ株式会社 LTLファーマコールセンター TEL 0120-303-711 医療従事者向け情報サイト <a href="https://www.ltl-pharma.com/">https://www.ltl-pharma.com/</a>

本IFは2022年3月改訂の添付文書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。

# IF 利用の手引きの概要

—日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

## 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（<https://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て、「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・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、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を利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。

# 目次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>23</b>
1. 開発の経緯	1	1. 血中濃度の推移	23
2. 製品の治療学的特性	1	2. 薬物速度論的パラメータ	25
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 母集団（ポピュレーション）解析	26
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 吸収	26
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	5. 分布	26
6. RMPの概要	2	6. 代謝	30
		7. 排泄	31
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>3</b>	8. トランスポーターに関する情報	32
1. 販売名	3	9. 透析等による除去率	32
2. 一般名	3	10. 特定の背景を有する患者	32
3. 構造式又は示性式	3	11. その他	34
4. 分子式及び分子量	3		
5. 化学名（命名法）又は本質	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> ..	<b>35</b>
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	1. 警告内容とその理由	35
		2. 禁忌内容とその理由	35
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	35
1. 物理化学的性質	4	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	35
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	5. 重要な基本的注意とその理由	35
3. 有効成分の確認試験法、定量法	6	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	36
		7. 相互作用	37
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>7</b>	8. 副作用	38
1. 剤形	7	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	40
2. 製剤の組成	7	10. 過量投与	40
3. 添付溶解液の組成及び容量	8	11. 適用上の注意	40
4. 力価	8	12. その他の注意	40
5. 混入する可能性のある夾雑物	8		
6. 製剤の各種条件下における安定性	8	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>41</b>
7. 調製法及び溶解後の安定性	8	1. 薬理試験	41
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	8	2. 毒性試験	41
9. 溶出性	8		
10. 容器・包装	9	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>43</b>
11. 別途提供される資材類	10	1. 規制区分	43
12. その他	10	2. 有効期間	43
		3. 包装状態での貯法	43
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>11</b>	4. 取扱い上の注意	43
1. 効能又は効果	11	5. 患者向け資材	43
2. 効能又は効果に関連する注意	11	6. 同一成分・同効薬	43
3. 用法及び用量	11	7. 国際誕生年月日	43
4. 用法及び用量に関連する注意	11	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	43
5. 臨床成績	11	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	43
		10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	44
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>17</b>		
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	17		
2. 薬理作用	17		

## 目次

---

11. 再審査期間	44
12. 投薬期間制限に関する情報	44
13. 各種コード	45
14. 保険給付上の注意	45
<b>X I . 文献</b>	<b>46</b>
1. 引用文献	46
2. その他の参考文献	47
<b>X II . 参考資料</b>	<b>48</b>
1. 主な外国での発売状況	48
2. 海外における臨床支援情報	48
<b>X III . 備考</b>	<b>49</b>
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	49
2. その他の関連資料	49

## 略語表

略語	フルスペル	略語内容
ADP	adenosine diphosphate	アデノシン二リン酸
Al-P	alkaline phosphatase	アルカリホスファターゼ
ALT	alanine aminotransferase	アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	aspartate aminotransferase	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
AUC	area under the curve	曲線下面積
BUN	blood urea nitrogen	血中尿素窒素
CAPD	Continuous ambulatory peritoneal dialysis	持続携行式腹膜透析
Ccr	creatinine clearance	クレアチニークリアランス
Cmax	maximum concentration	最高血中濃度
CRP	C-reactive protein	C反応性タンパク
FDA	Food and Drug Administration	食品医薬品局
ID <sub>50</sub>	50% inhibitory dose	<sup>14</sup> C-PCGの結合を50%阻止させる被検薬濃度
Ki	inhibition constant	阻害定数
Km	michaelis constant	ミカエリス定数
LD <sub>50</sub>	Lethal dose 50	50%致死量
MBC	Minimum bactericidal concentration	最小殺菌濃度
MIC	Minimum inhibitory concentration	最小発育阻止濃度
MSSA	Methicillin-sensitive <i>Staphylococcus aureus</i>	メチシリン感受性黄色ブドウ球菌
OAT	organic anion transport protein	有機アニオントランスポーター
PBP	Penicillin binding protein	ペニシリン結合蛋白
PRSP	Penicillin-resistant <i>Streptococcus pneumoniae</i>	ペニシリン耐性肺炎球菌
PSSP	Penicillin-sensitive <i>Streptococcus pneumoniae</i>	ペニシリン感受性肺炎球菌
RMP	risk management plan	医薬品リスク管理計画
S-Cr	serum creatinine	血清クレアチニン
t <sub>1/2</sub>	half life	半減期
TLC	thin-layer chromatography	薄層クロマトグラフィー
Tmax	time to maximum concentration	最高血中濃度到達時間

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

セフゾン<sup>®</sup>は藤沢薬品(現アステラス)研究所において開発された経口用セフェム系抗生物質で、7-アミノセファロスポラン酸の3位にビニル基を、7位に2-アミノチアゾリルヒドロキシイミノ基を有する。

本剤は各種β-lactamaseに安定で、グラム陽性菌・陰性菌に対し広範囲な抗菌スペクトルを有し、各種グラム陰性菌の他、特にブドウ球菌属、レンサ球菌属等グラム陽性菌に対し、既存の経口用セフェム剤に比べ優れた抗菌力を示し、その作用は殺菌的である。

非臨床試験から安全性と有効性が推定されたため、1986年より健康成人を対象に第I相試験を開始した。その結果、忍容性は問題なく、また、血漿中及び尿中濃度と抗菌力の関係より臨床的有用性が期待されたため、引き続き臨床試験へ移行した。各種感染症における基礎的・臨床的検討が行われた結果、本剤の感性菌による各種感染症に対し優れた有用性が確認され、1991年10月4日に承認を得た。1991年より使用成績調査を実施し11,352例を収集し、1997年12月に再審査申請を行った結果、1999年3月「薬事法第14条第2項各号(承認拒否事由)のいずれにも該当しない」との再審査結果を得た。

また、抗菌剤について、薬事法第14条の5の規定による再評価が行われ、2004年9月に再評価結果が通知された。そして、「効能・効果」を一部改めることにより、薬事法第14条の第2項各号(承認拒否事由)のいずれにも該当しないことが確認され、再評価結果に合わせて、「効能・効果」等の一部変更した。セフジニルカプセルは、第15改正日本薬局方(2006)より収載された。

2019年4月1日、LTLファーマ株式会社はセフゾンカプセル50mg、同100mgの製造販売承認を承継した。

## 2. 製品の治療学的特性

(1)メチシリン感受性黄色ブドウ球菌、化膿レンサ球菌、肺炎球菌、インフルエンザ菌、大腸菌など急性感染症の主要起炎菌に優れた抗菌力を発揮する。

(「VI. 2. (1)作用部位・作用機序」の項参照)

(2)上気道感染症をはじめ、各種の急性感染症に幅広い効能又は効果が認められている。

(「V. 1. 効能又は効果」の項参照)

(3)各科領域感染症に優れた臨床効果を示す。

(「V. 5. 臨床成績」の項参照)

(4)総症例13,715例中354例(2.58%)に臨床検査値異常変動を含む副作用が認められた。その副作用症状は、下痢、腹痛等の消化器症状110例(0.80%)、発疹、そう痒感等の皮膚症状31例(0.23%)等であった。また、主な臨床検査値異常変動は、ALT(GPT)上昇126件(0.92%)、AST(GOT)上昇89件(0.65%)、好酸球増多41件(0.30%)等であった。

重大な副作用としてショック、アナフィラキシー、皮膚障害、血液障害、大腸炎、間質性肺炎、PIE症候群、腎障害、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸が報告されている。

(再審査結果通知：1999年3月)

(「VIII. 8. 副作用」の項参照)

## 3. 製品の製剤学的特性

特になし

## 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、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
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

I. 概要に関する項目

---

**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

セフゾンカプセル 50mg、セフゾンカプセル 100mg

(2) 洋名

Cefzon Capsules 50mg、Cefzon Capsules 100mg

(3) 名称の由来

特になし

### 2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

セフジニル (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

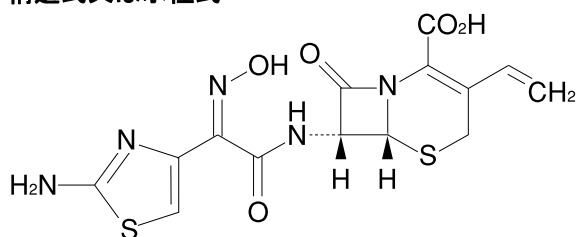
Cefdinir (JAN)

cefdinir (INN)

(3) ステム

抗生物質、セファロsporin酸誘導体 : cef-

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式 : C<sub>14</sub>H<sub>13</sub>N<sub>5</sub>O<sub>5</sub>S<sub>2</sub>

分子量 : 395.41

### 5. 化学名 (命名法) 又は本質

(6*R*,7*R*)-7-[(*Z*)-2-(2-Aminothiazol-4-yl)-2-(hydroxyimino)acetylamino]-8-oxo-3-vinyl-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylic acid (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号 : CFDN (日本化学療法学会制定)

開発番号 : FK482

### 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～淡黄色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

水、エタノール (95)又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。pH7.0 の 0.1mol/L リン酸塩緩衝液に溶ける。

測定温度：20±5℃

溶媒	セフジニル1gを溶解する のに要する溶媒量 (mL)	日本薬局方の 溶解性の表現
炭酸水素ナトリウム溶液(1→50)	12	やや溶けやすい
水	10000以上	ほとんど溶けない
エタノール(95)	10000以上	ほとんど溶けない
ジエチルエーテル	10000以上	ほとんど溶けない

溶解度37℃：pH1.2：1.94mg/mL、pH4.0：0.988mg/mL、pH6.8：5.03mg/mL、水：0.381mg/mL

(3) 吸湿性

25℃、相対湿度 75%において、ほとんど吸湿性は認められない。

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

融点：不明瞭。150℃付近から黄色味を帯び、その後徐々に褐色味を増し、220℃付近で黒色となり分解する。

(5) 酸塩基解離定数

pKa<sub>1</sub>：1.9 (カルボキシル基)、pKa<sub>2</sub>：3.3 (アミノ基)、pKa<sub>3</sub>：9.9 (ヒドロキシイミノ基)

(6) 分配係数

4.0×10<sup>-2</sup> (1-オクタノール/水系)

(7) その他の主な示性値

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>20</sup>：-58～-66° (0.25g、pH7.0 の 0.1mol/L リン酸塩緩衝液、25mL、100mm)

吸光度 E<sub>1cm</sub><sup>1%</sup> (287nm)：570～610 (0.05g、pH7.0 の 0.1mol/L リン酸塩緩衝液、5000mL)

pH：2.5～4.5 (飽和水溶液)

Ⅲ. 有効成分に関する項目

2. 有効成分の各種条件下における安定性

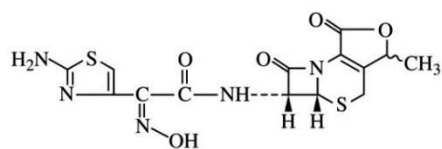
試験	保存条件		保存形態	保存期間	結果 (保存期間最終時点)
長期保存試験	室温		ポリエチレン袋 ースチール缶 包装	27 箇月	類縁物質量の増加(規格内)、TLC で分解物の生成(±)を認める以外変化なし。
加速試験	40°C、75%RH			6 箇月	褐色味を帯び、異臭、力価の低下(いずれも規格内)、TLC で分解物の生成(±~+)及び類縁物質量の増加(規格内)を認める。
苛酷試験	熱	40°C		ガラス瓶 (開放)	6 箇月
		30°C	12 箇月		TLC 上で変化(±)を認める以外変化なし。
	湿度	30°C、75%RH	3 箇月	黄色味の増加、水分量及び類縁物質量の増加(いずれも規格内)及び TLC 上で変化(±)を認める以外変化なし。	
	光	1000lx	シャーレ (開放)	40 日	黄色味の増加、類縁物質量の増加(いずれも規格内)を認める以外変化なし。
強制劣化試験	固体状態	熱 (80°C)	バイアル瓶 (密封)	6 週	褐色味を帯び、類縁物質量の増加(いずれも規格内)、TLC 上での変化(±~+)を認める。
		光 (30000lx)	シャーレ (開放)	4 週	褐色味を帯び、力価の低下、類縁物質量の増加(いずれも規格内)及び TLC 上での変化(+)を認める。
	溶液状態 (遮光及び 500lx)	pH1.0 の 緩衝液	濃度：1mg/mL 無色透明 バイアル(密封) 〔遮光条件はアル ミラッピング〕	3 日	露光条件で、経時的に力価の低下、類縁物質量の増加及び TLC 上での変化(+)を認める。
		pH6.0 の 緩衝液		21 日	遮光及び露光とも、経時的に黄色味の増加、力価の低下、類縁物質量の増加及び TLC 上での変化(±~+)を認める。なお、pH6 の液性が遮光及び露光とも、他の条件より比較的安定であった。
		pH9.0 の 緩衝液		8 時間	露光条件で、経時的に黄色味の増加、力価の低下、類縁物質量の増加及び TLC 上での変化(±)を認める。

測定項目：性状、類縁物質、水分、力価、TLC (薄層クロマトグラフィー：参考試験 一、±、+で評価)

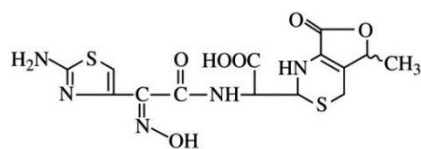
### Ⅲ. 有効成分に関する項目

強制劣化(固体状態)による主たる生成物

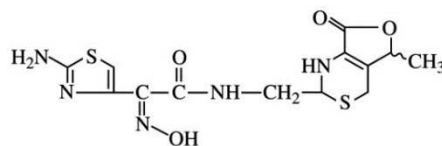
(1) 熱(80℃)・6週間



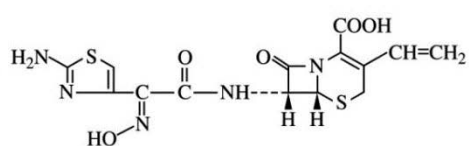
類縁物質 I



類縁物質 II



類縁物質 III



類縁物質 IV

(2) 光(約 30000lx)・4週間

類縁物質 I、II、VII

### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

日局「セフジニル」の確認試験法による。

定量法

日局「セフジニル」の定量法による。

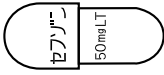
## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

(1) 剤形の区別

硬カプセル剤

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	剤形	色調	外形・号数・質量	
セフゾンカプセル50mg	硬カプセル剤	淡赤色		
			号数	質量
			5号	約90mg
セフゾンカプセル100mg	硬カプセル剤	淡赤色		
			号数	質量
			4号	約160mg

(3) 識別コード

セフゾンカプセル 50mg : —

セフゾンカプセル 100mg : **LT 022** (カプセル、PTPシート記載)

(4) 製剤の物性

崩壊試験

販売名	崩壊試験	
	日局第1液	水
セフゾンカプセル50mg	2～3分	2～3分
セフゾンカプセル100mg	2～3分	2～3分

(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

販売名	有効成分	添加剤
セフゾンカプセル 50mg	日局 セフジニル 50mg (力価) (1 カプセル中)	カルメロースカルシウム、ステアリン酸ポリオキシシル40、ステアリン酸マグネシウム、ゼラチン、ラウリル硫酸ナトリウム
セフゾンカプセル 100mg	日局 セフジニル 100mg (力価) (1 カプセル中)	

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

#### IV. 製剤に関する項目

##### 3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

##### 4. 力価

セフジニルの 1mg は 1mg(力価)を含有する。

##### 5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

##### 6. 製剤の各種条件下における安定性

(50mg、100mg カプセル)

試験	保存条件		保存形態	保存期間	結果 (保存期間最終時点)
長期保存試験	25°C、60%RH		PTP包装及び ポリエチレン瓶包装	24箇月	変化なし。
苛酷試験	熱	40°C	PTP包装	6箇月	内容物が帯褐白色に変化し、力価の低下(規格内)、TLCにおいて分解物の生成(±)を認める以外変化なし。
		30°C		12箇月	力価の低下(規格内)及びTLCにおいて分解物の生成(±)を認める以外変化なし。
	湿度	30°C、75%RH	ポリエチレン瓶 (開放)	3箇月	乾燥減量の増加(規格内)及びTLCにおいて分解物の生成(±)を認める以外変化なし。
	光	1000lx	シャーレ(開放)	40日	変化なし。

測定項目：性状、溶出性、乾燥減量、類縁物質、含量、TLC (薄層クロマトグラフィー：参考試験 ー、±、+で評価)

##### 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 (物理化学的变化)

該当しない

##### 9. 溶出性

〈セフジニルカプセル 50mg〉

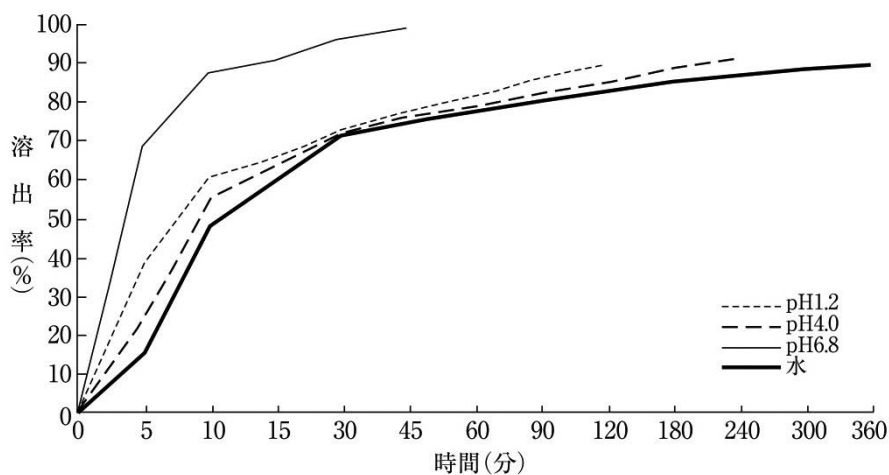
方 法：日局溶出試験法第 2 法 (シンカーを用いる)

条 件：回転数 50rpm

試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水

溶出率：30 分間で 80%以上

#### IV. 製剤に関する項目



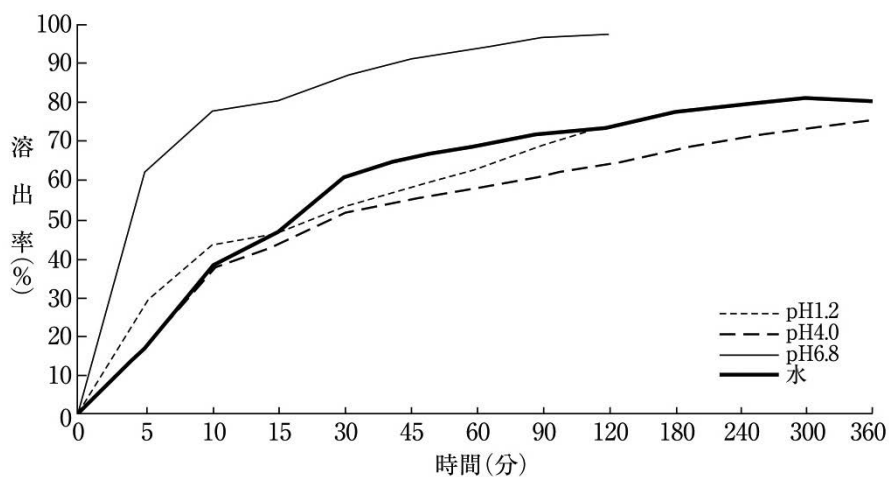
〈セフジニルカプセル 100mg〉

方 法：日局溶出試験法第2法（シンカーを用いる）

条 件：回転数 50rpm

試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水

溶出率：45分間で75%以上



#### 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

〈セフゾンカプセル 50mg〉

100 カプセル [10 カプセル(PTP)×10]

〈セフゾンカプセル 100mg〉

100 カプセル [10 カプセル(PTP)×10]

500 カプセル [10 カプセル(PTP)×50]

(3) 予備容量

該当しない

#### IV. 製剤に関する項目

---

(4) 容器の材質

PTP シート：表－ポリ塩化ビニル、裏－アルミニウム

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

#### 〈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、モラクセラ(ブランハメラ)・カタラーリス、大腸菌、クレブシエラ属、プロテウス・ミラビリス、プロビデンシア属、インフルエンザ菌、ペプトストレプトコッカス属、アクネ菌

#### 〈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、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、肛門周囲膿瘍、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、膀胱炎、腎盂腎炎、尿道炎、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、麦粒腫、瞼板腺炎、外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

### 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、急性気管支炎、中耳炎、副鼻腔炎〉

「抗微生物薬適正使用の手引き」<sup>1)</sup>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)

抗微生物薬の適正使用の推進を目的として、平成29年6月1日に厚生労働省健康局結核感染症課より「抗微生物薬適正使用の手引き第一版」<sup>1)</sup>が発出された。これを受け、平成30年3月27日付で厚生労働省医薬・生活衛生局医薬安全対策課長通知(抗微生物薬の「使用上の注意」の改訂について)が発出されたため、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、感染性腸炎又は副鼻腔炎のいずれかの効能又は効果を有する抗微生物薬について、「抗微生物薬適正使用の手引き」に基づき適正使用がなされるよう、「効能又は効果に関連する注意」の項を新設し、注意喚起することとした。

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

通常、セフジニルとして成人1回100mg(力価)を1日3回経口投与する。  
なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

「V. 5. (3) 用量反応探索試験、(4) 検証的試験」の項参照

### 4. 用法及び用量に関連する注意

#### 7. 用法及び用量に関連する注意

血液透析患者では1日100mg 1回投与が望ましい。[9.2.1、16.6.2 参照]

#### (解説)

血液透析患者では1日1回100mg 投与で十分な臨床効果が期待できると考えられる。

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当しない

## V. 治療に関する項目

### (2) 臨床薬理試験

第Ⅰ相試験として健康成人男子 30 例を対象にセフジニル 50～200mg の単回投与試験<sup>2,\*)</sup>、1 回 100mg、1 日 3 回、3 日間の連続投与試験<sup>\*)</sup> 及び 1 回 200mg<sup>注)</sup>、1 日 3 回、15 日間の連続投与試験<sup>2)</sup> を実施し、忍容性を検討した。その結果、軽度の副作用及び臨床検査値異常変動がみられたが、第Ⅱ相試験への移行は可能と判断された。  
(\* : 未公表資料)

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

### (3) 用量反応探索試験

下記「(4) 1) ①無作為化並行用量反応試験」の項参照

### (4) 検証的試験

#### 1) 有効性検証試験

##### ①無作為化並行用量反応試験（後期第Ⅱ相臨床用量検討試験）

##### i) 浅在性化膿性疾患<sup>3)</sup>

浅在性化膿性疾患(111 例)を対象にセフジニル 150mg/日<sup>注)</sup>及び 300mg/日、対照薬 750mg/日を 7 日間経口投与し有効性並びに安全性を比較検討した。なお、セフジニルの 2 用量間は二重盲検法とし、セフジニルと対照薬間是非盲検法とした。有効率はセフジニル 150mg 群 91.2% (31/34)、300mg 群 88.2% (30/34)、対照薬 750mg 群 84.8% (28/33)であり 3 薬剤群間に有意差は認められなかった。副作用はそれぞれ 5.6% (2/36)、5.4% (2/37)、11.4% (4/35)に認められた。

##### ii) 肺炎<sup>4)</sup>

肺炎(87 例)を対象にセフジニル 300mg/日及び 600mg/日<sup>注)</sup>を 14 日間経口投与し、有効性並びに安全性を二重盲検法により比較検討した。有効率はセフジニル 300mg/日群 93.8% (28/32)、600mg/日群 78.4% (29/37)で 300mg/日群が有意に優れていた。副作用はそれぞれ 2.6% (1/39)、4.8% (2/42)に認められた。

##### iii) 複雑性尿路感染症<sup>5)</sup>

複雑性尿路感染症 (151 例)を対象にセフジニル 300mg/日及び 600mg/日<sup>注)</sup>、対照薬 1,500mg/日を 5 日間経口投与し有効性並びに安全性を比較検討した。なお、セフジニルの 2 用量間は二重盲検法とし、セフジニルと対照薬間是非盲検法とした。有効率はセフジニル 300mg 群 78.1% (25/32)、600mg 群 80.6% (29/36)、対照薬 1,500mg 群 78.1% (25/32)であり 3 薬剤群間に有意差は認められなかった。副作用はそれぞれ 4.1% (2/49)、3.9% (2/51)、2.0% (1/49)に認められた。

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

V. 治療に関する項目

②比較試験（第Ⅲ相二重盲検比較試験）

浅在性化膿性疾患(300例)<sup>6)</sup>、肺炎(211例)<sup>7)</sup>、複雑性尿路感染症(298例)<sup>8)</sup>を対象に対照薬と二重盲検比較試験を実施した。

対象疾患	浅在性化膿性疾患		肺炎		複雑性尿路感染症	
	セフジニル	対照薬	セフジニル	対照薬	セフジニル	対照薬
用法・用量	300 (mg/日)	750 (mg/日)	300 (mg/日)	1,500 (mg/日)	600 <sup>注)</sup> (mg/日)	1,500 (mg/日)
	7～10日間経口投与		14日間経口投与		5日間経口投与	
臨床効果*	117/131 (89.3)	105/134 (78.4)	70/85 (82.4)	67/81 (82.7)	78/95 (82.1)	87/107 (81.3)
[検定]	[P<0.01 : U]		[N.S.]		[N.S.]	
細菌学的効果**	78/86 (90.7)	66/79 (83.5)	13/15 (86.7)	24/27 (88.9)	137/151 (90.7)	142/167 (85.0)
[検定]	[N.S.]		[N.S.]		[N.S.]	
有用性***	83/93 (89.2)	75/105 (71.4)	63/81 (77.8)	64/78 (82.1)	有用性のスコア平均値 77.3±27.3 73.8±30.8	
[検定]	[P<0.01 : U]		[N.S.]		[N.S.]	
副作用	9/142 (6.3)	4/145 (2.8)	5/102 (4.9)	3/96 (3.1)	7/147 (4.8)	6/147 (4.1)
[検定]	[N.S.]		[N.S.]		[N.S.]	

\* 臨床効果：著効・有効例/臨床効果判定例(潜在性化膿性疾患には急性二次感染、肺炎には非細菌性肺炎を含む)

\*\* 細菌学的効果：消失・菌交代例/細菌学的効果判定例、又は消失菌株数/検出菌株数

\*\*\* 有用性：極めて有用・有用例/有用性判定例、又は非常に満足(100)・非常に不満(0)としたスコアの平均値

i) 国内二重盲検比較試験

二重盲検比較試験(浅在性化膿性疾患)において本剤の有用性が認められている<sup>6)</sup>。

疾患名		有効例/症例数	有効率(%)
皮膚感染症	表在性皮膚感染症	26/29	89.7
	毛嚢(包)炎	17/20	85.0
	伝染性膿痂疹	9/9	—
	深在性皮膚感染症	39/41	95.1
	せつ、せつ腫症、よう	21/22	95.5
	丹毒、蜂巣炎、ひょう疽、 化膿性爪囲(廓)炎	18/19	94.7
	リンパ管・リンパ節炎	9/9	—
慢性膿皮症(皮下膿瘍、汗腺炎、 感染性粉瘤、慢性膿皮症)	27/34	79.4	
合計	101/113	89.4	

副作用は142例中9例(6.3%)11件に認められた。副作用の内訳は胃部不快感4例、下痢、軟便、胃もたれ感、嘔気、腹痛、アフタ性口内炎、蕁麻疹各1例であった。

本剤300mg(力価)/日を7～10日間投与。

## V. 治療に関する項目

### ii) 国内二重盲検比較試験

二重盲検比較試験(肺炎)において本剤の有用性が認められている<sup>7)</sup>。

疾患名		有効例/症例数	有効率(%)
呼吸器感染症	肺炎	64/72	88.9

副作用は102例中5例(4.9%)5件に認められた。副作用の内訳は、皮膚炎2例、発疹、胃部不快感、下痢各1例であった。

本剤300mg(力価)/日を14日間投与。

### iii) 国内二重盲検比較試験

二重盲検比較試験(複雑性尿路感染症)において本剤の有用性が認められている<sup>8)</sup>。

疾患名		有効例/症例数	有効率(%)
尿路感染症	膀胱炎	62/75	82.7
	腎盂腎炎	16/20	80.0
合計		78/95	82.1

副作用は147例中7例(4.8%)10件に認められた。副作用の内訳は、下痢5例、嘔気2例、胸部不快感、全身倦怠感、掻痒感各1例(重複症例あり)であった。

本剤600mg<sup>注)</sup>(力価)/日を5日間投与。

注)本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人1回100mg(力価)を1日3回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

## 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

#### ①使用成績調査<sup>9)</sup>

2,448施設から11,352例を収集した。

有効性の判定は、「著明改善、改善、やや改善、不変、悪化」の5段階で行い、「改善」以上の症例を「有効例」として有効率を算出した。有効性解析対象症例9,449例における使用理由別の有効率は、次表に示すように82.5~100%であり、全適応疾患でみると89.8%(8,428/9,388)であった。また、安全性について、臨床検査値の異常を含む副作用発現率は1.12%(124/11,082)であった。副作用の種類別では、AST(GOT)上昇・ALT(GPT)上昇等の肝臓・胆管系障害(0.51%)、下痢等の消化管障害(0.39%)が多く、ついで発疹などの皮膚・皮膚付属器器官障害、Al-P上昇の代謝・栄養障害などが認められた。

## V. 治療に関する項目

使用理由	有効率 (%)	使用理由	有効率 (%)
表在性皮膚感染症	187/202 (92.6)	急性気管支炎	1,255/1,420 (88.4)
毛嚢(包)炎	126/138 (91.3)	肺炎	305/369 (82.7)
伝染性膿痂疹	61/64 (95.3)	膀胱炎	1,537/1,691 (90.9)
深在性皮膚感染症	— (—)	腎盂腎炎	186/209 (89.0)
せつ、せつ腫症、よう	227/243 (93.4)	尿道炎(淋菌性尿道炎)	75/75 (100)
丹毒、蜂巣炎、ひょう疽、 化膿性爪囲(廓)炎	363/404 (89.9)	バルトリン腺炎	89/98 (90.8)
		子宮内感染	92/98 (93.9)
		子宮付属器炎	68/75 (90.7)
リンパ管・リンパ節炎		麦粒腫	184/207 (88.9)
慢性膿皮症 (皮下膿瘍、汗腺 炎、感染性粉瘤、慢性膿皮症)	489/526 (93.0)	瞼板腺炎	43/44 (97.7)
		外耳炎	114/129 (88.4)
		中耳炎	411/498 (82.5)
外傷・熱傷及び手術創等の二 次感染	215/240 (89.6)	副鼻腔炎	226/272 (83.1)
		歯周組織炎	163/178 (91.6)
乳腺炎	74/76 (97.4)	歯冠周囲炎	40/43 (93.0)
肛門周囲膿瘍	66/72 (91.7)	顎炎	144/156 (92.3)
咽頭・喉頭炎、扁桃炎	1,875/2,063 (90.9)	合計	8,428/9,388 (89.8)

### ②特別調査

#### i) 細菌感受性調査

セフジニルの承認時の感受性を対照として5年間にわたって3回の調査をした結果、ほとんどの菌種において感受性の変動は認められなかった。*S.pneumoniae* に関しては、ペニシリン耐性菌(PRSP)が増加傾向にあり、PRSPが33/95株(34.7%)を占めたため感受性は低下した。しかし、これらのPRSPに対するセフジニルのMICの上限は6.25 $\mu$ g/mLであり、耐性化は認められなかった。

グラム陰性菌においては、セフジニル感受性分布にほとんど変化はなかったが、耐性傾向を示した株は染色体由来あるいはTEM型と推定されるプラスミド由来の $\beta$ -lactamaseを産生しており、開発当初に知られていなかった機作で耐性化していると考えられる株はなかった。

#### ii) 妊婦に対する調査

収集した113例のうち、分娩調査解析対象の48例について解析を行った。分娩異常の発現頻度が37.5%と高かったが、帝王切開等そのほとんどが産科的原因によるものであり、対象患者にハイリスク妊婦が多かったことが原因と考えられた。一方、新生児の出生体重及び身長は一般の分布と同様であったが、異常発現頻度は22.4%と高かった。しかし、これは三胎の早産等、前述の分娩異常に起因するものと考えられた。

#### iii) 血液透析患者におけるセフゾンの体内動態の検討

「VII. 10. (1) 腎機能障害患者」の項参照

### ③市販後臨床試験

実施していない。

## 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

## V. 治療に関する項目

### (7) その他

1,638 例の一般臨床試験における成績概要は次のとおりである。なお、一般臨床試験における 1 日投与量は主として 300mg(力価)(食後分 3)であり、最大 600mg<sup>注)</sup>(力価)(食後分 3)であった。

疾患名		有効例/症例数	有効率 (%)
皮膚感染症	表在性皮膚感染症	22/25	88.0
	毛嚢(包)炎	20/23	87.0
	伝染性膿痂疹	2/2	—
	深在性皮膚感染症	96/110	87.3
	せつ、せつ腫症、よう	46/52	88.5
	丹毒、蜂巣炎、ひょう疽、化膿性爪囲(廓)炎	50/58	86.2
	リンパ管・リンパ節炎	13/14	92.9
慢性膿皮症(皮下膿瘍、汗腺炎、感染性粉瘤、慢性膿皮症)	91/107	85.0	
外科領域感染症	外傷・熱傷及び手術創等の二次感染	31/36	86.1
	乳腺炎	11/13	84.6
	肛門周囲膿瘍	12/12	100
呼吸器感染症	咽頭・喉頭炎	27/31	87.1
	扁桃炎	65/67	97.0
	急性気管支炎	108/133	81.2
	肺炎	139/174	79.9
尿路感染症	膀胱炎	271/327	82.9
	腎盂腎炎	60/76	78.9
	尿道炎(淋菌性尿道炎)	45/45	100
婦人科感染症	バルトリン腺炎	37/40	92.5
	子宮内感染	69/78	88.5
	子宮付属器炎	21/25	84.0
眼科領域感染症	麦粒腫	18/18	100
	瞼板腺炎	11/14	78.6
耳鼻科感染症	外耳炎	22/26	84.6
	中耳炎	43/60	71.7
	副鼻腔炎	23/33	69.7
歯科口腔外科感染症	歯周組織炎	54/59	91.5
	歯冠周囲炎	35/40	87.5
	顎炎	69/75	92.0
合計		1,393/1,638	85.0

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

## 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

セフェム系抗生物質

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

細菌の細胞壁合成阻害であり、ペプチドグリカン架橋酵素であるペニシリン結合蛋白(PBP)と強く結びつき、架橋反応を阻害する。その作用点は菌種により異なるが、PBP の 1(1a、1bs)、2 及び 3 に親和性が高い<sup>10,11)</sup>。

その作用は殺菌的であり<sup>11-15)</sup>、また食細胞、血清補体等生体防御因子と協力的に作用する<sup>10,11)</sup>。

#### 1) 抗菌スペクトル(標準菌株) (*in vitro*)<sup>12-16)</sup>

標準菌株	好気性菌の抗菌スペクトル <sup>14)</sup> (10 <sup>6</sup> cells/mL)			
	MIC (µg/mL)			
	セフジニル	セフィキシム	セファクロル	アモキシシリン
<b>グラム陽性菌</b>				
<i>Staphylococcus aureus</i> 209-PJC	0.05	25	0.78	0.10
<i>Staphylococcus aureus</i> Smith	0.20	12.5	0.78	0.20
<i>Staphylococcus aureus</i> Terajima	0.20	25	6.25	0.39
<i>Staphylococcus aureus</i> Neumann	0.20	12.5	1.56	0.20
<i>Staphylococcus aureus</i> E-46	0.20	6.25	1.56	0.20
<i>Staphylococcus aureus</i> No.80	0.20	12.5	1.56	0.20
<i>Staphylococcus epidermidis</i>	1.56	>100	1.56	0.39
<i>Streptococcus pyogenes</i> S-23	0.012	0.10	0.10	0.012
<i>Streptococcus pyogenes</i> Cook	0.012	0.10	0.20	0.012
<i>Streptococcus pyogenes</i> C-203	≤0.006	0.10	0.025	≤0.006
<i>Enterococcus faecalis</i>	50	>100	25	0.78
<i>Viridans group Streptococcus</i>	50	>100	25	0.78
<i>Streptococcus pneumoniae</i> type I	0.05	0.20	0.39	0.39
<i>Streptococcus pneumoniae</i> type II	0.05	0.20	0.39	≤0.006
<i>Streptococcus pneumoniae</i> type III	0.025	0.20	0.78	0.025
<i>Corynebacterium diphtheriae</i>	0.20	25	0.39	0.20
<i>Corynebacterium diphtheriae</i> Toronto	0.012	≤0.006	≤0.006	≤0.006
<i>Micrococcus luteus</i> ATCC 9341	0.025	1.56	0.025	≤0.006
<i>Bacillus subtilis</i> ATCC 6633	0.05	0.78	0.05	0.012
<i>Bacillus anthracis</i>	1.56	>100	0.39	0.012
<b>グラム陰性菌</b>				
<i>Neisseria gonorrhoeae</i>	≤0.006	≤0.006	0.10	0.10
<i>Neisseria meningitidis</i>	≤0.006	≤0.006	0.20	0.05
<i>Escherichia coli</i> NIHJC-2	0.39	0.39	1.56	6.25
<i>Escherichia coli</i> NIH	0.10	0.39	0.78	6.25
<i>Escherichia coli</i> K-12	0.10	0.20	0.78	3.13
<i>Escherichia coli</i> KC-14	0.20	0.39	0.78	6.25
<i>Citrobacter freundii</i> NIH 10018-68	100	50	>100	>100
<i>Klebsiella pneumoniae</i> NCTC 9632	0.10	0.025	0.39	50
<i>Klebsiella pneumoniae</i> KC-1	0.10	0.025	0.39	0.78
<i>Klebsiella pneumoniae</i> DT-S	0.10	0.05	0.39	0.78
<i>Enterobacter cloacae</i> NCTC 9394	6.25	1.56	>100	>100
<i>Enterobacter aerogenes</i> NCTC 10006	12.5	6.25	>100	>100
<i>Enterobacter aerogenes</i>	0.20	0.05	50	100
<i>Hafnia alvei</i> NCTC 9540	3.13	0.78	100	100
<i>Serratia marcescens</i> IFO 37361	3.13	0.20	>100	50
<i>Serratia marcescens</i> T-55	6.25	0.78	>100	25
<i>Proteus vulgaris</i> OX-19	0.39	≤0.006	25	50
<i>Proteus mirabilis</i> 1287	0.10	≤0.006	0.78	0.39
<i>Proteus mirabilis</i> 181	0.10	≤0.006	1.56	1.56
<i>Morganella morganii</i> Kono	3.13	0.39	100	>100
<i>Providencia rettgeri</i> NIH 96	≤0.006	≤0.006	0.20	0.39
<i>Providencia stuartii</i> NIH 118	0.05	≤0.006	6.25	100
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> No.12	>100	50	>100	>100
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> Nc-5	>100	100	>100	>100
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> E-2	>100	100	>100	>100
<i>Haemophilus influenzae</i> ATCC 10211	0.20	0.012	0.78	0.20
<i>Acinetobacter calcoaceticus</i> Ac-54	1.56	6.25	12.5	12.5
<i>Alcaligenes faecalis</i> IFO 1311	1.56	3.13	0.78	6.25

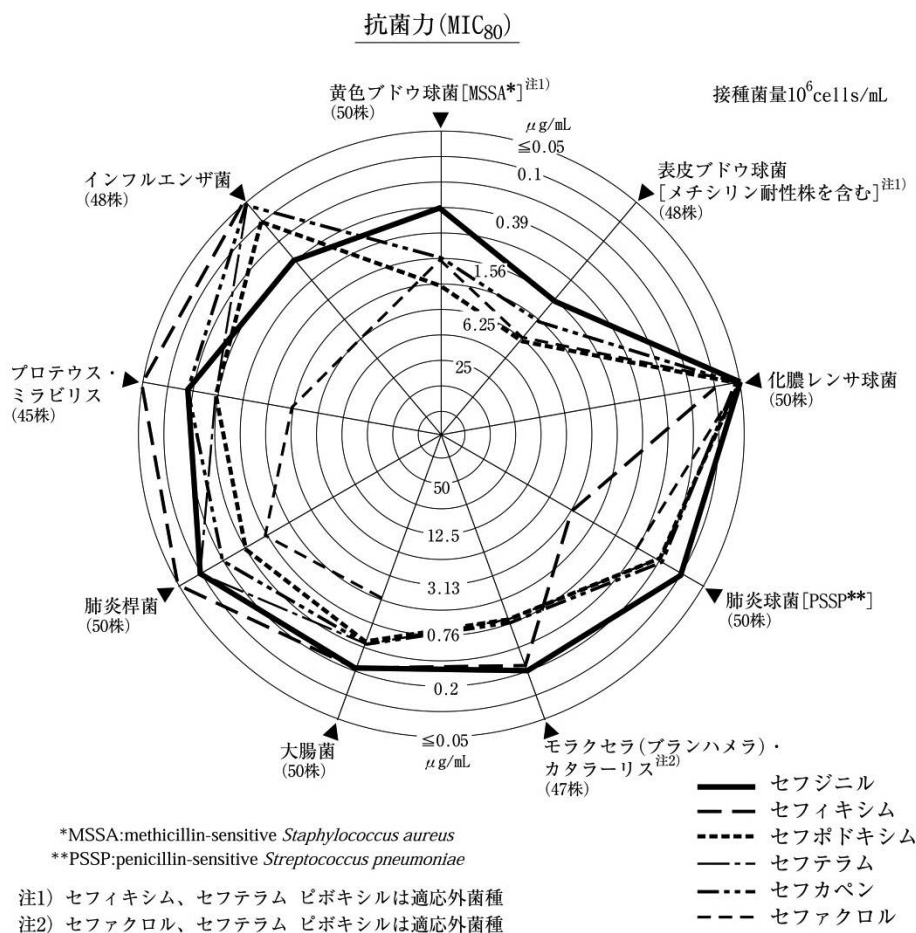
VI. 薬効薬理に関する項目

標準菌株	嫌気性菌の抗菌スペクトル <sup>15)</sup> (10 <sup>6</sup> cells/mL)			
	MIC (µg/mL)			
	セフジニル	セフィキシム	セファクロル	アモキシシリン
<b>グラム陽性菌</b>				
<i>Peptostreptococcus anaerobius</i> ATCC 27337	0.78	3.13	0.39	0.39
<i>Peptostreptococcus magnus</i> ATCC 29328	0.20	6.25	1.56	0.20
<i>Peptostreptococcus asaccharolyticus</i> WAL 3218	0.10	0.78	1.56	0.20
<i>Peptostreptococcus prevotii</i> ATCC 9321	0.05	0.78	0.39	≦0.025
<i>Streptococcus intermedius</i> ATCC 27335	0.39	3.13	1.56	0.39
<i>Staphylococcus saccharolyticus</i> ATCC 13953	≦0.025	3.13	0.10	≦0.025
<i>Propionibacterium acnes</i> ATCC 11828	0.39	1.56	3.13	0.78
<i>Bifidobacterium adolescentis</i> ATCC 15703	0.39	6.25	3.13	0.20
<i>Eubacterium lentum</i> ATCC 25559	25	>200	50	3.13
<i>Clostridium perfringens</i> GAI 5526	0.78	6.25	1.56	0.20
<i>Clostridium ramosum</i> ATCC 25582	0.39	0.78	0.10	≦0.025
<i>Clostridium septicum</i> ATCC 12464	3.13	>200	0.05	0.05
<i>Clostridium difficile</i> GAI 10029	6.25	25	50	25
<i>Clostridium difficile</i> GAI 10038	25	>200	50	0.78
<b>グラム陰性菌</b>				
<i>Bacteroides fragilis</i> GAI 0558	>200	>200	>200	>200
<i>Bacteroides fragilis</i> GAI 5562	6.25	12.5	100	25
<i>Bacteroides distasonis</i> ATCC 8503	0.10	0.39	3.13	0.78
<i>Bacteroides ovatus</i> ATCC 8483	25	50	>200	50
<i>Bacteroides thetaiotaomicron</i> ATCC 29741	25	100	200	25
<i>Bacteroides uniformis</i> GAI 5466	1.56	3.13	6.25	3.13
<i>Bacteroides oris</i> ATCC 33573	0.10	0.39	0.78	0.10
<i>Bacteroides oralis</i> ATCC 33269	0.10	0.39	1.56	0.10
<i>Bacteroides melaninogenicus</i> ATCC 29147	≦0.025	0.10	0.39	0.05
<i>Bacteroides bivius</i> ATCC 29303	0.20	1.56	1.56	0.39
<i>Bacteroides intermedius</i> ATCC 25611	0.05	0.20	0.20	0.10
<i>Bacteroides ureolyticus</i> NCTC 10941	0.20	≦0.025	0.39	0.05
<i>Fusobacterium nucleatum</i> ATCC 25586	0.39	1.56	1.56	0.10
<i>Fusobacterium varium</i> ATCC 8501	1.56	3.13	50	1.56
<i>Fusobacterium mortiferum</i> GAI 5576	3.13	0.78	12.5	0.78
<i>Veillonella parvula</i> ATCC 10790	0.20	0.78	0.20	0.10
<i>Capnocytophaga ochracea</i> Lo-ori	0.10	0.05	1.56	0.20



VI. 薬効薬理に関する項目

2) 各種臨床分離株の感受性分布(1996年分離株)<sup>17)</sup>



3) 最小発育阻止濃度(MIC)/最小殺菌濃度(MBC)<sup>12, 15, 16)</sup>

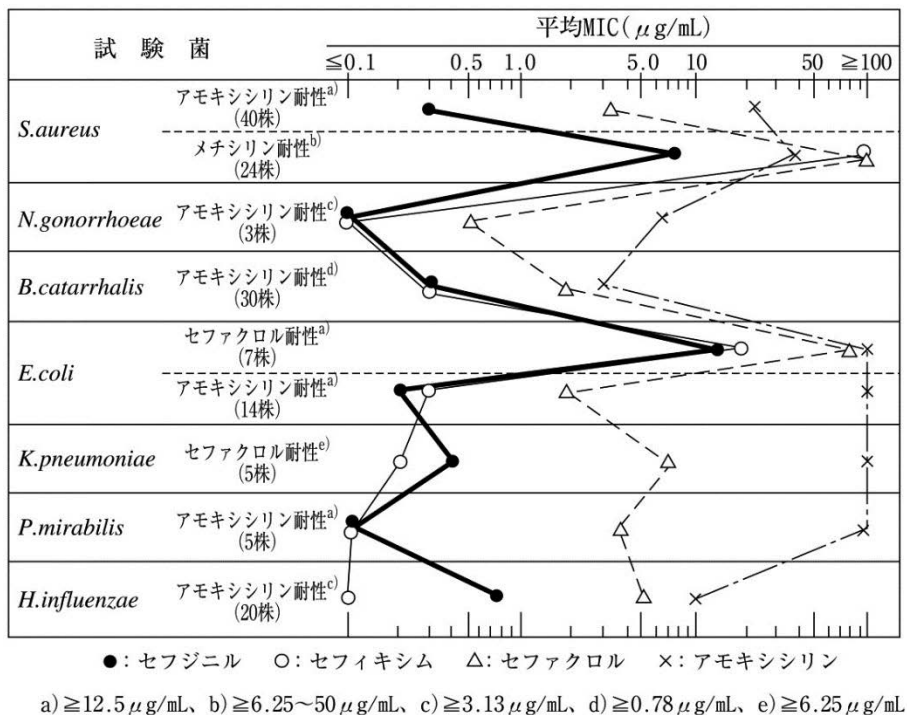
MBCはMICと近似し、強い殺菌作用を示す。

試験菌	薬剤名	MIC→MBC (μg/mL)					
		≤0.1	0.39	1.56	6.25	25	≥100
好気性菌	<i>S.aureus</i> FDA 209P JC-1		● → ●		△ → △		○
	<i>E.coli</i> NIHJ JC-2			○	●	△ → △	
	<i>K.pneumoniae</i> PCI 602	● ○			△		×
嫌気性菌	<i>P.magnus</i> ATCC 29328		● → ●			○ → ○	
	<i>P.acnes</i> ATCC 11828	● → ●		○ → ○			

VI. 薬効薬理に関する項目

4) 交差耐性<sup>16)</sup>

セファクロル及びアモキシシリン耐性の各菌株に対し強い抗菌力を示し、交差耐性は認められない。しかし、セファクロル耐性大腸菌に対しては耐性を示した。



(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) ペニシリン結合蛋白 (PBP) 親和性<sup>10, 11)</sup>

黄色ブドウ球菌の PBP1、2、3、肺炎球菌の PBP1a、1b、2a 及び大腸菌の PBP1a、1bs、2、3 に親和性を示す。

試験菌	PBP	ID <sub>50</sub> (μg/mL)*		
		セフジニル	セフィキシム	セファクロル
<i>S.aureus</i> 209P JC-1	1	0.58	2.9	0.2
	2	0.17	<0.2	125
	3	0.12	6.2	<0.2
	4	28	25	>125
	MIC (μg/mL)	0.2	25	0.78
<i>E.coli</i> NIHJ JC-2	1a	0.09	<0.2	1.6
	1bs	2.3	≤0.2	7.2
	2	1.6	16	27
	3	0.07	0.2	1.6
	4	1.1	>125	1.6
	5	>125	>125	>25
	6	>125	13	>25
MIC (μg/mL)	0.2	0.2	3.13	

\*<sup>14</sup>C-PCGの結合を50%阻止させる被検薬濃度

VI. 薬効薬理に関する項目

2)  $\beta$ -lactamase に対する安定性 (*in vitro*)<sup>10-13, 15)</sup>、結合親和性<sup>10, 18)</sup> 及び誘導能<sup>11)</sup>

- ・各種セファロスポリナーゼ、ペニシリナーゼに対して安定であるが、バクテロイデス・フラジリスの産生するセフロキシマーゼに不安定である。
- ・各種ペニシリナーゼ、セファロスポリナーゼに対し結合親和性は低いが、一部のセファロスポリナーゼに高い親和性を示す。
- ・ $\beta$ -lactamase 誘導活性は強くなく、既存のセファレキシン、セファクロル、セフィキシム等と同程度である。

	薬剤	セファロスポリナーゼ						ペニシリナーゼ				
		Ia(1)	Ia(2)	Ib	Ic	Id	CX <sub>ase</sub>	II	III	IV	V	<i>S.aureus</i>
安※ 定 性	セフジニル	3.2	0.5	3.5	27	18	320	<0.1	0.1	0.1	1.0	<0.1
	セフィキシム	4.4	0.3	1.0	2.6	0.9	12	<0.1	0.4	<0.1	0.1	<0.1
	セファクロル	140	45	102	292	31	46	0.1	2.7	3.2	0.3	2.2
親※※ 和 性	セフジニル	183	0.05	0.17	18	1.5	<u>95</u>	15	80	24	<u>79</u>	407
	セフィキシム	12	0.03	0.03	74	0.37	110	250	>1000	>1000	420	>1000
	セファクロル	168	3.8	2.5	33	6.1	<u>9.2</u>	536	>1000	>1000	>1000	54

※相対水解速度：セファロスポリナーゼはセファロジン、ペニシリナーゼはアンピシリンの水解速度を100とした時の相対値  
 ※※親和性：下線を付した値はKm値、それ以外はKi値を示す。

3) 外膜透過性<sup>11)</sup>

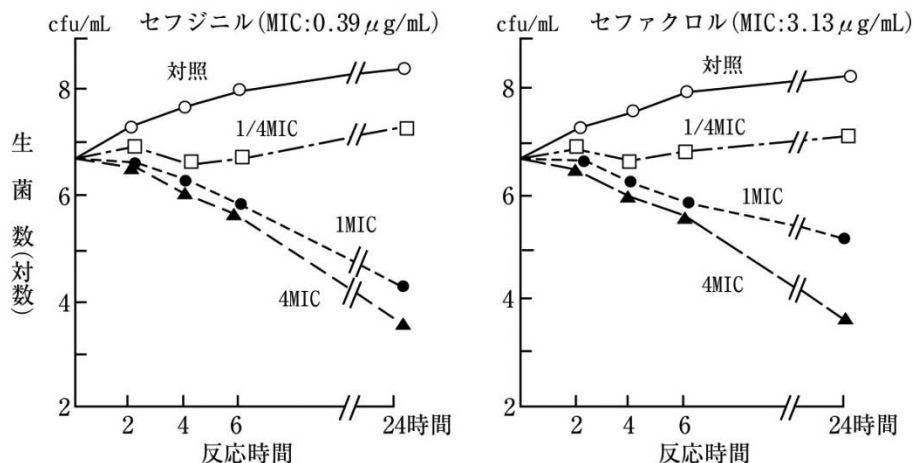
大腸菌における外膜透過性はセフィキシムより優れるものの、セファレキシン、セファクロルより劣る。

4) 殺菌作用<sup>12-16)</sup>

黄色ブドウ球菌、溶血レンサ球菌、大腸菌、肺炎桿菌に対し MIC 以上の濃度で殺菌的に作用する。

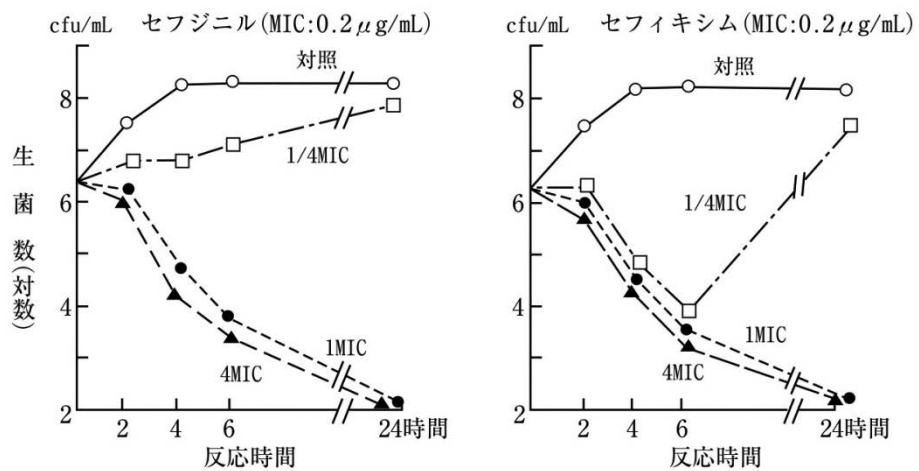
[増殖曲線に及ぼす影響]

*S. aureus* 2558



VI. 薬効薬理に関する項目

*E. coli* 3147



(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

### 1. 血中濃度の推移

#### (1) 治療上有効な血中濃度

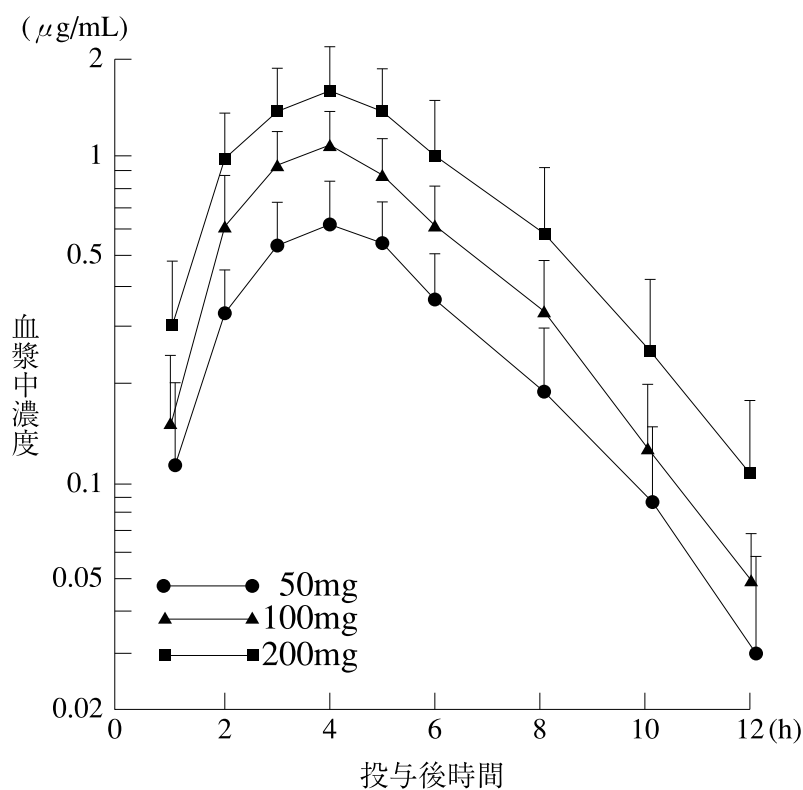
起炎菌の MIC(最小発育阻止濃度)以上の濃度

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 1) 単回投与<sup>2)</sup>

健康成人 6 例に 50、100、200mg<sup>註)</sup>(力価)を空腹時単回経口投与すると約 4 時間後にそれぞれ 0.64、1.11、1.74 $\mu\text{g}/\text{mL}$  の最高血漿中濃度が得られ、その消失半減期は 1.6~1.8 時間であった。

健康成人男子における単回経口投与時の血漿中濃度



投与量 (mg)	C <sub>max</sub> (μg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-∞</sub> (μg · h/mL)
50	0.64 ± 0.20	4.3 ± 0.5	1.75 ± 0.29	3.40 ± 1.12
100	1.11 ± 0.31	3.8 ± 0.4	1.59 ± 0.14	5.78 ± 1.62
200	1.74 ± 0.40	3.7 ± 1.0	1.78 ± 0.22	9.23 ± 2.59

(生物学的定量法、クロスオーバー法、n=6、平均±S.D.)

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

### 2) 連続投与<sup>2)</sup>

健康成人 6 例に 1 回 200mg<sup>注)</sup>(力価)を 1 日 3 回 14 日間と 15 日目 1 回の計 43 回食後連続経口投与したところ、初回投与時と最終投与時の最高血漿中濃度、最高血漿中濃度到達時間及び AUC 等両投与時の体内動態に有意な差はみられず、蓄積性は認められなかった。

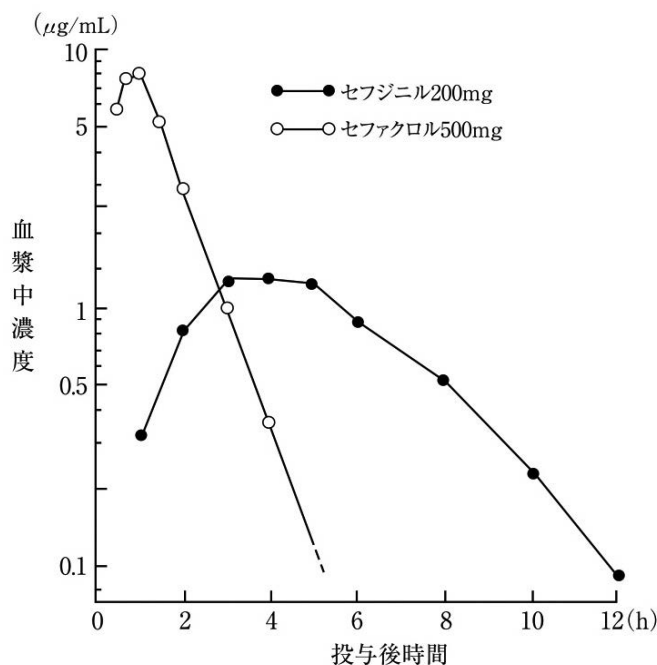
測定時期	C <sub>max</sub> (µg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-6</sub> (µg・h/mL)
初回投与時	1.36±0.22	3.8±0.4	—	4.99±0.78
最終投与時	1.37±0.23	3.5±0.5	1.88±0.51	5.84±0.88

(生物学的定量法、n=6、平均±S.D.)

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

### 3) 類薬との比較<sup>19)</sup>

健康成人 6 例にセフジニル 1 回 200mg<sup>注)</sup>(力価)又はセファクロル 1 回 500mg(力価)をクロスオーバー法で空腹時に単回経口投与した。



薬剤	C <sub>max</sub> (µg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	尿中回収率 (%)
セフジニル	1.35±0.12	3.70±0.45	1.25±0.17	28.7±3.9 <sup>(0-12h)</sup>
セファクロル	8.50±2.69	0.86±0.24	0.42±0.08	69.0±9.8 <sup>(0-6h)</sup>

(生物学的定量法、クロスオーバー法、n=6、平均±S.D.)

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

### (3) 中毒域

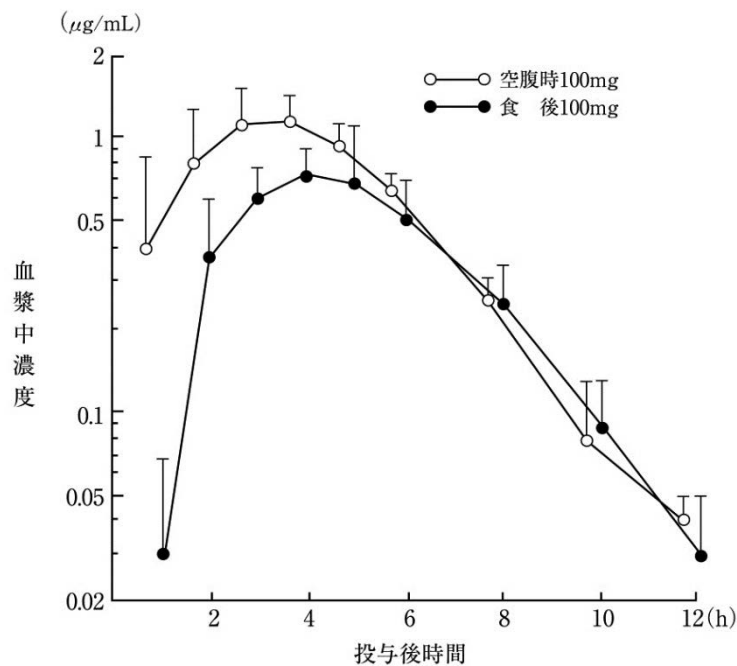
該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

(4) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響<sup>20)</sup>

健康成人 6 例に 100mg(力価)を空腹時及び食後に単回経口投与し比較したとき、最高血漿中濃度到達時間及び半減期に差はみられなかったが、最高血漿中濃度、AUC<sub>0-∞</sub>及び尿中排泄率が食後投与群で有意に低下し、食後投与では吸収率がやや低下した。



(食事内容: ロールパン2個(70g)、マーガリン(5g)、チーズ(20g)、  
半熟卵1個、オレンジジュース(100mL)、低脂肪ミルク(150mL))

投与条件	C <sub>max</sub> (µg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-∞</sub> (µg · h/mL)	尿中排泄率 (0-12h, %)
空腹時(100mg)	1.25 ± 0.33	3.5 ± 0.5	1.44 ± 0.12	6.16 ± 1.65	36.7 ± 8.6
食後(100mg)	0.79* ± 0.19	4.3 ± 0.5	1.48 ± 0.12	4.04* ± 0.72	24.8* ± 4.6

(生物学的定量法、クロスオーバー法、n=6、平均±S.D.)

\* : P<0.05

2) 併用薬の影響

「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照

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

単回投与 : 0.396~0.440h<sup>-1</sup>

連続投与 : 0.391h<sup>-1</sup>

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

### (4) クリアランス

単回投与：健康成人 6 例に 50、100 及び 200mg<sup>注)</sup> (力価)をクロスオーバー法により空腹時単回経口投与したとき、12 時間までの腎クリアランスはそれぞれ 85.4±12.7、89.2±6.0、93.5±23.1mL/min であった<sup>2)</sup>。

連続投与：健康成人 6 例に 1 回 200mg<sup>注)</sup> (力価)を 1 日 3 回 14 日間と 15 日目 1 回の計 43 回食後連続経口投与したとき、投与終了後から 6 時間までの腎クリアランスは 118±15mL/min であった<sup>2)</sup>。

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

### (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

吸収部位：腸管

吸収率：健康成人 6 例に 50、100 及び 200mg<sup>注)</sup> (力価)を単回経口投与したとき、投与 24 時間後までに尿中未変化体が投与量の約 30%排泄される<sup>2)</sup> ことから、吸収率は少なくとも 30%以上と推定される。

腸肝循環：ヒトの胆汁中移行は殆ど認められないことから、腸肝循環の体内動態に及ぼす影響はないと考えられる<sup>21)</sup>。

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

## 5. 分布

### (1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

### (2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

### (3) 乳汁への移行性

1) 授乳中の褥婦 4 例に 200mg<sup>注)</sup> (力価)単回経口投与したとき、投与後 6 時間までの母乳中には検出されなかった<sup>22)</sup>。

2) 授乳中の初産婦、経産婦各 10 例に 1 回 100mg (力価)を 1 日 3 回 5 日間経口投与したとき、100mg 投与後 4 時間までの母乳中への移行は認められず、また 5 日間連続投与においても検出されなかった<sup>23)</sup>。

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。



Ⅶ. 薬物動態に関する項目

(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

1) 喀痰中への移行<sup>24, 25-30)</sup>

下気道感染症患者に 100 又は 200mg<sup>注)</sup> (力価)を単回又は 1 日 3 回、1~7 日間連続投与したとき、31 例中 21 例において、喀痰中に 0.02~0.09µg/mL 検出された。

投与量	投与方法	最高濃度 (µg/mL)		喀痰/血漿 (%)
		喀痰	血漿	
100mg	連続投与(n=6) 3回/日、2~7日間	0.02~0.05	0.29~1.75	1.7~16.7
200mg	単回投与(n=7)	0.02~0.09	0.84~3.39	0.9~9.5
	連続投与(n=8) 3回/日、1~7日間	0.02~0.06	0.18~2.15	0.9~15.6

(生物学的定量法)

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

2) 扁桃組織への移行<sup>31, 32)</sup>

扁桃摘出施行患者に 100mg (力価)を単回経口投与したとき、14 例中 13 例において投与後 1.5~6 時間の扁桃組織中に 0.06~0.41µg/g 検出された。

投与量・ 投与方法	投与後時間	濃度 (µg/g又はmL)		組織/血漿 (%) <sup>※</sup>
		扁桃組織	血漿	
100mg 単回投与	1時間30分	0.41	0.57	71.7
	3時間	0.17	0.86	20.3
	3時間10分	0.06	0.45	13.3
	3時間10分	0.13	1.26	10.7
	3時間20分	0.30	1.02	29.4
	3時間30分	0.08	0.87	9.7
	3時間40分	0.25	0.88	27.8
	3時間45分	0.17	1.13	15.4
	4時間	0.18	0.75	24.0
	4時間	0.21	1.13	18.6
	4時間25分	0.23	1.25	18.7
	5時間	0.10	0.45	22.2
	5時間20分	0.12	0.41	29.3

(生物学的定量法)

※ 数値は元文献の値を使用(複数の試験結果を集計しているが、組織、血漿濃度の有効数字桁数を調整したため、表中の数字で計算すると合わないものがある)

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

3) 上顎洞粘膜組織への移行<sup>31, 32)</sup>

副鼻腔炎患者7例に100mg(力価)を単回経口投与したとき、投与後2.5～5時間の上顎洞粘膜中に0.06～0.60μg/g 検出された。

投与量・ 投与方法	投与後時間	濃度 (μg/g又はmL)		組織/血漿 (%) <sup>**</sup>
		上顎洞粘膜組織	血漿	
100mg 単回投与	2時間30分	0.19	0.75	25.5
	3時間30分	0.39	0.54	72.1
	3時間30分	0.06	0.82	7.7
	4時間5分	0.32	0.82	39.0
	4時間25分	0.20	0.76	26.3
	4時間35分	0.55	2.11	26.1
	5時間	0.60	0.92	65.2

(生物学的定量法)

※ 数値は元文献の値を使用(複数の試験結果を集計しているが、組織、血漿濃度の有効数字桁数を調整したため、表中の数字で計算すると合わないものがある)

4) 中耳分泌物中への移行<sup>31, 32)</sup>

中耳炎患者に100mg(力価)を単回又は1日3回連続経口投与したとき、6例中4例において投与後3.5～8時間の中耳分泌物中に0.02～0.12μg/mL 検出された。

投与量	投与方法	投与後時間	濃度 (μg/mL)		分泌物/血漿 (%)
			中耳分泌物	血漿 [投与後時間]	
100mg	単回投与	4時間	0.02	0.16 [4時間]	12.5
		8時間	0.05	0.36 [4時間]	13.9
	3回/日 1日間連続投与	3時間30分	0.12	0.26 [3時間30分]	46.2
		3時間30分	0.03	0.07 [3時間30分]	42.9

(生物学的定量法)

5) 皮膚組織への移行<sup>33-35)</sup>

皮膚切除施行患者に100mg(力価)を単回経口投与したとき、17例中12例において、投与後約3～4時間の皮膚組織中に0.07～0.37μg/g 検出された。

投与量・ 投与方法	投与後時間	濃度 (μg/g又はmL)		組織/血漿 (%) <sup>**</sup>
		皮膚組織	血漿	
100mg 単回投与	2時間40分	0.07	0.96	6.9
	3時間	0.37	0.77	48.1
	3時間10分	0.14	0.62	22.6
	3時間30分	0.31	0.58	53.4
	3時間30分	0.32	0.44	72.7
	3時間50分	0.22	0.50	44.0
	4時間	0.35	1.00	35.0
	4時間	0.33	0.73	45.2
	4時間	0.23	0.47	48.9
	4時間	0.12	0.31	38.7
	4時間13分	0.16	1.01	15.4
	4時間20分	0.35	1.07	33.1

(生物学的定量法)

※ 数値は元文献の値を使用(複数の試験結果を集計しているが、組織、血漿濃度の有効数字桁数を調整したため、表中の数字で計算すると合わないものがある)

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

6) 尿道分泌物中への移行<sup>36)</sup>

淋菌感染症(淋疾)患者 3 例に 200mg<sup>注)</sup>(力価)を単回経口投与したとき、投与後 1~3 時間の尿道分泌物中に 0.06~2.50µg/g 検出された。

投与量・ 投与方法	投与後時間	濃度 (µg/g又はmL)		組織/血清 (%)
		尿道分泌物	血清	
200mg 単回投与	1時間	0.06	—	—
	2時間	2.50	3.14	79.6
	3時間	0.50	1.07	46.7

(生物学的定量法) — : 測定せず

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

7) 女性性器への移行<sup>22, 37, 38)</sup>

子宮全摘術施行患者に 100mg 又は 200mg<sup>注)</sup>(力価)を単回経口投与したとき、69 例中 68 例において投与後約 2~9 時間に女性性器組織中への移行が認められた。

(µg/mL or g)

投与量	肘静脈血	子宮動脈血	子宮内膜	子宮体部	子宮頸部	膣部	卵巣	卵管
100mg (n=21)	0.15~1.81	0.15~1.88	0.07~0.71	0.12~0.60	0.09~0.73	0.14~0.94	0.12~0.49	0.09~0.69
200mg (n=47)	0.05~2.84	0.03~3.15	0.10~1.78	0.09~1.11	0.07~2.02	0.08~1.31	0.13~0.99	0.08~1.13

(生物学的定量法)

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

8) 涙液中への移行<sup>39)</sup>

健康成人男子 6 例に 100mg(力価)を単回経口投与したとき、投与後 2~8 時間の涙液中に 0.02~0.06µg/mL 検出された。

投与量・ 投与方法	投与後時間	2	3	4	5	6	8 (時間)
		100mg 単回投与	涙液中濃度 (µg/mL)	0.02±0.01	0.02±0.01	0.04±0.02	0.06±0.03
血漿中濃度 (µg/mL)	0.26±0.06		0.43±0.11	0.47±0.10	0.63±0.08	0.45±0.05	0.16±0.03

(生物学的定量法、n=3、平均±S.E.)

9) 瞼板腺組織への移行<sup>40)</sup>

霰粒腫患者 5 例に 200mg<sup>注)</sup>(力価)を単回経口投与したときの瞼板腺組織への移行は投与後 2 時間目の 3 例では検出されず、投与後 4 時間目の 2 例で 0.37~0.77µg/g (組織/血清比 : 43.5~49.7%)が検出された。

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

### 10) 口腔組織中への移行<sup>41, 42)</sup>

歯肉等の摘出施行患者に 100mg 又は 200mg<sup>注)</sup> (力価) を単回経口投与したとき、45 例中 42 例において、投与後約 2～8 時間に口腔組織中への移行が認められた。

( $\mu\text{g/mL}$  or g)

投与量・投与方法	歯肉	嚢胞壁	顎骨	顎下腺	耳下腺	筋組織
100mg 単回投与 (n=34)	0.04～0.96	0.09～0.52	0.12～0.75	0.23～0.43	0.04	0.08～0.28
200mg 単回投与 (n=8)	—	0.65～1.53	0.12～1.27	0.15～0.17	—	0.45

(生物学的定量法) — : 測定せず

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

### (6) 血漿蛋白結合率

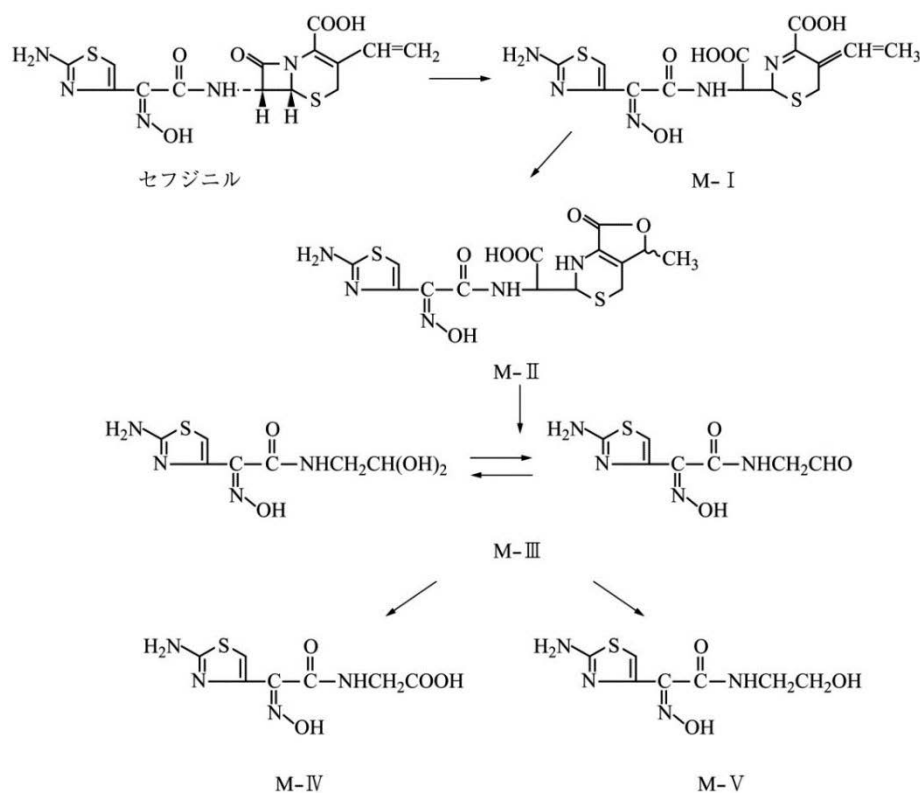
73.1 $\pm$ 2.2% (限外濾過法)<sup>43)</sup>

## 6. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

代謝部位：大腸 (腸内細菌)

推定代謝経路：



健康成人男子 6 例に 100mg(力価) を単回投与したとき、投与後 24 時間までの尿中に代謝物 M-III、IV、V が検出されたが、それらの各排泄率は投与量の 0.5% 以下と低かった<sup>44)</sup>。

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

### (2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

ラットにセフジニル 10mg/kg 又は 100mg/kg を 3 日間経口投与し、チトクロム P-450 含量、アミノピリン脱メチル化活性、アニリン水酸化活性及びエトキシレゾルフィン脱エチル化活性を測定したが、いずれも対照群と比較して有意な変動は認められなかった。

ラットにセフジニル 100mg/kg を経口投与後 24 時間の肝ミトコンドリア画分のアルデヒド脱水素酵素活性をアセトアルデヒドを基質として測定したが、対照群での活性と有意な差は認められなかった。なお、セフォペラゾン及びジスルフィラム投与群でのアルデヒド脱水素酵素活性は、対照群と比較して有意に阻害された。

したがって、セフジニルは薬物代謝酵素誘導作用及びアンタビユース様作用を有しないと推察された。

### (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

健康成人 12 例に 100mg (力価) を単回又は 200mg<sup>注)</sup> (力価) を 1 日 3 回 15 日間連続経口投与したとき、血漿、尿及び糞便中に抗菌活性代謝物は検出されなかった<sup>2)</sup>。

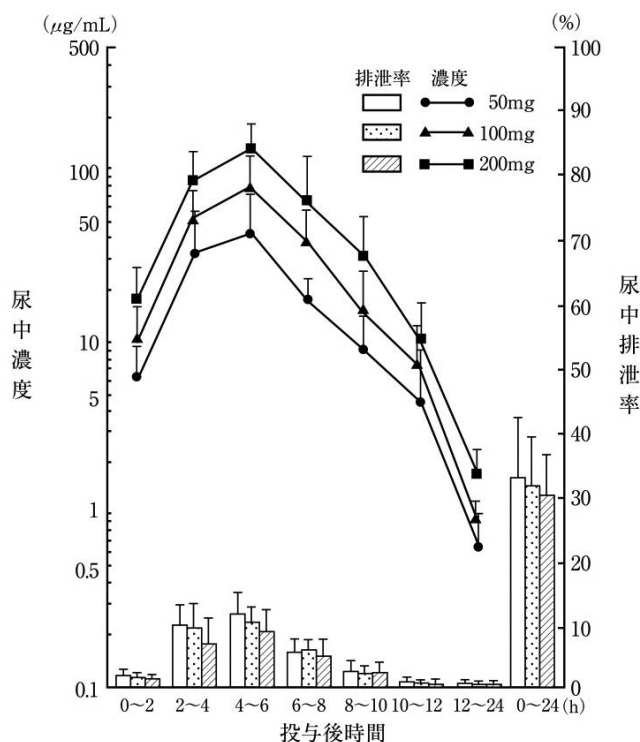
注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

## 7. 排泄

### 排泄部位及び経路

主として腎より排泄される。

健康成人 6 例に 50、100 及び 200mg<sup>注)</sup> (力価) をクロスオーバー法により空腹時単回経口投与したとき、24 時間までの尿中排泄率はそれぞれ 33.3±8.3%、30.8±8.2%、25.9±10.2% で、最高尿中濃度は投与後 4～6 時間でそれぞれ 44.3±31.0、81.5±55.5 及び 132±55µg/ml であった<sup>2)</sup>。



(生物学的定量法、n=6、平均±S.D.)

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

### 排泄速度

健康成人 3 例に 100mg (力価) を単回経口投与したとき、0～24 時間全排泄量の 82.9% が 6 時間までに排泄された<sup>45)</sup>。

## 8. トランスポーターに関する情報

セフジニルは、organic anion transporter (OAT) 3 の基質である<sup>46)</sup>。

## 9. 透析等による除去率

### (1) 腹膜透析

CAPD 施行患者 (BUN34-90mg/dL、S-Cr2.3-17mg/dL) 4 例に CAPD 施行 2 時間前に 100mg (力価) を単回経口投与したとき、投与後 23-25 時間で透析液へ 1.45-5.23mg 移行した<sup>47)</sup>。

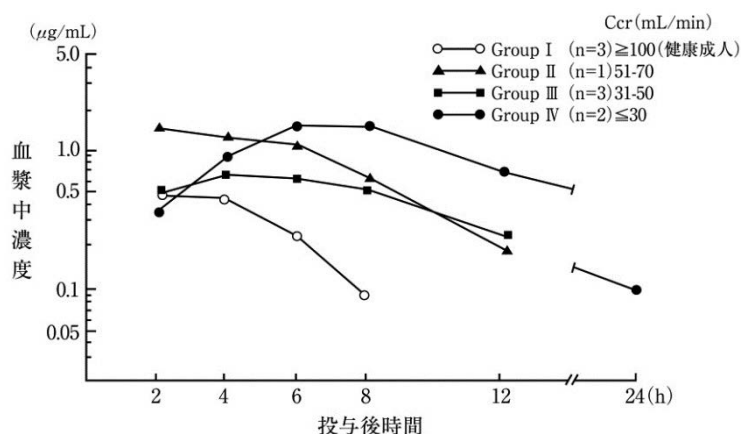
### (2) 血液透析

61%<sup>48)</sup> (「10. (2) 血液透析患者」の項参照)

## 10. 特定の背景を有する患者

### (1) 腎機能障害患者

①腎機能障害患者(Ccr12～51mL/min) 6 例に 100mg(力価)を空腹時に単回経口投与したとき、腎機能(Ccr)の低下に伴い血漿中濃度の消失半減期の延長、AUC の上昇が認められた<sup>45)</sup>。



群	Ccr (mL/min)	例数	血漿中濃度 (μg/mL)					t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-∞</sub> (μg · h/mL)	
			2	4	6	8	12			24時間
I	≥ 100	3	0.49 ± 0.08	0.47 ± 0.08	0.24 ± 0.09	0.09 ± 0.04	—	—	1.66 ± 0.26	2.76 ± 0.68
II	51-70	1	1.49	1.25	1.12	0.64	0.20	—	2.41	10.74
III	31-50	3	0.49 ± 0.25	0.73 ± 0.31	0.65 ± 0.25	0.55 ± 0.23	0.26 ± 0.14	—	2.92 ± 0.53	7.48 ± 3.44
IV	≤ 30	2	0.36 ± 0.23	0.97 ± 0.35	1.55 ± 0.11	1.59	0.73 ± 0.09	0.10 ± 0.04	4.06 ± 0.55	16.94 ± 0.94

(生物学的定量法、平均 ± S.E.) — : 測定せず

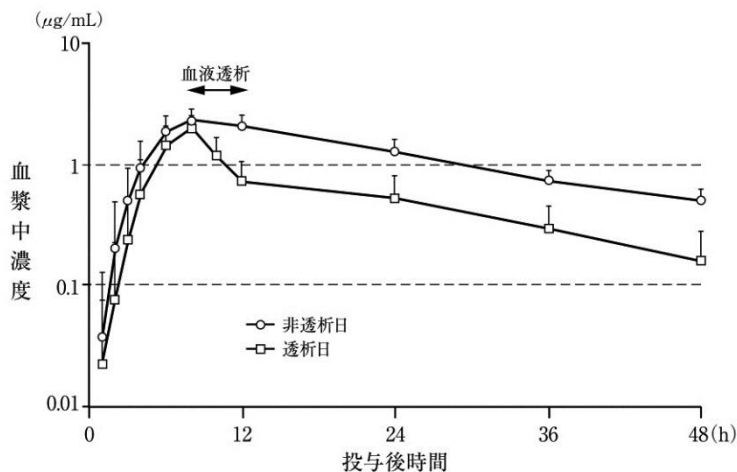
### ②排泄速度

健康成人 3 例及び腎機能障害患者 6 例に 100mg (力価) を単回経口投与したとき、健康成人では 0～24 時間全排泄量の 82.9% が 6 時間までに排泄されたが、腎機能障害例では Ccr51～70mL/min で 57.7%、31～50mL/min で 53.2%、≤30mL/min で 42.9% と Ccr の低下に伴い排泄の遅延が認められた<sup>45)</sup>。

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

(2) 血液透析患者

血液透析患者 6 例に 100mg(力価)を食後に単回経口投与したとき、血漿中濃度の消失半減期は健康成人の約 11 倍に増加した。同じ患者に 100mg(力価)を食後に単回経口投与し、ほぼ最高血漿中濃度に達した時間より 4 時間透析を施行したとき、透析中の半減期は非透析日の約 1/6 に短縮し、透析による除去率は 61%であった<sup>48)</sup>。



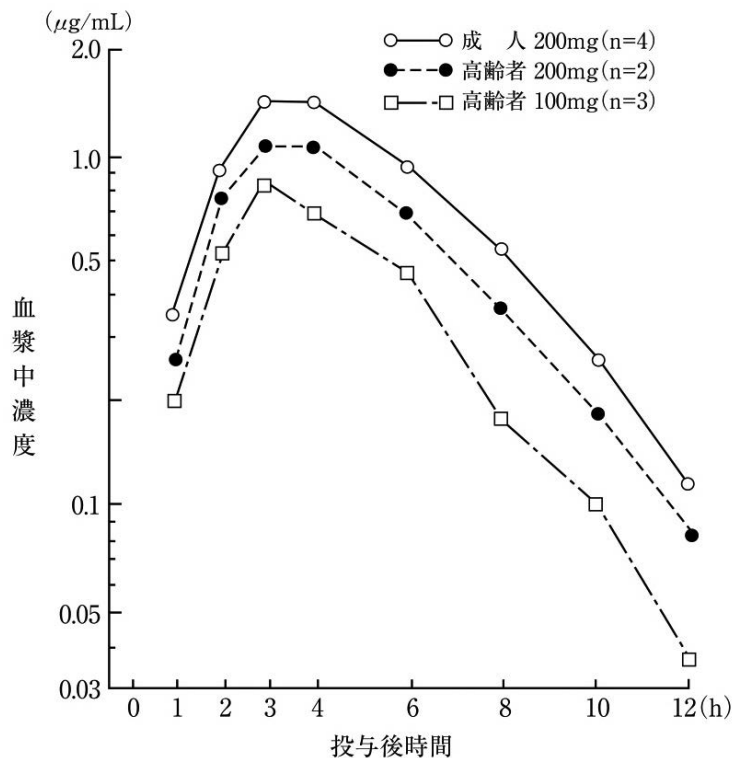
測定時期	C <sub>max</sub> (µg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-∞</sub> (µg · h/mL)	除去率 (%)
非透析日	2.36 ± 0.53	9.00 ± 2.45	16.95 ± 1.20	69.05 ± 14.84	—
透析日	2.03 ± 0.54	—	2.76 ± 1.01 <sup>注)</sup>	30.18 ± 12.03	61 ± 6

注)透析中の半減期

## VII. 薬物動態に関する項目

### (3) 高齢者

高齢患者(72～83歳)5例に100又は200mg<sup>注)</sup>(力価)を空腹時単回経口投与したとき、最高血漿中濃度及びAUCは健康成人男子と比較するとやや低下しているが、他のパラメータはほぼ同様であり、加齢による体内動態の著明な変化は認めなかった<sup>24)</sup>。



対象	投与量 (mg)	年齢	Ccr (mL/min)	C <sub>max</sub> (µg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-∞</sub> (µg·h/mL)
成人	200	48.3±10.9	—	1.51±0.04	3.5±0.6	1.76±0.17	8.66±0.32
高齢者	100	77.0±5.6	92.2±3.7	0.85±0.06	3.0±0.0	1.76±0.21	4.23±0.37
	200	74.5±3.5	98.9±0.7	1.15±0.04	3.5±0.7	1.90±0.01	6.60±0.29

(生物学的定量法、平均±S.D.)

注) 本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人1回100mg(力価)を1日3回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

## 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）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者 [9.1.1 参照]

(解説)

$\beta$ -ラクタム系抗生物質一般の注意事項であり、本剤の成分によるショックの既往歴のある患者に本剤が再投与された場合、ショック等の重篤な副作用を発現する可能性が高い。

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「Ⅴ. 2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「Ⅴ. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

### 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 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。[11.1.1 参照]
- 8.3 汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少、溶血性貧血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うこと。[11.1.4 参照]
- 8.4 急性腎障害等の重篤な腎障害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うこと。[11.1.7 参照]
- 8.5 劇症肝炎等の重篤な肝炎、著しいAST、ALT、Al-Pの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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うこと。[11.1.8 参照]

(解説)

- 8.1 細菌性感染症を効能・効果とする抗菌性物質製剤一般の注意事項である。  
細菌性感染症に抗菌剤を使用する場合には、起炎菌を同定し、その感受性等により抗菌剤を選択し、治療効果により、投与中止、投与継続、抗菌剤の変更を決定することが原則である。しかしながら、実際の臨床の場において、急性感染症では、起炎菌の同定、感受性の確認以前に抗菌剤の投与を開始しなければならないことがしばしばあり、検出頻度の高い細菌を感染症の起炎菌と想定し、治療を開始 (empiric therapy) しなければならないことが多い。この場合には、選択した抗菌剤を漫然と継続投与するのではなく、1) 感受性試験の結果に基づき、抗菌剤の変更を考慮するか、2) 選択した抗菌剤の有効性を72時間程度で、発熱、白血球数、CRP等の推移により判定し、①改善が得られていれば治療を継続、②改善が得られていなければ起炎菌の推定、あるいは同定と感受性、患者の病態、薬剤の使用量・使用方法等につき再検討を行い、薬剤の継続、変更を決定する必要がある。また、薬剤の中止時期は上記所見の改善をもって決定することが一般的のようである。
- 8.2  $\beta$ -ラクタム系抗生物質一般の注意事項であり、同系統の薬剤によるショックなどの過敏症状が多数報告されており、本剤においても過敏症状の発現に留意する必要がある。  
アナフィラキシーショックをはじめとする過敏症状を的確に予防する方法は現在のところ確立されておらず、最も重要なことは問診による予防である。なお、過敏症状が発現した場合には、投与は中止し、必要に応じ対症療法を行うこと。

## 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 セフェム系又は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（ただし、本剤に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと）

[2. 参照]

9.1.2 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

9.1.3 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

観察を十分に行うこと。ビタミン K 欠乏症状があらわれることがある。

(解説)

9.1.1、9.1.2  $\beta$ -ラクタム系抗生物質一般の注意事項であり、セフェム系抗生物質による過敏症の発現頻度がセフェム系又はペニシリンアレルギーの既往歴のある患者で高いとする報告があり、ショック等の重篤な副作用を生じるおそれがある。また本人又はその家族に薬剤アレルギー歴、アレルギー疾患などがある患者では、それらの素因を持たない患者に比べ  $\beta$ -ラクタム剤に対する過敏症状の発現頻度が高いことから、アレルギー歴、アレルギー素因のある患者には慎重に投与すべきである。

9.1.3 抗生物質一般の注意事項であり、抗生物質の投与により腸内細菌叢が変動しビタミン K の合成が阻害されるため、経口的なビタミン K の摂取が不良な患者では出血傾向などの注意が必要である。

### (2) 腎機能障害患者

#### 9.2 腎機能障害患者

##### 9.2.1 高度の腎障害のある患者

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。血中濃度が持続する。[7.、16.6.1 参照]

(解説)

腎機能障害のみられる患者では、障害の程度に応じて血漿中濃度半減期が延長し、血漿中濃度が長時間持続することから慎重に投与すべきである。

### (3) 肝機能障害患者

設定されていない

### (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

設定されていない

### (7) 小児等

#### 9.7 小児等

小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(8) 高齢者

9.8 高齢者

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。

- ・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。
- ・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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(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
鉄剤	本剤の吸収を約 10 分の 1 まで阻害するので、併用は避けることが望ましい。やむを得ず併用する場合には、本剤の投与後 3 時間以上間隔をあけて投与する。	腸管内において鉄イオンとほとんど吸収されない錯体を形成する。
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。
制酸剤 (アルミニウム又はマグネシウム含有)	本剤の吸収が低下し、効果が減弱されるおそれがあるため、本剤の投与後 2 時間以上間隔をあけて投与する。	機序不明

(解説)

鉄剤

鉄剤との併用により本剤の吸収が低下することは動物実験により確認されている<sup>49)</sup>。またヒトでの試験成績でも、鉄剤との同時服用により本剤の吸収が約 10 分の 1 まで低下すること、本剤の投与 3 時間後に鉄剤を投与した場合には、同時服用時に比べて吸収の低下が約 75% まで軽減することが報告されている<sup>50)</sup>。

ワルファリンカリウム

セフェム系抗生物質でビタミン K 欠乏による出血傾向があらわれることが知られている。一方、ワルファリンはビタミン K に拮抗して抗凝固作用を示す薬剤であり、併用した場合、抗凝固作用が増強されるおそれがある。

制酸剤(アルミニウム又はマグネシウム含有)

外国で健康成人にセフジニル 300mg と制酸剤(Maalox TC) 30mL(水酸化アルミニウム 120mg/mL、水酸化マグネシウム 60mg/mL)とを同時に経口投与したとき、セフジニルの吸収が約 40% 減少したとの報告がある<sup>51)</sup>。

注) 本邦において本剤の承認された用法及び用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

8. 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 ショック（0.1%未満）

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。[8.2 参照]

11.1.2 アナフィラキシー（0.1%未満）

アナフィラキシー（呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等）があらわれることがある。

11.1.3 皮膚障害（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）（各 0.1%未満）があらわれることがあるので、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。

11.1.4 血液障害（頻度不明）

汎血球減少、無顆粒球症（初期症状：発熱、咽頭痛、頭痛、倦怠感等）、血小板減少（初期症状：点状出血、紫斑等）、溶血性貧血（初期症状：発熱、ヘモグロビン尿、貧血症状等）（各 0.1%未満）があらわれることがある。[8.3 参照]

11.1.5 大腸炎（0.1%未満）

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、適切な処置を行うこと。

11.1.6 間質性肺炎、PIE 症候群（各 0.1%未満）

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。

11.1.7 腎障害（0.1%未満）

急性腎障害等の重篤な腎障害があらわれることがある。[8.4 参照]

11.1.8 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸（各 0.1%未満）

劇症肝炎等の重篤な肝炎、著しい AST、ALT、Al-P の上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがある。[8.5 参照]

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過 敏 症	発疹	蕁麻疹、そう痒、発熱、浮腫	紅斑
血 液	好酸球増多	顆粒球減少	
腎 臓		BUN 上昇	
消 化 器	下痢、腹痛、胃部不快感	悪心、嘔吐、胸やけ、食欲不振、便秘	
菌交代症		口内炎	カンジダ症、黒毛舌
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		めまい、頭痛、胸部圧迫感	しびれ

発現頻度は、承認時までの臨床試験及び使用成績調査結果に基づいている。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

時期	承認時	使用成績調査	計
調査施設数	264	2,435	2,654
調査症例数	2,633	11,082	13,715
副作用発現症例数	230	124	354
副作用発現件数	321	188	509
副作用発現症例率（%）	8.74	1.12	2.58

副作用等の種類	発現件数(%)			副作用等の種類	発現件数(%)		
	承認時	使用成績調査	計		承認時	使用成績調査	計
<b>皮膚・皮膚付属器官障害</b>	18(0.68)	13(0.12)	31(0.23)	AST(GOT)上昇	54(2.05)	35(0.32)	89(0.65)
肛囲そう痒	0	1(0.01)	1(0.01)	ALT(GPT)上昇	77(2.92)	49(0.44)	126(0.92)
湿疹	0	1(0.01)	1(0.01)	ビリルビン値上昇	2(0.08)	1(0.01)	3(0.02)
蕁麻疹	2(0.08)	1(0.01)	3(0.02)	*ウロビリノーゲン陽性	0	1(0.01)	1(0.01)
そう痒(感)	2(0.08)	0	2(0.01)	*γ-GTP上昇	4(0.15)	1(0.01)	5(0.04)
発疹	13(0.49)	6(0.05)	19(0.14)	<b>代謝・栄養障害</b>	14(0.53)	11(0.10)	25(0.18)
顔面皮疹	0	1(0.01)	1(0.01)	Al-P上昇	12(0.46)	11(0.10)	23(0.17)
中毒疹	1(0.04)	1(0.01)	2(0.01)	*LDH上昇	1(0.04)	0	1(0.01)
皮疹	0	2(0.02)	2(0.01)	*尿糖陽性	1(0.04)	0	1(0.01)
<b>中枢・末梢神経系障害</b>	2(0.08)	1(0.01)	3(0.02)	<b>赤血球障害</b>	3(0.11)	2(0.02)	5(0.04)
ふらつき(感)	2(0.08)	1(0.01)	3(0.02)	*赤血球減少	3(0.11)	2(0.02)	5(0.04)
<b>精神障害</b>	1(0.04)	0	1(0.01)	*ヘマトクリット値減少	3(0.11)	2(0.02)	5(0.04)
*眠気	1(0.04)	0	1(0.01)	*ヘモグロビン減少	3(0.11)	2(0.02)	5(0.04)
<b>消化管障害</b>	67(2.54)	43(0.39)	110(0.80)	<b>白血球・網内系障害</b>	44(1.67)	3(0.03)	47(0.34)
嘔気	5(0.19)	3(0.03)	8(0.06)	好中球減少	1(0.04)	0	1(0.01)
悪心	0	3(0.03)	3(0.02)	好酸球増多(症)	40(1.52)	1(0.01)	41(0.30)
吐き気	0	1(0.01)	1(0.01)	白血球減少(症)	3(0.11)	2(0.02)	5(0.04)
嘔吐	1(0.04)	1(0.01)	2(0.01)	*リンパ球増多	1(0.04)	0	1(0.01)
*口角炎	0	1(0.01)	1(0.01)	<b>血小板・出血凝血障害</b>	1(0.04)	0	1(0.01)
下痢	30(1.14)	23(0.21)	53(0.39)	*プロトロンビン時間延長	1(0.04)	0	1(0.01)
軟便	10(0.38)	3(0.03)	13(0.09)	<b>泌尿器系障害</b>	9(0.34)	6(0.05)	15(0.11)
口内炎	5(0.19)	2(0.02)	7(0.05)	*血清クレアチニン上昇	1(0.04)	0	1(0.01)
胃もたれ感	2(0.08)	2(0.02)	4(0.03)	*尿蛋白陽性	2(0.08)	0	2(0.01)
胸やけ	1(0.04)	0	1(0.01)	*尿沈渣陽性	3(0.11)	0	3(0.02)
食欲不振	3(0.11)	1(0.01)	4(0.03)	*尿円柱	0	1(0.01)	1(0.01)
腹痛	5(0.19)	5(0.05)	10(0.07)	*尿中WBC増加	0	1(0.01)	1(0.01)
胃不快感	11(0.42)	4(0.04)	15(0.11)	BUN上昇	4(0.15)	4(0.04)	8(0.06)
下腹部痛	1(0.04)	1(0.01)	2(0.01)	<b>一般的全身障害</b>	4(0.15)	3(0.03)	7(0.05)
便秘	2(0.08)	0	2(0.01)	悪寒	0	1(0.01)	1(0.01)
心窩部痛	1(0.04)	2(0.02)	3(0.02)	顔面浮腫	0	1(0.01)	1(0.01)
*歯肉炎	0	1(0.01)	1(0.01)	胸部圧迫感	2(0.08)	0	2(0.01)
変色便	1(0.04)	0	1(0.01)	頭重感	2(0.08)	0	2(0.01)
<b>肝臓・胆管系障害</b>	90(3.42)	56(0.51)	146(1.06)	発熱	1(0.04)	0	1(0.01)
*LAP上昇	1(0.04)	0	1(0.01)	*全身倦怠(感)	1(0.04)	1(0.01)	2(0.01)
肝機能障害	0	3(0.03)	3(0.02)	<b>抵抗機構障害</b>	0	1(0.01)	1(0.01)
肝障害	0	1(0.01)	1(0.01)	菌交代症	0	1(0.01)	1(0.01)

\*：使用上の注意から予測されないもの

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

#### 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

12.1 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。

12.2 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。

### 10. 過量投与

設定されていない

### 11. 適用上の注意

#### 14. 適用上の注意

##### 14.1 薬剤交付時の注意

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。

(解説)

日薬連発第240号(平成8年3月27日付)及び第304号(平成8年4月18日付)「PTP誤飲対策について」に従い設定した。

### 12. その他の注意

#### (1) 臨床使用に基づく情報

##### 15. その他の注意

##### 15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 粉ミルク、経腸栄養剤など鉄添加製品との併用により、便が赤色調を呈することがある。

15.1.2 尿が赤色調を呈することがある。

#### (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

### 1. 薬理試験

#### (1) 薬効薬理試験

「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照

#### (2) 安全性薬理試験

マウス、ラット、モルモット、ウサギ、ネコ、イヌ及びヒト血液標本を用いて中枢神経系、呼吸・循環器系、自律神経・運動神経系、消化器系、泌尿器・生殖器系、血液系、その他に及ぼす影響を *in vivo* 試験は静脈内投与で 1,000mg/kg を、*in vitro* 試験は  $1.0 \times 10^{-2}$  g/mL を最高用量として検討した。

*In vivo* 試験では、覚醒イヌの嘔吐が 320mg/kg 以上で、また麻酔イヌの生体位空腸自動運動の亢進、ラットの胆汁分泌の亢進及びラットの尿量、尿中  $\text{Na}^+$ 、 $\text{K}^+$  排泄量の増加が最高用量で認められた。

*In vitro* 試験では、モルモットの摘出心房の収縮力増強が最高用量で、またモルモットの摘出気管筋の弛緩、ヒト血小板の ADP 及び collagen 誘発凝集の抑制が  $1.0 \times 10^{-3}$  g/mL 以上で認められた。

なお、麻酔イヌの生体位空腸自動運動に対して、十二指腸投与の 1,000mg/kg では何ら影響を示さなかった<sup>52)</sup>。

#### (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

単回投与毒性 (LD<sub>50</sub>値)<sup>53)</sup>

(mg/kg)

動物種	性	経口	皮下	腹腔内	静脈内
マウス	雄	>5,600	>5,600	>5,600	>2,000
	雌	>5,600	>5,600	>5,600*	>2,000
ラット	雄	>5,600	>5,600	>5,600	>2,000
	雌	>5,600	>5,600	>5,600	>2,000
イヌ	雄	>1,000	—	—	—
	雌	>1,000	—	—	—

\* 1/5例死亡

#### (2) 反復投与毒性試験

ラット及びイヌに 100、320、1,000mg/kg を 13 週間それぞれ経口投与したとき 1,000mg/kg 投与群でラットは白血球数の軽度減少が、イヌでは摂餌量の減少及びそれに伴う体重減少が認められたが、320mg/kg 以下の投与群では薬物投与によると思われる異常所見は認められなかった。

その他、ラットでは軟便、盲腸膨満など、イヌでは嘔吐及び流涎など、抗生物質投与で一般に観察される変化が認められた<sup>54)</sup>。

(無影響量：ラット及びイヌ共 320mg/kg)

ラットに 100、320 及び 1,000mg/kg を、またイヌには 200、400 及び 800mg/kg を 26 週間経口投与したとき、ラットの 1,000mg/kg 投与群において加齢による慢性腎症の増強とこれに伴う腎重量及び尿蛋白の増加傾向、白血球数の減少が、イヌの 800mg/kg 投与群で胆嚢内胆汁量の増加が認められた。その他、亜急性毒性試験と同様にラット及びイヌに抗生物質で一般に観察される変化が認められた<sup>54)</sup>。

(無影響量：ラット 320mg/kg、イヌ 400mg/kg)

#### (3) 遺伝毒性試験<sup>55)</sup>

細菌を用いた復帰変異試験、哺乳類の培養細胞を用いた染色体異常試験及びマウスを用いた小核試験で遺伝毒性は認められなかった。

#### (4) がん原性試験

該当資料なし

## Ⅹ. 非臨床試験に関する項目

---

### (5) 生殖発生毒性試験

ラットの妊娠前及び妊娠初期、胎児の器官形成期に 100～1,000mg/kg を、周産期及び授乳期に 32～320mg/kg 並びにウサギの胎児の器官形成期に 1～10mg/kg を経口投与して生殖に及ぼす影響を検討したところ、ラットの器官形成期投与試験において、臨床用量 6mg/kg/日に対して 100mg/kg 以上の高用量で胎児体重の低値がみられたが、新生児の成長、発育、生殖能等に異常は認められず、また親動物の繁殖能への影響や催奇形性は認められなかった<sup>56)</sup>。

### (6) 局所刺激性試験

該当資料なし

### (7) その他の特殊毒性

#### 1) 抗原性<sup>55)</sup>

ウサギ、モルモット、マウスを用いて検討した結果、アナフィラキシー惹起性、IgE 抗体産生は認められず、本剤の免疫原性は弱いものと考えられた。また、本剤は誘発抗原性を持たず、セファレキシン、セファクロル及びセファロチンとの免疫学的交差性は認められなかった。

#### 2) 腎毒性<sup>55)</sup>

ウサギに 100～1,000mg/kg を単回経口投与し、腎への影響を検討した結果、薬物による異常所見は認められなかった。

ラットに 180～560mg/kg を単独ないし利尿剤と併用して 2 週間連続経口投与したが薬物による異常所見は認めず、利尿剤による腎障害を増悪させることもなかった。



## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：セフゾンカプセル 50mg、セフゾンカプセル 100mg  
処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）  
有効成分：セフジニル  
該当しない

### 2. 有効期間

2年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

設定されていない

### 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

同一成分薬：セフゾン細粒小児用 10%  
同 効 薬：セファクロル、セフポドキシムプロキシセチル、セフロキシムアキシセチル、セフィキシム、  
セフテラムピボキシル

### 7. 国際誕生年月日

1991年10月4日(国内開発)

### 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

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
セフゾンカプセル 50mg	1991年10月4日	20300AMZ00748	1991年11月29日	1991年12月10日 (製造販売承認承継 2019年4月1日)
セフゾンカプセル 100mg		20300AMZ00749		

### 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

1993年3月3日：「歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎」の効能・効果追加。  
2005年1月12日：2004年9月30日の再評価結果に合わせて、「効能・効果」等の一部変更。（「10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容」の項参照）

## X. 管理的事項に関する項目

### 10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再審査結果公表年月日：1999年3月3日

内容：医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第14条第2項第3号(承認拒否事由)イからハまでのいずれにも該当しない。

再評価結果公表年月日：2004年9月30日

内容：「効能・効果」を一部改めることにより、医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第14条第2項第3号(承認拒否事由)イからハまでのいずれにも該当しないことが確認されたため、「効能・効果」の項を下記のとおり変更した。

「旧効能・効果」

ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、ペプトストレプトコッカス属、プロピオニバクテリウム、淋菌、ブランハメラ・カタラーリス、大腸菌、クレブシエラ属、プロテウス・ミラビリス、プロビデンシア属、インフルエンザ菌のうちセフジニル感性菌による下記感染症

- 毛嚢(包)炎、せつ、せつ腫症、よう、伝染性膿痂疹、丹毒、蜂巣炎、リンパ管(節)炎、ひょう疽、化膿性爪囲(廓)炎、皮下膿瘍、汗腺炎、感染性粉瘤、慢性膿皮症
- 乳腺炎、肛門周囲膿瘍、外傷及び手術創の表在性二次感染
- 咽喉頭炎、急性気管支炎、扁桃炎、肺炎
- 腎盂腎炎、膀胱炎、淋菌性尿道炎
- 子宮付属器炎、子宮内感染、バルトリン腺炎
- 眼瞼炎、麦粒腫、瞼板腺炎
- 外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎
- 歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

「新効能・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、淋菌、モラクセラ(ブランハメラ)・カタラーリス、大腸菌、クレブシエラ属、プロテウス・ミラビリス、プロビデンシア属、インフルエンザ菌、ペプトストレプトコッカス属、アクネ菌

#### 〈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、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、肛門周囲膿瘍、咽喉頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、膀胱炎、腎盂腎炎、尿道炎、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、麦粒腫、瞼板腺炎、外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

### 11. 再審査期間

平成3年(1991年)10月4日～平成9年(1997年)10月3日(6年、終了)

### 12. 投薬期間制限に関する情報

「療担規則及び薬担規則並びに療担基準に基づき厚生労働大臣が定める掲示事項等」(厚生労働省告示第107号：平成18年3月6日付)とその一部改正(厚生労働省告示第97号：平成20年3月19日付)により「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。

ただし、8.重要な基本的注意の項には以下の記載がある。

#### 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。

X. 管理的事項に関する項目

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT(9桁)番号	レセプト電算処理 システム用コード
セフゾンカプセル 50mg	6132013M1029	6132013M1029	110929003	616130531
セフゾンカプセル 100mg	6132013M2025	6132013M2025	110930603	616130532

14. 保険給付上の注意

該当しない

# X I . 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 [R-07700]
- 2) 島田 馨 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：208-245 [CFN00031]
- 3) 荒田 次郎 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：996-1015 [CFN00109]
- 4) 原 耕平 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：612-633 [CFN00079]
- 5) 河田 幸道 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：874-892 [CFN00098]
- 6) 荒田 次郎 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：1016-1042 [CFN00110]
- 7) 原 耕平 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：634-659 [CFN00080]
- 8) 河田 幸道 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：893-914 [CFN00099]
- 9) 濱本 季子 他：日本化学療法学会雑誌 2001；49(8)：500-514 [CFN00541]
- 10) 横田 健 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：16-29 [CFN00017]
- 11) 峯 靖弘 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：122-134 [CFN00024]
- 12) 井上 栄子 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：1-15 [CFN00016]
- 13) 五島 瑳智子 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：30-55 [CFN00018]
- 14) 西野 武志 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：77-96 [CFN00021]
- 15) 加藤 直樹 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：65-76 [CFN00020]
- 16) 峯 靖弘 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：100-121 [CFN00023]
- 17) 横田 好子 他：Pharm. Med. 1998；16(7)：121-130 [CFN00448]
- 18) 社内報告書(DIR910006)
- 19) 前田 浩志 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：806-822 [CFN00093]
- 20) 島田 馨 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：246-256 [CFN00032]
- 21) 酒井 克治 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：708-717 [CFN00085]
- 22) 山元 貴雄 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：940-949 [CFN00102]
- 23) 山田 光興 他：産科と婦人科 1997；64(10)：1471-1475 [CFN00420]
- 24) 松本 文夫 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：426-435 [CFN00056]
- 25) 大野 勲 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：304-311 [CFN00040]
- 26) 渡辺 彰 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：312-325 [CFN00041]
- 27) 石岡 伸一 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：536-539 [CFN00071]
- 28) 中西 洋一 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：560-564 [CFN00074]
- 29) 林 敏明 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：565-578 [CFN00075]
- 30) 伊良部 勇栄 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：603-611 [CFN00078]
- 31) 河村 正三 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：1043-1052 [CFN00111]
- 32) 征矢野 薫 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：1053-1061 [CFN00112]
- 33) 乃木田 俊辰 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：955-969 [CFN00104]
- 34) 赤木 理 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：982-991 [CFN00107]
- 35) 山本 康生 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：992-995 [CFN00108]
- 36) 社内報告書(DIR910010)
- 37) 松田 静治 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：915-921 [CFN00100]
- 38) 張南 薫 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：922-939 [CFN00101]
- 39) 川嶋 尚平 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：1096-1100 [CFN00117]
- 40) 大石 正夫 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：1101-1111 [CFN00118]
- 41) 佐々木 次郎 他：菌科薬物療法 1992；11(2)：86-92 [CFN00208]
- 42) 大塚 芳基 他：日本化学療法学会雑誌 1992；40(10)：1237-1250 [CFN00217]
- 43) 坂本 博 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：165-178 [CFN00028]
- 44) 社内報告書(DIR910011)
- 45) 西谷 嘉夫 他：日本化学療法学会雑誌 1989；37(S-2)：823-840 [CFN00094]
- 46) Ueo, H. et al. : Biochem. Pharmacol. 2005；70(7)：1104-1113 [CFN00788] (PMID: 16098483)
- 47) Tomino, Y. et al. : Arzneimittelforschung. 1998；48(8)：862-867 [CFN00458] (PMID: 9748717)
- 48) Hishida, A. et al. : Antimicrob. Agents. Chemother. 1998；42(7)：1718-1721 [CFN00452] (PMID: 9661010)
- 49) 社内報告書(DIR910007)

## X I. 文献

---

- 50) Ueno, K. et al. : Clin. Pharmacol. Ther. 1993 ; 54(5) : 473-475 [CFN00253] (PMID: 8222489)
- 51) 社内報告書(DIR980049)
- 52) 社内報告書(DIR910012)
- 53) 中岡 農 他：基礎と臨床 1989 ; 23(15) : 5783-5788 [CFN00119]
- 54) 谷本 純一 他：基礎と臨床 1989 ; 23(15) : 5789-5831 [CFN00120]
- 55) 小原 要 他：基礎と臨床 1989 ; 23(15) : 5845-5858 [CFN00122]
- 56) 島津 宏 他：基礎と臨床 1989 ; 23(15) : 5833-5843 [CFN00121]

## 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II . 参考資料

---

### 1. 主な外国での発売状況

米国、欧州において、セフゾンの提携品は現在発売していない。(2022年1月現在)  
但し、同一成分である Cefdinir Capsules は複数社より発売されている。

### 2. 海外における臨床支援情報

#### (1) 妊婦に関する海外情報 (FDA)

本邦における使用上の注意「妊婦」の項は以下のとおりであり、米 FDA とは異なる。

#### 【使用上の注意】

##### 「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。

	分類
FDA : Pregnancy Category	B (2018年1月)

参考：分類の概要

FDA : Pregnancy Category

B : Animal reproduction studies have failed to demonstrate a risk to the fetus and there are no adequate and well-controlled studies in pregnant women.

#### (2) 小児等に関する記載

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) 粉碎**

該当資料なし

#### **(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性**

該当資料なし

### **2. その他の関連資料**

該当資料なし

製造販売  
**LTLファーマ株式会社**  
東京都新宿区西新宿6丁目10番1号

CFC1303hjA  
2022年4月作成