

**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2013に準拠して作成

**オキサゾリジノン系合成抗菌剤  
リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」  
LINEZOLID**

<b>剤形</b>	注射剤
<b>製剤の規制区分</b>	処方箋医薬品（注意 - 医師等の処方箋により使用すること）
<b>規格・含量</b>	1袋中リネゾリド 600mg/300mL 含有
<b>一般名</b>	和名：リネゾリド 洋名：Linezolid
<b>製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日</b>	承認年月日：2018年8月15日 薬価基準収載：2018年12月14日 発売年月日：2018年12月14日
<b>開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名</b>	製造販売元：日医工株式会社
<b>医薬情報担当者の連絡先</b>	
<b>問い合わせ窓口</b>	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>

本IFは2022年7月改訂（第6版）の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ

<https://www.pmda.go.jp/>にてご確認下さい。

## 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

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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（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）の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、（独）医薬品医療機器総合機構のホームページ（<https://www.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公式サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

### 2. IFとは

IFは「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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの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。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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の様式]

- ①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤字・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

#### [IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」（以下、「IF記載要領2013」と略す）により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

## **【IFの発行】**

- ①「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

### **3. IFの利用にあたって**

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	1	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	10
1. 開発の経緯 .....	1	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 ..	10
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1	2. 薬理作用 .....	10
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	2	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	11
1. 販売名 .....	2	1. 血中濃度の推移・測定法 .....	11
2. 一般名 .....	2	2. 薬物速度論的パラメータ .....	11
3. 構造式又は示性式 .....	2	3. 吸収 .....	11
4. 分子式及び分子量 .....	2	4. 分布 .....	12
5. 化学名（命名法） .....	2	5. 代謝 .....	12
6. 慣用名，別名，略号，記号番号 .....	2	6. 排泄 .....	12
7. CAS 登録番号 .....	2	7. トランスポーターに関する情報 .....	12
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	3	8. 透析等による除去率 .....	12
1. 物理化学的性質 .....	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> ..	13
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	3	1. 警告内容とその理由 .....	13
3. 有効成分の確認試験法 .....	3	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） ..	13
4. 有効成分の定量法 .....	3	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 .....	13
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	4	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 .....	13
1. 剤形 .....	4	5. 慎重投与内容とその理由 .....	13
2. 製剤の組成 .....	4	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 ..	13
3. 注射剤の調製法 .....	4	7. 相互作用 .....	15
4. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 .....	5	8. 副作用 .....	16
5. 製剤の各種条件下における安定性 .....	5	9. 高齢者への投与 .....	18
6. 溶解後の安定性 .....	6	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 .....	18
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	6	11. 小児等への投与 .....	18
8. 生物学的試験法 .....	6	12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	18
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	7	13. 過量投与 .....	18
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	7	14. 適用上の注意 .....	19
11. 力価 .....	7	15. その他の注意 .....	20
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	7	16. その他 .....	20
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 .....	7	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	21
14. その他 .....	7	1. 薬理試験 .....	21
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	8	2. 毒性試験 .....	21
1. 効能又は効果 .....	8	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	22
2. 用法及び用量 .....	8	1. 規制区分 .....	22
3. 臨床成績 .....	9		

2. 有効期間又は使用期限	22
3. 貯法・保存条件	22
4. 薬剤取扱い上の注意点	22
5. 承認条件等	22
6. 包装	22
7. 容器の材質	22
8. 同一成分・同効薬	22
9. 国際誕生年月日	22
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	22
11. 薬価基準収載年月日	22
12. 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	23
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	23
14. 再審査期間	23
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	23
16. 各種コード	23
17. 保険給付上の注意	23
<b>X I. 文献</b>	<b>24</b>
1. 引用文献	24
2. その他の参考文献	24
<b>X II. 参考資料</b>	<b>24</b>
1. 主な外国での発売状況	24
2. 海外における臨床支援情報	24
<b>X III. 備考</b>	<b>25</b>
その他の関連資料	25

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤はリネゾリドを有効成分とするオキサゾリジノン系合成抗菌剤である。

「リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」」は、共和薬品工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、安定性試験を実施し、2018年8月15日に承認を取得、日医工株式会社が2018年12月14日に販売を開始した。(薬食発1121第2号(平成26年11月21日)に基づき承認申請)

2019年6月5日に、「<適応菌種>本剤に感性のメチシリン耐性黄色ブドウ球菌(MRSA)<適応症>敗血症、深在性皮膚感染症、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、肺炎」の効能・効果が追加された。

2020年1月29日に、共和薬品工業株式会社から日医工株式会社に製造販売承認が承継された。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤はリネゾリドを有効成分とするオキサゾリジノン系合成抗菌剤である。
- (2) 1ポートの薄層バッグ製剤である。
- (3) バッグのラベル両面に販売名及びおよその目盛りを表示した。
- (4) 重大な副作用(頻度不明)として、可逆的な貧血・白血球減少症・汎血球減少症・血小板減少症等の骨髄抑制、代謝性アシドーシス、視神経症、ショック、アナフィラキシー、間質性肺炎、腎不全、低ナトリウム血症、偽膜性大腸炎、肝機能障害が報告されている。

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」

#### (2) 洋名

LINEZOLID

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

リネゾリド (JAN)

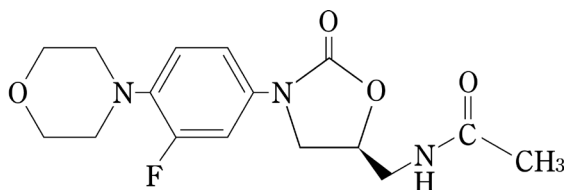
#### (2) 洋名 (命名法)

Linezolid (JAN)

#### (3) ステム

不明

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>16</sub>H<sub>20</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub>

分子量：337.35

### 5. 化学名 (命名法)

(-)-*N*-[[*(S)*]-3-(3-fluoro-4-morpholinophenyl)-2-oxo-5-oxazolidinyl]methyl] acetamide  
(IUPAC)

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

略号：LZD

### 7. CAS 登録番号

165800-03-3

### 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～微黄白色の粉末である。

##### (2) 溶解性

ジメチルスルホキシドに溶解やすく、メタノール又はエタノール（95）にやや溶解にくく、水に溶解にくい。

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点），沸点，凝固点

該当資料なし

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

##### (1) 紫外可視吸光度測定法

本品のメタノール溶液につき吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

##### (2) 赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤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。

#### 4. 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：リン酸二水素アンモニウム試液，メタノール混液



## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別, 外観及び性状

販売名	リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」
剤形・性状	水性注射剤 無色～黄色澄明の液
pH	4.4～5.2
浸透圧比	約 1 (生理食塩液に対する比)

#### (2) 溶液及び溶解時の pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 安定な pH 域等

(「IV. 1. (1) 剤形の区別, 外観及び性状」の項参照)

#### (3) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分 (活性成分) の含量

販売名	リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」
有効成分 (1 袋中)	リネゾリド 600mg/300mL
添加剤 (1 袋中)	ブドウ糖 13.702g, クエン酸ナトリウム水和物 492mg, クエン酸水和物 279mg, pH 調節剤

#### (2) 添加物

(「IV. 2. (1) 有効成分 (活性成分) の含量」の項参照)

#### (3) 電解質の濃度

該当資料なし

#### (4) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

#### (5) その他

該当資料なし

### 3. 注射剤の調製法

#### <添付文書>より抜粋 **適用上の注意**

本剤は用法・用量にしたがって、点滴静注のみに使用すること。本剤の使用に際しては、以下の点に注意すること。

#### (1) 投与前

- 1) 本剤は、調製不要の使い切りバッグであるので残液は使用しないこと。
- 2) バッグを包んでいる外袋は使用時まで開封しないこと。
- 3) 投与前に、不溶物の認められるものは使用しないこと。
- 4) バッグを押すことにより液漏れの有無の確認を行うこと。液漏れが認められた場合には、無菌性が損なわれている可能性があるため使用しないこと。
- 5) 本剤は、軟らかいバッグであるので、大気圧で自然に内容液が排出されるため、通気針は不要である。

続き

- 6) U字管連結は行わないこと。  
 7) バッグの液目盛りはおよその目安として使用すること。  
 8) 本剤は、時間の経過とともに黄色を呈することがあるが、効力に影響を及ぼすことはない。

**(2) 配合変化**

- 1) 本剤は、次の薬剤と配合禁忌である。  
 アムホテリシン B, クロルプロマジン塩酸塩, ジアゼパム, ペンタミジンイセチオン酸塩, エリスロマイシンラクトビオン酸塩, フェニトインナトリウム, スルファメトキサゾール・トリメトプリム, セフトリアキソンナトリウム
- 2) 本剤を他の薬剤と併用投与する場合には、各薬剤の定められた用法・用量に従い、別々に投与すること。
- 3) 本剤と他の薬剤を同一の輸液チューブにより連続注入する場合には、本剤及び他の薬剤と配合変化を起こさない輸液（生理食塩液）を本剤の投与前後に輸液チューブ内に流すこと。

**(3) 静脈内投与時**

本剤に他の薬剤を注入して使用しないこと。

**4. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意**

該当しない

**5. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>**

**(1) 加速試験**

最終包装製品を用いた加速試験（40℃, 75%RH, 6 ヶ月）の結果、リネズリド点滴静注液 600mg「日医工」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

◇リネズリド点滴静注液 600mg「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (バッグ包装)]

測定項目 <規格>	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 <無色～黄色澄明の液>	16R01 16R02 16R03	適合	適合	適合	適合
確認試験 (HPLC)	16R01 16R02 16R03	適合	適合	適合	適合
pH <4.4～5.2>	16R01 16R02 16R03	4.8 4.8 4.8	4.8～4.9 4.8 4.8	4.8 4.8 4.8	4.8 4.8 4.8
浸透圧比 <0.9～1.1>	16R01 16R02 16R03	1.0～1.1 1.0 1.0～1.1	1.0～1.1 1.0～1.1 1.0～1.1	1.0 1.0～1.1 1.0	1.0～1.1 1.0～1.1 1.0～1.1
純度試験 (HPLC) <※1>	16R01 16R02 16R03	適合	適合	適合	適合
含量 (%) ※2 <95.0～105.0%>	16R01 16R02 16R03	99.4～100.5 99.4～100.1 99.2～100.4	98.0～99.4 98.6～99.5 98.8～99.6	98.0～98.8 98.2～98.8 98.1～98.6	98.3～99.0 98.0～98.7 96.9～98.3

※1 : RRT 約 0.3 類縁物質 1.0%以下, RRT 約 0.7 類縁物質 0.5%以下, 左記以外の個々の類縁物質 : 0.15%以下, 総類縁物質 2.0%以下    ※2 : 表示量に対する含有率 (%)

その他, エンドトキシン, 採取容量, 不溶性異物, 不溶性微粒子及び無菌試験を実施し, 適合していることを確認した。

## (2) 光安定性試験

◇保存条件：曝光（D65 光源） [保存形態：黄色遮光外袋（二次包装）]

成り行きの温湿度（20.1～27.2℃，43.3～67.6RH）

測定項目 ＜規格＞	ロット 番号	総曝光量		
		開始時	60 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 n=3 ＜無色～黄色澄明の液＞	16R03	適合	適合	適合
確認試験 n=3 (HPLC)	16R03	適合	適合	適合
pH n=3 ＜4.4～5.2＞	16R03	4.80	4.85	4.80～4.81
浸透圧比 n=3 ＜0.9～1.1＞	16R03	1.04～1.05	1.04～1.05	1.05
純度試験 (HPLC) n=3 ＜※1＞	16R03	適合	適合	適合
含量 (%) ※2 n=3 ＜95.0～105.0%＞	16R03	99.16～100.36	99.08～99.49	97.88～99.74

※1：RRT 約 0.3 類縁物質 1.0%以下，RRT 約 0.7 類縁物質 0.5%以下，左記以外の個々の類縁物質：0.15%以下，総類縁物質 2.0%以下 ※2：表示量に対する含有率 (%)

その他，不溶性異物及び不溶性微粒子試験を実施し，適合していることを確認した。

◇保存条件：白色蛍光灯（1000Lx） [保存形態：黄色遮光外袋なし]

成り行きの温湿度（20.5～25.1℃，54.8～81.5RH）

測定項目 ＜規格＞	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	2.4 万 Lx・hr	7.2 万 Lx・hr	16.8 万 Lx・hr
性状 n=3 ＜無色～黄色澄明の液＞	18H02	無色澄明の液※3	微赤桃色 澄明の液	微赤桃色 澄明の液	微赤桃色 澄明の液
pH n=3 ＜4.4～5.2＞	18H02	4.82※3	4.82	4.81～4.82	4.80～4.81
純度試験 (HPLC) n=3 ＜※1＞	18H02	適合※3	適合	<b>不適合</b>	<b>不適合</b>
含量 (%) ※2 n=3 ＜95.0～105.0%＞	18H02	99.88※3	98.33～99.40	97.55～98.65	97.31～97.86

※1：RRT 約 0.3 類縁物質 1.0%以下，RRT 約 0.7 類縁物質 0.5%以下，左記以外の個々の類縁物質：0.15%以下，総類縁物質 2.0%以下 ※2：表示量に対する含有率 (%) ※3：n=1 規格外：太字

### 6. 溶解後の安定性

該当しない

### 7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

（「XⅢ. 備考 リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」配合変化試験」の項参照）

### 8. 生物学的試験法

該当しない

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

液体クロマトグラフィー

本品の保持時間は標準溶液から得たリネゾリドのピークの保持時間に一致する。また、吸収スペクトルを測定するとき、波長 249～253nm に吸収の極大を示す。

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：リン酸二水素アンモニウム溶液，メタノール混液

## 11. 力価

該当しない

## 12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

## 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

## 14. その他

### 輸液セットへの吸着性試験<sup>2)</sup>

試験報告日：2018/10/12

試料：リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」 ロット番号：18H02

輸液セット：

素材	型番	メーカー
PVC	JMS 輸液フィルター付輸液セット JY - NFC362F7 (0.2 $\mu$ m)	株式会社ジェイ・エム・エス
PVC フリー	テルフュージョン輸液セット TI - J352P (0.2 $\mu$ m)	テルモ株式会社

流 速：300mL を 120 分で滴下終了する速度

採取箇所：輸液バッグから直接採取，フィルター通過後から採取

採取時間：滴下直前，30 分，60 分，120 分

試験項目：外観，定量

試験条件：温湿度（19.6～23.4℃，58～71%RH），室内照度（1500Lx）

[結果]

リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」300mL に、JMS 製輸液セット及びテルモ製輸液セットの輸液用具を取り付け、滴下したとき、いずれの採取箇所、採取時間においても各試験結果に変化は認められず、輸液セットへの吸着は認められなかった。

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### (1) <適応菌種>

本剤に感性のメチシリン耐性黄色ブドウ球菌 (MRSA)

#### <適応症>

敗血症, 深在性皮膚感染症, 慢性膿皮症, 外傷・熱傷及び手術創等の二次感染, 肺炎

#### (2) <適応菌種>

本剤に感性のバンコマイシン耐性エンテロコッカス・フェシウム

#### <適応症>

各種感染症

### 2. 用法及び用量

通常, 成人及び12歳以上の小児にはリネゾリドとして1日1200mgを2回に分け, 1回600mgを12時間ごとに, それぞれ30分~2時間かけて点滴静注する。

通常, 12歳未満の小児にはリネゾリドとして1回10mg/kgを8時間ごとに, それぞれ30分~2時間かけて点滴静注する。なお, 1回投与量として600mgを超えないこと。

#### <用法・用量に関連する使用上の注意>

- (1) 本剤の使用にあたっては, 耐性菌の発現等を防ぐため, 次のことに注意すること。
  - 1) 感染症の治療に十分な知識と経験を持つ医師又はその指導のもとで行うこと。
  - 2) 原則として他の抗菌薬及び本剤に対する感受性(耐性)を確認すること。
  - 3) 投与期間は, 感染部位, 重症度, 患者の症状等を考慮し, 適切な時期に, 本剤の継続投与が必要か判定し, 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。
- (2) 点滴静注, 経口投与及び切り替え投与のいずれの投与方法においても, 28日を超える投与の安全性及び有効性は検討されていない。したがって, 原則として本剤の投与は28日を超えないことが望ましい。なお, 本剤を28日を超えて投与した場合, 視神経障害があらわれることがある。[「重要な基本的注意」(5)の項参照]
- (3) 本剤はグラム陽性菌に対してのみ抗菌活性を有する。したがってグラム陰性菌等を含む混合感染と診断された場合, 又は混合感染が疑われる場合は適切な薬剤を併用して治療を行うこと。
- (4) 本剤は添加物としてブドウ糖4.6% (ブドウ糖水和物換算で5%) (1バッグ300mL中, ブドウ糖として13.702g (水和物換算で15.071g)) を含有する。点滴静注する場合の速度は, 10mL/kg/hr (ブドウ糖水和物として0.5g/kg/hr) 以下とすること。
- (5) 注射剤から錠剤への切り替え  
注射剤からリネゾリドの投与を開始した患者において, 経口投与可能であると医師が判断した場合は, 同じ用量の錠剤に切り替えることができる。

### **3. 臨床成績**

#### **(1) 臨床データパッケージ**

該当資料なし

#### **(2) 臨床効果**

該当資料なし

#### **(3) 臨床薬理試験**

該当資料なし

#### **(4) 探索的試験**

該当資料なし

#### **(5) 検証的試験**

##### **1) 無作為化並行用量反応試験**

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

#### **(6) 治療的使用**

##### **1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（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**

該当しない

## 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

本剤と同一骨格を有する抗菌薬はない。

MRSAに適応を有する薬剤：日局注射用バンコマイシン塩酸塩，日局テイコプラニン，日局アルベカシン硫酸塩注射液

VREに適応を有する薬剤：キヌプリスチン・ダルホプリスチン

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>3)</sup>

オキサゾリジノン系の合成抗微生物薬である。

リボソームの 50S サブユニットの P 部位に結合することで，タンパク質合成を開始するリボソーム - fMet - tRNA 複合体の形成を阻止し，タンパク質合成を阻害する。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (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・測定法**

#### **(1) 治療上有効な血中濃度**

該当資料なし

#### **(2) 最高血中濃度到達時間**

該当資料なし

#### **(3) 臨床試験で確認された血中濃度**

該当資料なし

#### **(4) 中毒域**

該当資料なし

#### **(5) 食事・併用薬の影響**

(「VIII. 7. 相互作用」の項参照)

#### **(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因**

該当資料なし

### **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) バイオアベイラビリティ**

該当資料なし

#### **(4) 消失速度定数**

該当資料なし

#### **(5) クリアランス**

該当資料なし

#### **(6) 分布容積**

該当資料なし

#### **(7) 血漿蛋白結合率**

該当資料なし

### **3. 吸収**

該当資料なし



#### 4. 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

(「Ⅷ. 10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与」の項参照)

##### (3) 乳汁への移行性

(「Ⅷ. 10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与」の項参照)

##### (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

該当資料なし

#### 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) 排泄部位及び経路

該当資料なし

##### (2) 排泄率

該当資料なし

##### (3) 排泄速度

該当資料なし

#### 7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

#### 8. 透析等による除去率

(「Ⅷ. 13. 過量投与」の項参照)

## 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

#### 【警告】

本剤の耐性菌の発現を防ぐため、「用法・用量に関連する使用上の注意」の項を熟読の上、適正使用に努めること。

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

#### 【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

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

（「Ⅴ. 治療に関する項目」を参照）

### 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）投与前に貧血，白血球減少症，汎血球減少症，血小板減少症等の骨髄抑制が確認されている患者，骨髄抑制作用を有する薬剤との併用が必要な患者，感染症のため長期にわたり他の抗菌薬を本剤の投与前に投薬されていた，あるいは，本剤と併用して投薬される患者，14日を超えて本剤を投与される可能性のある患者〔「重要な基本的注意」(1)の項参照〕
- （2）高度な腎機能障害のある患者
- （3）体重40kg未満の患者〔貧血の発現頻度が高くなる傾向が認められている。〕
- （4）授乳婦〔「妊婦，産婦，授乳婦等への投与」(2)の項参照〕

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- （1）本剤の投与にあたっては，血液検査を定期的（週1回を目処）に実施すること。特に投与前に貧血，白血球減少症，汎血球減少症，血小板減少症等の骨髄抑制が確認されている患者，骨髄抑制作用を有する薬剤との併用が必要な患者，感染症のため長期にわたり他の抗菌薬を本剤の投与前に投薬されていた，あるいは，本剤と併用して投薬される患者，14日を超えて本剤を投与される可能性のある患者には血液検査値に注意すること。貧血，白血球減少症，汎血球減少症，血小板減少症等の骨髄抑制の傾向や悪化が認められた場合には，本剤の投与中止等の適切な処置を行うこと。〔「副作用」(1)の1)の項参照〕
- （2）本剤の投与により，乳酸アシドーシス等の代謝性アシドーシスがあらわれることがあるので，嘔気，嘔吐の症状が繰り返しあらわれた場合には，直ちに医師の診断を受けるよう患者を十分指導すること。これらの症状や原因不明のアシドーシスもしくは血中重炭酸塩減少等の症状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。

続き

- (3) 本剤の投与により、低ナトリウム血症があらわれることがあるので、定期的に血清ナトリウム値の測定を行い、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。
- (4) 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もある。  
したがって本剤を投与する場合には、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、直ちに医師に通知するよう注意すること。  
また、偽膜性大腸炎の症状が重篤な場合には適切な処置を行うこと。
- (5) 本剤を 28 日を超えて投与した場合、視神経障害があらわれることがあり、さらに視力喪失に進行する可能性があるため観察を十分に行うこと。また、視力低下、色覚異常、霧視、視野欠損のような自覚症状があらわれた場合、直ちに医師に連絡するように患者を指導すること。これらの症状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。[「副作用」(1)の3)の項参照]
- (6) 本剤と選択的セロトニン再取り込み阻害剤 (SSRI) を含むセロトニン作動薬との併用によるセロトニン症候群がまれに報告されている。本剤とセロトニン作動薬との併用投与にあたっては、セロトニン症候群の徴候及び症状 (錯乱、せん妄、情緒不安、振戦、潮紅、発汗、超高熱) に十分注意すること。[「相互作用」の項参照]
- (7) 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、次の措置をとること。
  - 1) 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。
  - 2) 投与に際しては、必ずショック等に対する救急処置のとれる準備をしておくこと。
  - 3) 投与開始から投与終了後まで、患者を安静の状態に保たせ、十分な観察を行うこと。特に、投与開始直後は注意深く観察すること。
- (8) 抗菌薬の使用は、非感受性菌の過剰増殖を促進する可能性があるため、治療中に重複感染が発現した場合には、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

該当記載事項なし

### (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
<b>モノアミン酸化酵素（MAO）阻害剤</b> 塩酸セレギリン	両薬剤が相加的に作用し血圧上昇等 があらわれるおそれがある。	本剤は非選択的、 可逆的 MAO 阻害 作用を有する。
<b>アドレナリン作動薬</b> ドパミン塩酸塩 アドレナリン フェニルプロパノールアミン等	血圧上昇、動悸があらわれることがあ るので、患者の状態を観察しながら、 これらの薬剤の初回量を減量するな ど用量に注意すること。	本剤は非選択的、 可逆的 MAO 阻害 作用を有する。
<b>セロトニン作動薬</b> 炭酸リチウム セロトニン・ノルアドレナリン再取り 込み阻害剤（SNRI） 選択的セロトニン再取り込み阻害剤 （SSRI） トリプタン系薬剤 L-トリプトファン含有製剤 トラマドール塩酸塩 フェンタニル メサドン塩酸塩 ペチジン塩酸塩等	セロトニン症候群の徴候及び症状（錯 乱、せん妄、情緒不安、振戦、潮紅、 発汗、超高熱）があらわれるおそれ があるので、十分に注意すること。 これらの徴候や症状が認められた場 合には、本剤と併用薬の両方あるい はいずれか一方の投与を中止するな ど適切な処置を行うこと。なお、セロ トニン作動薬の急激な減量又は投与中 止により離脱症状があらわれること があるので注意すること。	本剤は非選択的、 可逆的 MAO 阻害 作用を有する。
<b>リファンピシン</b>	リファンピシンとの併用により本剤 の Cmax 及び AUC がそれぞれ 21% 及び 32%低下した。	機序不明
<b>チラミンを多く含有する飲食物</b> チーズ ビール 赤ワイン等 <sup>注)</sup>	血圧上昇、動悸があらわれることがあ るので、本剤投与中には、チラミン含 有量の高い飲食物の過量摂取（1食あ たりチラミン 100mg 以上）を避けさ せること。	本剤は非選択的、 可逆的 MAO 阻害 作用を有する。

注) チラミン含有量：チーズ；0～5.3mg/10g，ビール；1.1mg/100mL，赤ワイン；0～2.5mg/100mL

## 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。

### (2) 重大な副作用と初期症状（頻度不明）

- 1) **可逆的な貧血・白血球減少症・汎血球減少症・血小板減少症等の骨髄抑制**：投与中止によって回復しうる貧血・白血球減少症・汎血球減少症・血小板減少症等の骨髄抑制があらわれることがあるので、血液検査を定期的に行い、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。なお、本剤の臨床試験において、14日を超えて本剤を投与した場合に血小板減少症の発現頻度が高くなる傾向が認められている。
- 2) **代謝性アシドーシス**：乳酸アシドーシス等の代謝性アシドーシスがあらわれることがあるので、患者の状態を十分に観察し、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。
- 3) **視神経症**：視神経症があらわれることがあるので、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。
- 4) **ショック、アナフィラキシー**：ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、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。
- 5) **間質性肺炎**：間質性肺炎があらわれることがあるので、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。
- 6) **腎不全**：クレアチニン上昇、BUN 上昇等を伴う腎不全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。
- 7) **低ナトリウム血症**：意識障害、嘔気、嘔吐、食欲不振等を伴う低ナトリウム血症があらわれることがあるので、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。
- 8) **偽膜性大腸炎**：偽膜性大腸炎があらわれることがあるので、観察を十分に行い、腹痛、頻回の下痢があらわれた場合には直ちに投与を中止するなど、適切な処置を行うこと。
- 9) **肝機能障害**：AST (GOT), ALT (GPT), LDH, Al-P,  $\gamma$ -GTP 等の上昇を伴う肝機能障害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。

続き

**(3) その他の副作用**

	頻度不明
血液	好酸球増加症, 血小板血症, 白血球増加症, 好中球減少症, 紫斑
代謝・栄養	リパーゼ増加, アミラーゼ増加, 低クロール血症, 高血糖, 高カリウム血症, 低カリウム血症, 高尿酸血症, CK (CPK) 増加, 脱水, 痛風, 低カルシウム血症, 体重増加
神経	浮動性めまい, 痙攣, 意識消失, 振戦, 落ち着きのなさ, 傾眠, 失見当識, 末梢神経障害, 一過性脳虚血発作, 回転性めまい, 感覚鈍麻, 錯感覚, 不眠症, 不安, 多幸症, 幻覚
感覚器	霧視, 眼の障害, 視覚異常, 瞳孔反射障害, 耳鳴, 耳の障害, 味覚消失, 味覚倒錯
循環器	上室性期外収縮, 高血圧, 動悸, 血栓性静脈炎, QT 延長, 頻脈, 低血圧, 血管拡張, 静脈炎
呼吸器	呼吸困難, 肺炎, 肺水腫, 気胸, 咳嗽, 喘鳴, 咽頭炎, 気管炎, 気管支炎, 胸水, 鼻出血
消化器	下痢, 悪心, 嘔吐, 食欲不振, 食道炎・胃腸炎, 胃腸出血, 腹痛, 麻痺性イレウス, 口渇, 胃食道逆流, 腹部膨満, 口唇炎, 口内炎, 口腔内潰瘍, 口腔内白斑症, 舌障害, 舌炎, 舌変色, 歯の変色, 食欲亢進, 膵炎, 消化不良, 便秘, メレナ
肝臓	肝機能検査値異常, ビリルビン血症, AST (GOT) 増加, ALT (GPT) 増加, $\gamma$ -GTP 増加, ALP 増加, LDH 増加, 肝炎
皮膚	発疹, 水疱, 皮膚炎, 斑状丘疹状皮疹, 剥脱性皮膚炎, 皮膚単純疱疹, 湿疹, 紅斑, 蕁麻疹, 皮膚感染, 真菌性皮膚炎, 皮膚びらん, そう痒, 皮膚刺激, 過敏性血管炎
筋・骨格	筋痛
泌尿器・生殖器	排尿困難, 頻尿, 多尿, 膣痛, 膣感染, 性器分泌物, 不正子宮出血, 陰茎感染
その他	網状赤血球減少症, 血管痛, 浮腫, 倦怠感, 網状赤血球数増加, 頭痛, 背部痛, 発熱, カンジダ症, 下肢脱力, $\beta$ -HCG 増加, 血管神経性浮腫, 顔面浮腫, アレルギー反応, 光線過敏性反応, 無力症, 疲労, 悪寒, 発汗, 粘膜乾燥, 膿瘍, 真菌感染, 注射部/血管カテーテル部浮腫, 注射部/血管カテーテル部そう痒感, 注射部/血管カテーテル部疼痛, 注射部/血管カテーテル部静脈炎/血栓性静脈炎, 注射部/血管カテーテル部反応

**(4) 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

**(5) 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

## (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

- 1) **禁忌**：本剤の成分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) **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，次の措置をとること。①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。②投与に際しては，必ずショック等に対する救急処置のとれる準備をしておくこと。③投与開始から投与終了後まで，患者を安静の状態に保たせ，十分な観察を行うこと。特に，投与開始直後は注意深く観察すること。
- 3) **重大な副作用**：ショック，アナフィラキシーがあらわれることがあるので，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。
- 4) **その他の副作用**：皮膚症状（発疹，水疱，皮膚炎，斑状丘疹状皮膚疹，剥脱性皮膚炎，皮膚単純疱疹，湿疹，紅斑，蕁麻疹，皮膚感染，真菌性皮膚炎，皮膚びらん，そう痒，皮膚刺激，過敏性血管炎）が報告されている。

## 9. 高齢者への投与

該当記載事項なし

## 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，治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
- (2) **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。[ヒト母乳中への移行の有無は不明である。動物実験（ラット）で乳汁中に移行することが認められている。]

## 11. 小児等への投与

生後7日目までの早産（在胎34週未満）新生児においてクリアランスが低い値を示し，7日目以降にクリアランスは迅速に増加するとの報告があることから，これらの患者に投与する場合には投与間隔を12時間ごとにする 것을考慮すること。

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当記載事項なし

## 13. 過量投与

- (1) **症状**：ヒトに過量投与した時の影響は知られていないが，動物実験（イヌ，ラット）において，ラットに自発運動低下と運動失調（投与量 3,000mg/kg/日），イヌに嘔吐と振戦（投与量 2,000mg/kg/日）があらわれた。
- (2) **処置**：患者の状態を注意深く観察し，本剤の過量投与が疑われた場合は，必要に応じ糸球体ろ過能を維持させる支持療法を行うことが望ましい。血液透析ではリネゾリドの急速な消失が認められた。第I相臨床試験において，リネゾリドの投与量の約30%は，リネゾリド投与3時間後に始めた3時間の血液透析期間中に除去された。腹膜透析又は血液灌流によるリネゾリドの除去については，データが得られていない。

## 14. 適用上の注意

本剤は用法・用量にしたがって、点滴静注のみに使用すること。本剤の使用に際しては、以下の点に注意すること。

### (1) 投与前

- 1) 本剤は、調製不要の使い切りバッグであるので残液は使用しないこと。
- 2) バッグを包んでいる外袋は使用時まで開封しないこと。
- 3) 投与前に、不溶物の認められるものは使用しないこと。
- 4) バッグを押すことにより液漏れの有無の確認を行うこと。液漏れが認められた場合には、無菌性が損なわれている可能性があるため使用しないこと。
- 5) 本剤は、軟らかいバッグであるので、大気圧で自然に内容液が排出されるため、通気針は不要である。
- 6) U字管連結は行わないこと。
- 7) バッグの液目盛りはおよその目安として使用すること。
- 8) 本剤は、時間の経過とともに黄色を呈することがあるが、効力に影響を及ぼすことはない。

### (2) 配合変化

- 1) 本剤は、次の薬剤と配合禁忌である。  
アムホテリシン B, クロルプロマジン塩酸塩, ジアゼパム, ペンタミジンイセチオン酸塩, エリスロマイシンラクトビオン酸塩, フェニトインナトリウム, スルファメトキサゾール・トリメトプリム, セフトリアキソンナトリウム
- 2) 本剤を他の薬剤と併用投与する場合には、各薬剤の定められた用法・用量に従い、別々に投与すること。
- 3) 本剤と他の薬剤を同一の輸液チューブにより連続注入する場合には、本剤及び他の薬剤と配合変化を起こさない輸液（生理食塩液）を本剤の投与前後に輸液チューブ内に流すこと。

### (3) 静脈内投与時

本剤に他の薬剤を注入して使用しないこと。



## 15. その他の注意

- (1) イヌにおける1ヵ月間反復経口投与毒性試験(0, 20, 40及び80mg/kg/日:AUCの比較で、ヒトの経口投与及び静脈内投与における曝露量のそれぞれ0.4倍以上及び0.8倍以上)において、対照群を含み投与群の雄に前立腺、精巣及び精巣上体の低形成が報告されているが、イヌにおける他の反復投与毒性試験では生殖器に変化は認められていない。
- (2) ラットにおける授(受)胎能・生殖能及び授乳期における生殖試験(0, 2.5, 15及び50mg/kg/日)において、高用量群(AUCの比較で、ヒトの経口投与及び静脈内投与における曝露量のそれぞれ0.7倍及び1.3倍に相当)に精子運動能の軽度低下が報告されている。幼若ラットにおける反復投与試験(100mg/kg/日, 22~35日齢)では、精子運動性の低下及び精子の形態変化が、いずれも可逆的な変化として認められた。このときの曝露量は、3ヵ月齢~11歳の小児患者(外国人)で認められるAUCの5.9倍であった。
- (3) 幼若雄ラットにおける反復投与試験(7~36日齢に50mg/kg/日, 37~55日齢に100mg/kg/日)では、授胎能の軽度低下が認められた。このときの曝露量は、3ヵ月齢~11歳の小児患者(外国人)で認められるAUCの5.1倍であった。
- (4) 雌ラットの妊娠及び授乳期にリネゾリド50mg/kg/日投与群(AUCの比較で、ヒトの経口投与及び静脈内投与における曝露量のそれぞれ0.7倍及び1.3倍に相当)において、生後1~4日における新生児の生存率が低下した。
- (5) ラットにおける雄性生殖能回復試験(0, 50及び100mg/kg/日, 9週間投与)において、高用量群(AUCの比較で、ヒトの経口投与及び静脈内投与における曝露量のそれぞれ2.1倍及び4.0倍に相当)で投与4週目のテストステロン値に減少がみられたが、回復12週目のテストステロン値に変化はみられていないと報告されている。雄性ラットにおける他の生殖能試験では、テストステロン値の減少は認められていない。

## 16. その他

### 【取扱上の注意】

製品の品質を保持するため、本品を包んでいる外袋は使用時まで開封しないこと。

## 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」参照)

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤	リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」	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	リネゾリド	なし

### 2. 有効期間又は使用期限

外箱等に表示。使用期限を過ぎた製品は使用しないこと。(3年：安定性試験結果に基づく)

### 3. 貯法・保存条件

遮光，室温保存（凍結を避けること）

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

(「規制区分」，「貯法・保存条件」の項参照)

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

患者向医薬品ガイド：有，くすりのしおり：有

(「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」を参照)

#### (3) 調剤時の留意点について

(「VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目」を参照)

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

300mL×5袋

### 7. 容器の材質

無色ポリエチレン製容器，ポリイソプレンゴム製ゴム栓，黄色遮光プラスチック製外袋

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分：ザイボックス注射液 600mg

### 9. 国際誕生年月日

不明

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造承認年月日	承認番号
リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」	2018年 8月 15日	23000AMX00607000

### 11. 薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日
リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」	2018年 12月 14日

## 12. 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

＜効能・効果追加＞

効能・効果追加年月日：2019年6月5日

販売名：リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」

内容：

	新	旧
効能・効果	<p>(1) &lt;適応菌種&gt; 本剤に感性のメチシリン耐性黄色ブドウ球菌 (MRSA)</p> <p>&lt;適応症&gt; 敗血症，深在性皮膚感染症，慢性膿皮症，外傷・熱傷及び手術創等の二次感染，肺炎</p> <p>(2) &lt;適応菌種&gt; 本剤に感性のバンコマイシン耐性エンテロコッカス・フェシウム</p> <p>&lt;適応症&gt; 各種感染症</p>	<p>&lt;適応菌種&gt; 本剤に感性のバンコマイシン耐性エンテロコッカス・フェシウム</p> <p>&lt;適応症&gt; 各種感染症</p>
	<p>通常，成人及び12歳以上の小児にはリネゾリドとして1日1200mgを2回に分け，1回600mgを12時間ごとに，それぞれ30分～2時間かけて点滴静注する。</p> <p>通常，12歳未満の小児にはリネゾリドとして1回10mg/kgを8時間ごとに，それぞれ30分～2時間かけて点滴静注する。なお，1回投与量として600mgを超えないこと。</p>	<p>通常，成人及び12歳以上の小児にはリネゾリドとして1日1200mgを2回に分け，1回600mgを12時間ごとに，それぞれ30分～2時間かけて点滴静注する。</p> <p>通常，12歳未満の小児にはリネゾリドとして1回10mg/kgを8時間ごとに，それぞれ30分～2時間かけて点滴静注する。なお，1回投与量として600mgを超えないこと。</p>
用法・用量		

( )：効能・効果追加に伴う変更箇所

## 13. 再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

## 14. 再審査期間

該当しない

## 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は，投薬期間に関する制限は定められていない。

(「Ⅷ. 1. 警告内容とその理由」，「Ⅴ. 2. 用法及び用量」の項参照)

## 16. 各種コード

販売名	薬価基準収載 医薬品コード	レセプト 電算コード	HOT(9桁) コード
リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」	6249401A1068	622652801	126528601

## 17. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## **X I. 文献**

### **1. 引用文献**

- 1) 日医工株式会社 社内資料：安定性試験
- 2) 日医工株式会社 社内資料：輸液セットへの吸着性試験
- 3) グッドマン・ギルマン：薬理書（下）第 12 版，廣川書店，1988（2013）

### **2. その他の参考文献**

なし

## **X II. 参考資料**

### **1. 主な外国での発売状況**

なし

### **2. 海外における臨床支援情報**

なし

### XIII. 備考

#### その他の関連資料

リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」 配合変化試験

#### 本項の情報に関する注意：

本項は、本剤の物理化学的安定性に関する情報であり、他剤と配合して使用した際の有効性・安全性についての評価は実施していない。また、配合した他剤の物理化学的安定性については検討していない。本剤を他剤と配合して使用する際には、各薬剤の添付文書を確認し、判断すること。

試験実施期間：2018/6/28～2018/11/1

#### (1) pH 変動試験

##### ◆リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」 pH 変動スケール

本品 20mL を試料とし、0.1mol/L HCl 及び 0.1mol/L NaOH を各 20mL 滴加した。

試料	試料量	試料 pH	0.1mol/L HCl(A)mL 0.1mol/L NaOH(B)mL	最終 pH	移動指数	残存率 (%) (試料のリネゾリド含量を 100 とした)	
						最終 pH 到達直後	最終 pH 24 時間後
リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」	20mL	4.84	(A) 20.0mL	1.46	3.38	99.96	99.74
			(B) 20.0mL	11.88	7.04	99.96	<b>54.49</b>

pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14
変化なし (無色澄明)	←0.1mol/L HCl 消費量 20.0mL										0.1mol/L NaOH→ 消費量 20.0mL		変化なし (無色澄明)	
	1.46			4.84			11.88							

## (2) 配合変化試験

### 試験方法

配合薬剤を添付文書に従って調製し、リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」(20mL) と容量 1 対 1 の割合で配合し、配合直後、1, 4, 24 時間後における外観、pH 及び残存率を測定した。(残存率は配合直後、4, 24 時間後の測定)

また、参考として、配合薬剤単剤の外観及び pH を測定した。

[試験実施条件 温湿度：18.3～21.6℃, 43～78%RH 室内照度：約 1400Lx]

<表中の略号>

－：1 つ前の測定時期より変化なし、×：試験未実施

→：分取 (例：200mL→20mL 200mL から 20mL を分取)

成分名：ナトリウムを Na と略記

A：アンプル、W：注射用水、S：生理食塩液、G：5%ブドウ糖注射液

分類	配合薬剤		配合薬剤 調製方法	試験項目	配合後の経過時間			
	配合薬剤名 [成分名等]	外観(pH)			配合直後	1 時間	4 時間	24 時間
輸液類	大塚生食注 [生理食塩液]	無色澄明 (5.97)	250mL →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.64 100.0	－ 4.65 ×	－ 4.64 99.8	－ 4.65 100.3
	大塚糖液 5% [ブドウ糖注射液]	無色澄明 (5.79)	100mL →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.89 100.0	－ 4.89 ×	－ 4.86 99.7	－ 4.89 99.8
	ソリターT3 号輸液 [維持液]	無色澄明 (5.48)	200mL →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.91 100.0	－ 4.91 ×	－ 4.92 99.7	－ 4.91 99.6
	フルカリック 1 号輸液 [アミノ酸・糖・電解質・ビタミン]	黄色澄明 (5.08)	903mL →20mL	外観 pH 残存率(%)	淡黄色澄明 4.90 100.0	－ 4.91 ×	－ 4.90 100.2	－ 4.89 100.2
	ラクテック注 [乳酸リンゲル液]	無色澄明 (6.53)	250mL →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.84 100.0	－ 4.84 ×	－ 4.84 99.4	－ 4.85 100.1
中枢神経系 系用薬	アレビアチン注 250mg [フェニトイン Na]	無色澄明 (12.12)	5mL×4A	外観 pH 残存率(%)	白濁 10.89 ×	白濁 10.97 ×	－ 10.98 ×	－ 10.97 ×
	コントミン筋注 50mg [クロルプロマジン塩酸塩注射液]	無色澄明 (5.75)	5mL×4A	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.63 100.0	－ 4.63 ×	－ 4.64 100.0	－ 4.62 100.4
	セルシン注射液 10mg [ジアゼパム]	黄色澄明 (6.43)	2mL×10A	外観 pH 残存率(%)	微黄色微濁 5.67 ×	－ 5.68 ×	－ 5.68 ×	－ 5.68 ×
	ホリゾン注射液 10mg [ジアゼパム]	黄色澄明 (6.47)	2mL×10A	外観 pH 残存率(%)	微黄色微濁 5.68 ×	－ 5.69 ×	－ 5.69 ×	－ 5.67 ×
強心剤	イノバン注 100mg [ドパミン塩酸塩]	無色澄明 (5.71)	5mL→0.5mL +19.5mL(S)	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.65 100.0	－ 4.64 ×	－ 4.64 99.7	－ 4.64 100.8
	去痰剤 ビスルボン注 4mg [プロムヘキシン塩酸塩]	無色澄明 (3.89)	2mL +100mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.62 100.0	－ 4.63 ×	－ 4.62 99.6	－ 4.62 99.8

続き

分類	配合薬剤		配合薬剤 調製方法	試験項目	配合後の経過時間			
	配合薬剤名 [成分名等]	外観(pH)			配合直後	1時間	4時間	24時間
抗 生 物 質 製 剤	エリスロシン点滴静注用 500mg [エリスロマイシンラクトビオン酸 塩]	無色澄明 (7.35)	500mg +10mL(W) +90mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.73 100.0	— 4.73 ×	— 4.73 99.6	— 4.73 98.9
	カルベニン点滴用 0.25g [パニペナム・ベタミブロン]	淡黄色澄明 (6.57)	0.25g +50mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	微黄色澄明 5.12 100.0	— 5.10 ×	淡黄色澄明 5.06 99.3	黄色澄明 4.95 99.5
	クラフォラン注射用 1g [セフトキシム Na]	微黄色澄明 (5.21)	1g +100mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	微黄色澄明 4.68 100.0	— 4.71 ×	— 4.70 100.5	— 4.68 100.8
	シオマリン静注用 1g [ラタモキシセフ Na]	微黄色澄明 (5.64)	1g +100mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	微黄色澄明 4.76 100.0	— 4.76 ×	— 4.77 99.5	— 4.79 99.8
	ジスロマック点滴静注用 500mg [アジスロマイシン水和物]	無色澄明 (6.77)	1g +100mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 5.75 100.0	— 5.77 ×	— 5.76 99.5	— 5.76 99.9
	スルペラゾン静注用 1g [セフトペラゾン Na・スルバクタム Na]	無色澄明 (5.40)	1g +100mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.65 100.0	— 4.66 ×	— 4.66 99.7	— 4.64 99.9
	セフメタゾン静注用 2g [セフメタゾール Na]	無色澄明 (4.75)	2g +200mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.64 100.0	— 4.63 ×	— 4.62 100.1	— 4.58 100.1
	ゾシン配合点滴静注用バッグ 4.5 [タゾバクタム Na・ピペラシリン Na]	無色澄明 (5.39)	4.5g/100mL (添付溶解液) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.71 100.0	— 4.70 ×	— 4.70 99.6	— 4.66 99.5
	チエナム点滴静注用キット 0.5g [イミペナム水和物・シラスタチン Na]	無色澄明 (7.35)	0.5g/100mL (添付溶解液) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 5.12 100.0	— 5.08 ×	微黄色澄明 4.99 99.7	黄色澄明 4.83 100.0
	ハベカシン注射液 200mg [アルベカシン硫酸塩]	無色澄明 (6.95)	4mL +100mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.84 100.0	— 4.84 ×	— 4.84 99.8	— 4.84 99.9
	パンスポリン静注用 1g [セフトチアム塩酸塩]	淡黄色澄明 (6.49)	1g +50mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	微黄色澄明 5.87 100.0	— 5.88 ×	— 5.89 99.9	— 5.85 99.7
	ファーストシン静注用 0.5g [セフトゾプラン塩酸塩]	淡黄色澄明 (7.95)	0.5g +50mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	微黄色澄明 5.72 100.0	— 5.79 ×	— 5.99 99.9	— 6.25 100.4
	ファンギゾン注射用 50mg [アムホテリシン B]	黄色澄明 (7.36)	50mg +510mL(G) →20mL	外観 pH 残存率(%)	淡黄色懸濁 4.96 ×	— 4.95 ×	— 4.96 ×	— 4.96 ×
	フルマリン静注用 1g [フロモキシセフ Na]	無色澄明 (4.79)	1g +100mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.64 100.0	— 4.64 ×	— 4.65 100.8	— 4.67 100.4
	ベストコール静注用 0.5g [セフメノキシム塩酸塩]	微黄褐色 澄明(7.61)	0.5g +50mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	微黄褐色澄明 6.18 100.0	— 6.26 ×	— 6.42 100.0	— 6.72 100.8
	メロペン点滴用キット 0.5g [メロペナム水和物]	無色澄明 (7.91)	0.5g/100mL (添付溶解液) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 6.58 100.0	— 6.63 ×	— 6.71 99.5	— 6.86 98.3
	ユナシン-S 静注用 1.5g [アンピシリン Na・スルバクタム Na]	無色澄明 (9.15)	1.5g +50mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 7.81 100.0	— 7.81 ×	— 7.79 100.4	— 7.66 100.6
	ロセフィン点滴静注用 1g バッグ [セフトリアキソン Na 水和物]	微黄色澄明 (6.50)	1g/100mL (添付溶解液) →20mL	外観 pH 残存率(%)	微黄色澄明 4.98 100.0	— 4.99 ×	— 4.99 97.6	— 5.01 98.1



続き

分類	配合薬剤		配合薬剤 調製方法	試験項目	配合後の経過時間			
	配合薬剤名 [成分名等]	外観(pH)			配合直後	1時間	4時間	24時間
その他	クラビット点滴静注バッグ 500mg/100mL [レボフロキサシン水和物]	淡黄色澄明 (4.85)	500mg/100mL →20mL	外観 pH 残存率(%)	微黄色澄明 4.64 100.0	— 4.64 ×	— 4.64 98.6	— 4.64 99.6
	ベナンボックス注用 300mg [ペンタミジンイセチオン酸塩]	無色澄明 (6.10)	300mg +3mL(W) +50mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 4.63 100.0	白色浮遊物 4.28 ×	白濁 白色沈殿 3.94 ×	— 3.91 ×
	バクタラミン注 [スルファメトキサゾール・トリメ トプリム]	無色澄明 (9.22)	5mL→2mL +50mL(S) →20mL	外観 pH 残存率(%)	無色澄明 5.89 100.0	— 5.90 ×	— 5.87 100.5	針状結晶 5.92 ×

◇リネゾリド点滴静注液 600mg「日医工」

《添付文書》からの抜粋

**適用上の注意**

本剤は用法・用量にしたがって、点滴静注のみに使用すること。本剤の使用に際しては、以下の点に注意すること。

(1) **投与前**

- 1) 本剤は、調製不要の使い切りバッグであるので残液は使用しないこと。
- 2) バッグを包んでいる外袋は使用時まで開封しないこと。
- 3) 投与前に、不溶物の認められるものは使用しないこと。
- 4) バッグを押すことにより液漏れの有無の確認を行うこと。液漏れが認められた場合には、無菌性が損なわれている可能性があるため使用しないこと。
- 5) 本剤は、軟らかいバッグであるので、大気圧で自然に内容液が排出されるため、通気針は不要である。
- 6) U字管連結は行わないこと。
- 7) バッグの液目盛りはおよその目安として使用すること。
- 8) 本剤は、時間の経過とともに黄色を呈することがあるが、効力に影響を及ぼすことはない。

(2) **配合変化**

- 1) 本剤は、次の薬剤と配合禁忌である。  
 アムホテリシン B, クロルプロマジン塩酸塩, ジアゼパム, ペンタミジンイセチオン酸塩, エリスロマイシンラクトビオン酸塩, フェニトインナトリウム, スルファメトキサゾール・トリメトプリム, セフトリアキソンナトリウム
- 2) 本剤を他の薬剤と併用投与する場合には、各薬剤の定められた用法・用量に従い、別々に投与すること。
- 3) 本剤と他の薬剤を同一の輸液チューブにより連続注入する場合には、本剤及び他の薬剤と配合変化を起こさない輸液（生理食塩液）を本剤の投与前後に輸液チューブ内に流すこと。

(3) **静脈内投与時**

本剤に他の薬剤を注入して使用しないこと。