

酸安定性・持続型マクロライド系抗生物質製剤

処方箋医薬品<sup>※1)</sup>

日本薬局方

ロキシスロマイシン錠

ロキシスロマイシン錠150mg「トーフ」

ROXITHROMYCIN TABLETS 150mg “TOWA”




貯 法：室温保存  
使用期限：外箱に記載

|                   |         |         |
|-------------------|---------|---------|
| 日本標準商品分類番号 876149 |         |         |
| 承認番号              | 薬価収載    | 販売開始    |
| 22900AMX00113     | 2017年6月 | 2005年7月 |

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- 1) 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2) エルゴタミン（エルゴタミン酒石酸塩、ジヒドロエルゴタミンメシル酸塩）含有製剤を投与中の患者（「相互作用」の項参照）

【組成・性状】

|          |   |   |   |
|----------|---|---|---|
| 1錠中の有効成分 | 日局 ロキシスロマイシン……………150mg（力価）  |   |   |
| 添加物      | トウモロコシデンプン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、メタケイ酸アルミン酸Mg、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、プロピレングリコール、タルク、酸化チタン    |   |   |
| 性状       | 白色のフィルムコーティング錠  |   |   |
| 識別コード    | 本体  | Tw RXM  |   |
|          | 包装  |   |   |
| 外形       | 表   | 裏   | 側面  |
|          |  |  |  |
| 錠径(mm)   | 9.1   |   |   |
| 厚さ(mm)   | 3.9   |   |   |
| 質量(mg)   | 215   |   |   |

【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、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、アクネ菌、肺炎マイコプラズマ（マイコプラズマ・ニューモニエ）

<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、ざ瘡（化膿性炎症を伴うもの）、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

\*\*\*【効能・効果に関連する使用上の注意】

咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、中耳炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」<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。

【用法・用量】

通常、成人にはロキシスロマイシンとして1日量300mg（力価）を2回に分割し、経口投与する。

【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。

※【使用上の注意】

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- 1) 過敏症の既往歴のある患者
- 2) 肝障害のある患者〔血中濃度が持続するおそれがあるので、投与間隔をあけること。〕
- 3) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）
- 4) QT延長を起こすおそれのある患者〔先天性QT延長症候群の患者、低カリウム血症等の電解質異常のある患者、QT延長を起こすことが知られている薬剤を投与中の患者（QT延長を起こすおそれがある。「副作用」の項参照）〕

2. 相互作用

1) 併用禁忌（併用しないこと）

| 薬剤名等   | 臨床症状・措置方法                       | 機序・危険因子  |
|--|---------------------------------|--|
| エルゴタミン（エルゴタミン酒石酸塩、ジヒドロエルゴタミンメシル酸塩）を含有する製剤<br>クリアミン<br>ジヒデルゴット<br>等 | エルゴタミンの作用を増強させ、四肢の虚血を起こすおそれがある。 | 肝薬物代謝酵素が阻害され、エルゴタミンの血中濃度が上昇し、エルゴタミンの末梢血管収縮作用が増強すると考えられる。 |

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                             |
|------------|--|-------------------------------------|
| テオフィリン     | テオフィリンの血中濃度が上昇し、中毒症状（悪心、嘔吐等）を起こすことがある。 | 肝薬物代謝酵素が阻害され、テオフィリン血中濃度が上昇すると考えられる。 |
| ワルファリンカリウム | ワルファリンの作用を増強させ出血症状を起こすおそれがある。          | 肝薬物代謝酵素が阻害され、ワルファリン血中濃度が上昇すると考えられる。 |

3. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

1) 重大な副作用（頻度不明）

- (1) ショック、アナフィラキシー：ショック、アナフィラキシー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、眩暈、便意、耳鳴、発汗、喘鳴、呼吸困難、血管浮腫、全身の潮紅・蕁麻疹等の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。

注1) 注意－医師等の処方箋により使用すること

- (2) 偽膜性大腸炎、出血性大腸炎：偽膜性大腸炎、出血性大腸炎等の重篤な大腸炎があらわれることがある。腹痛、頻回の下痢、血便等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。
- (3) 間質性肺炎：間質性肺炎（初期症状：発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常、好酸球増多等）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。
- (4) 血小板減少症：血小板減少症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するなど適切な処置を行うこと。
- (5) 肝機能障害、黄疸：AST(GOT)、ALT(GPT)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、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) 皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）：皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）があらわれることがあるので、観察を十分に行い、発熱、紅斑、そう痒感、眼充血、口内炎等の症状が認めら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) QT延長、心室頻拍（torsades de pointesを含む）：QT延長、心室頻拍（torsades de pointesを含む）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は投与を中止し、適切な処置を行うこと。

## 2) その他の副作用

|                    | 頻度不明                                       |
|--------------------|--|
| 過敏症 <sup>注2)</sup> | 発熱、多形紅斑、発疹等                                |
| 精神神経系              | 眠気、錯乱、頭痛、浮動性めまい、舌のしびれ感、しびれ                 |
| 血液                 | 好酸球増多、白血球減少                                |
| 肝臓                 | 胆汁うっ滞等の肝機能障害、AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇等 |
| 消化器                | 胸やけ、胃部不快感、腹痛、下痢、嘔吐、口渇、食欲不振、腹部膨満感等          |
| ※ 感覚器              | 味覚異常、嗅覚異常、難聴、耳鳴、回転性めまい、視力障害、霧視             |
| その他                | 全身けん怠感、脱力感、動悸、関節痛、鼻出血、月経異常、浮腫、菌交代症         |

注2) 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。

## 4. 高齢者への投与

高齢者での薬物動態試験で、健康成人に比べ高い血中濃度が持続する傾向が認められているので、慎重に投与すること。

## 5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断された場合にのみ投与すること。[動物実験（ラット）において臨床用量の約80倍で胎児の外表面異常及び骨格異常の発現頻度が対照群に比べ高いとの報告がある。]
- 授乳中の女性に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には、授乳を中止させること。[動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが認められている。]

## 6. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。（使用経験がない）

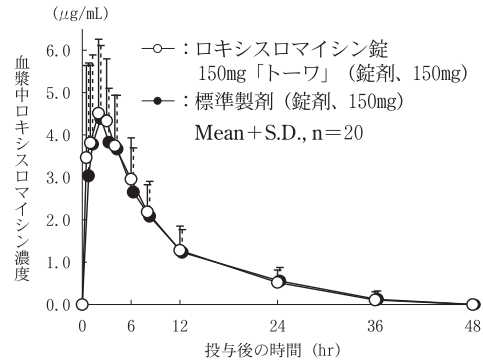
## 7. 適用上の注意

- 服用時：健康成人において天然ケイ酸アルミニウムと併用した場合、本剤の吸収が低下したとの報告がある。
- 薬剤交付時：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、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

## 【薬物動態】

### 1. 生物学的同等性試験

ロキシシロマイシン錠150mg「トーワ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（ロキシシロマイシンとして150mg（力価））健康成人男子（n=20）に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C<sub>max</sub>）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>2)</sup>。



|   | 判定パラメータ                           |                             | 参考パラメータ                  |                          |
|---|-----------------------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|
|   | AUC <sub>0-18</sub><br>(μg·hr/mL) | C <sub>max</sub><br>(μg/mL) | T <sub>max</sub><br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| ロキシシロマイシン錠<br>150mg「トーワ」<br>(錠剤, 150mg) | 49.32 ± 17.10                     | 5.03 ± 1.66                 | 2.23 ± 1.43              | 7.50 ± 2.29              |
| 標準製剤<br>(錠剤, 150mg)                     | 47.60 ± 17.85                     | 4.93 ± 1.89                 | 1.95 ± 1.45              | 7.87 ± 2.52              |

(Mean ± S. D., n=20)

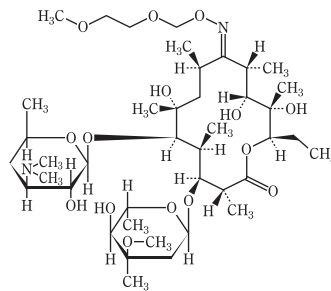
血漿中濃度並びにAUC、C<sub>max</sub>等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

### 2. 溶出挙動

ロキシシロマイシン錠150mg「トーワ」は、日本薬局方医薬品各条に定められたロキシシロマイシン錠の溶出規格に適合していることが確認されている<sup>3)</sup>。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



一般名：ロキシシロマイシン（Roxithromycin）

化学名：(2R, 3S, 4S, 5R, 6R, 8R, 9E, 10R, 11R, 12S, 13R)-5-(3, 4, 6-Trimethoxy-3-dimethylamino-β-D-xylo-hexopyranosyloxy)-3-(2, 6-dideoxy-3-C-methyl-3-O-methyl-α-L-ribo-hexopyranosyloxy)-6, 11, 12-trihydroxy-9-(2-methoxyethoxy)methoxyimino-2, 4, 6, 8, 10, 12-hexamethylpentadecan-13-olide

分子式：C<sub>41</sub>H<sub>76</sub>N<sub>2</sub>O<sub>15</sub>

分子量：837.05

性状：白色の結晶性の粉末である。エタノール（95）又はアセトンに溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、水にほとんど溶けない。

### 【取扱い上の注意】

#### 安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、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<sup>4)</sup>。

### 【包 装】

ロキシスロマイシン錠150mg「トーワ」：100錠（PTP）

### 【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) 東和薬品株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 3) 東和薬品株式会社 社内資料：溶出試験
- 4) 東和薬品株式会社 社内資料：安定性試験

#### ※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

東和薬品株式会社 学術部DIセンター  
〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号  
☎0120-108-932 FAX 06-7177-7379  
<https://med.towayakuhin.co.jp/medical/>

製造販売元

**東和薬品株式会社**

大阪府門真市新橋町2番11号