

# 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

酸安定性・持続型マクロライド系抗生剤  
 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「日医工」**  
**Roxithromycin**

剤形	フィルムコーティング錠
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	1錠中ロキシスロマイシン 150mg（力価）を含有する。
一般名	和名：ロキシスロマイシン 洋名：Roxithromycin
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	承認年月日：2013年7月22日 薬価基準収載：2014年6月20日 販売年月日：2014年6月20日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売元：日医工株式会社 製造販売元：日医工ファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	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2020年9月改訂（第7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、添付文書で赤枠・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. 薬理的に関連の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 .....	12
3. 構造式又は示性式 .....	2	3. 吸収 .....	12
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 .....	13
6. 慣用名，別名，略号，記号番号 .....	2	6. 排泄 .....	13
7. CAS 登録番号 .....	2	7. トランスポーターに関する情報 .....	13
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	3	8. 透析等による除去率 .....	13
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> .....	14
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 .....	14
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） ..	14
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 .....	14
<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 .....	14
1. 剤形 .....	4	5. 慎重投与内容とその理由 .....	14
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	14
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 .....	4	7. 相互作用 .....	14
4. 製剤の各種条件下における安定性 .....	4	8. 副作用 .....	15
5. 調製法及び溶解後の安定性 .....	5	9. 高齢者への投与 .....	16
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	5	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 .....	16
7. 溶出性 .....	6	11. 小児等への投与 .....	16
8. 生物学的試験法 .....	7	12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	16
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	7	13. 過量投与 .....	16
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	7	14. 適用上の注意 .....	17
11. 力価 .....	7	15. その他の注意 .....	17
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	7	16. その他 .....	17
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> .....	18
14. その他 .....	7	1. 薬理試験 .....	18
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	8	2. 毒性試験 .....	18
1. 効能又は効果 .....	8	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	19
2. 用法及び用量 .....	8	1. 規制区分 .....	19
3. 臨床成績 .....	8		

2.	有効期間又は使用期限	19
3.	貯法・保存条件	19
4.	薬剤取扱い上の注意点	19
5.	承認条件等	19
6.	包装	19
7.	容器の材質	19
8.	同一成分・同効薬	19
9.	国際誕生年月日	19
10.	製造販売承認年月日及び承認番号	19
11.	薬価基準収載年月日	20
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	20
13.	再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	20
14.	再審査期間	20
15.	投与期間制限医薬品に関する情報	20
16.	各種コード	20
17.	保険給付上の注意	20
<b>X I.</b>	<b>文献</b>	<b>21</b>
1.	引用文献	21
2.	その他の参考文献	21
<b>X II.</b>	<b>参考資料</b>	<b>21</b>
1.	主な外国での発売状況	21
2.	海外における臨床支援情報	21
<b>X III.</b>	<b>備考</b>	<b>22</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	22
2.	その他の関連資料	23

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤は、ロキシスロマイシンを有効成分とする酸安定性・持続型マクロライド系抗生剤である。

ロキシスロマイシン製剤の「ロキライド錠 150」は、日医工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、生物学的同等性試験を実施し、2005年3月3日に承認を取得し、2005年7月8日に販売を開始した。（医薬発第481号（平成11年4月8日）に基づき承認申請）

医療事故防止のため、2013年7月22日に販売名を「ロキライド錠 150」から「ロキシスロマイシン錠 150mg「日医工」」に変更の承認を取得し、2014年6月20日に販売を開始した。

2017年4月3日に、製造販売承認が日医工株式会社から日医工ファーマ株式会社へ承継された。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、ロキシスロマイシンを有効成分とする酸安定性・持続型マクロライド系抗生剤である。
- (2) PTPシートはピッチコントロールを行い、1錠ごとに成分名、含量を表示した。
- (3) 重大な副作用（頻度不明）として、ショック、アナフィラキシー、偽膜性大腸炎、出血性大腸炎、間質性肺炎、血小板減少症、肝機能障害、黄疸、皮膚粘膜眼症候群（Stevens - Johnson 症候群）、QT延長、心室頻拍（torsades de pointes を含む）が報告されている。

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

ロキシスロマイシン錠 150mg「日医工」

#### (2) 洋名

Roxithromycin

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

ロキシスロマイシン (JAN)

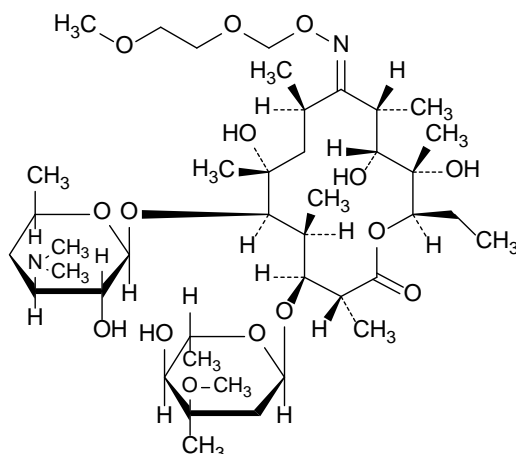
#### (2) 洋名 (命名法)

Roxithromycin (JAN)

#### (3) ステム

*Streptomyces* 属が産生する抗生物質：-mycin

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

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

分子量：837.05

### 5. 化学名 (命名法)

(2*R*,3*S*,4*S*,5*R*,6*R*,8*R*,9*E*,10*R*,11*R*,12*S*,13*R*)-5-(3,4,6-Trideoxy-3-dimethylamino-β-D-xylo-hexopyranosyloxy)-3-(2,6-dideoxy-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 (IUPAC)

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

略号：RXM

### 7. CAS 登録番号

80214-83-1

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。(無臭で味は苦い)

##### (2) 溶解性

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。

##### (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

旋光度  $[\alpha]_D^{20}$ :  $-93 \sim -96^\circ$  (脱水物に換算したもの 0.5g, アセトン, 50mL, 100mm)

#### 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

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又はロキシシロマイシン標準品のスペクトルを比較するとき、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, 水, 水酸化ナトリウム試液, アセトニトリル混液



#### 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	色調 剤形	形 状			本体コード 包装コード
		質量(mg)	直径(mm)	厚さ(mm)	
ロキシスロマイシン 錠 150mg「日医工」	白色 フィルムコーティング錠	 215	 9.1	 3.9	本体: <b>n</b> 723 包装: <b>n</b> 723

###### (2) 製剤の物性

(「IV - 4. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

###### (3) 識別コード

(「IV - 1.(1) 剤形の区別, 外観及び性状」の項参照)

###### (4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等

該当資料なし

##### 2. 製剤の組成

###### (1) 有効成分 (活性成分) の含量

1 錠中ロキシスロマイシン 150mg (力価) 含有

###### (2) 添加物

ヒドロキシプロピルセルロース, トウモロコシデンプン, 無水ケイ酸, ステアリン酸マグネシウム, タルク, ヒプロメロース, プロピレングリコール, 酸化チタン, その他 3 成分

###### (3) その他

該当記載事項なし

##### 3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

##### 4. 製剤の各種条件下における安定性<sup>1)</sup>

###### (1) 加速試験

本品につき加速試験 (40°C, 75%RH, 6 ヶ月) を行った結果, ロキシスロマイシン錠 150mg 「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。

◇ロキシスロマイシン錠 150mg「日医工」 加速試験 [最終包装形態 (PTP 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 <白色のフィルム コーティング錠>	ROX150T-1 ROX150T-2 ROX150T-3	適合	適合	適合	適合
確認試験 (呈色反応, 薄層 クロマトグラフィ)	ROX150T-1 ROX150T-2 ROX150T-3	適合	適合	適合	適合
崩壊試験 <30 分以内>	ROX150T-1 ROX150T-2 ROX150T-3	適合	適合	適合	適合
含量 (力価, %) * <90.0~120.0%>	ROX150T-1 ROX150T-2 ROX150T-3	97.2 97.0 96.5	96.9 96.7 97.4	97.1 96.8 96.5	96.6 97.3 97.5

※: 表示量 (力価) に対する含有率 (%)

## (2) 無包装の安定性試験

試験期間：2005/6/15～2005/9/29

### ◇ロキシスロマイシン錠 150mg 「日医工」 無包装 40℃ [遮光, 気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 <白色のフィルムコーティング錠>	DR210	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
崩壊試験 n=6 <60 分以内>	DR210	4.1～5.4	2.5～3.8	4.5～6.8	3.8～6.0	3.4～5.5
含量 (%) ※ n=3 <90.0～120.0%>	DR210	102.6	103.3	100.6	101.2	101.3
(参考値) 硬度 (N) n=10	DR210	98.5～114.8	99.9～118.5	76.6～112.4	94.7～116.0	96.2～117.0

※：表示量に対する含有率 (%)

### ◇ロキシスロマイシン錠 150mg 「日医工」 無包装 25℃・75%RH [遮光, 開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 <白色のフィルムコーティング錠>	DR210	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
崩壊試験 n=6 <60 分以内>	DR210	4.1～5.4	2.7～2.8	2.8～4.0	2.2～2.5	2.8～3.1
含量 (%) ※ n=3 <90.0～120.0%>	DR210	102.6	101.8	101.3	101.1	102.7
(参考値) 硬度 (N) n=10	DR210	98.5～114.8	88.2～108.1	90.0～109.6	85.8～107.6	84.8～100.8

※：表示量に対する含有率 (%)

### ◇ロキシスロマイシン錠 150mg 「日医工」 無包装 室温, 曝光 [気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40 万 Lx・hr	80 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 <白色のフィルムコーティング錠>	DR210	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
崩壊試験 n=6 <60 分以内>	DR210	4.1～5.4	4.8～8.0	3.9～5.3	4.1～4.7
含量 (%) ※ n=3 <90.0～120.0%>	DR210	102.6	102.3	101.3	100.2
(参考値) 硬度 (N) n=10	DR210	98.5～114.8	82.4～113.2	97.3～121.0	99.3～109.4

※：表示量に対する含有率 (%)

## 5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 6. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

該当しない

## 7. 溶出性

### (1) 溶出規格

ロキシシロマイシン錠 150mg「日医工」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。

(試験液に溶出試験第2液 900mLを用い、パドル法により、50rpmで試験を行う)

#### 溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
150mg	30分	80%以上

### (2) 溶出試験<sup>2)</sup>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成13年5月31日医薬審発第786号）

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

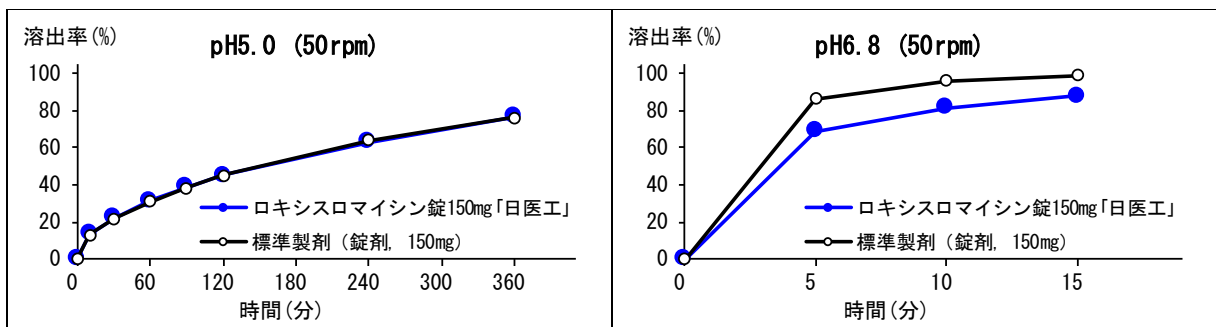
回転数及び試験液：50rpm (pH1.2, pH5.0, pH6.8, 水), 100rpm (pH6.8)

[判定]

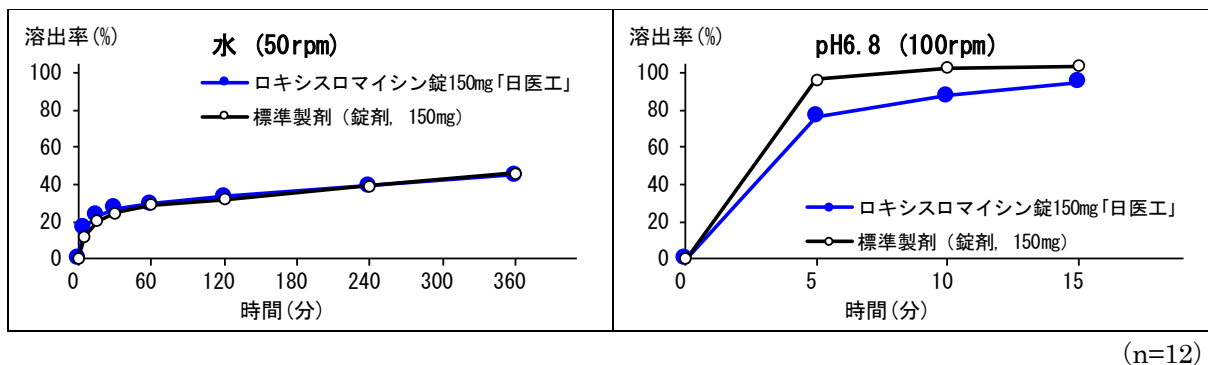
- ・ pH1.2 (50rpm) では、成分がpH1.2で分解するため試験を実施しなかった。
- ・ pH5.0 (50rpm) では、標準製剤が360分における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点及び360分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%及び±15%の範囲にあった。
- ・ pH6.8 (50rpm) では、標準製剤および本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ 水 (50rpm) では、標準製剤が360分における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点及び360分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。
- ・ pH6.8 (100rpm) では、標準製剤及び本品はともに15分以内に平均85%以上溶出した。

以上、本品の溶出挙動を標準製剤と比較した結果、全ての試験液において、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



続き



## 8. 生物学的試験法

本剤の力価は円筒平板法にて試験菌として *Bacillus subtilis* ATCC6633 を用いて測定する。

## 9. 製剤中の有効成分の確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤法により測定するとき、波数  $3460\text{cm}^{-1}$ 、 $2940\text{cm}^{-1}$ 、 $1728\text{cm}^{-1}$ 、 $1633\text{cm}^{-1}$  及び  $1464\text{cm}^{-1}$  付近に吸収を認める。

## 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、水、水酸化ナトリウム試液、アセトニトリル混液

## 11. 力価

本品の力価は、ロキシシロマイシン ( $\text{C}_{41}\text{H}_{76}\text{N}_2\text{O}_{15}$ ) としての量を質量 (力価) で示す。

## 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

該当しない

## 14. その他

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，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>3)</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。

### 2. 用法及び用量

通常，成人にはロキシシロマイシンとして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。

### 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. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

マクロライド系抗生物質

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>4)</sup>

抗菌スペクトルは、他のマクロライド系抗生物質と同様であり、ブドウ球菌属、レンサ球菌属、マイコプラズマ属、ブランハメラ・カタラーリスなどに抗菌力を示す。作用機序は他のマクロライド系抗生物質と同様に、細菌のリボソームにおけるタンパク合成を阻害し、静菌的に作用する。貪食細胞への移行にすぐれており、貪食細胞の食菌・殺菌作用を促進する。

#### (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

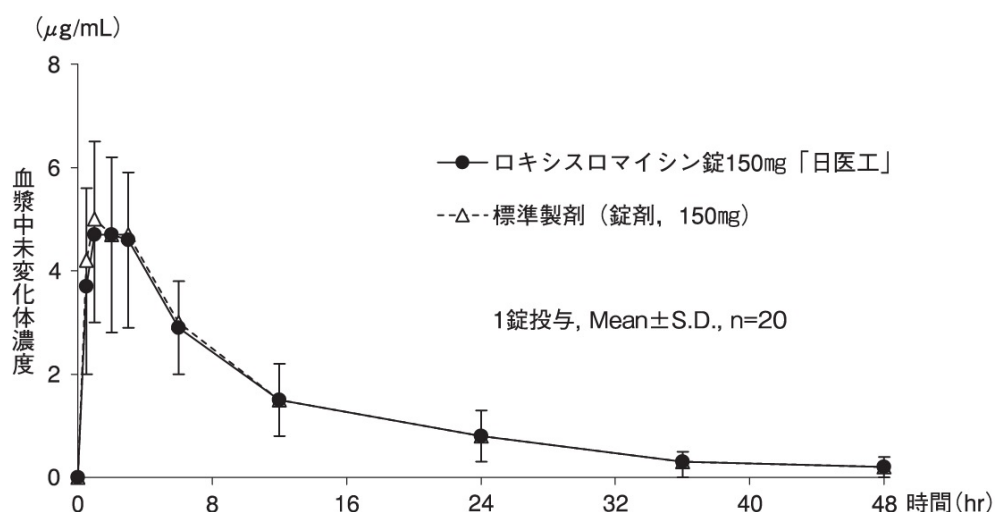
#### (2) 最高血中濃度到達時間

(「臨床試験で確認された血中濃度」の項参照)

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>5)</sup>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（平成 13 年 5 月 31 日 医薬審発第 786 号）

ロキシシロマイシン錠 150mg「日医工」及び標準製剤を、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, Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。



[薬物速度論的パラメータ]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	t1/2 (hr)
ロキシシロマイシン 錠 150mg「日医工」	60.4±22.7	5.5±1.8	1.48±0.83	11.6±3.4
標準製剤 (錠剤, 150mg)	62.1±26.3	5.6±2.2	1.68±1.08	12.4±5.6

(1 錠投与, Mean±S.D., n=20)

血漿中濃度並びに AUC, Cmax 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。



**(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

該当資料なし

## Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

該当記載事項なし

### 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）】

- (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）

### 3. 効能又は効果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）

### 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) 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）〕

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当記載事項なし

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

##### 併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
エルゴタミン（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（クリアミン、ジヒデルゴット等）	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
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。

## 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) **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。
- 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。

### (3) その他の副作用

	頻度不明
<b>過敏症</b> <sup>注)</sup>	発熱，多形紅斑，発疹等
<b>精神神経系</b>	眠気，錯乱，頭痛，流動性めまい，舌のしびれ感，しびれ
<b>血液</b>	好酸球増多，白血球減少
<b>肝臓</b>	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
<b>消化器</b>	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
<b>感覚器</b>	味覚異常，嗅覚異常，難聴，耳鳴，回転性めまい，視力障害，霧視
<b>その他</b>	全身倦怠感，脱力感，動悸，関節痛，鼻出血，月経異常，浮腫，菌交代症

注) 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) 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) **慎重投与**：過敏症の既往歴のある患者には慎重に投与すること。
- 3) **重大な副作用**：①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。②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。
- 4) **その他の副作用**：過敏症（発熱，多形紅斑，発疹等）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。

#### 9. 高齢者への投与

高齢者では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。

#### 10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与

- (1) 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。〕
- (2) 授乳中の婦人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。〕

#### 11. 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。）

#### 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

該当記載事項なし

#### 14. 適用上の注意

- (1) **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。
- (2) **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。)

#### 15. その他の注意

該当記載事項なし

#### 16. その他

該当記載事項なし

## 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	ロキシスロマイシン錠 150mg「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	ロキシスロマイシン	該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

外箱等に表示の使用期限内に使用すること。（3年：安定性試験結果に基づく）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 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」の項を参照）

#### （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）

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

該当記載事項なし

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

PTP包装：100錠（10錠×10）、500錠（10錠×50）

### 7. 容器の材質

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分：ルリッド錠 150

### 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
ロキシスロマイシン錠 150mg「日医工」	2013年7月22日	22500AMX01242000

旧販売名	製造承認年月日	承認番号
ロキライド錠 150	2005年3月3日	21700AMZ00257000



**11. 薬価基準収載年月日**

販売名	薬価基準収載年月日
ロキシスロマイシン錠 150mg「日医工」	2014年6月20日

旧販売名	薬価基準収載年月日
ロキライド錠 150	2005年7月8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**

該当しない

**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. 投与期間制限医薬品に関する情報**

本剤は, 投薬期間制限の対象となる医薬品ではない。

(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
ロキシスロマイシン錠 150mg「日医工」	6149002F1010 (統一収載コード)	621675901	116759701

**17. 保険給付上の注意**

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

## **X I. 文献**

### **1. 引用文献**

- 1) 日医工ファーマ株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 2) 日医工ファーマ株式会社 社内資料 (溶出試験)
- 3) 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
- 4) 第十七改正日本薬局方解説書 C - 5993, 廣川書店, 東京 (2016)
- 5) 日医工ファーマ株式会社 社内資料 (生物学的同等性試験)

### **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

#### 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

##### 本項の情報に関する注意

本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

#### (1) 粉砕

##### 粉砕物の安定性試験

##### ロキシシロマイシン錠 150mg 「日医工」

粉砕物の安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末であり、含量は規格内であった。

試験実施期間：2005/6/15～2005/9/29

#### ● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光, 開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	DR210	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量 (%) * n=3 <95.0~105.0%>	DR210	102.6	101.5	101.8	100.9	101.2
(参考値) 重量変化 (%)	DR210	—	+1.97	+1.11	+2.44	+2.42

※：表示量に対する含有率 (%)

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

### ロキシシロマイシン錠 150mg 「日医工」

#### 1) 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55°C の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

##### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施期間：2005/6/10

ロット番号：DR210

#### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
ロキシシロマイシン錠 150mg 「日医工」	5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

## 2. その他の関連資料

なし