

* * 2018年6月改訂(第19版)
* 2017年2月改訂
貯法：室温保存
使用期限：ケースに記載

処方箋医薬品^{注)}処方箋医薬品^{注)}

マクロライド系抗生物質製剤

エリスロシン錠100mg

エリスロシン錠200mg

<エリスロマイシステアリン酸塩錠>

日本標準商品分類番号
876141

承認番号
100mg：21500AMZ00087000
200mg：21500AMZ00088000
薬価収載
100mg：2003年7月
200mg：2003年7月
販売開始
100mg：1955年9月
200mg：1960年3月
再評価結果
2004年9月

®登録商標

注) 注意 - 医師等の処方箋により使用すること

Erythrocin®

■禁忌(次の患者には投与しないこと)

- (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
(2) エルゴタミン含有製剤, ピモジド, アスナプレビルを投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕

■組成・性状*

販売名	エリスロシン錠100mg			エリスロシン錠200mg		
成分・含量	1錠中エリスロマイシステアリン酸塩をエリスロマイシンとして100mg(力価)			1錠中エリスロマイシステアリン酸塩をエリスロマイシンとして200mg(力価)		
添加物	クエン酸ナトリウム水和物, トウモロコシデンプン, ポビドン, カルメロースナトリウム, セラセフェート, プロピレングリコール, マクロゴール6000, ソルビタン脂肪酸エステル, ヒマシ油					
剤形	類白色のフィルム錠					
外形	⑬ M ○			⑭ M ○		
大きさ	直径(mm)	厚さ(mm)	重さ(g)	直径(mm)	厚さ(mm)	重さ(g)
	9.7	4.6	0.33	11.9	5.9	0.65
識別コード	M13			M14		

■効能・効果

<適応菌種>

エリスロマイシンに感性のブドウ球菌属, レンサ球菌属, 肺炎球菌, 淋菌, 髄膜炎菌, ジフテリア菌, 軟性下痢菌, 百日咳菌, 破傷風菌, 梅毒トレポネーマ, トラコーマクラミジア(クラミジア・トラコマチス), マイコプラズマ属

<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, 乳腺炎, 扁桃炎, 肺炎, 肺膿瘍, 膿胸, 腎盂腎炎, 尿道炎, 淋菌感染症, 軟性下痢, 梅毒, 子宮内感染, 中耳炎, 歯冠周囲炎, 猩紅熱, ジフテリア, 百日咳, 破傷風

<効能・効果に関連する使用上の注意> **

扁桃炎への使用にあたっては, 「抗微生物薬適正使用の手引き」¹⁾を参照し, 抗菌薬投与の必要性を判断した上で, 本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

■用法・用量

通常, 成人にはエリスロマイシンとして1日800~1,200mg(力価)を4~6回に分割経口投与する。

小児には1日体重1kgあたり25~50mg(力価)を4~6回に分割経口投与する。

なお, 年齢, 症状により適宜増減する。ただし, 小児用量は成人量を上限とする。

<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) 肝機能障害のある患者〔血中濃度が上昇するおそれがある。〕
(2) 心疾患のある患者〔QT延長, 心室頻拍(Torsades de pointesを含む)を起こすことがある。〕〔副作用〕の項参照

2. 相互作用

本剤は薬物代謝酵素CYP3Aで代謝される。また, CYP3Aと結合し, 複合体を形成する。これにより, CYP3Aを阻害することから, CYP3Aで代謝される薬剤と併用したとき, 併用薬剤の代謝を阻害し血中濃度を上昇させる可能性がある。また, 本剤はP-糖蛋白阻害作用を有することから, P-糖蛋白質を介して排出される薬剤と併用したとき, 併用薬剤の排出が阻害され血中濃度が上昇する可能性がある。

(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)含有製剤 〔クリアミン ジヒデルゴット等〕	これらの薬剤の血中濃度が上昇し, 四肢の虚血, 血管攣縮等が報告されている。	本剤はCYP3Aと結合し, 複合体を形成するため, これらの薬剤の代謝を抑制することがある。
ピモジド 〔オーラップ〕	類薬クラリスロマイシンとの併用により, ピモジドの血中濃度が上昇し, QT延長, 心室性不整脈(Torsades de pointesを含む)等が報告されている。	
アスナプレビル 〔スンペブラ〕	アスナプレビルの血中濃度が上昇し, 肝臓に関連した副作用が発現, 重症化するおそれがある。	

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
ジソピラミド キニジン硫酸塩水 和物	血中濃度上昇に伴うQT延長, 心室性不整脈(Torsades de pointesを含む)等が報告されているので, 減量するなど慎重に投与すること.	本剤はCYP3Aと結合し, 複合体を形成するため, これらの薬剤の代謝を抑制することがある.
テオフィリン アミノフィリン水 和物	テオフィリンの血中濃度上昇に伴う悪心・嘔吐, 不整脈, 痙攣等が報告されているので, 減量するなど慎重に投与すること.	
シクロスポリン タクロリムス水 和物	血中濃度上昇に伴う腎障害等が報告されているので, 減量するなど慎重に投与すること.	
ワルファリンカリ ウム	血中濃度上昇に伴う出血傾向, プロトロンビン時間延長等が報告されているので, 減量するなど慎重に投与すること.	
イリノテカン塩酸 塩水 和物	活性代謝物の血中濃度上昇に伴う骨髄機能抑制, 下痢等の副作用を増強するおそれがあるため, 減量するなど慎重に投与すること.	
ビンブラスチン硫 酸塩	血中濃度上昇に伴う好中球減少, 筋肉痛等が報告されているので, 減量するなど慎重に投与すること.	
バルプロ酸ナトリ ウム	血中濃度上昇に伴う傾眠, 運動失調等が報告されているので, 減量するなど慎重に投与すること.	
フェロジピン	血中濃度上昇に伴う降圧作用の増強が報告されているので, 減量するなど慎重に投与すること.	
ベラパミル塩酸塩	血圧低下, 徐脈性不整脈, 乳酸アシドーシス等が報告されているので, 減量するなど慎重に投与すること.	
ミダゾラム トリアゾラム	血中濃度上昇に伴う鎮静作用の増強が報告されているので, 減量するなど慎重に投与すること.	
カルバマゼピン	血中濃度上昇に伴うめまい, 運動失調等が報告されているので, 減量するなど慎重に投与すること.	

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
コルヒチン	血中濃度上昇に伴う下痢, 腹痛, 発熱, 筋肉痛, 汎血球減少, 呼吸困難等が報告されているので, 減量するなど慎重に投与すること.	本剤はCYP3Aと結合し, 複合体を形成するため, これらの薬剤の代謝を抑制することがある.
シンバスタチン アトルバスタチンカル シウム水 和物	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがある. また, シンバスタチン, アトルバスタチンカルシウム水と併用により, 筋肉痛, 脱力感, CK(CPK)上昇, 血中および尿中ミオグロビン上昇を特徴とし, 急激な腎機能悪化を伴う横紋筋融解症があらわれたとの報告がある.	本剤がピタバスタチンの肝臓への取り込みを阻害するためと考えられる.
ピタバスタチンカル シウム		
プロモクリプチン メシル酸塩 ドセタキセル水 和物 パクリタキセル セレギリン塩酸塩 シルデナフィルク エン酸塩 バルデナフィルク 酸塩水 和物 タダラフィルク シロスタゾール	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがあるので, 減量するなど慎重に投与すること.	本剤はCYP3Aと結合し, 複合体を形成するため, これらの薬剤の代謝を抑制することがある.
プロナンセリン	プロナンセリンの血中濃度が上昇し, 作用が増強するおそれがある.	
エブレノン	エブレノンの血中濃度が上昇し, 作用が増強するおそれがある.	
エレトリプタン臭 化水素酸塩	エレトリプタンの血中濃度が上昇し, 作用が増強するおそれがある.	
エベロリムス	エベロリムスの血中濃度が上昇し, 作用が増強するおそれがある.	
サキナビルメシル 酸塩	サキナビルの血中濃度が上昇し, 作用が増強するおそれがある.	
副腎皮質ホルモン剤 メチルプレドニ ゾロン等	これらの薬剤の消失半減期が延長するとの報告があるので, 減量するなど慎重に投与すること.	本剤はこれらの薬剤の代謝を抑制することがある.
エバスチン	エバスチンの代謝物カレバスチンの血中濃度が上昇するとの報告がある.	

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
エドキサバントシル酸塩水和物	エドキサバンの血中濃度を上昇させ、出血のリスクを増大させるおそれがある。併用する場合、エドキサバントシル酸塩水和物の用量は、エドキサバントシル酸塩水和物の添付文書を参照すること。	本剤がP-糖蛋白質を阻害するためと考えられる。
ジゴキシン	ジゴキシンの作用増強による嘔気、嘔吐、不整脈等の中毒症状が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	本剤の腸内細菌叢への影響により、ジゴキシンの代謝が抑制される。
ザフィルルカスト	ザフィルルカストの血中濃度が低下するとの報告がある。	機序は不明である。
シメチジン	本剤の血中濃度上昇に伴う難聴が報告されているので、減量するなど慎重に投与すること。	これらの薬剤のCYP3A阻害作用により、本剤の代謝が抑制されると考えられる。
リトナビル	本剤のAUCが上昇することが予想される。	

3. 副作用

3,806例中180例(4.7%)に副作用がみられ、主なものは悪心・嘔吐(1.2%)、下痢(0.9%)、胃痛(0.8%)、鼓腸(0.8%)等の消化器症状であった。(再評価結果)

(1) 重大な副作用

- 偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎(頻度不明): 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、直ちに投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 心室頻拍、QT延長(頻度不明): 心室頻拍(Torsades de pointesを含む)、QT延長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、適切な処置を行うこと。〔「慎重投与」の項参照〕
- ショック、アナフィラキシー(頻度不明): 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、呼吸困難、胸内苦悶、血圧低下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。
- 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)(頻度不明): 中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状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。
- 急性腎障害(急性間質性腎炎)(頻度不明): 急性腎障害(急性間質性腎炎)があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 肝機能障害、黄疸(頻度不明): AST(GOT)、ALT(GPT)、ALPの上昇等を伴う肝機能障害や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。

(2) その他の副作用

	0.1~5%未満	頻度不明
過敏症(注)	発疹	蕁麻疹
消化器	食欲不振、悪心・嘔吐、胃痛、胃部不快感、下痢、鼓腸、便秘	腹部痙攣、膝炎
眼		視力低下、霧視

注: これらの症状があらわれた場合には、投与を中止すること。

4. 高齢者への投与

用量に留意するなど慎重に投与すること。〔一般に高齢者では生理機能が低下している。〕

5. 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) 本剤投与中は授乳を避けさせること。〔ヒト母乳中へ移行することが報告されている。〕

6. 小児等への投与

新生児、乳児で、肥厚性幽門狭窄があらわれたとの報告があるので、嘔吐等の症状に注意すること。

7. 過量投与

症状 胃腸症状がみられる。また、可逆性の難聴や一過性かつ軽症の急性腎炎があらわれたとの報告がある。

処置 胃洗浄等により、未吸収の薬物を速やかに体外に排出させる。なお、エリスロマイシンは腹膜透析、血液透析では除去されない。

8. 適用上の注意

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。〕

9. その他の注意

- 大量投与により、可逆性の難聴があらわれたとの報告がある。
- 外国で重症筋無力症が悪化したとの報告がある。

■薬物動態

1. 血漿中濃度

〔健康成人、空腹時エリスロシン錠(200mg)1錠1回投与〕

Tmax(h)	Cmax[μg (力価)/mL]	t _{1/2}
2.8	0.82	データなし

2. 血漿蛋白結合率²⁾

64.5% (in vitro, ヒト血漿, 0.5 μg /mL, 平衡透析法)

3. 組織内移行

上顎洞粘膜³⁾、喀痰⁴⁾、気管支分泌物⁴⁾等に移行が認められた。(外国人)

4. 主な代謝産物及び代謝経路⁵⁾(参考)

肝ミクロゾーム分画中の酵素によって脱メチル化され、des-N-methylerythromycinを生じる。(ウサギ)

5. 排泄経路及び排泄率⁶⁾

主として胆汁中に排泄され、尿中排泄は経口投与量の5%以下である。

6. 代謝酵素^{7,8)}

チトクローム P-450分子種: CYP3A

■薬効薬理

1. 抗菌作用

(1) エリスロマイシンステアリン酸塩は体内で解離し、エリスロマイシンとして作用する。

エリスロマイシンは主としてブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌等のグラム陽性球菌に強い抗菌力を発揮するほか、グラム陰性球菌、一部のグラム陰性桿菌、梅毒トレポネーマ及び肺炎マイコプラズマ(マイコプラズマ・ニューモニエ)にも作用を示す^{6,9)}。

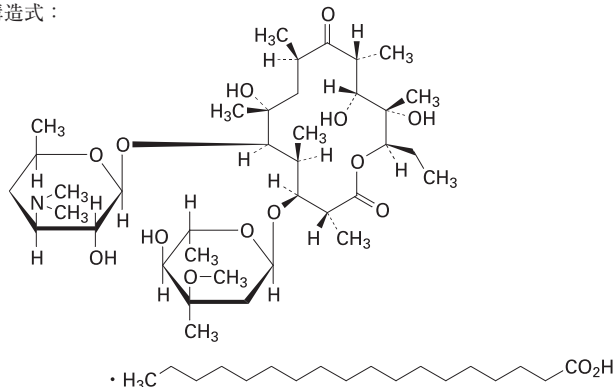
(2) 抗菌作用は細菌により静菌的ないし殺菌的である¹⁰⁾。

2. 作用機序

細菌の蛋白合成阻害で¹¹⁾、70S系のリボソームの50Sサブユニットと結合することによる¹²⁾。

■有効成分に関する理化学的知見

構造式：



一般名：エリスロマイシステアリン酸塩

Erythromycin Stearate

化学名：(2*R*, 3*S*, 4*S*, 5*R*, 6*R*, 8*R*, 10*R*, 11*R*, 12*S*, 13*R*)-5-(3, 4, 6-Trideoxy-3-dimethylamino-β-D-xylo-hexopyranosyloxy)-3-(2, 6-dideoxy-3-C-methyl-3-O-methyl-α-L-ribo-hexopyranosyloxy)-6, 11, 12-trihydroxy-2, 4, 6, 8, 10, 12-hexamethyl-9-oxopentadecan-13-olide monostearate

略号：EM(エリスロマイシン)

分子式：C₃₇H₆₇NO₁₃ · C₁₈H₃₆O₂

分子量：1018.40

性状：白色の粉末である。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。

■包装

エリスロシン錠100mg 100錠(10錠×10) 500錠(10錠×50)

エリスロシン錠200mg 100錠(10錠×10) 500錠(10錠×50)

■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) Prandota, J., et al. : J. Int. Med. Res., **8**(suppl. 2) : 1, 1980
- 3) Paavolainen, M., et al. : Acta Otolaryngol., **84** : 292, 1977
- 4) Frascini, F., et al. : J.Int. Med. Res., **8**(suppl. 2) : 36, 1980
- 5) Mao, J. C. H., et al. : Biochem. Pharmacol., **14** : 1049, 1965
- 6) Sande, M. A. & Mandell, G. L. : GOODMAN and GILMAN's The Pharmacological Basis of Therapeutics 8th ed., Pergamon Press, p.1130, 1990
- 7) Watkins, P.B., et al. : Proc. Natl. Acad. Sci. U. S. A., **82** : 6310, 1985
- 8) Brian, W. R., et al. : Biochemistry, **29** : 11280, 1990
- 9) 日本抗生物質医薬品基準解説, p.723, 1971
- 10) McCall, C. E., et al. : Am. J. Med. Sci., **254** : 144, 1967
- 11) Brock, T. D., et al. : Biochim. Biophys. Acta, **33** : 274, 1959
- 12) Mao, J. C. H. : Biochem. Pharmacol., **16** : 2441, 1967

■文献請求先*

マイランEPD合同会社 くすり相談室

〒105-0001 東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

フリーダイヤル 0120-938-837

製造販売元

* **マイランEPD合同会社**
東京都港区虎ノ門5丁目11番2号