

\* \* 2015年11月改訂(第6版)  
 \* 2015年3月改訂  
 貯法：室温保存  
 使用期限：ラベル，ケースに記載

日本標準商品分類番号

876141

承認番号  
22100AMX01330000  
 薬価収載  
2009年9月  
 販売開始  
1976年4月  
 再評価結果  
2004年9月

処方箋医薬品<sup>注</sup>)

マクロライド系抗生物質製剤

**エリスロシン<sup>®</sup>点滴静注用500mg**

&lt;注射用エリスロマイシンラクトビオン酸塩&gt;

®登録商標

注)注意-医師等の処方箋により使用すること

**Erythrocin<sup>®</sup>****■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   | エリスロシン点滴静注用500mg                            |
| 成分・含量 | 1バイアル中エリスロマイシンラクトビオン酸塩をエリスロマイシンとして500mg(力価) |
| 剤形    | バイアル注射剤(用時溶解)<br>バイアル内容物は白色の粉末              |
| pH    | 5.0~7.5〔50mg(力価)/mL溶液〕                      |
| 浸透圧比  | 約1〔生理食塩液に対する比, 5%ブドウ糖注射液中10mg(力価)/mL〕       |

**■効能・効果**

## &lt;適応菌種&gt;

エリスロマイシンに感性的のブドウ球菌属, レンサ球菌属, 肺炎球菌, ジフテリア菌

## &lt;適応症&gt;

外傷・熱傷及び手術創等の二次感染, 肺炎, ジフテリア

**■用法・用量**

通常, 成人にはエリスロマイシンとして1日600~1,500mg(力価)を2~3回に分けて1回2時間以上かけて点滴静注する。  
 なお, 年齢, 症状により適宜増減する。

## &lt;用法・用量に関連する使用上の注意&gt;

- (1) 経口投与が困難な場合, あるいは, 緊急を要する場合に本剤を使用すること。
- (2) 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) 急速な静注によって心室頻拍(Torsades de pointesを含む)が発現したとの報告があるので, 患者の状態に十分注意しながら, 必ず1回2時間以上かけて点滴静注すること。〔「慎重投与」, 「副作用」の項参照〕

## 〔注射液調製法〕

1. 注射液は注射用水で5%溶液をつくり, これをブドウ糖注射液, 生理食塩液等で希釈して点滴静注溶液とする。  
5%溶液を調製するには, エリスロシン点滴静注用500mg 1バイアル500mg(力価)に注射用水10mLを加える。
2. 5%溶液調製の際には, 生理食塩液あるいは無機塩類を含有する溶液を使用しないこと。  
5%溶液をさらに希釈する際には, 注射用水を使用しないこと(低張になる)。
3. 5%溶液は冷蔵庫内で2週間安定である。

**■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。〔用法・用量に関連する使用上の注意〕, 「副作用」の項参照〕

**2. 重要な基本的注意**

本剤によるショック, アナフィラキシー様症状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。〔「副作用」の項参照〕

- (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. 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<br>〔クリアミン<br>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<br>〔オーラップ〕  | 類薬クラリスロマイシンの併用により, 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<br>〔スンベブラ〕   | 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<br>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<br>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<br>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<br>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<br>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和物との併用により, 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  |   |  |
| ブロモクリプチンメシル酸塩<br>ドセタキセル水和物<br>バクリタキセル<br>セレギリン塩酸塩<br>シルデナフィルクエン酸塩<br>バルデナフィル塩酸塩水和物<br>タダラフィル<br>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。  |  |
| エプレレノン  | エプレ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<br>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。  |  |

#### 4. 副作用

本剤は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

- 1) 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。
- 2) 心室頻拍、心室細動、QT延長（頻度不明）：心室頻拍(Torsades de pointesを含む)、心室細動、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。〔「用法・用量に関連する使用上の注意」, 「慎重投与」の項参照〕
- 3) 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。〔「重要な基本的注意」の項参照〕
- 4) 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。
- 5) 急性腎不全(急性間質性腎炎)（頻度不明）：急性腎不全(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。
- 6) 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

|             | 頻度不明                |
|-------------|---------------------|
| 過敏症<br>(注1) | 発疹、蕁麻疹              |
| 消化器         | 食欲不振、悪心・嘔吐、胃痛、下痢、膵炎 |
| 聴覚<br>(注2)  | 難聴                  |
| 眼           | 視力低下、霧視             |

注1：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。

注2：大量投与により、可逆性の難聴<sup>1)</sup>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、休薬等の適切な処置を行うこと。

##### 5. 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。〕

##### 6. 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。〕

##### 7. 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。

##### 8. 適用上の注意

- (1) 投与経路 点滴静注にのみ使用すること。
- (2) 投与速度 必ず1回2時間以上かけて点滴静注すること。〔「用法・用量に関連する使用上の注意」の項参照〕
- (3) 投与時 血管痛、血栓、静脈炎を起こすことがあるので、注意すること。

##### 9. その他の注意

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. 血清中濃度<sup>2)</sup>

患者(外国人)に本剤400mg(力価)を5%ブドウ糖注射液500mLで溶解し、1.5時間かけて点滴静注した場合、点滴終了直後の血清中濃度は平均7.8 $\mu$ g(力価)/mLであった。

##### 2. 血漿蛋白結合率<sup>3)</sup>

64.5% (*in vitro*, ヒト血漿, 0.5 $\mu$ g/mL, 平衡透析法)

##### 3. 組織内移行

気管支分泌物<sup>4)</sup>、唾液<sup>5)</sup>、胆汁<sup>6)</sup>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<sup>7)</sup> (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

排泄経路：尿中、胆汁中

排泄率<sup>2)</sup>：患者(外国人)に本剤400mg(力価)を5%ブドウ糖注射液500mLで溶解し、1.5時間かけて点滴静注した場合、点滴静注後24時間までに投与量の5.5%が尿中に排泄されたが、その89%は12時間までに排泄された。

##### 6. 代謝酵素<sup>8,9)</sup>

チトクローム P-450分子種：CYP3A

#### ■薬効薬理

##### 1. 抗菌作用

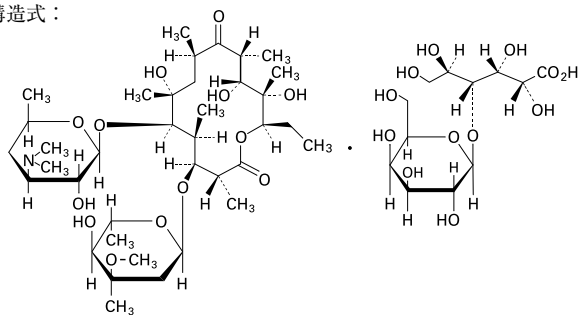
- (1) エリスロマイシンラクトビオン酸塩は血中で解離し、エリスロマイシンとして作用する<sup>10,11)</sup>。
- (2) 抗菌作用は細菌により静菌的ないし殺菌的である<sup>12)</sup>。

##### 2. 作用機序

細菌の蛋白合成阻害で<sup>13)</sup>、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<sup>14)</sup>。

## ■有効成分に関する理化学的知見

構造式：



一般名：エリスロマイシンラクトビオン酸塩

Erythromycin Lactobionate

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 mono(4-*O*-β-D-galactopyranosyl-D-gluconate)

略号：EM(エリスロマイシン)

分子式：C<sub>37</sub>H<sub>67</sub>NO<sub>13</sub> · C<sub>12</sub>H<sub>22</sub>O<sub>12</sub>

分子量：1092.22

性状：白色の粉末である。水、メタノール又はエタノール(99.5)に溶けやすく、アセトンに極めて溶けにくい。

## ■包装

エリスロシン点滴静注用500mg(力価) 10バイアル

## ■主要文献

- 1) Quinnan, G. V. & McCabe, W. R. : Lancet, I(8074) : 1160, 1978
- 2) Lopez-Belio, M. & Takimura, Y. : Antibiot. Annu., **295**, 1954/1955
- 3) Prandota, J., et al. : J. Int. Med. Res., **8**(suppl. 2) : 1, 1980
- 4) Lopez-Belio, M., et al. : Antibiot. Annu., **152**, 1956/1957
- 5) Simon, C. & Clasen, I. : Curr. Med. Res. Opin., **5**(suppl. 2) : 19, 1978
- 6) Takimura, Y. & Lopez-Belio, M. : Antibiot. Med., **1** : 561, 1955
- 7) Mao, J. C. H., et al. : Biochem. Pharmacol., **14** : 1049, 1965
- 8) Watkins, P. B., et al. : Proc. Natl. Acad. Sci. U. S. A., **82** : 6310, 1985
- 9) Brian, W. R., et al. : Biochemistry, **29** : 11280, 1990
- 10) 日本抗生物質医薬品基準解説, p. 723, 1971
- 11) Sande, M. A. & Mandell, G. L. : GOODMAN and GILMAN's The Pharmacological Basis of Therapeutics 8th ed., Pergamon Press, p.1130, 1990
- 12) McCall, C. E., et al. : Am. J. Med. Sci., **254** : 144, 1967
- 13) Brock, T. D., et al. : Biochim. Biophys. Acta, **33** : 274, 1959
- 14) 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

〒108-6306 東京都港区三田3-5-27

フリーダイヤル 0120-938-837

製造販売元

\*\* **マイランEPD合同会社**

東京都港区三田3丁目5番27号