

## 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（1998年9月）に準拠して作成

処方箋医薬品

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**

<注射用エリスロマイシンラクトビオン酸塩>

**Erythrocin<sup>®</sup>**

剤形	バイアル注射剤(用時溶解) バイアル内容物は白色の粉末
規格・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)
一般名	和名:エリスロマイシンラクトビオン酸塩(JAN) 洋名:Erythromycin Lactobionate(JAN, INN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造販売承認年月日:2009年6月26日 薬価基準収載年月日:2009年9月25日 発売年月日:1976年4月
開発・製造販売 (輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元: <b>マイランEPD合同会社</b>
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	

本 I F は 2017 年 2 月 改 訂 の 添 付 文 書 の 記 載 に 基 づ き 改 訂 し た。

## 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の作成の経緯

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MRと略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和63年日本病院薬剤師会（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）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成10年日病薬学術第3小委員会によって新たな位置付けとIF記載要領が策定された。

#### 2. IFとは

IFは「医療用医薬品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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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。しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関する情報、製薬企業の製剤意図に反した情報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。

#### 3. IFの様式・作成・発行

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で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IFは日病薬が策定した「IF記載要領」に従って記載するが、本IF記載要領は、平成11年1月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合にはIFが改訂・発行される。

#### 4. IFの利用にあたって

IF策定の原点を踏まえ、MRへのインタビュー、自己調査のデータを加えてIFの内容を充実させ、IFの利用性を高めておく必要がある。MRへのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段にIF作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全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」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

## 目次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の特徴及び有用性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名	3
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号	3
7. CAS登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
1. 有効成分の規制区分	4
2. 物理化学的性質	4
3. 有効成分の各種条件下における安定性	4
4. 有効成分の確認試験法	4
5. 有効成分の定量法	5
IV. 製剤に関する項目	6
1. 剤形	6
2. 製剤の組成	6
3. 注射剤の調製法	6
4. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意	7
5. 製剤の各種条件下における安定性	7
6. 溶解後の安定性	7
7. 他剤との配合変化 (物理化学的変化)	7
8. 電解質の濃度	7
9. 混入する可能性のある夾雑物	7
10. 生物学的試験法	7
11. 製剤中の有効成分の確認試験法	7
12. 製剤中の有効成分の定量法	7
13. 力価	7
14. 容器の材質	7
15. その他	8
V. 治療に関する項目	9
1. 効能又は効果	9
2. 用法及び用量	9

3. 臨床成績.....	10
VI. 薬効薬理に関する項目.....	12
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群.....	12
2. 薬理作用.....	12
VII. 薬物動態に関する項目.....	19
1. 血中濃度の推移・測定法.....	19
2. 薬物速度論的パラメータ.....	19
3. 吸収.....	20
4. 分布.....	20
5. 代謝.....	21
6. 排泄.....	21
7. 透析等による除去率.....	22
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目.....	23
1. 警告内容とその理由.....	23
2. 禁忌内容とその理由.....	23
3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由.....	23
4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由.....	23
5. 慎重投与内容とその理由.....	23
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法.....	24
7. 相互作用.....	24
8. 副作用.....	28
9. 高齢者への投与.....	30
10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与.....	30
11. 小児等への投与.....	30
12. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	30
13. 過量投与.....	31
14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）.....	31
15. その他の注意.....	31
16. その他.....	31
IX. 非臨床試験に関する項目.....	32
1. 一般薬理.....	32
2. 毒性.....	32
X. 取扱い上の注意等に関する項目.....	34
1. 有効期間又は使用期限.....	34
2. 貯法・保存条件.....	34
3. 薬剤取扱い上の注意点.....	34
4. 承認条件.....	34

5. 包装.....	34
6. 同一成分・同効薬.....	34
7. 国際誕生年月日.....	34
8. 製造販売承認年月日及び承認番号.....	34
9. 薬価基準収載年月日.....	35
10. 効能・効果追加, 用法・用量変更追加等の年月日及びその内容.....	35
11. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容.....	35
12. 再審査期間.....	35
13. 長期投与の可否.....	35
14. 厚生省薬価基準収載医薬品コード.....	35
15. 保険給付上の注意.....	35
XI. 文献.....	36
XII. 参考資料.....	38
1. 主な外国での発売状況.....	38
2. アメリカにおけるエリスロマイシン注射剤の効能・効果と用法・用量.....	38

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

エリスロマイシンは主としてグラム陽性菌に強い抗菌力を示すマクロライド系抗生物質で、1952年 McGuire らにより *Streptomyces erythreus* の培養液から分離抽出された。

エリスロマイシンは塩基性物質で、酸と塩又はエステルをつくる。エリスロマイシンラクトビオン酸塩はエリスロマイシンのラクトビオン酸塩であり、水溶性で静脈内投与が可能である。静脈内投与により各臓器・組織に広く分布するが、特に肺及び肝へ高濃度に移行する特性を有する。

注射用エリスロシンはエリスロマイシンラクトビオン酸塩の粉末注射剤で、経口投与が困難な場合や緊急を要する場合に点滴静注される。

また、1975年12月と1994年6月に再評価結果の公示を受け、有用性が確認された。

## 2. 製品の特徴及び有用性

エリスロマイシンの塩である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塩基となることにより、その抗菌活性を発揮し、塩そのものは抗菌活性が弱いと考えられている。

- ・エリスロマイシンは他のマクロライド剤に比べ強い抗菌力を示す。
- ・肺へ高濃度に移行し、感染部位へ優れた移行性を示す。

### 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。

重大な副作用として

偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎、心室頻拍、心室細動、QT延長、ショック、アナフィラキシー、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)、急性腎不全(急性間質性腎炎)、肝機能障害、黄疸が報告されている。(いずれも頻度不明)



5. 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- $\beta$ -D-*xylo*-hexopyranosyloxy)-3-(2, 6-dideoxy-3-*C*-methyl-3-*O*-methyl- $\alpha$ -L-*ribo*-hexopyranosyloxy)-6, 11, 12-trihydroxy-2, 4, 6, 8, 10, 12-hexamethyl-9-oxopentadecan-13-olide mono(4-*O*- $\beta$ -D-galactopyranosyl-D-gluconate)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

略号:EM(エリスロマイシン) (日本化学療法学会制定略号)

7. CAS登録番号

3847-29-8



### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 有効成分の規制区分

該当しない

(製剤: 処方箋医薬品: 注意－医師等の処方箋により使用すること)

#### 2. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色の粉末である.

##### (2) 溶解性

溶媒	添付文書の記載
水	溶けやすい
エタノール(99.5)	溶けやすい
メタノール	溶けやすい
アセトン	極めて溶けにくい

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点），沸点，凝固点

融点: 145～150°C [THE MERCK INDEX]

##### (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

pH: 5.0～7.5 [50mg(力価)/mL 溶液] [局外規]

#### 3. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 4. 有効成分の確認試験法

局外規「エリスロマイシンラクトビオン酸塩」による.

## 5. 有効成分の定量法

円筒平板法により試験菌として *Staphylococcus aureus* ATCC 6538P を用いて測定する.

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別, 規格及び性状

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) 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]

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

pH 及び浸透圧比は「(1) 剤形の区別, 規格及び性状」の項参照.

#### (3) 酸価, ヨウ素価等

該当しない

#### (4) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

窒素ガス

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分 (活性成分) の含量

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)

#### (2) 添加物

該当しない

#### (3) 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

### 3. 注射剤の調製法

#### 〔注射液調整法〕

- 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.

#### 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

室温の気密容器での長期保存試験で，性状，含量に変化は認められなかったことから，5年間安定であった。

#### 6. 溶解後の安定性

5%溶液〔本剤1バイアル500mg(力価)に注射用水10mLを加える〕は，冷蔵庫内で2週間安定である。

#### 7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

巻末参照

#### 8. 電解質の濃度

該当しない

#### 9. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

#### 10. 生物学的試験法

本剤の力価は，円筒平板法により試験菌として *Staphylococcus aureus* ATCC 6538P を用いて測定する。

#### 11. 製剤中の有効成分の確認試験法

局外規「注射用エリスロマイシンラクトビオン酸塩」による。

#### 12. 製剤中の有効成分の定量法

局外規「注射用エリスロマイシンラクトビオン酸塩」による。

#### 13. 力価

エリスロマイシンの塩の力価は，エリスロマイシン塩基としての重量を表す。

#### 14. 容器の材質

無色透明ガラス瓶

15. その他

該当しない

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

＜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，ジフテリア菌

＜適応症＞

外傷・熱傷及び手術創等の二次感染，肺炎，ジフテリア

### 効能・効果に関連する使用上の注意

該当しない

### 2. 用法及び用量

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．

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

- (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．

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床効果

疾患名	有効率(%)
敗血症	50.0( 4/8 )
心内膜炎	53.8( 7/13)
せつ・せつ腫症・面疔	100.0( 3/3 )
蜂巣炎	85.7(18/21)
皮下膿瘍	63.6( 7/11)
咽頭炎, 喉頭炎	100.0( 6/6 )
扁桃炎	100.0(52/52)
扁桃周囲炎	87.0(20/23)
乳腺炎	100.0( 1/1 )
リンパ節炎・リンパ管炎	100.0( 2/2 )
骨髓炎・骨膜炎	71.0(22/31)
手術創感染	90.2(55/61)
気管支炎	93.1(67/72)
肺炎・気管支肺炎	94.4(119/126)
肺化膿症・肺膿瘍	88.9(16/18)
胆のう炎・胆管炎	93.6(44/47)
腎盂炎・腎盂腎炎	79.5(31/39)
膀胱炎	80.0(16/20)
尿道炎	100.0( 5/5 )
子宮付属器炎	100.0( 2/2 )
卵管・卵巣膿瘍	100.0( 1/1 )
淋疾	100.0( 2/2 )
髄膜炎	91.7(11/12)
中耳炎	91.7(11/12)
副鼻腔炎	100.0(33/33)
耳下腺炎	100.0( 1/1 )
梅毒	50.0( 1/2 )

有効=著効+有効+やや有効

再評価結果時(1972年)

注) グルコヘプトン酸エリスロマイシン使用例も含む。  
表中の疾患名は再評価結果(1972年)時の記載である。

#### (2) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

#### (3) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

#### (4) 検証的試験

該当資料なし

(5) 治療的使用

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

アセチルスピラマイシン, ジョサマイシン, ミデカマイシン酢酸エステル, ミデカマイシン, クラリスロマイシン, ロキシスロマイシン, ロキタマイシン, アジスロマイシン水和物

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

細菌の蛋白合成阻害で<sup>1)</sup>, 70S系のリボソームの50S subunitと結合することによる<sup>2)</sup>.

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 抗菌力

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, 肺炎球菌などのグラム陽性球菌<sup>3~7)</sup>に強い抗菌力を発揮するほか, 一部のグラム陰性菌<sup>3~7)</sup>, 嫌気性菌<sup>8)</sup>, 肺炎マイコプラズマ<sup>7,9)</sup>, クラミジア属<sup>10,11)</sup>にも強い抗菌力を示す.

#### グラム陽性菌に対する抗菌スペクトラム

接種菌量:10<sup>6</sup>cfu/mL

菌 種	MIC (μg/mL)				
	EM	CAM	JM	ABPC	CEX
<i>Staphylococcus aureus</i> 209P-JC	0.10	0.10	0.20	0.025	0.78
<i>S. aureus</i> Terajima	0.10	0.10	0.78	0.10	6.25
<i>S. aureus</i> Smith 4	0.20	0.10	0.78	0.05	1.56
<i>S. epidermidis</i> IID866	0.20	0.10	0.39	0.39	3.13
<i>S. epidermidis</i> sp-al-1	0.20	0.10	1.56	0.10	1.56
<i>Streptococcus pyogenes</i> IID689	0.025	≤0.012	0.10	≤0.012	0.78
<i>S. pyogenes</i> J-1	0.05	0.05	0.20	0.025	0.78
<i>S. pneumoniae</i> IID552	0.025	0.025	0.10	0.025	3.13
<i>S. pneumoniae</i> IID553	0.05	0.025	0.10	0.025	3.13
<i>S. pneumoniae</i> IID554	0.025	0.025	0.10	0.05	1.56
<i>Streptococcus</i> B group 1	0.025	0.025	0.10	0.10	3.13
<i>Streptococcus</i> C group 1	0.05	0.05	0.39	0.025	0.78
<i>Streptococcus</i> G group 1	0.05	0.025	0.20	0.025	0.78
<i>Enterococcus faecalis</i> ATCC8043	0.05	0.05	0.39	0.20	50
<i>Micrococcus luteus</i> NIHJ	0.025	0.025	0.10	≤0.012	0.05
<i>Corynebacterium xerosis</i> IID551	0.05	0.025	0.39	0.20	25
<i>C. diptheriae</i> IID526	≤0.012	≤0.012	≤0.012	0.39	0.78
<i>Bacillus subtilis</i> ATCC6633	0.20	0.10	0.39	≤0.012	0.78
<i>B. cereus</i> ATCC9634	0.05	0.05	0.78	12.5	3.13
<i>B. anthracis</i> IID502	0.39	0.10	0.39	0.025	1.56

グラム陰性菌に対する抗菌スペクトル

接種菌量:10<sup>6</sup>cfu/mL

菌 種	MIC (μg/mL)				
	EM	CAM	JM	ABPC	CEX
<i>Escherichia coli</i> NIHJ JC-2	100	100	>100	6.25	6.25
<i>E. coli</i> K-12	25	25	>100	3.13	6.25
<i>Salmonella typhi</i> IID610	3.13	3.13	3.13	0.10	3.13
<i>S. paratyphi</i> B	25	25	>100	0.39	6.25
<i>S. enteritidis</i> KB-21	50	25	100	0.39	6.25
<i>Shigella flexneri</i> 2a	12.5	12.5	100	3.13	12.5
<i>S. sonnei</i> EW-33	25	12.5	100	6.25	12.5
<i>Klebsiella pneumoniae</i> IF03317	50	50	>100	12.5	6.25
<i>K. pneumoniae</i> 3K-2	25	25	>100	25	6.25
<i>Serratia marcescens</i> IID618	50	100	>100	25	>100
<i>Enterobacter aerogenes</i> IF012010	50	50	>100	6.25	12.5
<i>Proteus mirabilis</i> IF03849	>100	>100	>100	3.13	12.5
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> P-32	25	12.5	100	>100	>100
<i>Neisseria gonorrhoeae</i> J-1	0.20	0.10	0.78	0.39	3.13
<i>N. gonorrhoeae</i> J-4	0.20	0.10	0.78	0.10	3.13
<i>Haemophilus influenzae</i> IID981	3.13	6.25	25	0.20	6.25
<i>H. influenzae</i> J-13	3.13	6.25	25	0.20	6.25

嫌気性菌に対する抗菌スペクトル

接種菌量:10<sup>6</sup>cfu/mL

菌 種	MIC (μg/mL)				
	EM	CAM	JM	CLDM	ABPC
<i>Peptostreptococcus anaerobius</i> ATCC27337	0.05	≦0.025	0.20	0.10	0.10
<i>P. magnus</i> ATCC29328	1.56	0.78	0.78	0.78	0.20
<i>P. micros</i> VPI5464-1	≦0.025	≦0.025	≦0.025	≦0.025	≦0.025
<i>Streptococcus constellatus</i> ATCC27823	0.10	≦0.025	0.78	0.10	0.39
<i>S. intermedius</i> ATCC27335	0.10	0.05	0.78	0.10	0.39
<i>Staphylococcus saccharolyticus</i> GAI5520	≦0.025	≦0.025	≦0.025	≦0.025	≦0.025
<i>Propionibacterium acnes</i> ATCC11828	≦0.025	≦0.025	≦0.025	≦0.025	≦0.025
<i>P. granulosum</i> GAI7414	0.05	≦0.025	0.10	≦0.025	≦0.025
<i>Bifidobacterium adolescentis</i> ATCC15703	0.05	≦0.025	0.05	≦0.025	0.10
<i>Eubacterium aerofaciens</i> ATCC25986	≦0.025	≦0.025	≦0.025	≦0.025	≦0.025
<i>Clostridium perfringens</i> GAI	0.78	0.10	1.56	≦0.025	≦0.025
<i>C. septicum</i> ATCC12464	0.39	0.10	0.39	≦0.025	0.05
<i>C. tertium</i> ATCC19405	1.56	0.20	0.78	6.25	0.05
<i>Bacteroides fragilis</i> GAI5562	1.56	0.39	0.39	0.10	12.5
<i>B. vulgatus</i> ATCC29327	0.78	0.39	0.20	≦0.025	0.78
<i>B. thetaiotaomicron</i> WAL3304	6.25	3.13	1.56	3.13	25
<i>Fusobacterium varium</i> GAI5566	>100	>100	>100	1.56	1.56
<i>Veillonella parvula</i> ATCC10790	12.5	6.25	12.5	0.05	≦0.025

その他の菌に対する抗菌スペクトル

接種菌量:  $10^2 \sim 8$  cfu/mL

菌種	MIC ( $\mu$ g/mL)						
	EM	CAM	JM	RKM	MDM	MINO	DOXY
<i>M. pneumoniae</i> FH	0.00625	0.00625	0.025	—	—	—	—
<i>M. pneumoniae</i> IID Kawanishi	0.0078	0.0078	0.0313	—	—	—	—
<i>C. trachomatis</i> B	0.78	0.05	—	0.39	0.78	<0.025	<0.025
<i>C. trachomatis</i> L2	1.56	0.10	—	0.18	0.78	<0.025	<0.025
<i>C. trachomatis</i> D	0.03-0.14	0.005-0.01	—	—	—	0.01	0.02
<i>C. trachomatis</i> E	0.02-0.14	0.10	—	—	—	0.005-0.01	0.02-0.03
<i>C. psittaci</i> MP	1.56	0.025-0.05	—	0.05-0.10	0.18-0.78	<0.025	0.05
<i>C. psittaci</i> Izawa	1.56	0.025-0.05	—	0.05-0.10	0.18-0.78	<0.025	0.10

臨床分離株における感受性分布(グラム陽性菌)

菌種	薬剤	菌株数	MIC <sub>50</sub> ( $\mu$ g/mL)
<i>S. aureus</i>	EM	765	0.39
	CAM	765	0.20
	JM	661	0.78
	MOM	181	1.56
	RKM	250	0.39
	ABPC	158	3.13
	CEX	75	6.25
	CCL	166	3.13
<i>S. epidermidis</i>	EM	262	0.20
	CAM	262	0.10
	JM	262	0.39
	MOM	40	0.78
	RKM	100	0.20
	ABPC	76	3.13
	CEX	75	12.5
	CCL	61	1.56
<i>S. saprophyticus</i>	EM	10	0.39
	CAM	10	0.20
	JM	10	1.56
	MOM	10	1.56
	AMPC	10	0.39
	CCL	10	1.56
	<i>S. pyogenes</i>	EM	274
CAM		274	0.05
JM		274	0.20
MOM		65	0.39
RKM		164	0.20
ABPC		49	$\leq 0.025$
CEX		31	0.39
CCL		61	0.20

菌 種	薬 剤	菌株数	MIC <sub>50</sub> (μ g/mL)
<i>S. pneumoniae</i>	EM	166	0.05
	CAM	166	≦0.025
	JM	165	0.20
	MOM	20	0.39
	RKM	45	0.20
	ABPC	73	≦0.025
	CEX	24	1.56
	CCL	14	0.39
<i>S. agalactiae</i>	EM	21	0.10
	CAM	21	≦0.05
	JM	21	0.39
	MOM	20	0.78
	AMPC	20	≦0.05
	CCL	20	0.39
<i>α-Streptococcus</i>	EM	44	0.20
	CAM	44	0.20
	JM	34	0.78
	ABPC	34	≦0.025
<i>β-Streptococcus</i>	EM	14	0.05
	CAM	14	0.05
	JM	14	0.20
	MOM	14	0.78
	RKM	14	0.20
<i>E. faecalis</i>	EM	300	1.56
	CAM	300	0.78
	JM	273	3.13
	MOM	94	25
	RKM	87	6.25
	ABPC	63	0.78
	CEX	60	100
	CCL	85	100
<i>E. faecium</i>	EM	119	6.25
	CAM	119	3.13
	JM	119	1.56
	MOM	70	1.56
	RKM	66	0.39
	AMPC	8	25
	CCL	37	50

臨床分離株における感受性分布(グラム陰性菌)

菌種	薬剤	菌株数	MIC <sub>50</sub> (μg/mL)
<i>B. catarrhalis</i>	EM	110	0.10
	CAM	110	0.10
	JM	109	0.78
	MOM	20	0.78
	RKM	18	0.20
	ABPC	67	3.13
	CEX	17	3.13
	CCL	37	1.56
<i>N. gonorrhoeae</i>	EM	63	0.20
	CAM	63	0.20
	JM	30	0.78
	RKM	20	3.13
	ABPC	43	≦0.05
	CEX	10	3.13
	CCL	33	0.39
	DOXY	33	1.56
<i>B. pertussis</i>	EM	22	0.025
	CAM	22	≦0.012
	JM	22	0.10
	ABPC	22	0.39
	CCL	21	3.13
<i>H. influenzae</i>	EM	345	3.13
	CAM	345	3.13
	JM	303	12.5
	MOM	59	12.5
	RKM	115	6.25
	ABPC	124	0.39
	CEX	32	6.25
	CCL	62	1.56
<i>C. jejuni</i>	EM	83	0.78
	CAM	83	0.39
	JM	83	0.39
	MOM	67	0.78
	RKM	57	0.10
	ABPC	14	3.13
	CCL	16	12.5
	<i>L. pneumophila</i>	EM	8
CAM		8	≦0.025
JM		8	0.39

臨床分離株における感受性分布(嫌気性菌およびその他の菌)

菌 種	薬 剤	菌株数	MIC <sub>50</sub> (μg/mL)
<i>Peptostreptococcus sp.</i>	EM	108	0.39
	CAM	108	0.39
	JM	102	0.39
	CLDM	55	≦0.05
	ABPC	81	≦0.05
<i>B. fragilis</i>	EM	100	1.56
	CAM	100	0.39
	JM	100	0.39
	CLDM	50	0.10
	RMK	27	0.10
	ABPC	73	12.5
	CCL	23	100
<i>M. pneumoniae</i>	EM	50	0.006
	CAM	50	≦0.003
	JM	50	0.006
<i>U. urealyticum</i>	EM	21	8.0
	CAM	21	1.0
	MINO	21	0.50
<i>C. trachomatis</i>	EM	14	0.10
	CAM	15	≦0.006
	JM	14	0.05
	MINO	15	0.05
	TC	14	0.10

2) 感染防御効果

黄色ブドウ球菌, 化膿レンサ球菌, 肺炎球菌によるマウスの腹腔内感染に対する感染防御効果を検討した結果, ジョサマイシン(JM), ロキタマイシン(RKM)の約3~4倍優れた感染防御効果(ED<sub>50</sub>値の比較)を示した<sup>3)</sup>.

マウスの腹腔内感染に対する感染防御効果

菌種	接種菌量 (cells/マウス)	薬剤	MIC ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	ED <sub>50</sub> * (mg/マウス)	ED <sub>50</sub> 比 (EMを1とした場合)	
黄色ブドウ球菌 S. aureus Smith	6.3×10 <sup>8</sup>	EM	0.39	1.68	1	
		JM	3.13	5.17		3.1
		RKM	0.39	4.54		2.7
化膿レンサ球菌 S. pyogenes MSI5028	7.1×10 <sup>8</sup>	EM	0.012	1.56	1	
		JM	0.10	5.13		3.3
		RKM	0.025	4.45		2.9
肺炎球菌 S. pneumoniae MSI5024	3.4×10 <sup>8</sup>	EM	0.05	0.79	1	
		JM	0.20	2.17		2.7
		RKM	0.10	2.87		3.6

MIC : 10<sup>8</sup>cells/mL n=20 \*ED<sub>50</sub> : mg/kgの数値をマウスの重量に換算

薬剤投与 : 感染1時間後1回経口投与

## 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

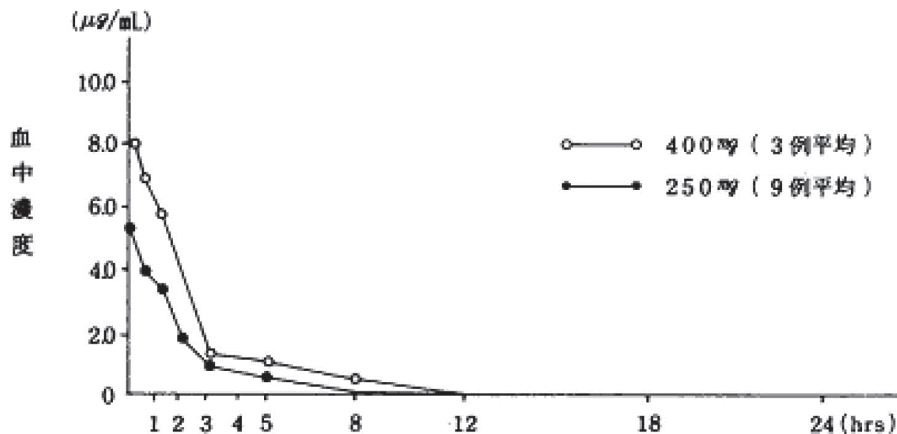
#### (2) 最高血中濃度到達時間

投与直後

#### (3) 通常用量での血中濃度

患者(外国人)にエリスロマイシンラクトビオン酸塩 250 または 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, 点滴終了直後では血清中濃度はそれぞれ 5.4, 7.8  $\mu\text{g}$ (力価)/mL, 1 時間後で 3.1, 5.7  $\mu\text{g}$ (力価)/mL, 3 時間後で 0.5, 0.8  $\mu\text{g}$ (力価)/mL, 8 時間後では検出不能 (0.2  $\mu\text{g}$ (力価)/mL) であった<sup>12)</sup>.

点滴静注後の血中濃度



#### (4) 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

### 2. 薬物速度論的パラメータ

#### (1) 吸収速度定数

該当資料なし

#### (2) バイオアベイラビリティ

該当資料なし



(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

64.5% (*in vitro*, ヒト血漿, 0.5  $\mu$ g/mL, 平衡透析法)<sup>13)</sup>

3. 吸収

該当資料なし

4. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

成人及び小児にエリスロマイシンを経口投与した時, 脳脊髄液中へはほとんど移行しなかった<sup>14, 15)</sup>.

(2) 胎児への移行性

妊婦にエリスロマイシンを 200~400mg (力価) 1 回経口投与したとき, 臍帯血, 羊水中に活性物質は検出されなかった. 合計 800mg (力価) 以上を連続投与した場合には, 微量の活性物質の移行が認められた<sup>16)</sup>.

(3) 乳汁中への移行性

乳汁中への移行がみられたとの報告がある<sup>17)</sup>.

エリスロマイシン 500mg を経口投与後の乳汁中及び血中濃度の推移

・ 乳汁中濃度 ( $\mu$ g/mL)

1 時間後: 痕跡 → 2 時間後: 1.04 → 4 時間後: 1.19 → 6 時間後: 1.08

・ 血中濃度 ( $\mu$ g/mL)

1 時間後: 4.35 → 2 時間後: 3.36 → 4 時間後: 1.34 → 6 時間後: 0.86

(4) 髄液への移行性

結核性髄膜炎患者にエリスロマイシン 200mg (力価) を投与したとき, 髄液中へはほとんど移行しなかった.

## (5) その他の組織への移行性

外国人のデータでは、下記の成績がある。

組織	1日投与量	測定時刻	平均濃度
気道分泌物 <sup>18)</sup>	250mg	投与45分後	9.1 $\mu$ g/mL
唾液 <sup>19)</sup>	500mg	投与1時間後	7.05 $\mu$ g/mL
胆汁 <sup>20)</sup>	250mg	投与2時間後	183 $\mu$ g/mL

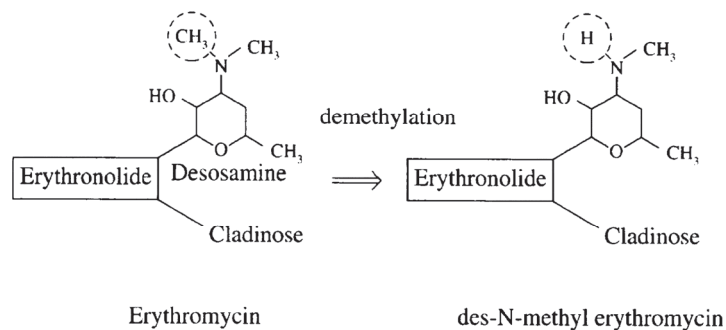
## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

(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-methyl erythromycinを生じる。

(ウサギ)<sup>21)</sup>



### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

チトクローム P-450 分子種: CYP3A<sup>22, 23)</sup>

### (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

尿中, 胆汁中

## (2) 排泄率

### 1) 胆汁排泄

患者(外国人)にエリスロマイシンラクトビオン酸塩 250mg を 6 名の成人の患者に 1 回静注した場合、胆汁中濃度は 2 時間後に平均  $183 \mu\text{g/mL}$  のピークに達し、12 時間後までに平均 11mg が回収された<sup>20)</sup>。

### 2) 尿中排泄

患者(外国人)にエリスロマイシンラクトビオン酸塩 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<sup>12)</sup>。

## (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. 透析等による除去率

### (1) 腹膜透析

除去されないとの報告がある。(PDR, 2000)

### (2) 血液透析

除去されないとの報告がある。(PDR, 2000)

### (3) 直接血液灌流

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由

#### ■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<br>(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〕 |
|--|

（解説）

相互作用(1)の項参照

### 3. 効能・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・用量に関連する使用上の注意とその理由

#### <用法・用量に関連する使用上の注意>

- |   |
|---|
| (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。<br>(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。<br>(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〕 |
|---|

### 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)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。〕<br>(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。〕<br>〔「用法・用量に関連する使用上の注意」，「副作用」の項参照〕 |
|--|

（解説）

エリスロマイシンは肝排泄型の薬剤であり，肝障害のある患者では血中濃度が上昇するおそれがある。

## 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

### 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。

## 7. 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)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 [スンベプラ]	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。	

#### (解説)

エルゴタミンは、主に CYP3A4 で代謝されるため、CYP3A 阻害作用を有する本剤との併用により代謝が阻害され、エルゴタミンの血中濃度が上昇することがある。海外では、血管攣縮等の重篤な副作用が報告されており、本剤との併用は避けるべきであると考えられる。<sup>35)</sup>

ピモジドとクラリスロマイシンとの相互作用が報告されている。ピモジドは主に CYP3A によって代謝されるが、大量投与により不整脈や心電図異常が発現する危険性があるとされている。エリスロマイシンとの併用時には、クラリスロマイシンと同様、CYP3A 阻害作用によってピモジドの血中濃度が上昇して、QT 延長や Torsades de pointes 等の心室性不整脈を起こすおそれがあるため、併用は避ける必要がある。

アスナプレビルは、主に CYP3A4 で代謝されるため、CYP3A 阻害作用を有する本剤との併用により代謝が阻害され、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
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。	

次ページへ続く

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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。	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。
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。	
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。	
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。	
ピタバスタチンカルシウム	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。	
ブ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 バルデナフィル塩酸塩水和物 タダラフィル 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。
ブロナンセリン	ブ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。	

次ページへ続く

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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。	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。
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。	
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。
ジゴキシシン	ジゴキシ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。	



## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

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 (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 (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>57)</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。

#### ・ 類薬による重大な副作用

該当しない

## (2) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

### 再評価時における副作用の種類と発現頻度

副作用チェック例数	475
副作用発生例数	46(9.7%)
副作用発生件数	54

副作用の種類	件数	頻度%
悪心(嘔気)	19	4.0
嘔吐	4	0.8
胃部不快感	4	0.8
下痢	1	0.2
発疹	2	0.4
じん麻疹	1	0.2
血管痛	15	3.2
胸部熱感	2	0.4
悪寒	1	0.2
めまい	1	0.2
口内炎	2	0.4
舌炎	1	0.2
肝機能障害	1	0.2

## (3) 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

## (4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

### ■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

### 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.

### 重大な副作用

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]

その他の副作用	
	頻度不明
過敏症 (注1)	発疹, 蕁麻疹

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.

## 9. 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。〕

(解説)

エリスロマイシンの尿中排泄率は注射剤では約15%であり, そのほとんどは肝で代謝され, 胆汁中に排泄されるが, 高齢者では肝機能の低下や腎の排泄機能の低下がみられるため, 本剤の代謝や排泄が低下する可能性が考えられる。

## 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。〕

(解説)

授乳婦へのエリスロマイシン投与で, 母乳中への移行が認められており<sup>17)</sup>, 授乳婦へエリスロマイシンを投与する際には, 授乳を避けさせる。

エリスロマイシン 500mg を経口投与後の乳汁中及び血中濃度の推移

・乳汁中濃度 ( $\mu\text{g/mL}$ )

1 時間後:痕跡→2 時間後:1.04→4 時間後:1.19→6 時間後:1.08

・血中濃度 ( $\mu\text{g/mL}$ )

1 時間後:4.35→2 時間後:3.36→4 時間後:1.34→6 時間後:0.86

## 11. 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。

(解説)

海外において, 肥厚性幽門狭窄の発生率が, 自然発生率に比べてエリスロマイシン服用児で高いとの報告がある<sup>64)</sup>。

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

### 13. 過量投与

該当しない

なお、注射剤は、医療機関で過量に注射されることが少ないと考えられるため、「過量投与」の項は設定していない。

### 14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

#### 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) 投与时 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。

### 15. 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。

### 16. その他

該当しない

## Ⅹ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 一般薬理

#### (1) 中枢神経系に対する作用

重大な影響を及ぼすとの報告は見当たらない。

#### (2) 自律神経系に対する作用

重大な影響を及ぼすとの報告は見当たらない。

#### (3) 呼吸・循環器系に対する作用

重大な影響を及ぼすとの報告は見当たらない。

#### (4) 消化器系及び平滑筋に対する作用

重大な影響を及ぼすとの報告は見当たらない。

#### (5) 血液系に対する作用

重大な影響を及ぼすとの報告は見当たらない。

#### (6) 腎機能に対する作用

重大な影響を及ぼすとの報告は見当たらない。

#### (7) その他の作用

該当資料なし

### 2. 毒性

#### (1) 単回投与毒性試験

薬剤	動物種	LD <sub>50</sub> (mg/kg)		
		経口	皮下	腹腔内
エリスロマイシン <sup>58)</sup>	マウス	3, 112	>2, 500	—
	モルモット	—	—	413

#### (2) 反復投与毒性試験

ラット(雌)にエリスロマイシン塩基を0.05, 0.1及び0.2%の割合に含む飼料を3ヵ月間にわたって与えたが体重曲線はコントロールと同じであった。投薬後の肉眼的及び病理組織学的検査では検査臓器(心臓, 肺臓, 肝臓, 脾臓, 膵臓, 胃, 腸, 腎臓, 胸腺, 甲状腺及び副腎)に異常はみられなかった。毎週行なわれた血液学的検査においても異常は認められなかった<sup>58)</sup>。

イヌに85mg/kgのエリスロマイシンを1日2回3ヵ月間静注すると, 注射直後に軽度の振せん及び嘔吐がみられたが, やがて消失しその他に異常は認められなかった<sup>59)</sup>。

筋注で5及び10mg/kgのエリスロマイシンを, 1日1回4ヵ月間連続投与した場合にも内部臓器には異常は認められなかった<sup>59)</sup>。

イヌにエリスロマイシンを経口投与で100mg/kg/日, 一年間連続投与したが, 内部臓器や骨髄内の骨髄細胞, 赤血球, リンパ球などに異常はみられなかった<sup>59)</sup>。

### (3) 生殖発生毒性試験

エリスロマイシンエチルコハク酸エステル 200 及び 2,000mg/kg/日を妊娠ラット(妊娠 9 日目より 14 日目まで投薬)及び妊娠マウス(妊娠 7 日目より 12 日目まで投薬)に強制経口投与して、催奇形性試験を行なったがいずれの動物においても催奇形作用は認められなかった。

また、200 及び 400mg/kg/日を 60 日間雌雄ラットに経口投与しても、繁殖に対する影響はみられず、更に 45 日間追加継続投与し再交配を行なっても繁殖は正常であった。

### (4) その他の特殊毒性

肝臓に対する作用<sup>60, 61)</sup>

マウス及びヒトの肝細胞に対するエリスロマイシンの毒性を肝細片及び組織培養で検討した結果、エリスロマイシン塩基や塩の毒性は弱かった。

## X. 取扱い上の注意等に関する項目

### 1. 有効期間又は使用期限

使用期限:

ラベル, ケースに記載(5年(安定性試験結果による))

### 2. 貯法・保存条件

室温保存

### 3. 薬剤取扱い上の注意点

処方箋医薬品:注意—医師等の処方箋により使用すること.

### 4. 承認条件

該当しない

### 5. 包装

エリスロシン点滴静注用 500mg(力価) 10 バイアル

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬:なし

同効薬:アセチルスピラマイシン, ジョサマイシン, クラリスロマイシン, ロキシスロマイシン,  
アジスロマイシン

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日:

2009年6月26日

承認番号:

22100AMX01330000

<参考:旧販売名品(注射用エリスロシン)の製造販売承認年月日及び承認番号>

製造販売承認年月日:

1955年10月13日

承認番号:

13027KUY08446000

**9. 薬価基準収載年月日**

2009年9月25日

<参考:旧販売名品(注射用エリスロシン)の薬価基準収載年月日>

1976年1月1日

**10. 効能・効果追加, 用法・用量変更追加等の年月日及びその内容**

該当しない

**11. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容**

再評価結果通知年月日:

2004年9月30日[製造(輸入)承認事項の一部を変更すれば薬事法(昭和35年法律第145号)第14条第2項各号のいずれにも該当しない]

**12. 再審査期間**

該当しない

**13. 長期投与の可否**

該当しない

**14. 厚生省薬価基準収載医薬品コード**

6141400D1031

**15. 保険給付上の注意**

該当しない



## XI . 文献

- 1) Brock, T. D. , et al. :Biochim. Biophys. Acta, 33:274, 1959
- 2) Mao, J. C. H. :Biochem. Pharmacol. , 16:2441, 1967
- 3) 小野武夫, ほか:Chemotherapy, 36(S-3) :1, 1988
- 4) 五島瑳智子, ほか:Chemotherapy, 36(S-3) :35, 1988
- 5) 横田健, ほか:Chemotherapy, 36(S-3) :59, 1988
- 6) 西野武志, ほか:Chemotherapy, 36(S-3) :95, 1988
- 7) 長手尊俊, ほか:Chemotherapy, 36(S-3) :129, 1988
- 8) 加藤直樹, ほか:Chemotherapy, 36(S-3) :71, 1988
- 9) 洲崎健, ほか:Chemotherapy, 36(S-3) :111, 1988
- 10) 吉沢花子, ほか:Chemotherapy, 36(S-3) :117, 1988
- 11) 副島林造, ほか:Chemotherapy, 36(S-3) :673, 1988
- 12) Lopez-Belio, M. &Takimura, Y. :Antibiot. Annu. , 295, 1954/1955
- 13) Prandota, J. , et al. :J. Int. Med. Res. , 8(suppl. 2) :1, 1980
- 14) 飯尾孝子:耳鼻臨床, 50:905, 1957
- 15) Coriell, L. L. , et al. :Antibiot. Ann. :254, 1954/1955
- 16) Kiefer L. , et al. :Am. J. Obstet. Gynecol. , 69:174, 1955
- 17) 森操七郎:日本産科婦人科学会雑誌, 23:547, 1971
- 18) Lopez-Belio, M. , et al. :Antibiot. Annu. , 152, 1956/1957
- 19) Simon, C. &Clasen, I. :Curr. Med. Res. Opin. , 5(suppl. 2) :19, 1978
- 20) Takimura, Y. &Lopez-Belio, M. :Antibiot. Med. , 1:561, 1955
- 21) Mao, J. C. H. , et al. :Biochem, Pharmacol. , 14:1049, 1965
- 22) Watkins, P. B. , et al. :Proc. Natl. Acad. Sci. U. S. A. , 82:6310, 1985
- 23) Brian, W. R. , et al. :Biochemistry, 29:11280, 1990
- 24) Honing, P. K. , et al. :Clin. Pharmacol. Ther. , 52:231, 1992
- 25) Adkins, J. C. , et al. :Drugs, 55(1) :121, 1998
- 26) Olsson, S. , et al. :Br. Med. J. , 305:748, 1992
- 27) Bran, S. , et al. :Arch. Intern. Med. , 155:765, 1995
- 28) 川本俊治, ほか:心臓, 25:696, 1993
- 29) Martell, R. , et al. :Ann. Intern. Med. , 104:660, 1986
- 30) Hansten, P. D. , et al. :Drug Interactions &Updates Quarterly, 13:224, 1993
- 31) Furlan, V. , et al. :Transplantation, 59:1217, 1995
- 32) Sato, R. I. , et al. :Arch. Intern. Med. , 144:2413, 1984
- 33) Hansten, P. D. , et al. :Drug Interactions &Updates Quarterly, 13:227, 1993
- 34) Tobe, S. W. , et al. :Cancer Chemother. Pharmacol. , 35:188, 1995
- 35) Ghali, R. , et al. :Ann. Vasc. Surg. , 7:291, 1993

- 36) Hansten, P. D., et al. :Drug Interactions &Updates Quarterly, 13:229, 1993
- 37) Liedholm, H., et al. :DICP, Ann. Pharmacother., 25:1007, 1991
- 38) Olkkola, K. T., et al. :Clin. Pharmacol. Ther., 53:298, 1993
- 39) Phillips, J. P., et al. :J. Clin. Psychopharmacol., 6:297, 1986
- 40) Zitelli, B. J. et al. :Clin Pediatr., 26:117, 1987
- 41) Kantola, T., et al. :Clin Pharmacol. Ther., 64:177, 1998
- 42) Spinler, S. A., et al. :Clin. Pharmacol. Ther., 57:89, 1995
- 43) Reisz, G., et al. :Am. Rev. Respir. Dis., 127:581, 1983
- 44) 前田昇三, ほか:Chemotherapy, 41:765, 1993
- 45) Nelson, M. V., et al. :Clin. Pharmacol. Ther., 47:694, 1990
- 46) Marre, F., et al. :Cancer Research, 56:1296, 1996
- 47) Cresteil, T., et al. :Cancer Research, 54:386, 1994
- 48) Harris, J. W., et al. :Cancer Research, 54:4026, 1994
- 49) Wachter, V. J., et al. :7th North American ISSX Meeting 10(20 oct.):351, 1996
- 50) Zusman, R. M., et al. :Am. J. Cardiol., 83:35C, 1999
- 51) Laforce, C. F., et al. :J. Allergy Clin. Immunol., 72:34, 1983
- 52) 長沢紘一, ほか:臨床医薬, 11:1213, 1995
- 53) Ludden, T. M., et al. :Clin. Pharmacokinet., 10:63, 1985
- 54) Friedman, H. S., et al. :Chest, 82:202, 1982
- 55) Mogford, N., et al. :Brit. Med. J., 309:1620, 1994
- 56) Kumar, G. N., et al. :J. Pharmacol. Exp. Ther., 277:423, 1996
- 57) Quinnan, G. V. &McCabe, W. R. :Lancet, I (8074):1160, 1978
- 58) Anderson, R. C., et al. :J. Am. Pharm. Ass. Sci. Ed., 41:555, 1952
- 59) Anderson, R. C., et al. :J. Am. Pharm. Ass. Sci. Ed., 44:199, 1955
- 60) Dujovne, C. A., et al. :Gastroenterol., 58:296, 1970
- 61) Dujovne, C. A., et al. :Clin. Res., 18:48, 1970
- 62) Siedlik, P. H., et al. :J. Clin. Pharmacol., 39:501, 1999
- 63) 藤川 敏:診断と治療, 84(suppl.):346, 1996
- 64) Honein, M. A., et al. :Lancet, 354:2101, 1999
- 65) Kehrer, D. F. S., et al. :J. Clin. Oncology, 20(14):3122, 2002
- 66) Caraco, Y., et al. :J. Rheumatol., 19:494, 1992

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

アメリカ, イギリス, フランス, ドイツ等で販売されている.

### 2. アメリカにおけるエリスロマイシン注射剤の効能・効果と用法・用量

販売名: Erythrocin Lactobionate-I.V.

販売会社: Hospira

規格: 500mg(力価)バイアル, 1g(力価)バイアル

効能・効果	用法・用量
溶連菌, 肺炎球菌, インフルエンザ菌による軽症から中等症の上気道感染症	通常, 原則として重症の1日体重1kgあたり15~20mg(力価)を分割投与する. なお, 重症度に応じ, 1日の最高用量は4gまで増量する. なお, 1日4gを超える用量では, 特に腎機能低下あるいは肝機能低下を起こしている高齢者においてエリスロマイシンによる難聴の副作用発生頻度が高くなるので注意すること.  また, ペニシリンアレルギー患者のリウマチ熱の初発予防の投与期間は10日間である.
溶連菌, 肺炎球菌による軽症から中等症の下気道感染症	
肺炎マイコプラズマによる呼吸器感染症	
溶連菌, 黄色ブドウ球菌による軽症から中等症の皮膚及び皮膚組織炎	
百日咳	
ジフテリア症	
<i>Corynebacterium minutissimum</i> による紅色陰癬	
ペニシリンアレルギー患者のリウマチ熱の初発予防	
ペニシリンアレルギー患者の再発性リウマチ熱発症予防	
ペニシリンアレルギー患者の淋菌による急性骨盤炎	
レジオネラ症	最適な用量は未だ確立されていないが, 臨床試験の報告では1日の投与量が1~4gとなるよう分割投与されている. なお, 1日4gを超える用量では, 特に腎機能低下あるいは肝機能低下を起こしている高齢者においてエリスロマイシンによる難聴の副作用発生頻度が高くなるので注意すること.
ペニシリンアレルギー患者の細菌性心内膜炎の予防	1g(力価)を手術1時間前に投与, 500mg(力価)を手術6時間後に投与.

### 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

## ●エリスロシン点滴静注用 500mg 配合変化表

### 【試験方法】

- A. エリスロシン点滴静注用 500mg (ロット番号:816-3627) 1 バイアル(300mg)を注射用蒸留水 10mL に溶解したのち、生理食塩液 100mL を加えたものに混合する。注射剤の 1 回量(表示)を 200mL 共栓マイエル中で混合し、室温にて単味、混注直後、10 分、30 分、1 時間、6 時間、24 時間後の外観、pH を観察測定した。(1969 年実施)
- B. エリスロシン点滴静注用 500mg 1 バイアル 300mg を注射用蒸留水 6mL に溶解後、これを 3 等分して 100mg-2mL として混注用試験液とした。  
このエリスロシン注及び配合薬剤の外観、色相、澄明度及び pH を観察した。  
次にエリスロシン注 2mL に配合薬剤の各々 1 アンプルを混注後、外観(沈澱析出の有無及びその状態)及び pH の変化を観察した。  
(1965 年実施)
- C. エリスロシン点滴静注用 500mg (ロット番号:841-1802) 300mg 力価を注射用蒸留水 30mL に溶解したもの(エリスロシン 1%力価水溶液)を 50mL 共栓付き三角マイエルに入れ、これにアニトロン 0 注 1mL (オキシトシン 1 単位)を添加、軽く振とうし混合する。  
この混合液を経時的に混合直後、10 分、30 分、1 時間、2 時間、3 時間、24 時間後の外観、pH 値を観察した。  
pH の測定はベックマン G 型 pH メーター、外観観察は異物検査器を用いて行った。また実験は液温 23℃で行った。(1972 年実施)
- D. エリスロシン点滴静注用 500mg (ロット番号:61-035-AF) 500mg は注射用蒸留水 10mL で溶解し、各薬剤と 1:1 に配合した。  
配合後、各混合液を 4 本の共栓付試験管に分割し、pH 測定用(5℃用、RT 用)、外観観察用(5℃用、RT 用)とした。  
測定は、配合直後及び室温 1、3、5、24 時間目、5℃ 1、2 週目に行った。  
5℃保存の場合は、室温に 1~2 時間放置してから測定及び観察を行った。  
外観は異物検査器を用い、澄明度、不溶性異物について観察を行った。(1977 年実施)
- E. エリスロシン点滴静注用 500mg (ロット番号:770-3542) 1 バイアル 300mg を 6mL の注射用蒸留水に溶解し、その 2mL (100mg) を 1 注射量とし、他社注射剤 1 アンプルと混合した。注射筒を用い、薬液を 25mL 共栓付き試験管に注入する。  
混合後試験管の上部を持って軽く振り混ぜる。  
混合中、直後、混合後 5 分、10 分、30 分、1 時間、24 時間の外観変化を観察した。  
pH 測定はベックマン G 型 pH メーターを用いて混合前並びに混合約 1 時間後の pH を測定した。  
実験は室温 19~23℃で行った。  
(1965 年実施)
- F. エリスロシン点滴静注用 500mg (ロット番号:819-1362) 300mg を注射用蒸留水 6mL に溶解する。  
他剤注射剤は容器(アンプル、バイアル)ごとに外観の状況を参考程度に記入しておく。

他剤注射剤を共栓マイエル(100mL)に移し、エリスロシン 6mL を徐々に注加し、混注直後、10分、30分、1時間、2時間及び24時間後の外観、pHを観察測定した。

なお、混注2時間後は点滴注射を考慮して行い、24時間後は参考程度で判定範囲に入れない。(1969年実施)

#### G. 1. 配合試験液の調整法

(1)対輸液:エリスロシン点滴静注用 500mg 1g 力価を水 20mL に溶解後、輸液 500mL (1V) に混合する。(エリスロマイシン 2mg 力価/mL)

(2)対輸液+薬剤:(1)の混合液 100mL に薬剤 1 用量(1A または 1V)を混合する。なお、粉末注射剤は指定の溶剤に溶解後、用いた。

#### 2. 配合試験液の外観及び pH

(1)外観 上記方法で作成した配合試験液について、直後、1、3、5、24 時間後に沈澱析出、濁りの発生及び色相の変化を観察した。

なお、観察は輸液瓶を想定し、三角マイエル 100mL を用いて、1000 ルックスの光源のもとで白色及び黒色板を背景として肉眼で観察した。

(2)pH 変動 配合試験液について、直後、5、24 時間後にベックマン G 型 pH メーターを用いて測定した。

#### 3. 配合試験液中のエリスロマイシン力価の測定

薄層クロマトグラフィーにより分離後、分解物の Anhydroerythromycin を比色定量で比較測定することにより、配合試験液中の残余力価を測定する方法を用いて定量法とした。配合試験液について、5、24 時間後に測定した。(1975年実施)

H. エリスロシン点滴静注用 500mg (ロット番号:69-893-27) 500mg を注射用水 10mL で溶解し、配合注射剤の容器中に加えて混合し、配合液とした。ただし配合注射液がアンプルの場合は、その内容を共栓ガラス試験管にとり、これにエリスロシン点滴静注用 500mg 溶解液を混合した。

保存方法:温度 18~25℃、室温散光下(保存 6 時間以後の夜間は消灯)で保存した。

測定時間:配合直後、1、3、6 及び 24 時間後の 5 時点

測定項目及び測定方法:配合液について次の測定を行った。

(1)外観 肉眼で色、澄明性、沈澱の有無を観察した。

(2)pH pH メーターで測定した。

(3)含量 エリスロマイシン力価を測定した。(1994年実施)

I. エリスロシン点滴静注用 500mg (ロット番号:03-972-AN) 300mg 力価対応量(1V)を注射用蒸留水 80mL で溶解し、これにオルガドロン注 1mL を加える。この試料溶液を室温に保ち、配合直後、1、3、6、24、48 時間後の外観変化、pH 及びエリスロマイシン力価を観察した。(1980年実施)

J. エリスロシン点滴静注用 500mg (300mg 力価)を注射用蒸留水 6mL で溶解する。共栓試験管 2 本を用い、4mL (200mg 力価)と 2mL (100mg 力価)入れる。キシロカイン注をこの 2 本に 2mL ずつ混合する。混注後軽く振り混ぜて、混合直後、5分、10分、30分、1時間、24時間後の外

観変化を観察した。

pH の測定はベックマン G 型 pH メーターを用いて混合後約 1 時間及び 24 時間後の pH を測定した。

なお、実験は室温 22～25℃で行った。(1966 年実施)

#### K. 1. 配合方法

共栓付 50mL 三角マイエル 3 個に各々エリスロシン点滴静注用 500mg (ロット番号:794-3555) 1%溶液を調整し(各 300mg を注射用蒸留水 30mL にて溶解)、これに 10%トランサミン S 注 2.5mL、5.0mL、10.0mL を注射筒で混入した。

また 500mL 三角マイエルにラクテック G 注 200mL、500mL を入れ、これに各々エリスロシン点滴静注用 500mg 1%溶液(各 300mg を注射用蒸留水 30mL にて溶解)を注射筒で混入した。

#### 2. 観察方法

前期配合方法により混合したものを、混合直後、5分、10分、30分、1、2、3、4、24時間後と経時的に外観変化(濁り、沈澱析出、変色)の観察と、ベックマン G 型 pH メーターを用いて pH(直後、30分、1、3、24時間後)を測定した。

実験はすべて室温 24～26℃で行った。(1970 年実施)

L. エリスロシン点滴静注用 500mg (ロット番号:61-035-AF) 500mg 1 バイアルを注射用蒸留水 10mL で溶解、リラシリンは同 5mL で溶解、ケフリンは同 5mL で溶解し、配合に用いた。表の配合比の割合で共栓付三角マイヤー中で配合し、外観観察用とするとともに、この各混合液の一部を共栓付試験管にとり、pH 測定用とした。

測定は配合直後及び室温放置 1、3、5、24 時間目に行った。

外観は異物検査機を用い、澄明度、不溶性異物について観察を行った。(1977 年実施)

【エリスロシン点滴静注用 500mg 2 剤試験結果】

注射用エリスロシンの含量/液量	配合注射剤商品名 (試験当時メーカー名、ロット番号) [現メーカー名]	含量/液量	試験方法	測定項目	配合前	配合直後	5分	10分	30分	1時間	2時間	3時間	5時間	6時間	24時間	1週間	2週間	備考
100mg/2mL	アドナ注静注用50mg (田辺) [田辺三菱]	0.5% 2mL 1管	B	外観変化	橙色,ほとんど透明	—	+											1分後濁り, 3分後沈殿
				pH	5.69	6.39												
300mg/30mL	アトニン-0注1 単位 (帝国臓器-武田= 住友製薬, eH27C6) [あすか]	1単位 1mL	C	外観変化	無色 澄明	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	
				pH	2.83	6.47		6.45	6.41	6.34	6.26	6.1			6.01			
300mg/110mL	アリナミンF10注 (武田, ONREXF1) [武田]	10mg, 2mL	A	外観変化	無色	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	
				pH	3.56	4.83		4.83	4.83	4.83				4.86	4.79			
500mg/10mL	アリナミン注射液10mg (武田, S015) (室温保存) [武田]	10mg 2mL 1管	D	外観変化	澄明,不溶性異物なし	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	含量低下
				pH	3.62	5.35				5.43		5.39	5.02		5.35			
				残存力価(%)		100							85		50			
500mg/10mL	アリナミン注射液10mg (武田, S015) (5℃保存) [武田]	10mg 2mL 1管	D	外観変化	澄明,不溶性異物なし	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	含量低下
				pH	3.62	5.35										5.28	5.27	
				残存力価(%)		100										50		
300mg/6mL	EL-3号輸液 (HMR, MN857T) [エイワイファーマ/陽進堂]	100mL	F	外観変化	無色 澄明	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	
				pH	5.68	5.32		5.38	5.38	5.41	5.38				5.41			
100mg/2mL	注射用エンドキサン100mg (塩野義) [塩野義]	100mg/ 5mL 1瓶	B	外観変化	無色,ほとんど透明	—	—	—	—	+	—	—	—	—	—	—	—	20分後濁り
				pH	5.35	7.1												
1g/20mL	大塚糖液5% (大塚製薬工場) [大塚製薬工場]	500mL	G	外観変化	無色	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	
				pH	6.12								6.17		6.22			
				残存力価(%)	100								95以上		90			
500mg/10mL	大塚生食注 (大塚製薬工場, 3H96P) [大塚製薬工場]	100mL 1瓶	H	外観変化	無色 澄明	無色 澄明	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	含量低下
				pH	7.51	6.97			6.78	6.77	6.76	6.81						
				含量		100			96.4	92.1	85.1	83.2						
300mg/80mL	オルガドロン注射液3.8mg (三共, 2T41) [MSD]	3.8mg/ mL 1管	I	外観変化	無色 透明	無色 透明	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	—	48時間後, —
				pH	7.0~ 8.5	7.4			7.43	7.36	7.33	7.32						48時間後, 7.28
				力価		103.7								103.7	105			48時間後, 104.8
100mg/2mL	キシロカイン注射液2% (藤沢, 606KASOT) [アストラゼネカ]	10mg/ 2mL	J	外観変化		僅かに濁り	—	—	—	—	—	—	—	—	+	—	—	約20分後濁り 消失, 24時間後再び濁り
				pH					6.88					6.87				
200mg/4mL	キシロカイン注射液2% (藤沢, 606KASOT) [アストラゼネカ]	10mg/ 2mL	J	外観変化		僅かに濁り	—	—	—	—	—	—	—	—	+	—	—	約20分後濁り 消失, 24時間後再び濁り
				pH					6.94					6.93				

注射用エリスロシンの含量/液量	配合注射剤商品名 (試験当時メーカー名、ロット番号) [現メーカー名]	含量/液量	試験方法	測定項目	配合前	配合直後	5分	10分	30分	1時間	2時間	3時間	5時間	6時間	24時間	1週間	2週間	備考	
500mg/10mL	ケイツーN静注用10mg (エーザイ, A23GA) (室温保存) [エーザイ]	10mg 1管	D	外観変化	黄色僅濁, 不溶性異物なし	—				—		—	—		—				
				pH	5.21	7.07				6.99		6.94	6.8		6.85				
				残存力価(%)		100										95以上			
500mg/10mL	ケイツーN静注用10mg (エーザイ, A23GA) (5℃保存) [エーザイ]	10mg 1管	D	外観変化	黄色僅濁, 不溶性異物なし	—										—	—		
				pH	5.21	7.07									6.89	6.77			
				残存力価(%)		100											95以上		
100mg/2mL	ジゴシン注0.25mg/ (中外, 227E3) [中外]	0.25mg/ 1mL 1管	E	外観変化		—	—	—	—	—					—				
				pH	6.48					7.2									
300mg/6mL	ソリターT4号輸液 (味の素, 71411SB) [エイワイファーマ/陽進堂]	100mL	F	外観変化	無色 澄明	—	—	—	—	—	—				—				
				pH	5.12	5.39	5.47	5.47	5.51	5.51				5.37					
1g/20mL	ソリターT2号輸液 (味の素) [エイワイファーマ/陽進堂]	500mL	G	外観変化	無色					—		—	—		—				
				pH	5.19								5.21		5.2				
				残存力価(%)	100									85		50		含量低下	
1g/20mL	ソリターT3号輸液 (味の素) [エイワイファーマ/陽進堂]	500mL	G	外観変化	無色					—		—	—		—				
				pH	5.28									5.31		5.29			
				残存力価(%)	100										85		50		含量低下
300mg/110mL	タチオン注射用200mg (アステラス) (室温保存) [長生堂/日本ジェネリック]	200mg 3mL	A	外観変化	無色	—	—	—	—	—				—	—				
				pH	6.08	6.08	6.09	6.1	6.1					6.1	6.01				
500mg/10mL	タチオン注射用100mg (アステラス, KAK1) (室温保存) [長生堂/日本ジェネリック]	100mg/ 2mL	D	外観変化	透明, 不溶性異物なし	—				—		—	—		—				
				pH	5.79	6.98				6.92		6.77	6.78		6.74				
				残存力価(%)		100										95以上			
500mg/10mL	タチオン注射用100mg (アステラス, KAK1) (5℃保存) [長生堂/日本ジェネリック]	100mg/ 2mL	D	外観変化	透明, 不溶性異物なし	—										—	—		
				pH	5.79	6.98										6.74	6.74		
				残存力価(%)		100												95以上	
300mg/30mL	トランサミン注10% (第一, 125YAT) [第一三共]	10% 2.5mL	K	外観変化	無色 澄明	—	—	—	—	—	—	—			—				
				pH	7.22	7.1			7.05	7.08		7.06		7.1					
		10% 5mL	K	外観変化	無色 澄明	—	—	—	—	—	—	—				—			
				pH	7.22	7.2			7.18	7.18		7.18		7.18					
		10% 10mL	K	外観変化	無色 澄明	—	—	—	—	—	—	—				—			
				pH	7.22	7.15			7.12	7.14		7.1		7.1					



注射用エリスロシンの含量/液量	配合注射剤商品名 (試験当時メーカー名、ロット番号) [現メーカー名]	含量/液量	試験方法	測定項目	配合前	配合直後	5分	10分	30分	1時間	2時間	3時間	5時間	6時間	24時間	1週間	2週間	備考	
300mg/110mL	パントシン注10% (第一, 003Y11D) [第一三共エスファ]	200mg/2mL	A	外観変化	無色	—	—	—	—					—	—				
				pH	4.97	4.99	4.99	5.02	5.02				5.02	4.96					
300mg/110mL	ビタミン注射液 100mg (武田, SLNHTB3) [武田]	200mg/2mL	A	外観変化	無色	—	—	—	—					—	—				
				pH	7.03	6.74	6.79	6.82	6.89				6.74	6.43					
100mg/2mL	ビタミン B1 剤	20mg/2mL	B	外観変化	無色, ほとんど澄明	—	±	+		++								5分後変化がみ, 10分後濁りがあり, 1時間後沈殿を生じた	
				pH	3.22	4.56													
100mg/2mL	ビタミン B2 剤	2mg/1mL	B	外観変化	橙色, ほとんど澄明	+												配合直後沈殿	
				pH	5.65	5.5													
300mg/110mL	ピドキサール注10mg (中外, 426J7) [中外]	20mg/2mL	A	外観変化	淡黄色	±		±	±	—				—	—			±淡黄緑色, 30分後淡緑色	
				pH	6.7	6.47	6.49	6.46	6.46				6.2	6.08					
100mg/2mL	ピドキサール注30mg (中外, 419J3) [中外]	30mg/1mL	E	外観変化	淡黄色	+	+	+	+	+					+			配合直後より粥状沈殿	
				pH	6.6														
300mg/110mL	フラビタン注5mg (トーアエイヨー-アステラス, N410172) [トーアエイヨー-アステラス]	10mg/2mL	A	外観変化	橙色(蛍光)	黄色		—	—	—				—	—			—黄色	
				pH	5.74	6.06	6.17	6.18	6.17				6.18	6.11					
300mg/6mL	20%フルクトン注 (大塚製薬工場, 8180S) [大塚製薬工場]	20% 100mL	F	外観変化	無色 澄明	—		—	—	—	—				—				
				pH	3.76	4.53	4.57	4.57	4.61	4.59				4.54					
500mg/10mL	マルトス輸液 10% (大塚製薬工場, 6H00) (室温保存) [大塚製薬工場]	10% 500mL 1袋	D	外観変化	澄明, 不溶性異物なし	—				—		—	—		—				
				pH	4.37	5.35				5.43		5.39	5.02		5.5				
				残存力価(%)		100								85		50			
500mg/10mL	マルトス輸液 10% (大塚製薬工場, 6H00) (5℃保存) [大塚製薬工場]	10% 500mL 1袋	D	外観変化	澄明, 不溶性異物なし	—										—	—		
				pH	4.37	5.35									5.29	5.38			
				残存力価(%)		100											50		

【エリスロシン点滴静注用 500mg2, 3 剤試験結果】

大塚糖液 5%との混合剤に 1 剤を配合

注射用エリスロシンの 含量/液量	配合注射剤商品名 (メーカー名)	含量/ 液量	試験 方法	測定項目	配合前	配合直後	1 時間	3 時間	5 時間	24 時間	備考
1g/ 20mL	大塚糖液 5% (大塚製薬工場)	500mL	G	外観変化	無色		—	—	—	—	
				pH	6.12				6.17	6.22	
				残存力価 (%)	100					90	

	配合注射剤商品名 (メーカー名)	含量/ 液量	試験 方法	測定項目	配合前	配合直後	1 時間	3 時間	5 時間	24 時間	備考
上記混合液 100mL	アドナ注(静脈用)50mg (田辺三菱/田辺)	0.5% 10mL	G	外観変化		橙色—	—	—	—	—	含量低下
				pH		6			5.97	5.95	
				残存力価 (%)						85	
上記混合液 100mL	アリナミン F25 注 (武田)	25mg 10mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下
				pH		4.98			4.99	5.05	
				残存力価 (%)					80	35	
上記混合液 100mL	水溶性プレドニン 20m (塩野義)	20mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	
				pH		6.83			6.72	6.72	
				残存力価 (%)				100			
上記混合液 100mL	タチオン注射用 200mg (長生堂/日本ジェネ リック)	200mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	
				pH		6.19			6.05	6.09	
				残存力価 (%)						95 以上	
上記混合液 100mL	トランサミン注 5% (第一三共)	5% 5mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	
				pH		6.84			6.82	6.82	
				残存力価 (%)						95 以上	
上記混合液 100mL	ニコリン注射液 100mg (武田)	5% 2mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	
				pH		6.53			6.49	6.45	
				残存力価 (%)						95	
上記混合液 100mL	ネオフィリン注 250mg (エーザイ)	2.5% 10mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	
				pH		8.71			8.68	8.65	
				残存力価 (%)						100	
上記混合液 100mL	パントシン注 10% (第一三共エスファ)	100mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下
				pH		5.51			5.15	5.14	
				残存力価 (%)					85	50	
上記混合液 100mL	ビタシミン注射液 100mg (武田)	100mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	
				pH		7.18			6.92	6.7	
				残存力価 (%)						95 以上	
上記混合液 100mL	ビタメジン静注用 (第一三共)	1 瓶	G	外観変化		淡赤色—	—	—	—	—	含量低下
				pH		4.78			4.75	4.78	
				残存力価 (%)					60	15	
上記混合液 100mL	ラシックス注 20mg (サノフィ/日医工)	20mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	
				pH		6.68			6.73	6.51	
				残存力価 (%)						95	
上記混合液 100mL	注射用ルシドロール 250mg (共和薬品)	250mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下
				pH		5.02			4.48	4.06	
				残存力価 (%)					50		

ソリタ-T2 号輸液との混合剤に 1 剤を配合

注射用エリスロシンの 含量/液量	配合注射剤商品名 (メーカー名)	含量/ 液量	試験 方法	測定項目	配合前	配合直後	1 時間	3 時間	5 時間	24 時間	備考
1g/ 20mL	ソリタ-T2 号輸液 (500mL) (エイワイファーマ/ 陽進堂)	500mL	G	外観変化	無色		—	—	—	—	含量低下
				pH	5.19				5.21	5.2	
				残存力価 (%)	100				85	50	

	配合注射剤商品名 (メーカー名)	含量/ 液量	試験 方法	測定項目	配合前	配合直後	1 時間	3 時間	5 時間	24 時間	備考	
上記混合液 100mL	アドナ注(静脈用)50mg (田辺三菱/田辺)	0.5% 10mL	G	外観変化		橙黄色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.22				5.22		5.22
				残存力価 (%)						85		50
上記混合液 100mL	アリナミン F25 注 (武田)	25mg 10mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.14				5.12		5.12
				残存力価 (%)						85		40
上記混合液 100mL	水溶性プレドニン 20mg (塩野義)	20mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.32				5.28		5.3
				残存力価 (%)						90		60
上記混合液 100mL	タチオン注射用200mg (長生堂/日本ジェネ リック)	200mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.27				5.23		5.26
				残存力価 (%)						85		50
上記混合液 100mL	トランサミン注 5% (第一三共)	5% 5mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.63				5.62		5.62
				残存力価 (%)						90~95		70
上記混合液 100mL	ニコリン注射液100mg (武田)	5% 2mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.3				5.29		5.28
				残存力価 (%)						90		60
上記混合液 100mL	ネオフィリン注250mg (エーザイ)	2.5% 10mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		7.62				7.38		7.32
				残存力価 (%)						—		100
上記混合液 100mL	パントシン注 10% (第一三共エスファ)	100mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.13				5.12		5.12
				残存力価 (%)						85		40
上記混合液 100mL	ピタシミン注射液100mg (武田)	100mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.37				5.42		5.45
				残存力価 (%)						90		60
上記混合液 100mL	ビタメジン静注用 (第一三共)	1 瓶	G	外観変化		淡赤色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		4.98				4.97		4.98
				残存力価 (%)						85		40
上記混合液 100mL	ラシックス注 20mg (サノフィ/日医工)	20mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.22				5.2		5.21
				残存力価 (%)						85		50
上記混合液 100mL	注射用ルシドロール 250mg (共和薬品)	250mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.16				4.98		4.72
				残存力価 (%)						80		40

ソリタ-T3 号輸液との混合剤に 1 剤を配合

注射用エリスロシンの 含量/液量	配合注射剤商品名 (メーカー名)	含量/ 液量	試験 方法	測定項目	配合前	配合直後	1 時間	3 時間	5 時間	24 時間	備考
1g/ 20mL	ソリタ-T3 号輸液 (500mL) (エイワイファーマ/ 陽進堂)	500mL	G	外観変化	無色		—	—	—	—	含量低下
				pH	5.28				5.31	5.29	
				残存力価 (%)	100				85	50	

	配合注射剤商品名 (メーカー名)	含量/ 液量	試験 方法	測定項目	配合前	配合直後	1 時間	3 時間	5 時間	24 時間	備考	
上記混合液 100mL	アドナ注(静脈用)50mg (田辺三菱/田辺)	0.5% 10mL	G	外観変化		橙黄色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.32				5.37		5.32
				残存力価 (%)						85		50
上記混合液 100mL	アリナミン F25 注 (武田)	25mg 10mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.12				5.17		5.19
				残存力価 (%)						80		50
上記混合液 100mL	水溶性プレドニン 20mg (塩野義)	20mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.5				5.53		5.58
				残存力価 (%)						90		70 以上
上記混合液 100mL	タチオン注射用 200mg (長生堂/日本ジェネ リック)	200mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.35				5.38		5.39
				残存力価 (%)						80		60
上記混合液 100mL	トランサミン注 5% (第一三共)	5% 5mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.92				5.99		5.92
				残存力価 (%)						95		80
上記混合液 100mL	ニコリン注射液 100mg (武田)	5% 2mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.47				5.47		5.42
				残存力価 (%)						90		60
上記混合液 100mL	ネオフィリン注 250mg (エーザイ)	2.5% 10mL 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		8.6				8.6		8.57
				残存力価 (%)								95 以上
上記混合液 100mL	パントシン注 10% (第一三共エスファ)	100mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.16				5.18		5.21
				残存力価 (%)						80		50
上記混合液 100mL	ピタシミン注射液 100mg (武田)	100mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.59				5.89		5.92
				残存力価 (%)						95		75
上記混合液 100mL	ビタメジン静注用 (第一三共)	1 瓶	G	外観変化		淡赤色—	—	—	±	+	含量低下	
				pH		4.82				4.89		4.92
				残存力価 (%)						75		40
上記混合液 100mL	ラシックス注 20mg (サノフィ/日医工)	20mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.3				5.33		5.3
				残存力価 (%)						85		50 以上
上記混合液 100mL	注射用ルシドロール 250mg (共和薬品)	250mg 1 管	G	外観変化		無色—	—	—	—	—	含量低下	
				pH		5.14				4.88		4.57
				残存力価 (%)						70		30