

貯法：室温保存
有効期間：ドライシロップ10%：4年8ヵ月
ドライシロップW20%：3年
W顆粒20%：3年6ヵ月処方箋医薬品^注)

マクロライド系抗生物質製剤

エリスロマイシンエチルコハク酸エステルドライシロップ

エリスロシンドライシロップ[®]10%**エリスロシンドライシロップ[®]W20%****Erythrocin[®] Dry Syrup 10%・W20%**

エリスロマイシンエチルコハク酸エステル顆粒

エリスロシン[®]W顆粒20%**Erythrocin[®] W Granules 20%**処方箋医薬品^注)

注) 注意 - 医師等の処方箋により使用すること

	ドライシロップ10%	ドライシロップW20%	W顆粒20%
承認番号	21600AMZ00139	21600AMZ00140	21500AMZ00089
販売開始	1966年10月	1981年10月	1981年9月

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.2 エルゴタミン酒石酸塩・無水カフェイン・イソプロピルアンチピリン、ジヒドロエルゴタミンメシル酸塩、ピモジド、アスナプレビルを投与中の患者 [10.1参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	エリスロシン ドライシロップ10%	エリスロシン ドライシロップW20%	エリスロシンW顆粒20%
有効成分	1g中 日局 エリスロマイシンエチルコハク酸エステル 100mg（力価）	1g中 日局 エリスロマイシンエチルコハク酸エステル 200mg（力価）	1g中 日局 エリスロマイシンエチルコハク酸エステル 200mg（力価）
添加剤	クエン酸ナトリウム水和物、白糖、カルメロースナトリウム、ショ糖脂肪酸エステル、軽質無水ケイ酸、香料	クエン酸ナトリウム水和物、D-マンニトール、ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、香料	クエン酸ナトリウム水和物、D-マンニトール、ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、香料

3.2 製剤の性状

販売名	エリスロシン ドライシロップ10%	エリスロシン ドライシロップW20%	エリスロシンW顆粒20%
色調等	白色の顆粒	白色の顆粒	白色の顆粒

4. 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、淋菌、髄膜炎菌、ジフテリア菌、百日咳菌、梅毒トレポネマ、トラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス）、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、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、膿胸、慢性呼吸器病変の二次感染、腎盂腎炎、尿道炎、淋菌感染症、梅毒、子宮内感染、中耳炎、猩紅熱、ジフテリア、百日咳

*5. 効能又は効果に関連する注意

<咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、中耳炎>

「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。

6. 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800～1200mg（力価）を4～6回に分経口投与する。

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。

8. 重要な基本的注意

- 8.1 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。
- 8.2 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こと。[11.1.5参照]

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 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。[11.1.2参照]

9.3 肝機能障害患者

血中濃度が上昇するおそれがある。

9.5 妊婦

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る場合にのみ投与すること。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。ヒト母乳中へ移行することが報告されている²⁾。

9.7 小児等

嘔吐等の症状に注意すること。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³⁾。

9.8 高齢者

用量に留意するなど慎重に投与すること。一般に生理機能が低下していることが多い。

10. 相互作用

本剤はCYP3Aで代謝される。また、本剤はCYP3A、P-糖蛋白質を阻害する。[16.4参照]

10.1 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
エルゴタミン酒石酸塩・無水カフェイン・イソプロピルアンチピリン（クリアミン） ジヒドロエルゴタミンメシル酸塩（ジヒデルゴット） [2.2参照]	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し、血中濃度が上昇することがある。
ピモジド（オーラップ） [2.2参照]	QT延長、心室性不整脈（Torsades de pointesを含む）等が発現するおそれがある。	
アスナプレビル（スンペラ） [2.2参照]	肝臓に関連した副作用が発現、重症化するおそれがある。	

10.2 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
ジシプラミド キニジン硫酸塩水和物	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し、血中濃度が上昇することがある。
テオフィリン ^{4,5)} アミノフィリン水和物	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	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	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	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。	
ピンラスチン硫酸塩	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	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。	
フェゾジピン	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 ⁶⁾ トリアゾラム ⁷⁾	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	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。	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。
コルヒチン	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 ⁸⁾ アトルバスタチンカルシウム水和物 ⁹⁾	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上昇、血中及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水和物		
プロモクリブチンメシル酸塩 ¹⁰⁾ ドセタキセル水和物 バクリタキセル セレギリン塩酸塩 シルデナフィルクエン酸塩 ¹¹⁾ バルデナフィル塩酸塩水和物 タグラフィル シロスタゾール	減量するなど慎重に投与すること。	
プロナンセリン エブレノン エレクトリプタン臭化水素酸塩 エベロリムス サキナビルメシル酸塩	これらの薬剤の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 ¹²⁾ 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。	
エバスタチン ¹³⁾	エバスタチンの代謝物カレバスタ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	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-糖蛋白質を阻害し、エドキサバンの血中濃度を上昇させ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。
ザフィルクアスト	ザフィルクア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	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、血中濃度が上昇すると考えられる。
リトナビル	本剤のAUCが上昇することが予想される。	

11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

11.1 重大な副作用

11.1.1 偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎（頻度不明）

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。

11.1.2 心室頻拍（Torsades de pointesを含む）、QT延長（頻度不明）

[9.1.1参照]

11.1.3 ショック、アナフィラキシー（0.03%）

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。

11.1.4 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）

11.1.5 急性腎障害（急性間質性腎炎）（頻度不明）

[8.2参照]

11.1.6 肝機能障害、黄疸（頻度不明）

AST、ALT、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。

11.2 その他の副作用

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

13. 過量投与

13.1 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膀胱炎があらわれたとの報告がある。

13.2 処置

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。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

〈エリスロシンドライシロップ10%〉

14.1.1 本剤10gに20mLの水を加え、よくふりまぜると25mLの懸濁液になる。この懸濁液1mLはエリスロマイシン40mg（力価）に相当する。

〈エリスロシンドライシロップW20%〉

14.1.2 本剤10gに12mLの水を加え、よくふりまぜると20mLの懸濁液になる。この懸濁液1mLはエリスロマイシン100mg（力価）に相当する。

14.2 薬剤交付時の注意

〈ドライシロップ共通〉

14.2.1 懸濁液調製後は冷蔵庫内に保存するよう指導すること。

14.2.2 調製後の懸濁液は用時、よくふりまぜて服用するよう指導すること。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

外国で重症筋無力症が悪化したとの報告がある。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

〈エリスロシンドライシロップ10%〉

健康成人にエリスロシンドライシロップ10% 4g（エリスロマイシンとして400mg（力価））を空腹時単回経口投与した時の血漿中濃度は以下のとおりであった。

C _{max} (μg/mL)	T _{max} (min)	T _{1/2} (hr)
1.37	31	1.2

〈エリスロシンドライシロップW20%〉

健康成人にエリスロシンドライシロップW20% 2g（エリスロマイシンとして400mg（力価））を空腹時単回経口投与した時の血漿中濃度は以下のとおりであった。

C _{max} (μg/mL)	T _{max} (min)	T _{1/2} (hr)
1.27	42	1.6

〈エリスロシンW顆粒20%〉

健康成人にエリスロシンW顆粒20% 2g（エリスロマイシンとして400mg（力価））を空腹時単回経口投与した時の血漿中濃度は以下のとおりであった。

C _{max} (μg/mL)	T _{max} (min)	T _{1/2} (hr)
1.12	27	1.3

16.3 分布

16.3.1 組織移行

扁桃¹⁴⁾、副鼻腔粘膜¹⁴⁾、中耳滲出液¹⁵⁾、唾液¹⁶⁾に移行が認められた（外国人データ）。

16.3.2 血漿蛋白結合率

64.5%であった（*in vitro*、ヒト血漿、0.5μg/mL、平衡透析法¹⁷⁾）。

16.4 代謝

CYP3Aによって脱メチル化され、des-N-methyl-erythromycinを生じる（ウサギ¹⁸⁻²⁰⁾。[10.参照]

16.5 排泄

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²¹⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

細菌の蛋白合成阻害で²²⁾、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²³⁾。

18.2 抗菌作用

18.2.1 エリスロマイシンエチルコハク酸エステルは体内で加水分解し、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^{21,24)}。

18.2.2 抗菌作用は細菌により静菌的ないし殺菌的である²⁵⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：エリスロマイシンエチルコハク酸エステル
(Erythromycin Ethylsuccinate)

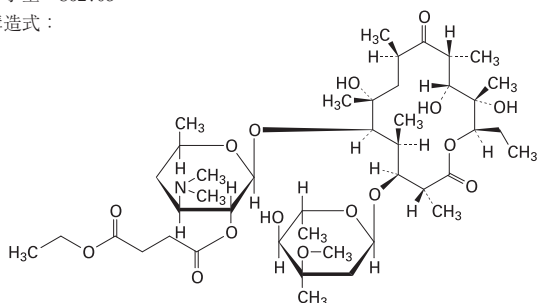
略号：EM（エリスロマイシン）

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-2-O*-(3-ethoxycarbonylpropanoyl)-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

分子式：C₄₈H₇₅NO₁₆

分子量：862.05

構造式：



性状：白色の粉末である。

メタノール又はアセトンに溶けやすく、エタノール（95）にやや溶けやすく、水にほとんど溶けない。

20. 取扱い上の注意

アルミピロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

22. 包装

〈エリスロシンドライシロップ10%〉

100g [瓶]
500g [瓶、乾燥剤入り]
500包 [1g×500、乾燥剤入り]

〈エリスロシンドライシロップW20%〉

100g [瓶、乾燥剤入り]
500g [瓶、乾燥剤入り]
500包 [1g×500、乾燥剤入り]

〈エリスロシンW顆粒20%〉

500包 [1g×500、乾燥剤入り]

23. 主要文献

- 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
- 森操七郎：日本産科婦人科学会雑誌。1971；23（7）：547-555
- Honein MA, et al. : Lancet. 1999; 354 : 2101-2105
- Reisz G, et al. : Am Rev Respir Dis. 1983; 127 : 581-584
- 前田昇三：Chemotherapy. 1993; 41（7）：765-769
- Olkkola KT, et al. : Clin Pharmacol Ther. 1993; 53（3）：298-305
- Phillips JP, et al. : J Clin Psychopharmacol. 1986; 6（5）：297-299
- Kantola T, et al. : Clin Pharmacol Ther. 1998; 64（2）：177-182
- Siedlik PH, et al. : J Clin Pharmacol. 1999; 39 : 501-504
- Nelson MV, et al. : Clin Pharmacol Ther. 1990; 47（6）：694-697
- Zusman RM, et al. : Am J Cardiol. 1999; 83（5A）：35C-44C
- Laforce CF, et al. : J Allergy Clin Immunol. 1983; 72（1）：34-39
- 長澤紘一ほか：臨床医薬。1995; 11（6）：1213-1226
- Blenk H, et al. : Infection. 1982; 10（suppl. 2）：108-112
- Sundberg L, et al. : Acta Otolaryngol. 1979; suppl. 365 : 1-17
- Simon C & Clasen I. : Curr Med Res Opin. 1978; 5（suppl. 2）：19-22
- Prandota J, et al. : J Int Med Res. 1980; 8（suppl. 2）：1-8
- Mao JCH, et al. : Biochem Pharmacol. 1965; 14 : 1049-1058
- Watkins PB, et al. : Proc Natl Acad Sci USA. 1985; 82 : 6310-6314
- Brian WR, et al. : Biochemistry. 1990; 29（51）：11280-11292
- GOODMAN and GILMAN's The Pharmacological Basis of Therapeutics 8th ed. Pergamon Press. 1990 : 1130-1134
- Brock TD, et al. : Biochim Biophys Acta. 1959; 33 : 274-275
- Mao JCH. : Biochem Pharmacol. 1967; 16 : 2441-2443
- 日本抗生物質医薬品基準解説。薬業時報社。1971 : 723-728
- McCall CE, et al. : Am J Med Sci. 1967; 254（2）：144-155

24. 文献請求先及び問い合わせ先

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

26. 製造販売業者等

26.1 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

