

貯法：室温保存
有効期間：3年日本標準商品分類番号
876132処方箋医薬品^(注)経口用セフェム系抗生物質製剤
日本薬局方 シロップ用セフポドキシム プロキセチル
セフポドキシムプロキセチルDS小児用5%「サワイ」
CEFPODOXIME PROXETIL DS for Pediatric [SAWAI]承認番号 22500AMX01897000
販売開始 2006年7月

注)注意-医師等の処方箋により使用すること

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

有効成分 [1g中]	日局セフポドキシム プロキセチル 50mg(力価)
添加剤	アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、カルメロースCa、カルメロースNa、クエン酸、L-グルタミン酸Na、軽質無水ケイ酸、三酸化鉄、タルク、白糖、ヒドロキシプロピルセルロース、香料

3.2 製剤の性状

剤形	ドライシロップ
性状	赤みのだいたい色～だいたい色の粉末を含む微細な粒子でわずかにオレンジ様の芳香がある。 水懸濁液(1→4)はpH4～6である。

4. 効能又は効果

〈適応菌種〉

セフポドキシム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、大腸菌、シトロバクター属、クレブシエラ属、エンテロバクター属、プロテウス属、プロビデンシア属、インフルエンザ菌

〈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、咽頭・喉頭炎、扁桃炎(扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む)、急性気管支炎、肺炎、膀胱炎、腎盂腎炎、中耳炎、副鼻腔炎、猩紅熱

5. 効能又は効果に関連する注意

〈咽頭・喉頭炎、扁桃炎(扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む)、急性気管支炎、中耳炎、副鼻腔炎〉

「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、幼小児に対しては、セフポドキシム プロキセチルとして1回3mg(力価)/kgを1日2～3回、用時懸濁して経口投与する。なお、年齢、体重、症状等に応じて適宜増減するが、重症又は効果不十分と思われる症例には、1回4.5mg(力価)/kgを1日3回経口投与する。

8. 重要な基本的注意

- 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。
- ショックがあらわれるおそれがあるので、十分な問診を行うこと。[11.1.1参照]
- 急性腎障害等の重篤な腎機能障害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うこと。[11.1.4参照]

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 セフェム系又はペニシリン系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者(ただし、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)

9.1.2 本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー症状を起こしやすい体質を有する患者

9.1.3 経口摂取の不良な患者又は非経口栄養の患者、全身状態の悪い患者

観察を十分に行うこと。ビタミンK欠乏症状があらわれることがある。

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 高度の腎機能障害のある患者

投与量・投与間隔の適切な調節をするなど慎重に投与すること。本剤は腎排泄型の抗生物質のため排泄遅延が起る。[16.6.1参照]

9.7 小児等

新生児、低出生体重児を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。生理機能が低下していることが多く副作用が発現しやすい。ビタミンK欠乏症状があらわれることがある。

10. 相互作用

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
アルミニウム又はマグネシウム含有の制酸剤	本剤の効果を減弱させることがあるので、同時に服用させないなど慎重に投与すること。	機序は不明であるが、本剤の吸収が阻害されるとの報告がある。

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 ショック(頻度不明)、アナフィラキシー(頻度不明)

ショック、アナフィラキシー(血圧低下、不快感、口内異常感、喘鳴、めまい、便秘、耳鳴、発汗、発疹等)を起こすことがある。[8.2参照]

11.1.2 中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis : TEN)(頻度不明)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)(頻度不明)

11.1.3 偽膜性大腸炎(頻度不明)

偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎(初期症状：腹痛、頻回の下痢)があらわれることがある。

11.1.4 急性腎障害(頻度不明)

急性腎障害等の重篤な腎機能障害があらわれることがある。[8.3参照]

11.1.5 間質性肺炎(頻度不明)、PIE症候群(頻度不明)

発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常、好酸球増多等を伴う間質性肺炎、PIE症候群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直ちに投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

11.1.6 肝機能障害(頻度不明)、黄疸(頻度不明)

AST、ALT、 γ -GTP上昇等の肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

11.1.7 汎血球減少症(頻度不明)、無顆粒球症(頻度不明)、溶血性貧血(頻度不明)、血小板減少(頻度不明)

11.1.8 痙攣(頻度不明)

11.2 その他の副作用

	1~5%未満	1%未満	頻度不明
過敏症		発疹	蕁麻疹、紅斑、そう痒、発熱、リンパ腺腫脹、関節痛
血液	好酸球増多、血小板増多		血小板減少、顆粒球減少
肝臓	AST上昇、ALT上昇		ALP上昇、肝機能障害、LDH上昇
腎臓			BUN上昇、血中クレアチニン上昇、血尿
消化器	下痢	軟便、嘔吐	悪心、腹痛、胃痛、食欲不振、胃部不快感、便秘
菌交代症		カンジダ症	口内炎
ビタミン欠乏症			ビタミンK欠乏症状(低プロトロンビン血症、出血傾向等)、ビタミンB群欠乏症状(舌炎、口内炎、食欲不振、神経炎等)
その他			めまい、頭痛、浮腫、しびれ感

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

12.1 テステープ反応を除くベネディクト試薬、フェーリング試薬による尿糖検査では偽陽性を呈することがあるので注意すること。

12.2 直接タームス試験陽性を呈することがあるので注意すること。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

懸濁液に調製後は冷所に保存し、2週間以内に使用すること。

14.2 薬剤投与時の注意

使用時十分に振り混ぜること。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

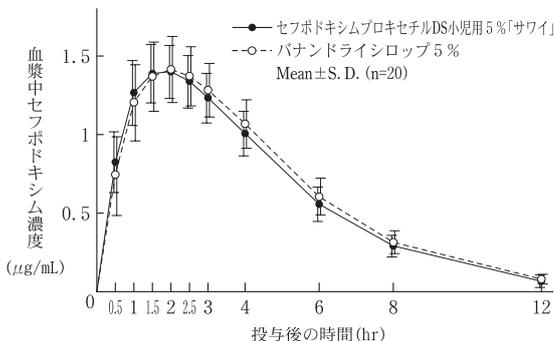
16.1.1 生物学的同源性試験

セフポドキシムプロキセチルDS小児用5%「サワイ」とバナンドライシロップ5%を健康成人男子にそれぞれ2g〔セフポドキシムプロキセチルとして100mg(力価)〕空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中セフポドキシム濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同源性が確認された²⁾。

各製剤2g投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-12hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)
セフポドキシムプロキセチルDS小児用5%「サワイ」	1.41 \pm 0.19	1.9 \pm 0.3	2.1 \pm 0.2	7.62 \pm 0.97
バナンドライシロップ5%	1.42 \pm 0.21	2.1 \pm 0.4	2.1 \pm 0.2	7.90 \pm 1.03

(Mean \pm S.D.)



血漿中濃度ならびに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。

16.3 分布

16.3.1 血清蛋白結合率

健康成人男性6名にセフポドキシムプロキセチル錠200mgを食後単回経口投与したとき、0.5~12時間後のセフポドキシムの血清蛋白結合率は、約30%であった³⁾。

16.4 代謝

セフポドキシムプロキセチルは腸管壁エステラーゼにより加水分解され、活性代謝物のセフポドキシムとして循環血に移行する³⁾。

16.5 排泄

セフポドキシムプロキセチルはセフポドキシムとして尿中に排泄される。ヒト小児における食後投与8時間までの尿中排泄率は約40%であった⁴⁾。

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

軽度腎機能障害患者(A群:7例)及び中等度腎機能障害患者(B群:2例)に、セフポドキシムプロキセチル錠200mgを食後30分に経口投与したとき、腎機能の低下に伴い、Cmaxの増加、Tmaxの延長、AUC₀₋₁₂の増加が認められた。

尿中濃度は、A群で4~6時間にピークを示し、12時間までの尿中回収率は33.8 \pm 3.8%であった。またB群で8~12時間にピークを示し、12時間までの尿中回収率は17.5%であり、腎機能の低下に伴い尿中への排泄遅延が認められた⁵⁾。[9.2.1参照]

	クレアチニン クリアランス (mL/min)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)	AUC ₀₋₁₂ ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)
A群 (n=7)	54 \pm 5	3.9 \pm 0.3	3.7 \pm 0.3	3.6 \pm 0.4	28.3 \pm 2.2
B群 (n=2)	36	4.8	7.0	3.4	34.0

(mean \pm SE)

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

細菌細胞壁の合成阻害による殺菌作用を示す。その作用点は菌種により異なるが、ペニシリン結合蛋白(PBP)の1、3に親和性が高い⁶⁾⁻⁸⁾。

18.2 抗菌作用

18.2.1 セフポドキシムプロキセチルは腸管壁で代謝され、セフポドキシムとなり抗菌力を示す³⁾。

18.2.2 セフポドキシムはグラム陽性菌・陰性菌に対し広い抗菌スペクトルを有し、特にグラム陽性菌ではブドウ球菌属、レンサ球菌属、グラム陰性菌では大腸菌、クレブシエラ属、プロテウス属、プロビデンシア属、インフルエンザ菌に対し優れた抗菌力を示した⁹⁾⁻¹⁵⁾ (*in vitro*)。

18.2.3 セフポドキシムは生体防御機構との協力的殺菌作用を示す^{7)、8)}。

18.2.4 セフポドキシムは各種細菌の産生する β -ラクタマーゼに安定で、 β -ラクタマーゼ産生株に対しても強い抗菌力を示した⁹⁾⁻¹⁵⁾ (*in vitro*)。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般名: セフポドキシムプロキセチル(Cefpodoxime Proxetil)

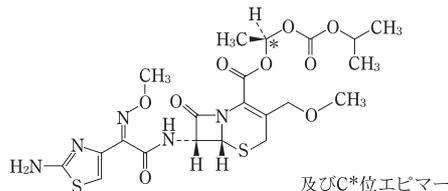
略号: CPDX-PR

化学名: (1*R*S)-1-[(1-Methylethoxy)carbonyloxy]ethyl(6*R*,7*R*)-7-[(*Z*)-2-(2-aminothiazol-4-yl)-2-(methoxyimino)acetylamino]-3-methoxymethyl-8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylate

分子式: C₂₁H₂₇N₅O₈S₂

分子量: 557.60

構造式:



性状: 白色~淡褐色の粉末である。アセトニトリル、メタノール又はクロロホルムに極めて溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けやすく、水に極めて溶けにくい。

20. 取扱い上の注意

プラスチックボトル開封後は湿気を避けて保存すること。

*22. 包装

バラ[乾燥剤入り]: 100g

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
- 前田彰他: 診療と新薬, 2006; 43(5): 504-514
- 小林真一他: 日本化学療法学会雑誌, 1988; 36(S-1): 200-214
- 岩井直一他: Jpn. J. Antibiot., 1989; 42(7): 1571-1592
- 植田省吾他: 日本化学療法学会雑誌, 1988; 36(S-1): 859-867
- 西野武志他: 日本化学療法学会雑誌, 1988; 36(S-1): 72-93
- 宇津井幸男他: 日本化学療法学会雑誌, 1988; 36(S-1): 146-158
- 横田健他: 日本化学療法学会雑誌, 1988; 36(S-1): 16-26
- 田島政三他: 日本化学療法学会雑誌, 1988; 36(S-1): 104-145
- 宇津井幸男他: 日本化学療法学会雑誌, 1988; 36(S-1): 1-15
- 五島瑤智子他: 日本化学療法学会雑誌, 1988; 36(S-1): 43-61
- 永山在明他: 日本化学療法学会雑誌, 1988; 36(S-1): 94-103
- 小栗豊子他: 日本化学療法学会雑誌, 1988; 36(S-1): 27-42

- 14) 安田紘他：日本化学療法学会雑誌, 1988；36(S-1)：159-172
15) 宇津井幸男他：日本化学療法学会雑誌, 1988；36(S-1)：173-184

***24. 文献請求先及び問い合わせ先**

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL：0120-381-999 FAX：06-7708-8966

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

沢井製薬株式会社
大阪市淀川区宮原5丁目2-30