

マクロライド系抗生物質製剤
エリスロマイシンステアリン酸塩錠

日本標準商品分類番号
8 7 6 1 4 1

エリスロシン[®]錠100mg
エリスロシン[®]錠200mg
Erythrocin[®] Tablets

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

	100mg	200mg
承認番号	21500AMZ00087	21500AMZ00088
販売開始	1955年9月	1960年3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、ロミタピドメシル酸塩、クリンダマイシン（注射剤、経口剤）、リンコマイシン塩酸塩水和物を投与中の患者 [10.1参照]

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	エリスロシン錠100mg	エリスロシン錠200mg
有効成分	1錠中 日局 エリスロマイシンステアリン酸塩 100mg（力価）	1錠中 日局 エリスロマイシンステアリン酸塩 200mg（力価）
添加剤	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	

3.2 製剤の性状

販売名	外形			識別コード	色調等
	上面	下面	側面		
エリスロシン錠100mg				M13	類白色フィルムコーティング錠
	直径 9.7mm	厚さ 4.6mm	重量 330mg		
エリスロシン錠200mg				M14	類白色フィルムコーティング錠
	直径 11.9mm	厚さ 5.9mm	重量 647mg		

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、軟性下疳菌、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、乳腺炎、骨髓炎、扁桃炎、肺炎、肺膿瘍、膿胸、腎盂腎炎、尿道炎、淋菌感染症、軟性下疳、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

5. 効能又は効果に関連する注意

〔扁桃炎、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（Torsade 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 [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 [2.2参照]	QT延長、心室性不整脈（Torsade de pointesを含む）等が発現するおそれがある。	
* ロミタピドメシル酸塩（ジャクスタピッド） [2.2参照]	ロミタピドメシル酸塩の血中濃度が著しく上昇するおそれがある。	
* クリンダマイシン（注射剤、経口剤）（ダラシンS注射液、ダラシンカプセル）リンコマイシン塩酸塩水和物（リンコシン） [2.2参照]	併用してもこれらの薬剤の効果があらわれないと考えられる。	本剤の細菌のリボゾーム50S Subunitへの親和性が高いため、これらの薬剤より高いと考えられる。

****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
ジソピラミド キニジン硫酸塩水和物	QT延長、心室性不整脈（Torsade 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	骨髓機能抑制、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。	
*ビンカルカロイド ビンプラスチン硫酸塩 ビノレルビン酒石酸塩等	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。	本剤がビ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。
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。	
フェロジピン	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。
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。	
ビタバスタチンカルシウム水和物	同上	
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 タダラフィル 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 クロザピン ゾピクロン アルプラゾラム エブレノン エレトリプタン臭化水素酸塩 エベロリムス	これらの薬剤の作用が増強するおそれがある。	本剤はこれらの薬剤の代謝を抑制することがある。
*ドンペリドン	ドンペリドンの血中濃度が上昇する。また、ドンペリドンとの併用により、QT延長が報告されている。	
副腎皮質ホルモン剤 メチルプレドニゾロン 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ため、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。	
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電子添文を参照すること。	

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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。
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。	
*クリンダマイシン（外用剤）	併用してもクリンダマイシンの効果があらわれないと考えられる。	本剤の細菌のリボゾーム50S Subunitへの親和性がクリンダマイシンより高いと考えられる。
*リバーロキサバン	リバーロキサバンの血中濃度が上昇したとの報告がある。	本剤がCYP3A4及びP-糖蛋白質を阻害することによりリバーロキサバンのクリアランスが減少する。
*フェキソフェナジン塩酸塩	フェキソフェナジンの血漿中濃度を上昇させるとの報告がある。	P-糖蛋白質の阻害によるフェキソフェナジンのクリアランスの低下及び吸収率の増加に起因するものと推定される。
*CYP3A4誘導作用を有する薬剤 リファンピシン、リファブチン、フェニトイン、フェノバルビタール等 セイヨウオトギリソウ（St. John's Wort、セント・ジョーンズ・ワート）含有食品	本剤の作用が減弱するおそれがある。	これらの薬剤のCYP3A誘導作用により、本剤の代謝を促進し、本剤の血中濃度を低下させる。

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（Torsade de pointesを含む）、QT延長（頻度不明）

11.1.3 ショック、アナフィラキシー（頻度不明）

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）

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	頻度不明
*過敏症	発疹	蕁麻疹、血管性浮腫
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、痔炎
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膵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 薬剤交付時の注意

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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

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

健康成人にエリスロシン錠200mg1錠(エリスロマイシンとして200mg(力価))を空腹時単回経口投与したときの血漿中濃度は下記のとおりであった。

C _{max} (μg/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
0.82	2.8	データなし

16.3 分布

16.3.1 組織移行

上顎洞粘膜¹⁴⁾、喀痰¹⁵⁾、気管支分泌物¹⁵⁾等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、0.5 μg/mL、平衡透析法)¹⁶⁾。

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)¹⁷⁻¹⁹⁾。[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²⁰⁾。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

細菌の蛋白合成阻害で²¹⁾、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²²⁾。

18.2 抗菌作用

18.2.1 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^{20,23)}。

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²⁴⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：エリスロマイシンステアリン酸塩(Erythromycin Stearate)

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*-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-olidemonostearate

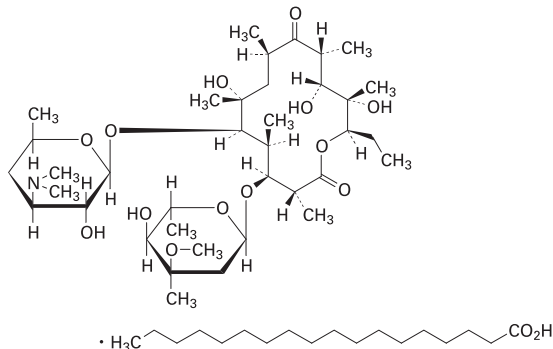
分子式：C₅₇H₆₇NO₁₃・C₁₈H₃₆O₂

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。

化学構造式：



20. 取扱い上の注意

アルミビロー包装開封後は、湿気を避けて保存すること。

*22. 包装

〈エリスロシン錠100mg〉

100錠[10錠(PTP)×10、乾燥剤入り]

〈エリスロシン錠200mg〉

100錠[10錠(PTP)×10、乾燥剤入り]

23. 主要文献

- 厚生労働省健康・生活衛生局感染症対策部 感染症対策課編：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
- Paavolainen M,et al.：Acta Otolaryngol. 1977；84：292-295
- Fraschini F,et al.：J Int Med Res. 1980；8（suppl.2）：36-40
- 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

ヴィアトリス製薬合同会社 メディカルインフォメーション部
〒106-0041 東京都港区麻布台一丁目3番1号
フリーダイヤル 0120-419-043

26. 製造販売業者等

*26.1 製造販売元

ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社
東京都港区麻布台一丁目3番1号

*26.2 販売元

ヴィアトリス製薬合同会社
東京都港区麻布台一丁目3番1号