

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2018(2019年更新版)に準拠して作成

酸安定性・持続型マクロライド系抗生物質製剤

日本薬局方 ロキシスロマイシン錠

ロキシスロマイシン錠 150mg「サワイ」

ROXITHROMYCIN Tablets [SAWAI]

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	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
規格・含量	1錠中日局ロキシスロマイシン150mg(力価)含有
一般名	和名：ロキシスロマイシン(JAN) 洋名：Roxithromycin(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2013年12月6日(販売名変更) 薬価基準収載年月日：2014年6月20日(販売名変更) 販売開始年月日：2005年7月8日
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： https://med.sawai.co.jp/

本IFは2023年12月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム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作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書(以下、添付文書)がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。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、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020年4月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	19
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	19
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	19
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	19
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	19
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	19
6. RMPの概要	1	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	19
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	20
1. 販売名	3	8. 副作用	21
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	22
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	22
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	22
5. 化学名(命名法)又は本質	4	12. その他の注意	22
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	IX. 非臨床試験に関する項目	23
III. 有効成分に関する項目	5	1. 薬理試験	23
1. 物理化学的性質	5	2. 毒性試験	23
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	X. 管理的事項に関する項目	24
3. 有効成分の確認試験法、定量法	6	1. 規制区分	24
IV. 製剤に関する項目	7	2. 有効期間	24
1. 剤形	7	3. 包装状態での貯法	24
2. 製剤の組成	7	4. 取扱い上の注意	24
3. 添付溶解液の組成及び容量	7	5. 患者向け資材	24
4. 力価	8	6. 同一成分・同効薬	24
5. 混入する可能性のある夾雑物	8	7. 国際誕生年月日	24
6. 製剤の各種条件下における安定性	8	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日	24
7. 調製法及び溶解後の安定性	8	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等 の年月日及びその内容	24
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	24
9. 溶出性	9	11. 再審査期間	24
10. 容器・包装	10	12. 投薬期間制限に関する情報	25
11. 別途提供される資材類	10	13. 各種コード	25
12. その他	10	14. 保険給付上の注意	25
V. 治療に関する項目	11	XI. 文献	26
1. 効能又は効果	11	1. 引用文献	26
2. 効能又は効果に関連する注意	11	2. その他の参考文献	26
3. 用法及び用量	11	XII. 参考資料	27
4. 用法及び用量に関連する注意	11	1. 主な外国での発売状況	27
5. 臨床成績	11	2. 海外における臨床支援情報	27
VI. 薬効薬理に関する項目	14	XIII. 備考	28
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	14	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たっての参考情報	28
2. 薬理作用	14	2. その他の関連資料	28
VII. 薬物動態に関する項目	15		
1. 血中濃度の推移	15		
2. 薬物速度論的パラメータ	16		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	17		
4. 吸収	17		
5. 分布	17		
6. 代謝	18		
7. 排泄	18		
8. トランスポーターに関する情報	18		
9. 透析等による除去率	18		
10. 特定の背景を有する患者	18		
11. その他	18		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」は、日局ロキシスロマイシンを含有する酸安定性・持続型マクロライド系抗生物質製剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

	ルリシン錠150mg(旧販売名)
承認申請に際し準拠した通知名	平成11年4月8日 医薬発第481号
承認	2005年3月
上市	2005年7月

2014年6月に「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号)に基づき、『ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」』に販売名を変更した。(X. -8. 参照)

2. 製品の治療学的特性

1)本剤の用法は、「1日2回投与」である。(V. -3. 参照)

2)他のマクロライド系抗生剤同様、細菌のリボゾームに作用し、タンパク合成を阻害する¹⁾。
(VI. -2. 参照)

7)重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、偽膜性大腸炎、出血性大腸炎、間質性肺炎、血小板減少症、肝機能障害、黄疸、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、QT延長、心室頻拍(torsades de pointesを含む)が報告されている。(VIII. -8. 参照)

3. 製品の製剤学的特性

特になし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

(2025年3月3日時点)

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

1)承認条件

該当しない

2)流通・使用上の制限事項

該当しない

I. 概要に関する項目

- 6. RMPの概要
該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」

2) 洋名

ROXITHROMYCIN Tablets [SAWAI]

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

ロキシスロマイシン(JAN)

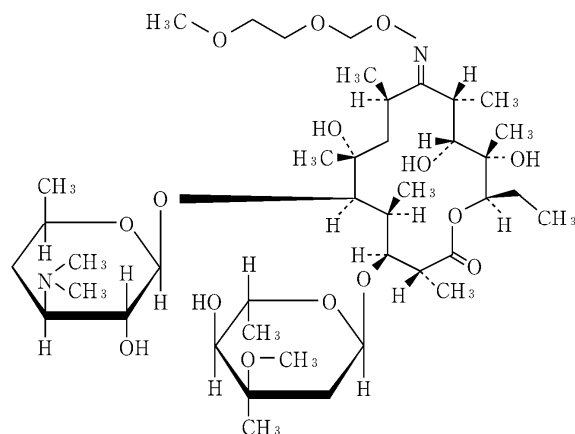
2) 洋名(命名法)

Roxithromycin(JAN、INN)

3) ステム(stem)

-mycin : antibiotics, produced by *Streptomyces* strains

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{41}H_{76}N_2O_{15}$

分子量 : 837.05

II. 名称に関する項目

5. 化学名(命名法)又は本質.....
(2*R*, 3*S*, 4*S*, 5*R*, 6*R*, 8*R*, 9*E*, 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-9-(2-methoxyethoxy)methoxyimino-2, 4, 6, 8, 10, 12-hexamethylpentadecan-13-olide
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....
略号: RXM

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

2) 溶解性

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。

3) 吸湿性

水分：3.0%以下(0.3g、容量滴定法、直接滴定)

4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

該当資料なし

5) 酸塩基解離定数

pka：測定困難(酸性で分解するため)²⁾

6) 分配係数

該当資料なし

7) その他の主な示性値

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$ ：-93~-96°(脱水物に換算したもの0.5g、アセトン、50mL、100mm)

2. 有効成分の各種条件下における安定性

原薬の安定性²⁾

水：該当資料なし

液性(pH)：該当資料なし

光：

ロキシシロマイシンを下記の条件下に保存し、性状(外観及びにおい)、確認試験(塩酸・アセトンとの反応、薄層クロマトグラフィー、赤外吸収スペクトル)、比旋光度、含湿度、毒性物質試験、力価[円筒平板法、液体クロマトグラフィー(絶対検量線法)]、溶状及び分解物(薄層クロマトグラフィー)について試験を行った。

試験の種類	保存条件	保存形態	保存期間	結果
苛酷試験・光	室温 散光	気密容器	12ヵ月	変化なし

以上の試験結果より、ロキシシロマイシンは光に対して安定であることが明らかとなった。

その他：

ロキシシロマイシンを下記の各条件下に保存し、性状(外観及びにおい)、確認試験(塩酸・アセトンとの反応、薄層クロマトグラフィー、赤外吸収スペクトル)、比旋光度、含湿度、毒性物質試験、力価[円筒平板法、液体クロマトグラフィー(絶対検量線法)]、溶状及び分解物(薄層クロマトグラフィー)について試験を行った。

Ⅲ. 有効成分に関する項目

試験の種類		保存条件	保存形態	保存期間	結果
長期保存試験		室温	気密容器	42ヵ月	変化なし
苛酷試験	温度	40℃	気密容器	6ヵ月	変化なし
	湿度	40℃・75%RH	気密容器	6ヵ月	変化なし
		40℃・75%RH	開放状態	6ヵ月	変化なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

<確認試験法>

日局「ロキシスロマイシン」の確認試験に準ずる。(赤外吸収スペクトル測定法)

<定量法>

日局「ロキシスロマイシン」の定量法に準ずる。(液体クロマトグラフィー)

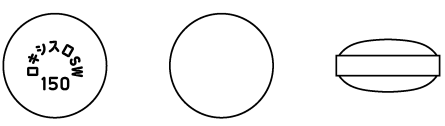
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

2) 製剤の外観及び性状

外 形	
性 状	白色
直径(mm)	9.1
厚さ(mm)	4.6
重量(mg)	約227

3) 識別コード

表示部位：錠剤本体(片面)

表示内容：ロキシスロ SW 150

4) 製剤の物性

製剤均一性：日局ロキシスロマイシン錠 製剤均一性の項により質量偏差試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局ロキシスロマイシン錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

有効成分 [1錠中]	日局ロキシスロマイシン 150mg(力価)
添加剤	カルナウバロウ、カルメロースCa、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸Mg、タルク、デンプングリコール酸Na、トウモロコシデンプン、ヒプロメロース、ポビドン、マクロゴール6000

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

IV. 製剤に関する項目

4. 力価

ロキシスロマイシン(C₄₁H₇₆N₂O₁₅:837.05)としての量を質量(力価)で示す。

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

●ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)³⁾

ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
力価試験※	100.7	112.0

※：表示力価に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験⁴⁾

ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)
性状	白色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	5.4	5.6	5.2	5.1
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
力価試験※	100.0	100.4	101.0	101.0

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

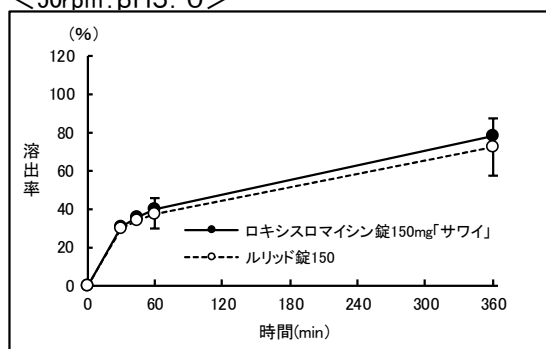
該当資料なし

9. 溶出性

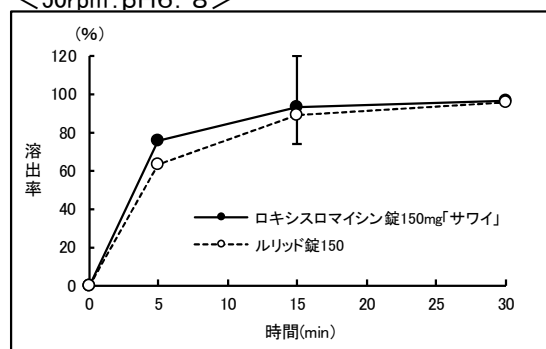
<溶出挙動における同等性及び類似性>⁵⁾

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成9年12月22日 医薬審第487号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH5.0、6.8、水)、100rpm(pH6.8)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	ロキシシロマイシン錠150mg「サワイ」	
標準製剤	ルリッド錠150	
結果及び考察	<p>本剤成分のロキシシロマイシンは低pH領域で非常に不安定であり、pH1.2における溶出試験の正確な評価は不可能であると判断し、試験液にはpH5.0、pH6.8及び水を用いて溶出試験を実施した。</p> <p><50rpm：pH5.0> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(60分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%及び±15%の範囲にあった。</p> <p><50rpm：pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p><50rpm：水> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(45分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%及び±15%の範囲にあった。</p> <p><100rpm：pH6.8> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。</p>	

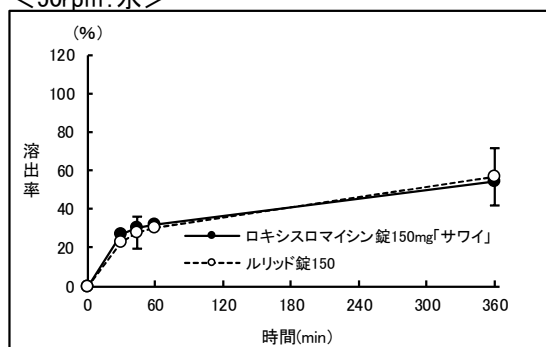
<50rpm:pH5.0>



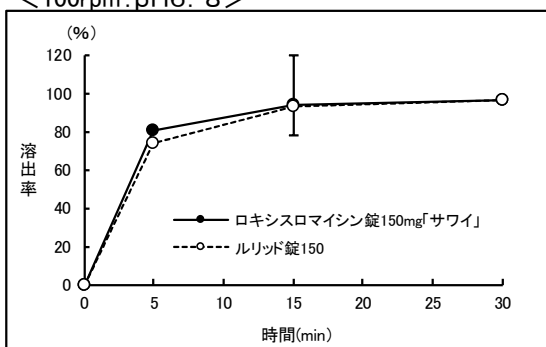
<50rpm:pH6.8>



<50rpm:水>



<100rpm:pH6.8>



([] : 判定基準の適合範囲)

IV. 製剤に関する項目

10. 容器・包装

1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

2) 包装

22. 包装

PTP : 100錠 (10錠×10)、500錠 (10錠×50)

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

PTP : [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔

[ピロー] ポリエチレンフィルム

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

○適応菌種

本剤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、アクネ菌、肺炎マイコプラズマ(マイコプラズマ・ニューモニエ)

○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、ざ瘡(化膿性炎症を伴うもの)、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

2. 効能又は効果に関連する注意

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、副鼻腔炎〉

「抗微生物薬適正使用の手引き」⁶⁾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。

3. 用法及び用量

1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

通常、成人にはロキシスロマイシンとして1日量300mg(力価)を2回に分割し、経口投与する。

2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

2) 臨床薬理試験

該当資料なし

3) 用量反応探索試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

4) 検証的試験

(1) 有効性検証試験

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 皮膚軟部組織感染症に対する国内臨床試験(二重盲検試験)

浅在性化膿性疾患患者を対象にロキシスロマイシン150mg(力価)を1日2回又は対照薬400mgを1日3回投与した二重盲検比較試験の結果、有効率はロキシスロマイシン群82.9%(87/105例)及び対照薬群80.8%(84/104例)で、両群間に有意差はなかった。ロキシスロマイシン群の副作用発現率は3.6%(4/111例)で、軟便、腹痛・下痢、悪心増強及び頭痛・悪心が各0.9%(1/111例)であった⁷⁾。

17.1.2 呼吸器感染症に対する国内臨床試験(二重盲検試験)

(1) 急性陰窩性扁桃炎患者を対象にロキシスロマイシン150mgを1日2回又は対照薬200mgを1日3回投与した二重盲検比較試験の結果、有効率はロキシスロマイシン群84.8%(78/92例)及び対照薬群77.5%(62/80例)で、両群間に有意差はなかった。ロキシスロマイシン群の副作用発現率は4.2%(4/96例)で、胃部不快感2.1%(2/96例)、食欲低下1.0%(1/96例)及び胃痛1.0%(1/96例)であった⁸⁾。

(2) 肺炎患者を対象にロキシスロマイシン150mgを1日2回又は対照薬200mgを1日3回投与した二重盲検比較試験の結果、有効率はロキシスロマイシン群81.4%(57/70例)及び対照薬群70.0%(56/80例)で、両群間に有意差はなかった。ロキシスロマイシン群の副作用発現率は4.3%(4/94例)で、発疹3.2%(3/94例)、胃部不快感・嘔吐1.1%(1/94例)であった⁹⁾。

17.1.3 耳鼻科領域感染症に対する国内臨床試験(一般臨床試験)

ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌等による副鼻腔炎に対し、有効率92.6%(25/27例)であった¹⁰⁾。

17.1.4 耳鼻科領域感染症に対する国内臨床試験(二重盲検試験)

化膿性中耳炎を対象にロキシスロマイシン150mgを1日2回又は対照薬200mgを1日3回投与した二重盲検比較試験の結果、有効率はロキシスロマイシン群53.3%(49/92例)及び対照薬群49.5%(48/97例)で、両群間に有意差はなかった。ロキシスロマイシン群の副作用発現率は1.0%(1/97例)で、下痢が1.0%(1/97例)であった¹¹⁾。

17.1.5 急性菌性感染症に対する国内臨床試験(二重盲検試験)

急性菌性感染症患者を対象にロキシスロマイシン150mgを1日2回又は対照薬400mgを1日3回投与した二重盲検比較試験の結果、有効率はロキシスロマイシン群78.6%(99/126例)及び対照薬群82.1%(96/117例)で、両群間に有意差はなかった。ロキシスロマイシン群の副作用発現率は2.9%(4/136例)で、胃部不快感1.5%(2/136例)、下痢及び発疹が各0.7%(1/136例)であった¹²⁾。

(2) 安全性試験

該当資料なし

5) 患者・病態別試験

該当資料なし

6) 治療的使用

(1) 使用成績調査(一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

(2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

7) その他

該当資料なし

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

蛋白合成阻害作用(マクロライド系)：

エリスロマイシン、エリスロマイシンエチルコハク酸エステル、エリスロマイシンステアリン酸塩、クラリスロマイシン、アジスロマイシン水和物、ジョサマイシン、ジョサマイシンプロピオン酸エステル¹³⁾

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

他のマクロライド系抗生剤同様、細菌のリボゾームに作用し、タンパク合成を阻害する¹⁾。

2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 抗菌作用

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)・カタラーリス及びアクネ菌及び肺炎マイコプラズマ(マイコプラズマ・ニューモニエ)に抗菌作用を示し、細菌に対し静菌的又は一部殺菌的である。貪食細胞に顕著に取り込まれ、貪食細胞の食菌・殺菌作用を促進する。黄色ブドウ球菌、化膿レンサ球菌、肺炎球菌、肺炎マイコプラズマ(マイコプラズマ・ニューモニエ)による動物実験感染症に対し優れた*in vivo*効果を示す^{14~20)}。

3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

健康成人男子12例にロキシスロマイシン150mg(力価)を空腹時に単回経口投与した際^{注)}の血漿中濃度は投与2.5時間後にピーク値6.8 μ g/mLを示し、消失半減期は6.2時間であった^{1,21)}。

投与量	定数	t _{max} (hr)	C _{max} (μ g/mL)	t _{1/2} (hr)	AUC (μ g \cdot hr/mL)
150mg n=12		2.5	6.8	6.2	75.3

(Mean, n=12)

16.1.2 反復投与

健康成人男子6例にロキシスロマイシン150mg(力価)を経口により1日2回15日間反復投与した際、血漿中濃度及び尿中排泄の推移から蓄積性は認められなかった²¹⁾。

注)本剤の承認された用量は「通常、成人にはロキシスロマイシンとして1日量300mg(力価)を2回に分割し、経口投与する」である。

<生物学的同等性試験>²²⁾

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成9年12月22日 医薬審第487号
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.5、2、2.5、3、4、6、12、24hr
休薬期間	1週間
測定方法	高速液体クロマトグラフィー
試験製剤	ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」
標準製剤	ルリッド錠150

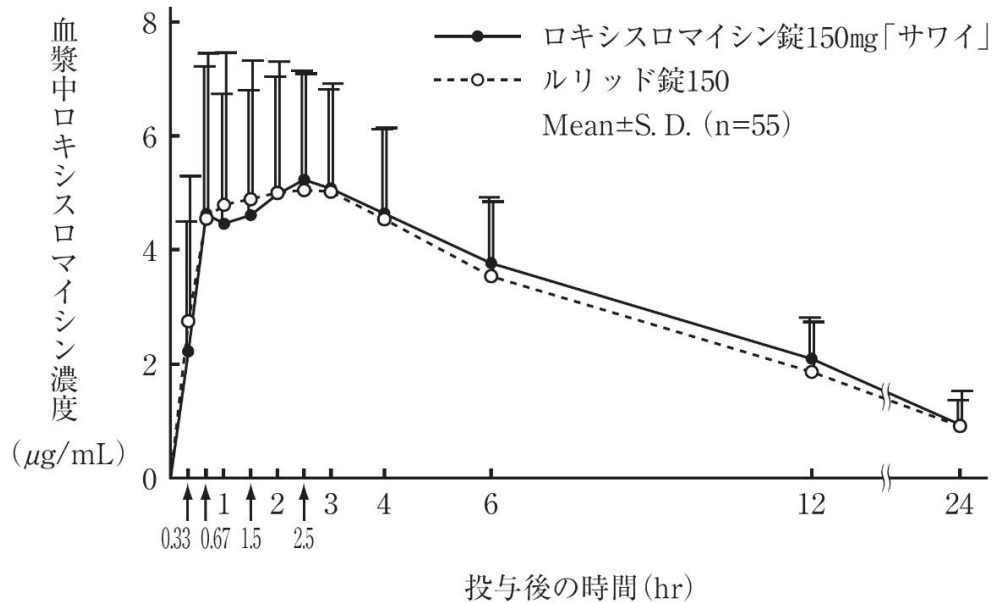
ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」とルリッド錠150を健康成人男子にそれぞれ1錠[ロキシスロマイシンとして150mg(力価)]空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ロキシスロマイシン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC_t、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C _{max} (μ g/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-24hr} (μ g \cdot hr/mL)
ロキシスロマイシン錠 150mg「サワイ」	6.07 \pm 1.97	2.0 \pm 1.3	8.9 \pm 1.9	61.79 \pm 19.85
ルリッド錠150	5.86 \pm 2.08	1.9 \pm 1.2	9.0 \pm 2.3	58.90 \pm 24.72

(Mean \pm S.D.)

VII. 薬物動態に関する項目



血漿中濃度ならびにAUCt、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。

3) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

16.7 薬物相互作用

*In vitro*試験において、ロキシスロマイシンはCYP3Aの弱い阻害作用を示したが、CYP1A2、CYP2C9、CYP2C19及びCYP2D6は阻害しなかった²³⁾。
 健康成人10例に、ロキシスロマイシン300mg(力価)とCYP3Aの基質であるミダゾラムを併用した臨床薬理試験において、ミダゾラムのAUCが1.47倍増加した²⁴⁾(外国人データ)。

VIII. - 7. 参照

2. 薬物速度論的パラメータ.....

1) 解析方法

該当資料なし

2) 吸収速度定数

該当資料なし

3) 消失速度定数

ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」を健康成人男子に1錠[ロキシスロマイシンとして150mg(力価)]空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数²²⁾

$$0.081 \pm 0.017 \text{hr}^{-1}$$

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) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

1) 解析方法

該当資料なし

2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

16.3 分布

健康成人における喀痰、扁桃、上顎洞粘膜、皮膚、歯肉及び顎骨組織への移行性は良好であった¹⁾。

1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

2) 血液-胎盤関門通過性

VIII. -6. -5) 参照

3) 乳汁への移行性

VIII. -6. -6) 参照

4) 髄液への移行性

該当資料なし

5) その他の組織への移行性

VII. -5. 参照

6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

6. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

ロキシスロマイシンは、主に肝で代謝されるが、代謝される割合は少ない²¹⁾。ロキシスロマイシンは主に薬物代謝酵素CYP3Aにより代謝される²⁵⁾。

2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

VII. -6. -1)参照

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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

健康成人男子4例にロキシスロマイシン150mg(力価)を投与した際^{注)}の検討では、ロキシスロマイシンは肝から糞中へ排泄されたが、尿中にも排泄された²⁶⁾。

健康成人男子24例にロキシスロマイシン100、150、300及び600mg(力価)を経口投与した際^{注)}の尿中排泄率は、投与後48時間で6～8%であった²¹⁾。

注)本剤の承認された用量は「通常、成人にはロキシスロマイシンとして1日量300mg(力価)を2回に分割し、経口投与する」である。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 高齢者

高齢者7例(平均78.6歳)にロキシスロマイシン150mg(力価)を経口投与した際^{注)}、健康成人男子に比べ高い血中濃度推移、消失半減期の延長等がみられた²⁷⁾。[9.8参照]

注)本剤の承認された用量は「通常、成人にはロキシスロマイシンとして1日量300mg(力価)を2回に分割し、経口投与する」である。

11. その他

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……………
 設定されていない

2. 禁忌内容とその理由……………

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

2.1 本剤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を投与中の患者[10.1参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由……………
 V. -2. 参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………
 設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由……………

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 血小板減少症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。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意……………

1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 過敏症の既往歴のある患者

9.1.2 QT延長を起こすおそれのある患者(先天性QT延長症候群の患者、低カリウム血症等の電解質異常のある患者)
 QT延長を起こすおそれがある。[10.2、11.1.7参照]

2) 腎機能障害患者

設定されていない

3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者
 投与間隔をあけること。血中濃度が持続するおそれがある。

4) 生殖能を有する者

設定されていない

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

5) 妊婦

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た場合にのみ投与すること。
 動物実験(ラット)において臨床用量の約80倍で胎児の外表異常及び骨格異常の発現頻度が対照群に比べ高いとの報告がある。

6) 授乳婦

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。動物実験(ラット)で乳汁中へ移行することが認められている。

7) 小児等

9.7 小児等
 小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

8) 高齢者

9.8 高齢者
 高齢者での薬物動態試験で、健康成人に比べ高い血中濃度が持続する傾向が認められているので、慎重に投与すること。[16. 6. 1参照]

7. 相互作用

1) 併用禁忌とその理由

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]	エルゴタミンの作用を増強させ、四肢の虚血を起こすおそれがある。	肝薬物代謝酵素が阻害され、エルゴタミンの血中濃度が上昇し、エルゴタミンの末梢血管収縮作用が増強すると考えられる。

2) 併用注意とその理由

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
テオフィリン	テオフィリンの血中濃度が上昇し、中毒症状(悪心、嘔吐等)を起こすことがある。	肝薬物代謝酵素が阻害され、テオフィリン血中濃度が上昇すると考えられる。
ワルファリンカリウム	ワルファリンの作用を増強させ出血症状を起こすおそれがある。	肝薬物代謝酵素が阻害され、ワルファリン血中濃度が上昇すると考えられる。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
QT延長を起こすことが知られている薬剤 クラスIA抗不整脈薬 キニジン ジソピラミド クラスIII抗不整脈薬 アミオダロン ソタロール 等 [9.1.2、11.1.7参照]	QT延長を起こすおそれがある。	これらの薬剤との併用により、本剤によるQT延長が助長されるおそれがある。
ケイ酸アルミニウム	本剤の効果が減弱するおそれがある。	本剤の消化管からの吸収が阻害されると考えられる。

8. 副作用

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。

1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー(頻度不明)

不快感、口内異常感、眩暈、便意、耳鳴、発汗、喘鳴、呼吸困難、血管浮腫、全身の潮紅・蕁麻疹等の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。

11.1.2 偽膜性大腸炎、出血性大腸炎(頻度不明)

偽膜性大腸炎、出血性大腸炎等の重篤な大腸炎があらわれることがある。腹痛、頻回の下痢、血便等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。

11.1.3 間質性肺炎(頻度不明)

初期症状として発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常、好酸球増多等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、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

11.1.4 血小板減少症(頻度不明)

11.1.5 肝機能障害、黄疸(頻度不明)

AST、ALTの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

11.1.6 皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)(頻度不明)

発熱、紅斑、そう痒感、眼充血、口内炎等の症状が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.1.7 QT延長、心室頻拍(torsade de pointesを含む)(頻度不明)

[9.1.2参照]

2) その他の副作用

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	発疹等		発熱、多形紅斑
精神神経系		頭痛、浮動性めまい、舌のしびれ感、しびれ	眠気、錯乱
血液	好酸球増多	白血球減少	
肝臓	AST、ALT、Al-P等の上昇		胆汁うっ滞等の肝機能障害

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
消化器	胃部不快感、腹痛、下痢、嘔吐等	口渇、食欲不振、腹部膨満感	胸やけ
感覚器			味覚異常、嗅覚異常、難聴、耳鳴、回転性めまい、視力障害、霧視
その他		浮腫、菌交代症	全身倦怠感、脱力感、動悸、関節痛、鼻出血、月経異常

注) 発現割合は使用成績調査結果を含む

9. 臨床検査結果に及ぼす影響
 設定されていない

10. 過量投与
 設定されていない

11. 適用上の注意

<p>14. 適用上の注意</p> <p>14.1 薬剤交付時の注意</p> <p>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に刺入し、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。</p>
--

12. その他の注意

1) 臨床使用に基づく情報
 設定されていない

2) 非臨床試験に基づく情報
 設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験
 - 1) 薬効薬理試験
「VI. 薬効薬理に関する項目」参照
 - 2) 安全性薬理試験
該当資料なし
 - 3) その他の薬理試験
該当資料なし

2. 毒性試験
 - 1) 単回投与毒性試験
該当資料なし
 - 2) 反復投与毒性試験
該当資料なし
 - 3) 遺伝毒性試験
該当資料なし
 - 4) がん原性試験
該当資料なし
 - 5) 生殖発生毒性試験
該当資料なし
 - 6) 局所刺激性試験
該当資料なし
 - 7) その他の特殊毒性
該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

	規制区分
製剤	処方箋医薬品 ^{注)}
有効成分	該当しない

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

該当しない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

同一成分：ルリッド錠150

同効薬：蛋白合成阻害作用(マクロライド系)

エリスロマイシン、エリスロマイシンエチルコハク酸エステル、エリスロマイシンステアリン酸塩、クラリスロマイシン、アジスロマイシン水和物、ジョサマイシン、ジョサマイシンプロピオン酸エステル¹³⁾

7. 国際誕生年月日

該当しない

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

製品名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 ルリン錠150mg	2005年3月3日	21700AMZ00300000	2005年7月8日	2005年7月8日
販売名変更 ロキシスロマイシン錠 150mg「サワイ」	2013年12月6日	22500AMX01918000	2014年6月20日	

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

X. 管理的事項に関する項目

11. 再審査期間
 該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報
 本剤は、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

製品名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号	レセプト電算処理 システム用コード
ロキシスロマイシン錠 150mg「サワイ」	6149002F1177	6149002F1177	116942301	621694201

14. 保険給付上の注意
 本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI . 文 献

1. 引用文献
- 1) 第十八改正日本薬局方解説書, 廣川書店, 2021 ; C-6303-6308
 - 2) 医療用医薬品最新品質情報集(ブルーブック) <<https://www.nihs.go.jp/drug/ecqaged/bluebook/list.html>> (2025/3/3 アクセス)
 - 3) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」
 - 4) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」
 - 5) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」
 - 6) 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
 - 7) 野原望他 : 感染症学雑誌, 1989 ; 63 : 203-227
 - 8) 河村正三他 : 耳鼻と臨床, 1989 ; 35 : 285-307
 - 9) 副島林造他 : 感染症学雑誌, 1989 ; 63 : 501-529
 - 10) 河村正三他 : 耳鼻と臨床, 1989 ; 35 : 103-112
 - 11) 馬場駿吉他 : 耳鼻と臨床, 1989 ; 35 : 314-340
 - 12) 佐々木次郎他 : Jpn. J. Antibiot., 1989 ; 42 : 1233-1255
 - 13) 薬剤分類情報閲覧システム <<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2025/3/3 アクセス)
 - 14) 赤松浩彦他 : 西日本皮膚科, 1997 ; 59 : 451-455
 - 15) 荒田次郎他 : 西日本皮膚科, 1997 ; 59 : 444-450
 - 16) 横田健他 : Chemotherapy, 1988 ; 36(S-4) : 35-52
 - 17) 坪井靖他 : Chemotherapy, 1988 ; 36(S-4) : 1-17
 - 18) 村岡宏昭他 : Chemotherapy, 1988 ; 36(S-4) : 18-34
 - 19) 加藤直樹他 : Chemotherapy, 1988 ; 36(S-4) : 65-75
 - 20) 眞崎美矢子他 : Chemotherapy, 1988 ; 36(S-4) : 421-437
 - 21) 小山優他 : Chemotherapy, 1988 ; 36(S-4) : 164-183
 - 22) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」
 - 23) Obach, R. S. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., 2006 ; 316(1) : 336-348
 - 24) Backman, J. T. et al. : Eur. J. Clin. Pharmacol., 1994 ; 46(6) : 551-555
 - 25) Yamazaki, H. et al. : Xenobiotica, 1996 ; 26(11) : 1143-1153
 - 26) McLean, A. et al. : Br. J. Clin. Pract., 1988 ; 42(S. 55) : 52-53
 - 27) 稲松孝思他 : Chemotherapy, 1988 ; 36(S-4) : 184-190
 - 28) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」
 - 29) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ロキシスロマイシン錠150mg「サワイ」
2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

2. 海外における臨床支援情報.....
 該当資料なし

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

1) 粉砕

<粉砕後の安定性試験>²⁸⁾

ロキシシロマイシン錠150mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
力価試験※	100.0	98.9	100.2	98.7

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

<崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験>²⁹⁾

試験方法

- ロキシシロマイシン錠150mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55°C)20mLを採取して数回転倒混和し、10分間放置した。
- 10分後シリンジを再度数回転倒混和し、8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

結果

懸濁状態	錠剤は崩壊し、ほぼ均一な懸濁液となった
チューブ通過性	粒子がわずかに残留するが、チューブを通過した

2. その他の関連資料

該当資料なし

