



**2018年5月改訂（第17版）
2018年4月改訂（日本薬局方収載に伴う改訂）

日本標準商品分類番号	
876149	
承認番号	20300AMZ00036
薬価収載	1991年3月
販売開始	1991年3月
再審査結果	1998年3月
効能追加	1999年3月

0518-01230 D0083430

貯 法：室温保存
使用期限：外箱に表示

処方箋医薬品：注意－医師等の処方箋により使用すること

酸安定性・持続型 マクロライド系抗生剤

日本薬局方ロキシシロマイシン錠
ルリッド[®]錠150

Rulid[®]

SANOFI

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 本剤に対し過敏症の既往歴のある患者
2. 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）含有製剤を投与中の患者〔「2. 相互作用」の項参照〕

【組成・性状】

販売名	ルリッド錠150
有効成分（1錠中）	日局ロキシシロマイシン150mg（力価）
添加物	トウモロコシデンプン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ポビドン、タルク、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、ポリオキシエチレン[160]ポリオキシプロピレン[30]グリコール、ヒプロメロース、ブドウ糖、プロピレングリコール、酸化チタン
色・剤形	白色のフィルムコート錠
外形	
直径(mm)	9.1
厚さ(mm)	4.0
重量(mg)	215
識別コード	RU 164 D

【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

（効能又は効果に関連する使用上の注意）

** 咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「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。

【用法及び用量】

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

（用法及び用量に関連する使用上の注意）

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。

【使用上の注意】

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1)過敏症の既往歴のある患者
- (2)肝障害のある患者
（血中濃度が持続するおそれがあるので、投与間隔をあけること。）
- (3)高齢者〔「4. 高齢者への投与」の項参照〕
- (4)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延長を起こすことが知られている薬剤を投与中の患者）〔QT延長を起こすおそれがある。〕〔「3. 副作用」の項参照〕

2. 相互作用

(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（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）を含有する製剤（クリアミン、ジヒデルゴット等）	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（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。

3. 副作用

総症例8,903例中、202例（2.27%）に副作用（臨床検査値異常を含む）が認められ、主な副作用は、ALT(GPT)



上昇42件 (0.47%)、AST(GOT)上昇32件 (0.36%)、好酸球増多24件 (0.27%)、下痢14件 (0.16%)、胃不快感13件 (0.15%)であった。

(再審査終了時並びに効能・効果追加時)

(1)重大な副作用

- 1) ショック、アナフィラキシー (頻度不明*) …ショック、アナフィラキシーを起こすことがあるので、観察を十分に行い、不快感、口内異常感、眩暈、便秘、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。
- 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。
- 3) 間質性肺炎 (頻度不明*) …間質性肺炎 (初期症状：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。
- 4) 血小板減少症 (頻度不明*) …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。
- 5) 肝機能障害、黄疸 (頻度不明*) …AST (GOT)、ALT (GPT) 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。
- 6) 皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson症候群) (頻度不明*) …皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson症候群) があらわれることがあるので、観察を十分に行い、発熱、紅斑、痒痒感、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。
- 7) QT延長、心室頻拍 (torsades de pointesを含む) (頻度不明*) …QT延長、心室頻拍 (torsades de pointesを含む) 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*	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{注)}	発熱、多形紅斑	発疹等	
精神神経系	眠気、錯乱		頭痛、浮動性めまい、舌のしびれ感、しびれ
血液		好酸球増多	白血球減少
肝臓	胆汁うっ滞等の肝機能障害	AST(GOT)、ALT(GPT)、ALP等の上昇	
消化器	胸やけ	胃部不快感、腹痛、下痢、嘔吐等	口渇、食欲不振、腹部膨満感

	頻度不明*	0.1～5%未満	0.1%未満
** 感覚器	味覚異常、嗅覚異常、難聴、耳鳴、回転性めまい、 <u>視力障害</u> 、 <u>霧視</u>		
その他	全身倦怠感、脱力感、動悸、関節痛、鼻出血、月経異常		浮腫、菌交代症

注) 症状があらわ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。

*自発報告又は海外での報告のため頻度不明

4. 高齢者への投与

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 [[薬物動態] の項参照] ので、慎重に投与すること。

5. 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。]

(2)授乳中の婦人に投与することを避け、やむを得ず投与する場合には、授乳を中止させること。

[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。]

6. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。[使用経験がない。]

7. 適用上の注意

(1)服用時

健康成人において天然ケイ酸アルミニウムと併用した場合、本剤の吸収が低下したとの報告がある。

(2)薬剤交付時

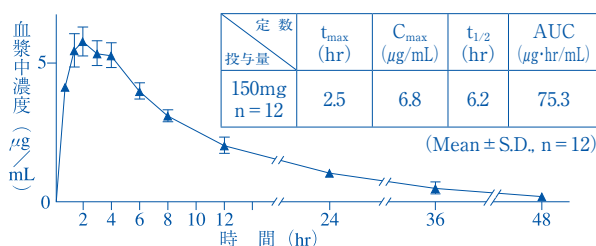
PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜に刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

【薬物動態】

1. 吸収

(1)血中濃度^{2,3)}

健康成人男子12名に本剤150mg (力価) を空腹時に単回経口投与した際の血漿中濃度は投与2.5時間後にピーク値6.8μg/mLを示し、消失半減期は6.2時間である。



また、高齢者7名 (平均78.6歳) に本剤150mg (力価)

を経口投与した際、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。

(2)反復投与²⁾

健康成人男子6名に本剤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ていない。

2. 分 布

患者における喀痰、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る。

3. 代謝・排泄^{2,4)}

本剤は、主に肝で代謝されるが、代謝される割合は少ない。本剤は主に薬物代謝酵素CYP3Aにより代謝される。

また、健康成人男子では、肝から糞中へ排泄されるが、尿中にも48時間で6～8%排泄される。

4. 薬物相互作用^{5,6)}

*In vitro*試験において、本剤は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。

健康成人に、本剤と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。

【 臨床成績 】

二重盲検比較試験(呼吸器感染症(肺炎、扁桃炎)、中耳炎、皮膚軟部組織感染症、急性菌性感染症)を含む臨床試験2039例の概要は次のとおりである。

1. 皮膚軟部組織感染症⁷⁾

ブドウ球菌属等による各種皮膚軟部組織感染症に対し、有効率80.0%(356/445)であった。また、二重盲検比較試験によって本剤の有用性が確認された。

さらに、アクネ菌によるざ瘡(化膿性炎症を伴うもの)に対し、有効率71.9%(41/57)であった。

2. 呼吸器感染症

(1)咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎⁸⁾

ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌等による咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎に対し、有効率84.1%(297/353)であった。また、扁桃炎に対する二重盲検比較試験によって本剤の有用性が確認された。

(2)肺炎⁹⁾

ブドウ球菌属、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)等による肺炎に対し、有効率81.6%(204/250)であった。また、二重盲検比較試験によって本剤の有用性が確認された。

3. 耳鼻科領域感染症

(1)中耳炎¹⁰⁾

ブドウ球菌属等による中耳炎に対し、有効率55.5%(106/191)であった。また、二重盲検比較試験によって本剤の有用性が確認された。

(2)副鼻腔炎¹¹⁾

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87.8%(36/41)であった。

4. 急性菌性感染症(歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎)¹²⁾

レンサ球菌属等による急性菌性感染症に対し、有効率82.9%(262/316)であった。また、二重盲検比較試験

によって本剤の有用性が確認された。

【 薬効薬理 】

1. 抗菌作用^{13~19)}

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。

2. 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。

【 有効成分に関する理化学的知見 】

一般名：ロキシシロマイシン (Roxithromycin)

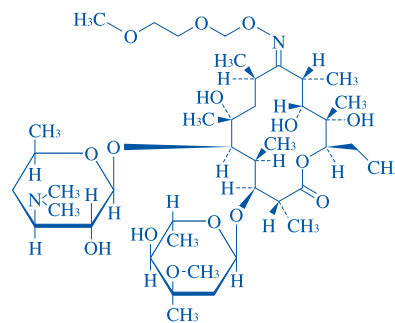
略号：RXM

化学名：(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*-xylohexopyranosyloxy)-3-(2, 6-dideoxy-3-*C*-methyl-3-*O*-methyl- α -*L*-ribohexopyranosyloxy)-6, 11, 12-trihydroxy-9-(2-methoxyethoxy)methoxyimino-2, 4, 6, 8, 10, 12-hexamethylpentadecan-13-olide

分子式：C₄₁H₇₆N₂O₁₅

分子量：837.05

構造式：



性 状：本品は白色の結晶性の粉末である。

本品はエタノール(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、アセトニトリルにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。

分配係数：3.0 (pH7.0、オクタノール-リン酸塩緩衝液25℃)

【 包 装 】

100錠 [10錠(PTP)×10]、

500錠 [10錠(PTP)×50]

【 主要文献 】

- ** 1) 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
- 2) 小山優 他：Chemotherapy, 36(S-4), 164, 1988 [RLD0016]
- 3) 稲松孝思 他：Chemotherapy, 36(S-4), 184, 1988 [RLD0017]



- 4) Yamazaki, H., et al. : Xenobiotica, **26**(11), 1143, 1996
[RLD0185]
- 5) Obach, R. S., et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., **316**(1), 336, 2006
[RLD0528]
- 6) Backman, J. T., et al. : Eur. J. Clin. Pharmacol., **46**(6), 551, 1994
[RLD0529]
- 7) 野原望 他 : 感染症学雑誌, **63**, 203, 1989 [RLD0005]
- 8) 河村正三 他 : 耳鼻と臨床, **35**, 285, 1989 [RLD0001]
- 9) 副島林造 他 : 感染症学雑誌, **63**, 501, 1989 [RLD0002]
- 10) 馬場駿吉 他 : 耳鼻と臨床, **35**, 314, 1989 [RLD0003]
- 11) 河村正三 他 : 耳鼻と臨床, **35**, 103, 1989 [RLD0004]
- 12) 佐々木次郎 他 : Jpn. J. Antibiot., **42**, 1233, 1989 [RLD0006]
- 13) 赤松浩彦 他 : 西日本皮膚科, **59**, 451, 1997 [RLD0007]
- 14) 荒田次郎 他 : 西日本皮膚科, **59**, 444, 1997 [RLD0014]
- 15) 横田健 他 : Chemotherapy, **36**(S-4), 35, 1988 [RLD0009]
- 16) 坪井靖 他 : Chemotherapy, **36**(S-4), 1, 1988 [RLD0010]
- 17) 村岡宏昭 他 : Chemotherapy, **36**(S-4), 18, 1988 [RLD0011]
- 18) 加藤直樹 他 : Chemotherapy, **36**(S-4), 65, 1988 [RLD0012]
- 19) 眞崎美矢子 他 : Chemotherapy, **36**(S-4), 421, 1988 [RLD0013]

【 文献請求先 】

サノフィ株式会社

コールセンター くすり相談室

〒163-1488 東京都新宿区西新宿三丁目20番2号

フリーダイヤル0120-109-905 FAX(03)6301-3010

製造販売 :

サノフィ株式会社

〒163-1488 東京都新宿区西新宿三丁目20番2号