

**2012年4月改訂（第10版、薬食安通知に基づく使用上の注意の項の改訂）
*2010年8月改訂

貯 法：室温保存
使用期限：外箱等に表示（使用期間3年）

日本標準商品分類番号
876241

ニューキノロン系経口抗菌製剤

処方せん医薬品^{注1)}

ロメバクト[®]カプセル100mg

ロメフロキサシン塩酸塩カプセル

Lomebact[®]

承認番号	20200AMZ00101
薬価収載	1990年4月
販売開始	1990年4月
再審査結果	1998年3月
再評価結果	2004年9月

 シオノギ製薬

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2. フルルビプロフェン アキセチル又はフルルビプロフェンを投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕
3. 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人〔「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照〕
4. 小児〔「小児等への投与」の項参照〕

【組成・性状】

1. 組成

販売名	ロメバクトカプセル 100mg
成分・含量 (1カプセル中)	ロメフロキサシン塩酸塩 110.4mg (ロメフロキサシンとして100mgに相当)
添加物	乳糖水和物、カルメロースカルシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸ポリオキシシル40、ステアリン酸マグネシウム カプセル本体中：ラウリル硫酸ナトリウム、ゼラチン、酸化チタン

2. 性状

販売名	ロメバクトカプセル 100mg
性状・剤形	キャップ、ボディとも白色の不透明な硬カプセル (中央に赤色斜線がある)
外形	 782
大きさ	3号カプセル
重量	約0.22g
識別コード	 782

【効能・効果】

<適応菌種>

ロメフロキサシンに感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、淋菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、大腸菌、赤痢菌、サルモネラ属、シトロバクター属、クレブシエラ属、エンテロバクター属、セラチア属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、プロビデンシア属、インフルエンザ菌、緑膿菌、アシネトバクター属、カンピロバクター属、ペプトストレプトコッカス属

<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、慢性膿皮症
- 外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、肛門周囲膿瘍
- 骨髄炎、関節炎
- 急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、慢性呼吸器病変の二次感染
- 膀胱炎、腎盂腎炎、前立腺炎（急性症、慢性症）、尿道炎
- 感染性腸炎
- バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎
- 眼瞼膿瘍、涙囊炎、麦粒腫、瞼板腺炎、角膜炎（角膜潰瘍を含む）
- 中耳炎、副鼻腔炎
- 歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

【用法・用量】

通常、成人にはロメフロキサシンとして1回100～200mgを1日2～3回経口投与する。

なお、感染症の種類及び症状により適宜増減する。

<用法・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) 高度の腎障害のある患者〔血中濃度が持続するので、減量又は投与間隔をあけて使用すること。〔副作用〕及び「薬物動態」の項参照〕
- (2) てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者〔痙攣を起こすことがある。〕
- (3) 類似化合物（キノロン系抗菌剤）に対し過敏症の既往歴のある患者
- (4) 高齢者〔副作用〕、「高齢者への投与」及び「薬物動態」の項参照〕
- (5) 重症筋無力症の患者〔薬で症状を悪化させるとの報告がある¹⁾。〕

2. 重要な基本的注意

光線過敏症、全身発疹等の皮膚症状があらわれることがあるので、投与にあたっては、事前に患者に対し以下の点について指導すること。

- (1) 日光曝露をできるだけ避けること。
- (2) 発疹等があらわれた場合には服薬を中止すること。
また、このような症状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。〔副作用〕の項参照〕

3. 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
フルルビプロフェン アキセチル ロピオン	臨床症状：痙攣を起こすおそれがある ²⁾ 。	機序：ニューキノロン系抗菌剤のGABA受容体結合阻害作用が、非ステロイド性消炎鎮痛剤との併用により増強され、痙攣が誘発されると考えられている。
フルルビプロフェン フロベン等	臨床症状：フルルビプロフェンアキセチルとの併用により、痙攣を起こすおそれがあるとの報告がある。	危険因子：てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者、腎障害のある患者

注1) 注意－医師等の処方せんにより使用すること

(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
フェニル酢酸系非ステロイド性消炎鎮痛剤 ジクロフェナク、アンフェナク等	臨床症状：痙攣を起こすおそれがある。	機序：ニューキノロン系抗菌剤の GABA 受容体結合阻害作用が、非ステロイド性消炎鎮痛剤との併用により増強され、痙攣が誘発されると考えられている。
プロピオン酸系非ステロイド性消炎鎮痛剤 (ただし、フルビプロフェン アキセチル、フルビプロフェンは併用禁忌) ロキソプロフェン、ザルトプロフェン、プラノプロフェン等		危険因子：てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者、腎障害のある患者
アルミニウム又はマグネシウム含有製剤 (制酸剤等) 水酸化アルミニウムゲル・水酸化マグネシウム (配合剤)、乾燥水酸化アルミニウムゲル、スクラルファート等	本剤の吸収が低下し、効果が減弱するおそれがある。 措置方法：本剤服用後、2 時間以上の間隔をあけて、制酸剤等を服用するなど注意すること。	アルミニウムイオン、マグネシウムイオンと不溶性のキレートを形成するため、本剤の消化管からの吸収が阻害され、血中濃度が低下すると考えられている。

4. 副作用

承認時における安全性評価対象例 4488 例中、副作用は 155 例 (3.45%) に認められた。

また、臨床検査値の異常変動は検査を実施した安全性評価対象例 3029 例中、163 例 (5.38%) に認められた³⁾。

再審査終了時における安全性評価対象例 111810 例中、臨床検査値の異常変動を含む副作用は 830 例 (0.74%) に認められた⁴⁾。

(副作用発現頻度は上記調査の成績及び自発報告等に基づく)

光線過敏症に関する市販後調査

全国 100 施設で 2 年間にわたり、光線過敏症に注目した市販後調査では、収集した 4276 例中、副作用は 101 例 (2.36%) に認められた。主なものは、光線過敏症、発疹等の過敏症状 56 例 (1.31%) であった。そのうち光線過敏症は 44 例 (1.03%) であり、大部分は軽度～中等度で、投与中止後軽快又は正常化した。光線過敏症の発現しやすい治療要因としては、投与日数 30 日以上、総投与量 20g 以上、キノロン服薬歴ありであった⁵⁾。

また、光線過敏症の発現を防止する目的で、過度の日光曝露を避けるよう指導し、投与方法を原則として 1 回 200mg、1 日 2 回 (朝・夕食後)、14 日以内の投与とし、更に継続投与が必要な場合には 1 日 200mg 就寝前 1 回投与に減量し、総投与量 20g 以下とした調査において、安全性評価対象例 324 例中、光線過敏症は 1 例 (0.3%) であった⁶⁾。

(1) 重大な副作用

- 1) ショック、アナフィラキシー様症状 (0.1%未満)：ショック、アナフィラキシー様症状 (呼吸困難、潮紅、浮腫等) を起こすことがあるので、観察を十分に行い、症状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。
- 2) 急性腎不全 (0.1%未満)：急性腎不全等の重篤な腎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。
- 3) 偽膜性大腸炎 (0.1%未満)：偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎があらわれることがある。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。
- 4) 低血糖 (0.1%未満)：重篤な低血糖があらわれることがある (高齢者、特に腎障害患者であらわれやすい) 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。
- 5) 横紋筋融解症 (頻度不明)：筋肉痛、脱力感、CK (CPK) 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る可能性があるため注意すること。

- 6) 痙攣、口蓋弓腫脹 (0.1%未満)：痙攣や口蓋弓腫脹があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 7) アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害 (頻度不明)：アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害があらわれたとの報告があるので、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。
- 8) 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)：中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状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。
- 9) 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には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) 重大な副作用 (類薬)

- 1) 間質性肺炎：他のニューキノロン系抗菌剤で発熱、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があらわれたとの報告があるので、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。
- 2) 重症筋無力症の悪化：他のニューキノロン系抗菌剤で重症筋無力症の悪化が報告されているので¹⁾、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。

(3) その他の副作用

種類\頻度	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症 ^{注1)}	発疹	蕁麻疹、そう痒感、発赤、浮腫、光線過敏症、結膜充血
血液 ^{注1)}		白血球減少、血小板減少、好酸球増多、赤血球減少、ヘモグロビン減少、ヘマトクリット減少
腎臓		BUN 上昇、クレアチニン上昇
肝臓		AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、ALP 上昇、総ビリルビン上昇
消化器	軟便・下痢	食欲不振、胃不快感、嘔気、嘔吐、腹痛、口内炎、口角炎、口内乾燥、胸やけ、腹部膨満感、胃腸障害、便秘
精神神経系		頭痛、めまい、不眠、眠気、振戦
その他		倦怠感、熱感、リンパ節腫脹、心悸亢進

注1：症状 (異常) が認められた場合には投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがあり、副作用が発現しやすいので、用量並びに投与間隔に留意し、慎重に投与すること。

〔「副作用」及び「薬物動態」の項参照〕

6. 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投与しないこと。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- 2) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。〔動物試験 (ラット) で乳汁中へ移行することが認められている。〕

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していないので、投与しないこと。〔「その他の注意」の項参照〕

8. 適用上の注意

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へ刺入し、更には穿孔を起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。)

9. その他の注意

- 1) 動物試験 (幼若イヌ、幼若ラット) で関節異常が認められている。
- 2) Skh-1 雌マウスに対し、紫外線照射と共に本剤を経口投与する反復試験を 52 週間実施したところ、16 週目に最初の皮膚腫瘍を認

め、22週目では半数に腫瘍が認められた。また、試験終了時には全例に腫瘍が認められた⁷⁾。

【薬物動態】

1. 血清中濃度

(1) 健康成人

健康成人に100mg及び200mgを空腹時単回経口投与したときの血清中濃度及び薬物動態パラメータを図1・表1に示す⁸⁾。

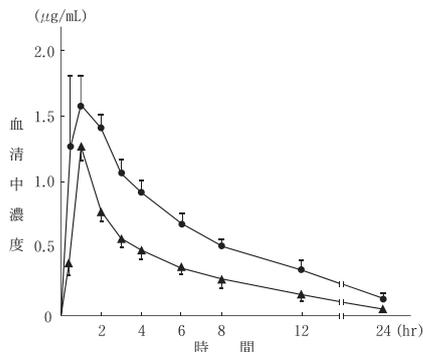


図1 経口投与時の血清中濃度

表1 薬物動態パラメータ

記号	投与量 (mg)	n	Cmax (µg/mL)	Tmax (hr)	AUC _{0-∞} (µg·hr/mL)	T _{1/2} (β) (hr)
▲	100	5	1.18±0.15	0.97±0.02	6.93±0.38	7.12±0.39
●	200	5	1.89±0.29	1.23±0.29	13.97±1.40	8.48±0.97

(測定法：HPLC) (mean±S.E.)

(2) 腎機能障害患者

腎機能障害患者に200mgを単回経口投与したときの血清中濃度及び薬物動態パラメータを図2・表2に示す。腎機能の低下に伴い、血清からの消失の遅延が認められた⁹⁾。

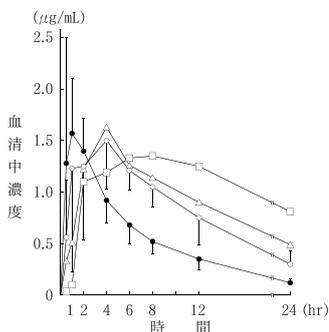


図2 経口投与時の血清中濃度

表2 薬物動態パラメータ

記号	患者群	n	Ccr (mL/min)	AUC _{0-∞} (µg·hr/mL)	T _{1/2} (β) (hr)
●	健康成人	5	>72.8	13.97±3.13	8.48±2.18
○	軽度障害患者	3	58.8~72.8	25.35±11.35	10.55±4.92
△	中度障害患者	1	30.0	29.31	12.58
□	重度障害患者	1	9.8	49.58	20.84

(測定法：HPLC) (mean±S.D.)

(3) 高齢者

重篤な肝機能障害及び腎機能障害のない高齢の患者(平均年齢75.9歳)に200mgを食後単回経口投与したときの血清中濃度及び薬物動態パラメータを図3・表3に示す。Cmax, AUCは増加し、T_{1/2}は延長した¹⁰⁾。

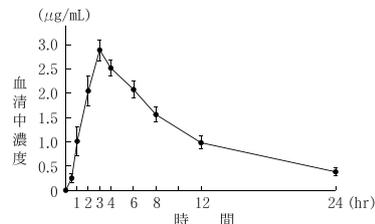


図3 経口投与時の血清中濃度

表3 薬物動態パラメータ

n	Cmax (µg/mL)	Tmax (hr)	AUC _{0-∞} (µg·hr/mL)	T _{1/2} (β) (hr)
19	2.49±0.60	3.38±0.82	28.56±6.93	13.08±3.17

(測定法：bioassay) (mean±S.E.)

2. 分布

ヒトにおける各組織への移行は良好で、皮膚、骨髄血、喀痰、扁桃、上顎洞粘膜、前立腺、胆嚢、胆汁、女性性器、涙液、唾液、歯肉等の組織では血中濃度と同程度若しくはそれ以上であった。

3. 代謝

健康成人5例に200mgを空腹時単回経口投与したときの0~24時間尿では、未変化体が最も多く存在し、投与量の72.2%(尿中排泄量の93.9%)を占めた。次いでロメフロキサシンのグルクロン酸抱合体が投与量の4.5%であり、他の代謝物は極めてわずかであった⁸⁾。

4. 排泄

健康成人5例に200mgを空腹時単回経口投与したとき、投与後72時間までの未変化体の累積尿中及び糞中排泄率は、それぞれ投与量の80.6%及び9.4%であった⁸⁾。

5. その他

血清蛋白結合率：血清蛋白結合率は平均21.4%と低く、濃度、経過時間に依存せず、ほぼ一定であった⁸⁾。

【臨床成績】

承認時における一般臨床試験での有効性評価対象例は2609例であり、有効率は78.4%(2046例)であった³⁾。

表4 臨床成績

疾患	有効例数/有効性評価対象例数	有効率(%)
皮膚科領域感染症	206/258	79.8
外科領域感染症	87/103	84.5
整形外科領域感染症	43/64	67.2
呼吸器感染症	411/527	78.0
尿路感染症	796/985	80.8
感染性腸炎	72/79	91.1
産婦人科領域感染症	108/140	77.1
眼科領域感染症	102/122	83.6
耳鼻科領域感染症	87/144	60.4
歯科・口腔外科領域感染症	134/187	71.7

【薬効薬理】

1. 薬理作用

抗菌作用

- ロメフロキサシン塩酸塩は、試験管内ではグラム陽性菌及びグラム陰性菌に対し、幅広い抗菌スペクトルを有し、ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、淋菌、モラクセラ(プランハメラ)・カタラーリス、大腸菌、赤痢菌、サルモネラ属、シトロバクター属、クレブシエラ属、エンテロバクター属、セラチア属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、プロピデンシア属、インフルエンザ菌、緑膿菌、アシネトバクター属、カンピロバクター属、ペプトストレプトコッカス属に対して抗菌力を示す。
- 抗菌作用は殺菌的であり、最小殺菌濃度は最小発育阻止濃度とほぼ一致している。

2. 作用機序

細菌の DNA ジャイレースに作用し、DNA 合成を阻害する。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般的名称：ロメフロキサシン塩酸塩 (JAN) [局外規]

Lomefloxacin Hydrochloride

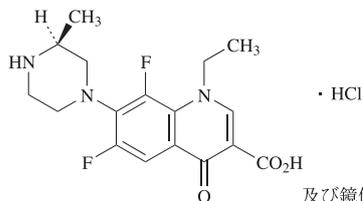
略号：LFLX

化学名：(RS)-1-Ethyl-6,8-difluoro-1,4-dihydro-7-(3-methylpiperazin-1-yl)-4-oxoquinoline-3-carboxylic acid monohydrochloride

分子式： $C_{17}H_{19}F_2N_3O_3 \cdot HCl$

分子量：387.81

化学構造式：



性状：白色～微黄白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。
水又はエチレングリコールに溶けにくく、メタノールに極めて溶けにくく、エタノール (95) にほとんど溶けない。
水酸化ナトリウム試液に溶ける。
水酸化ナトリウム試液溶液 (1→40) は旋光性を示さない。

融点：約 310 °C (分解, 乾燥後)

分配係数：0.093 [pH7.4, 1-オクタノール/緩衝液]

【包装】

ロメバクトカプセル 100mg：PTP100 カプセル (10 カプセル×10),
PTP500 カプセル (10 カプセル×50)

【主要文献】*

[文献請求番号]

- 1) Sieb, J. P. : Neurology, 1998, **50**, 804 [200901074]
- 2) 厚生省薬務局安全課：医薬品副作用情報 No. 120, 1993, pp. 2-4 [199302662]
- 3) 塩野義製薬集計；斎藤玲ほか：Chemotherapy, 1988, **36**(S-2), 461 [198801666] を含む計140文献
- 4) 厚生省医薬安全局：医薬品研究, 1998, **29**(12), 924 [199900543]
- 5) 副島林造ほか：日本化学療法学会雑誌, 1995, **43**(12), 1110 [199500472]
- 6) 戸澤啓一ほか：日本化学療法学会雑誌, 1996, **44**(1), 15 [199600002]
- 7) Klecak, G. et al. : J. Photochem. Photobiol. B., 1997, **37**, 174 [200300257]
- 8) 中島光好ほか：Chemotherapy, 1988, **36**(S-2), 201 [198801648]
- 9) 恒川琢司ほか：Chemotherapy, 1988, **36**(S-2), 803 [198801709]
- 10) 片山直之ほか：Chemotherapy, 1988, **36**(S-2), 647 [198801689]

【文献請求先】

塩野義製薬株式会社 医薬情報センター

〒541-0045 大阪市中央区道修町3丁目1番8号

電話 0120-956-734

FAX 06-6202-1541

http://www.shionogi.co.jp/med/

アボット ジャパン株式会社提携

製造販売元

塩野義製薬株式会社

〒541-0045 大阪市中央区道修町3丁目1番8号