

\*\*2008年5月改訂(第8版 住所変更等)  
\*2007年2月改訂

日本標準商品分類番号
876149

マクロライド系抗生物質製剤

処方せん医薬品

注意-医師等の処方せんにより使用すること

# リカマイシンドライシロップ200

## Ricamycin® Dry Syrup 200

(シロップ用ロキタマイシン)



承認番号	20500AMZ00308000
薬価収載	1994年7月
販売開始	1994年7月
再審査結果	1996年3月 (リカマイシンドライシロップとして)
再評価結果	2004年9月

貯法: 室温保存  
使用期限: 外箱等に表示(3年)

### 【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

### 【組成・性状】

販売名	リカマイシンドライシロップ200
成分・含量 (1g中)	ロキタマイシン 200mg(力価)
* 添加物	エチルセルロース、アミノアルキルメタアクリレートコポリマーE、硬化油、軽質無水ケイ酸、精製白糖、D-マンニトール、ショ糖脂肪酸エステル、グリシン、沈降炭酸カルシウム、サッカリンナトリウム水和物、グリチルリチン酸、ヒドロキシプロピルセルロース、結晶セルロース、カルメロースナトリウム、黄色三酸化鉄、シリコーン樹脂、黄色5号アルミニウムレーキ、アラビアゴム末、乳糖水和物、香料
色・剤形	うすいだいだい色の細粒
識別コード	1g分包  662、0.5g分包  663

### 【効能・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、カンピロバクター属、ペプトストレプトコッカス属、バクテロイデス属、クラミジア属、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、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、感染性腸炎、外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、顎炎

### 【用法・用量】

用時懸濁し、通常、未熟児・新生児を含む小児に対しては体重1kg当たり、ロキタマイシンとして1日20~30mg(力価)を3回に分けて経口投与する。

なお、年齢、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)

肝機能障害のある患者[体内貯留の延長するおそれがあるので、適宜減量するなどの注意をすること。]

#### 2. 副作用

総症例9,712例中、77例(0.79%)に副作用が認められた。その主なものは、下痢39例(0.40%)、発疹17例(0.18%)、AST(GOT)の上昇9例(0.09%)等であった。(再審査終了時)

##### (1)重大な副作用

- 1) **ショック、アナフィラキシー様症状**(頻度不明): ショック、アナフィラキシー様症状を起こすことがあるので、観察を十分に行い、血圧低下、呼吸困難、喉頭浮腫、蕁麻疹、嘔気等の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) **肝機能障害、黄疸**(0.01%): AST(GOT)、ALT(GPT)、LDH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するなど、適切な処置を行うこと。

##### (2)その他の副作用

分類	頻度	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 <sup>注)</sup>	発疹	蕁麻疹	痒痒	
消化器	下痢	悪心、胃部不快感、腹痛、食欲不振、嘔吐、軟便	腹部膨満感、便秘	
肝臓		AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇		
血液		好酸球増多		
その他				口内炎、視朦感

注) 発現した場合には、投与を中止すること。

#### 3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

本剤は小児用製剤である。

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る場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、ウサギの器官形成期に100~600mg/kg/日を経口投与した試験では、300及び600mg/kg/日投与群で親動物の軟便、体重抑制に起因すると思われる生児数の減少が認められた。]

#### 4. 適用上の注意

##### (1)懸濁液調製時

用時調製の製剤であるため、調製後の保存は避けること。やむを得ず保存する必要がある場合には冷所に保存し、できるだけ速やかに使用すること。また、服用時十分に振り混ぜること。

##### (2)服用時

主薬の苦味を防ぐ製剤設計が施してあるので、酸性飲料(オレンジジュース等)で服用すると苦味が発現するため避けることが望ましい。

## 【薬物動態】

### 1. 血中濃度（吸収）<sup>1)</sup>

小児（n=29）にリカマイシンドライシロップ10mg（力価）/kgを経口投与した時の平均血漿中濃度は、投与後30分でピーク値0.55 $\mu$ g（力価）/mLに達し、以後漸減した（半減期約2時間）。なお、無酸症の症例では吸収が不良な場合がある。

### 2. 組織移行性（成人：錠剤での成績）<sup>2~7)</sup>

慢性気管支炎患者の喀痰中濃度は経口投与後2～3時間で最高濃度に達し、同時点の血漿中濃度の約1/2であった。患者扁桃中にも良好に移行し、投与後1時間で最高濃度に達した。その他、健康成人の唾液中（血漿中濃度の約1/4）、患者の皮膚組織及び患者の歯肉内にも移行が認められた。また、産婦臍帯血漿中及び羊水中にはほとんど移行しないが、産褥婦乳汁中へは移行が認められた。

### 3. 代謝<sup>8,9)</sup>

他の16員環マクロライド系抗生物質と同様に、生体内で比較的速やかに代謝され、尿中には未変化体のロキタマイシンとともにロイコマイシンA<sub>7</sub>、10<sup>n</sup>-ヒドロキシロキタマイシン及びロイコマイシンVが認められた。これらの代謝物にも比較的強い抗菌力が認められた。

### 4. 排泄<sup>1)</sup>

小児（n=19）にリカマイシンドライシロップ10mg（力価）/kgを経口投与したときの6時間後までの尿中排泄率は2%以下であった。

### 5. 連続投与（成人：錠剤での成績）<sup>7)</sup>

21日間（61回）の連続経口投与試験において、その吸収及び排泄パターンに経日変化はなく、蓄積性は認められなかった。

### 6. 肝機能障害時の血中濃度（成人：錠剤での成績）<sup>7)</sup>

高度肝機能障害患者では高い血漿中濃度が持続した。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

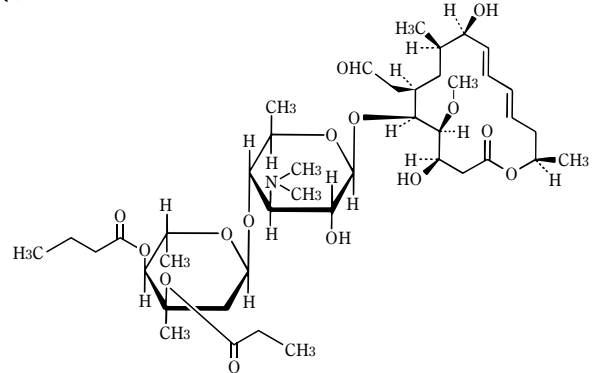
一般名：ロキタマイシン（JAN）

Rokitamycin (r-INN)

略号：RKM

\*化学名：(3R, 4S, 5S, 6R, 8R, 9R, 10E, 12E, 15R)-5-[4-O-Butanoyl-2, 6-dideoxy-3-C-methyl-3-O-propanoyl- $\alpha$ -L-ribo-hexopyranosyl-(1 $\rightarrow$ 4)-3, 6-dideoxy-3-dimethylamino- $\beta$ -D-glucopyranosyloxy]-6-formylmethyl-3, 9-dihydroxy-4-methoxy-8-methylhexadeca-10, 12-dien-15-olide

構造式：



分子式：C<sub>42</sub>H<sub>69</sub>NO<sub>15</sub>

分子量：827.99

\*性状：本品は、白色～帯黄白色の粉末である。

本品は、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）又はアセトニトリルに溶けやすく、水にほとんど溶けない。

## 【包装】

リカマイシンドライシロップ200：100g、1g $\times$ 120包、0.5g $\times$ 120包

## 【主要文献】

- 1) 藤井 良知他：Jpn. J. Antibiot., 41(6), 646(1988)
- 2) 小森 宗敬他：Chemotherapy, 32(S-6), 346(1984)
- 3) 木下 治二他：Chemotherapy, 32(S-6), 452(1984)
- 4) 金子 明寛他：Chemotherapy, 32(S-6), 592(1984)
- 5) 渡辺 晋一他：Chemotherapy, 32(S-6), 474(1984)
- 6) 田口 雅史他：Chemotherapy, 32(S-6), 620(1984)
- 7) 森下 真孝他：化学療法の領域, 3(3), 381(1987)
- 8) 五島瑛智子他：Chemotherapy, 32(S-6), 37(1984)
- 9) 坂田 宏他：Jpn. J. Antibiot., 41(6), 663(1988)
- 10) 鳥屋 実他：Chemotherapy, 32(S-6), 1(1984)
- 11) 諸星 俊郎他：Chemotherapy, 32(S-6), 12(1984)
- 12) 横井山繁行他：Chemotherapy, 32(S-6), 26(1984)
- 13) 渡辺 邦友他：Chemotherapy, 32(S-6), 54(1984)
- 14) 副島 林造他：Jpn. J. Antibiot., 41(7), 830(1988)
- 15) 井上 松久他：日本臨床, 46(特別号), 65(1988)
- 16) 出口 浩一他：Jpn. J. Antibiot., 43(12), 2133(1990)
- 17) Ishiguro, M. et al. : J. Antimicrob. Chemother., 24, 719(1989)
- 18) Tasaka, Y. et al. : Jpn. J. Antibiot., 41(7), 836(1988)
- 19) 尻谷 善則他：社内資料(薬効薬理：食細胞との協力的殺菌作用)

## 【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

\*\*旭化成ファーマ株式会社 医薬学術部くすり相談窓口  
〒101-8101 東京都千代田区神田神保町一丁目105番地  
☎0120-114-936（9：00～17：45/土日祝日を除く）

## 【臨床成績】

一般臨床試験の承認適応疾患776例に対する有効率は、87.6%（680/776）であった。疾患別の有効率は、次のとおりであった。

疾患名	有効率
浅在性化膿性疾患	92.9% (92/99)
細菌性肺炎	80.2% (130/162)
マイコプラズマ肺炎	90.0% (72/80)
クラミジア肺炎	95.2% (20/21)
その他の呼吸器感染症	86.7% (216/249)
カンピロバクター腸炎	100% (103/103)
耳鼻科領域感染症	71.7% (33/46)
歯科口腔外科領域感染症	87.5% (14/16)

## 【薬効薬理】

### 1. 抗菌作用

#### (1) 抗菌スペクトル<sup>2, 8, 10~14)</sup>

ロキタマイシンは、好気性のグラム陽性菌（ブドウ球菌属、レンサ球菌属）、嫌気性菌、カンピロバクター属、マイコプラズマ属及びクラミジア属に強い抗菌作用を示す（*in vitro*）。

#### (2) 殺菌作用<sup>10, 11)</sup>

作用は殺菌的で、最小発育阻止濃度（MIC）付近で生菌数を減少させる（*in vitro*）。

#### (3) 耐性誘導能<sup>15, 16)</sup>

本剤は、耐性誘導能が低く、マクロライド耐性黄色ブドウ球菌のうち、A1、B、C群菌に対して抗菌力を示し、また表皮ブドウ球菌、肺炎球菌、化膿連鎖球菌のマクロライド耐性菌の一部にも抗菌力を示す（*in vitro*）。

#### (4) 食細胞との協力作用<sup>17~19)</sup>

多核白血球、マクロファージなどの食細胞中に高濃度に取り込まれ、食細胞の殺菌作用に協力的に作用する（*in vitro*）。

### 2. 作用機序<sup>10, 11)</sup>

細菌のリボソームの50Sサブユニットに結合し、蛋白合成を阻害することにより抗菌作用を示すと考えられている。

\*\* 製造販売元（輸入元）

**旭化成ファーマ株式会社**  
東京都千代田区神田神保町一丁目105番地