

処方箋医薬品
注意-医師等の処方箋により
使用すること

マクロライド系抗生物質製剤

ジョサマイ[®]ドライシロップ10%

シロップ用ジョサマイシンプロピオン酸エステル

Josamy[®] Dry Syrup 10%

貯法: 気密容器、室温保存
(開封後は遮光して保存)

使用期限: ケース等に表示 (製造後2年)

承認番号	21800AMX10562
薬価収載	2006年12月
販売開始	1975年2月
再評価結果	2004年9月
効能追加	1985年7月
国際誕生	1970年3月

【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)エルゴタミン酒石酸塩を含有する製剤又はジヒドロエルゴタミンメシル酸塩を投与中の患者 (「相互作用」の項参照)

【組成・性状】

1.組成

有効成分 (1g中)	添加物
日局 ジョサマイシン プロピオン酸エステル 100mg (力価)	精製白糖、D-マンニトール、クエン酸ナトリウム水和物、カルメロースナトリウム、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、ヒドロキシプロピルセルロース、軽質無水ケイ酸、赤色3号、ジメチルポリシロキサン、二酸化ケイ素、グリセリン脂肪酸エステル、香料

2.製剤の性状

剤形	色・形状	におい	味
用時懸濁して用いるシロップ剤	淡紅色の粒状	芳香を有する	甘い

【効能・効果】

〈適応菌種〉

ジョサマイシンに感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、インフルエンザ菌、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、慢性膿皮症、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染、涙囊炎、外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、上顎洞炎、顎炎、猩紅熱

*** 〈効能・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・用量】

通常、幼小児には、1日量体重1kg当りジョサマイシンとして30mg (力価) を3~4回に分けて経口投与する。ただし、症状により適宜増減する。

シロップ剤の標準調製法は次のとおりである。

ドライシロップの量	加える水の量	シロップのでき上がり量	シロップ1mL中の含量
3g	8mL	10mL	30mg (力価)
4g	7.5mL	10mL	40mg (力価)

〈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)他のマクロライド系薬剤に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2)肝障害のある患者 [血中濃度が上昇するおそれがある。]

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
エルゴタミン酒石酸塩を含有する製剤 (クリアミン) ジヒドロエルゴタミンメシル酸塩 (ジヒデルゴット)	これらの薬剤の作用を増強させ、四肢の虚血を起こすおそれがある ²⁾ 。	CYP3A4に対する阻害によりこれらの薬剤の代謝が阻害される ²⁾ 。

(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
免疫抑制剤 シクロスポリン等	これらの薬剤の作用を増強させ、腎障害等を起こすことがある ³⁾ 。	CYP3A4に対する阻害によりこれらの薬剤の代謝が阻害される ³⁾⁴⁾ 。
トリアゾラム	この薬剤の作用を増強させ、傾眠等を起こすことがある。	
プロモクリプチンメシル酸塩	この薬剤の作用を増強させ、嗜眠、眩暈、運動失調等を起こすことがある。	

3.副作用

承認時及び承認後の全調査症例8,235例中、本剤との関連が疑われる副作用発現症例数は、176例 (2.1%)であった。その主なものは、下痢・軟便、食欲減退、悪心、嘔吐等であった。(1978年9月までの集計)

(1)重大な副作用

- 1) ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）：ショック、アナフィラキシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、蕁麻疹、呼吸困難、血圧低下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) 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。
- 3) 偽膜性大腸炎（頻度不明）：外国で偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎があらわれたとの報告がある。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。

(2)その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹		
肝臓		肝機能異常	黄疸
消化器	食欲不振、悪心、嘔吐、腹部膨満感、腹痛、下痢		
その他			顔面浮腫

注)このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

4.妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1)妊婦等：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。]
- (2)授乳婦：本剤投与中は授乳を避けさせること。[ヒト母乳中へ移行する。]

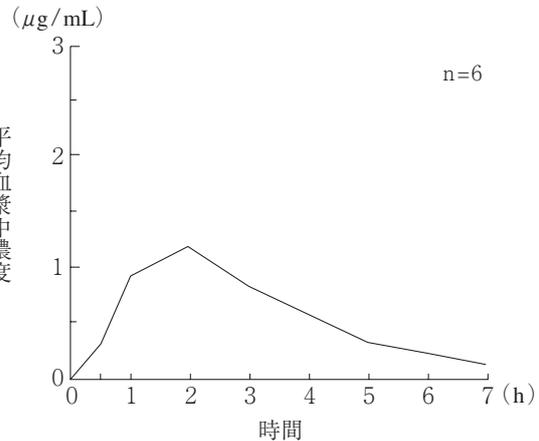
5.適用上の注意

- (1)調製時：シロップ調製後は冷所に保存し、できるだけ速やかに使用すること。
- (2)服用時：軽く振盪してから服用するよう指示すること。

【薬物動態】

1.血中濃度

健康成人男性6名に本剤を1g（力価）内服させて、血中濃度を抗菌活性（*St. hemolyticus* Cook株、重層法）で測定した成績⁵⁾では、服用1～2時間後に血漿中濃度は最高に達し、その平均は1.18 μ g/mLであった。
また、臨床的には小児に20mg/kg 1回投与後の血中濃度は、1時間で2.6～8.0 μ g/mL、2時間で4.1～7.2 μ g/mL、6時間で0.66～4.4 μ g/mLであったとの報告がある⁶⁾。



空腹時1g（力価）服用したときの血漿中濃度

2.尿中排泄

本剤を小児に20mg/kg 1回投与後24時間までの尿中への排泄率は、微生物学的測定法で6.6～12.5%であった⁶⁾。
なお、ジョサマイシンプロピオン酸エステルを経口投与後のヒトの尿中より分離された物質は、全てジョサマイシン又はその代謝物であることが確認されている⁵⁾⁷⁾。

【臨床成績】

各種細菌感染症に対する臨床試験成績は、比較臨床試験を含めて総数1,120例で、その有効率（有効以上）は80.4%（900/1,120）であった。

扁桃炎、急性気管支炎を対象とした二重盲検比較試験による臨床的評価の結果、本剤の有用性が認められている。

また、猩紅熱に対する二重盲検比較試験でも本剤の有用性が認められている⁸⁾。

疾患名	有効率	症例数
咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染等	83.7%	545/651
猩紅熱	75.4%	224/297
表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症等	72.4%	55/76
菌周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎等	78.3%	36/46

【薬効薬理】

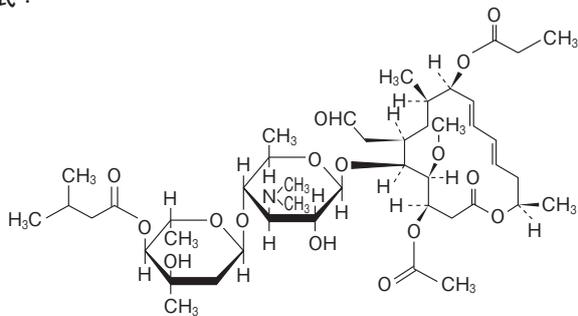
1. ジョサマイシンプロピオン酸エステルはジョサマイシンと同様に、ブドウ球菌属、レンサ球菌属及び肺炎球菌等のグラム陽性菌、インフルエンザ菌、マイコプラズマ属に対して強い抗菌力を有する^{9)~12)}。
2. ジョサマイシンは、ブドウ球菌属のマクロライド耐性を誘導しない耐性非誘導型抗生物質である¹³⁾。
3. ジョサマイシンプロピオン酸エステルは、ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌等による動物の実験感染症に対して強い防御効果を示す⁹⁾。
4. ジョサマイシンプロピオン酸エステルは、動物実験で臓器内へよく移行する⁵⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ジョサマイシンプロピオン酸エステル
(Josamycin Propionate)

化学名：(3R, 4S, 5S, 6R, 8R, 9R, 10E, 12E, 15R)-3-Acetoxy-5-[2,6-dideoxy-4-O-(3-methylbutanoyl)-3-C-methyl- α -L-ribo-hexopyranosyl-(1 \rightarrow 4)]-3,6-dideoxy-3-dimethylamino- β -D-glucopyranosyloxy]-6-formylmethyl-4-methoxy-8-methyl-9-propanoyloxyhexadeca-10,12-dien-15-olide

構造式：



分子式：C₄₅H₇₃NO₁₆

分子量：884.06

性状：ジョサマイシンプロピオン酸エステルは白色～淡黄白色の結晶性の粉末である。アセトニトリルに極めて溶けやすく、メタノール又はエタノール（99.5）に溶けやすく、水にほとんど溶けない。

【包 装】

100g

【主要文献及び文献請求先】

1.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 [R-07700]
- 2) 仲川義人 編：医薬品相互作用 医薬ジャーナル社：161, 1994 [JM-03741]
- 3) 厚生省監修：医薬品相互作用ハンドブック 薬業時報社：267, 1992 [R-04416]
- 4) 伊賀立二 他：医薬品相互作用 文光社：50, 1997 [JM-03740]
- 5) 立花章男 他：Jpn. J. Antibiot. **26** (2)：122, 1973 [JP-C02379]
- 6) 中沢 進 他：基礎と臨床 **7** (5)：1232, 1973 [JP-C02310]
- 7) Osono, T. et al.：Rep. Yamanouchi Cent. Res. Lab. **3**：143, 1977 [JM-0097]
- 8) 秋葉 享 他：Jpn. J. Antibiot. **27** (2)：73, 1974 [JP-D02377]
- 9) 大藪 卓 他：Jpn. J. Antibiot. **26** (2)：115, 1973 [JM-0251]
- 10) 中沢昭三 他：Chemotherapy **17** (4)：576, 1969 [JM-0092]
- 11) 泉川欣一 他：Jpn. J. Antibiot. **34** (9)：1288, 1981 [JP-L06848]
- 12) 洲崎 健 他：Jpn. J. Antibiot. **35** (2)：318, 1982 [JM-0094]
- 13) 三橋 進：Chemotherapy **17** (4)：567, 1969 [JM-0093]

**2.文献請求先・製品情報お問い合わせ先

LTLファーマ株式会社 コールセンター
〒160-0023 東京都新宿区西新宿6丁目10番1号
☎ 0120-303-711

** 製造販売

LTLファーマ株式会社
東京都新宿区西新宿6丁目10番1号

G1400