

貯法：室温保存  
有効期間：3年

承認番号	販売開始
22500AMX01067000	2006年7月

### 経口用セフェム系抗生物質製剤

## 日本薬局方 セフポドキシム プロキセチル錠

処方箋医薬品<sup>注)</sup>

## セフポドキシムプロキセチル錠100mg「JG」

### Cefpodoxime Proxetil Tablets

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

#### 2. 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

#### 3. 組成・性状

##### 3.1 組成

販売名	セフポドキシムプロキセチル錠100mg「JG」
有効成分	1錠中 日局 セフポドキシム プロキセチル 100mg（力価）
添加剤	乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール6000、タルク

##### 3.2 製剤の性状

販売名	セフポドキシムプロキセチル錠100mg「JG」
色調・剤形	白色～微黄白色のフィルムコーティング錠
外形	
大きさ	直径 8.6mm 厚さ 4.2mm
重量	230mg
識別コード	ch103

#### 4. 効能又は効果

##### 〈適応菌種〉

セフポドキシムに感性的ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、淋菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、大腸菌、シトロバクター属、クレブシエラ属、エンテロバクター属、プロテウス属、プロビデンシア属、インフルエンザ菌、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、乳腺炎、肛門周囲膿瘍、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、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、尿道炎、バルトリン腺炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

#### 5. 効能又は効果に関連する注意

〈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、中耳炎、副鼻腔炎〉

〔抗微生物薬適正使用の手引き〕<sup>1)</sup>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。

#### 6. 用法及び用量

通常、成人にはセフポドキシム プロキセチルとして1回100mg（力価）を1日2回食後経口投与する。

なお、年齢及び症状に応じて適宜増減するが、重症又は効果不十分と思われる症例には、1回200mg（力価）を1日2回食後経口投与する。

#### 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 ショックがあらわれるおそれがあるので、十分な問診を行うこと。〔11.1.1 参照〕

8.3 急性腎障害等の重篤な腎機能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うこと。〔11.1.4 参照〕

#### 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

##### 9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 セフェム系又はペニシリン系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者（ただし、本剤に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと）

9.1.2 本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー症状を起こしやすい体質を有する患者

9.1.3 経口摂取の不良な患者又は非経口栄養の患者、全身状態の悪い患者

観察を十分に行うこと。ビタミンK欠乏症状があらわれることがある。

##### 9.2 腎機能障害患者

###### 9.2.1 高度の腎機能障害のある患者

投与量・投与間隔の適切な調節をするなど慎重に投与すること。本剤は腎排泄型の抗生物質のため排泄遅延が起こる。

〔16.6.1 参照〕

##### 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る場合にのみ投与すること。

##### 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。ヒト乳汁中へ移行する<sup>2)</sup>。

##### 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。

##### 9.8 高齢者

次の点に注意し、用量並びに投与間隔に留意するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

・生理機能が低下していることが多く副作用が発現しやすい。

・ビタミンK欠乏による出血傾向があらわれることがある。

#### 10. 相互作用

##### 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
アルミニウム又はマグネシウム含有の制酸剤	本剤の効果を減弱させることがあるので、同時に服用させないなど慎重に投与すること。	機序は不明であるが、本剤の吸収が阻害されるとの報告がある。

#### 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。

## 11.1 重大な副作用

### 11.1.1 ショック（頻度不明）、アナフィラキシー（頻度不明）

ショック、アナフィラキシー（血圧低下、不快感、口内異常感、喘鳴、めまい、便意、耳鳴、発汗、発疹等）を起こすことがある。[8.2 参照]

### 11.1.2 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis : TEN）（頻度不明）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）（頻度不明）

### 11.1.3 偽膜性大腸炎（頻度不明）

偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎（初期症状：腹痛、頻回の下痢）があらわれることがある。

### 11.1.4 急性腎障害（頻度不明）

急性腎障害等の重篤な腎機能障害があらわれることがある。[8.3 参照]

### 11.1.5 間質性肺炎（頻度不明）、PIE症候群（頻度不明）

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、PIE症候群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直ちに投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

### 11.1.6 肝機能障害（頻度不明）、黄疸（頻度不明）

AST、ALT、 $\gamma$ -GTP上昇等の肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

### 11.1.7 汎血球減少症（頻度不明）、無顆粒球症（頻度不明）、溶血性貧血（頻度不明）、血小板減少（頻度不明）

### 11.1.8 痙攣（頻度不明）

## 11.2 その他の副作用

	0.1～2%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	発疹	そう痒、発熱	蕁麻疹、紅斑、リンパ腺腫脹、関節痛
血液	好酸球増多	血小板減少	顆粒球減少
肝臓	AST上昇、ALT上昇、ALP上昇、LDH上昇		肝機能障害
腎臓	BUN上昇	血中クレアチニン上昇	血尿
消化器	下痢、胃部不快感、悪心、軟便、胃痛、食欲不振	嘔吐、腹痛、便秘	
菌交代症		口内炎	カンジダ症
ビタミン欠乏症			ビタミンK欠乏症状（低プロトロンビ血症、出血傾向等）、ビタミンB群欠乏症状（舌炎、口内炎、食欲不振、神経炎等）
その他		めまい、頭痛	浮腫、しびれ感

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

12.1 テステープ反応を除くベネディクト試薬、フェーリング試薬による尿糖検査では偽陽性を呈することがあるので注意すること。

12.2 直接クームス試験陽性を呈することがあるので注意すること。

## 14. 適用上の注意

### 14.1 薬剤交付時の注意

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。

## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

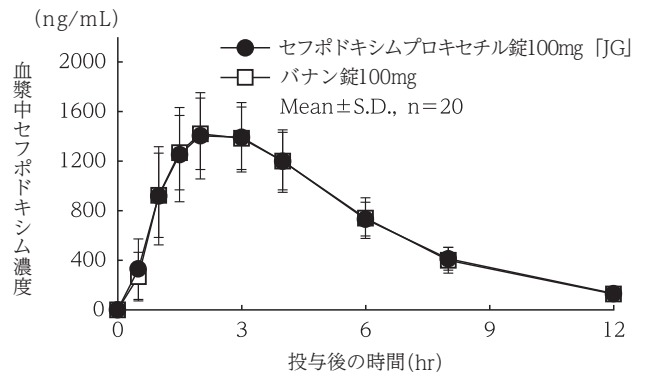
#### 16.1.1 単回投与

健康成人男性にセフポドキシム プロキセチル錠100mg又は200mgを食後単回経口投与したときのセフポドキシムの最高血清中濃度は投与後2.7時間で得られ、それぞれ1.7 $\mu$ g/mL、2.8 $\mu$ g/mLの濃度を示し、dose responseが認められた。血清中濃度の半減期は投与量に依存せず一定で、約2時間であった<sup>3)</sup>。

#### 16.1.2 生物学的同等性試験

セフポドキシムプロキセチル錠100mg [JG] とパナシ錠100mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（セフポドキシムプロキセチルとして100mg（力価））健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中セフポドキシム濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法

にて統計解析を行った結果、log (0.80) ～log (1.25) の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>4)</sup>。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-12</sub> (ng · hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
セフポドキシムプロキセチル錠100mg [JG]	8450.6 ±1667.4	1455.8 ±332.6	2.5 ±0.5	2.4 ±0.2
パナシ錠100mg	8396.7 ±1549.4	1475.2 ±271.4	2.4 ±0.5	2.4 ±0.3

(Mean ± S.D., n=20)

血漿中濃度並びにAUC、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。

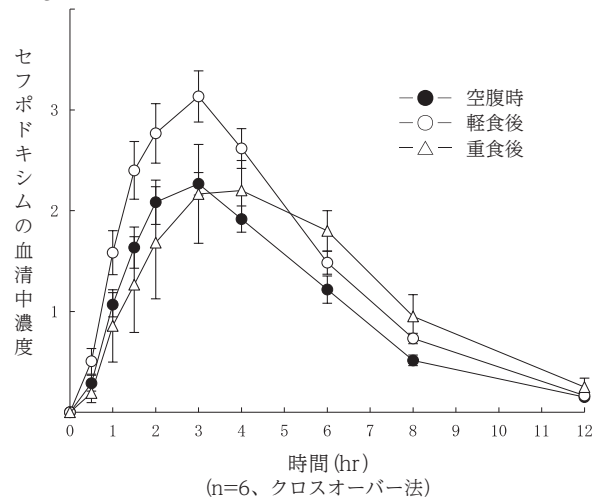
## 16.2 吸収

### 16.2.1 食事の影響

健康成人男性6名にセフポドキシム プロキセチル錠200mgを空腹時又は軽食あるいは重食30分後に単回経口投与したときのセフポドキシムの最高血清中濃度は投与後2.6～3.5時間で得られ、それぞれ2.1 $\mu$ g/mL、3.0 $\mu$ g/mL、2.7 $\mu$ g/mLの濃度を示した。また、AUC<sub>0-12</sub>はそれぞれ12.5 $\mu$ g · hr/mL、16.9 $\mu$ g · hr/mL、14.8 $\mu$ g · hr/mLであり、空腹時より食後で吸収は良好であった。血清中濃度の半減期は空腹時、食後の影響は小さく、約2時間であった<sup>5)</sup>。

200mg経口投与時（単回投与）の血清中濃度

( $\mu$ g/mL)



### 16.2.2 薬物動態パラメータ

健康成人男性にセフポドキシム プロキセチル錠を食後単回経口投与したときの薬物動態パラメータは次のとおりであった<sup>3)、6)</sup>。

投与量	吸収速度定数 Ka (hr <sup>-1</sup> )	消失速度定数 Ke (hr <sup>-1</sup> )	AUC ( $\mu$ g · hr/mL)
100mg	—	—	8.7 ± 0.3 (n=6)
200mg	0.75 ± 0.09 (n=6)	0.37 ± 0.02 (n=6)	15.2 ± 1.8 (n=6)

(mean ± SE)

## 16.3 分布

### 16.3.1 組織移行性

喀痰、口蓋扁桃組織、皮膚組織、口腔組織等への移行が認められた<sup>7)-10)</sup>。

### 16.3.2 血清蛋白結合率

健康成人男性6名にセフポドキシム プロキセチル錠200mgを食後単回経口投与したとき、0.5～12時間後のセフポドキシムの血清蛋白結合率は、約30%であった<sup>3)</sup>。

## 16.4 代謝

セフポドキシム プロキセチルは腸管壁エステラーゼにより加水分解され、活性代謝物のセフポドキシムとして循環血に移行する<sup>3)</sup>。

## 16.5 排泄

セフポドキシム プロキセチルはセフポドキシムとして尿中に排泄される。健康成人男性5名にセフポドキシム プロキセチル錠100mg又は200mgを食後経口投与したとき、12時間後までの尿中排泄率は投与量の約40～50%であった。また、セフポドキシム プロキセチル錠200mgを1日2回14日間反復投与したとき、蓄積性は認められなかった<sup>3)、11)</sup>。

## 16.6 特定の背景を有する患者

### 16.6.1 腎機能障害患者

軽度腎機能障害患者（A群：7例）及び中等度腎機能障害患者（B群：2例）に、セフポドキシム プロキセチル錠200mgを食後30分に経口投与したとき、腎機能の低下に伴い、Cmaxの増加、Tmaxの延長、AUC<sub>0-12</sub>の増加が認められた。尿中濃度は、A群で4～6時間にピークを示し、12時間までの尿中回収率は33.8±3.8%であった。またB群で8～12時間にピークを示し、12時間までの尿中回収率は17.5%であり、腎機能の低下に伴い尿中への排泄遅延が認められた<sup>12)</sup>。[9.2.1 参照]

	クレアチニン クリアランス (mL/min)	Cmax (μg/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-12</sub> (μg・hr/mL)
A群 (n=7)	54±5	3.9±0.3	3.7±0.3	3.6±0.4	28.3±2.2
B群 (n=2)	36	4.8	7.0	3.4	34.0

(mean±SE)

### 16.6.2 高齢者

健康成人3名と重篤な基礎疾患のない高齢者3名（平均82.7歳）にセフポドキシム プロキセチル錠200mgを食後30分に経口投与したとき、吸収、排泄とも高齢者では遅延する傾向が見られた<sup>13)</sup>。

## 17. 臨床成績

### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

#### 〈歯科・口腔外科領域感染症〉

#### 17.1.1 国内臨床試験

歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎に対する有効率は89.6% (276/308例)であった。安全性解析対象症例のうち2.2% (7/320)で副作用が発現し、主なものは下痢、嘔吐等の胃腸障害であった<sup>14)、15)</sup>。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

細菌細胞壁の合成阻害による殺菌作用を示す。その作用点は菌種により異なるが、ペニシリン結合蛋白 (PBP) の1、3に親和性が高い<sup>16)-18)</sup>。

### 18.2 抗菌作用

18.2.1 セフポドキシム プロキセチルは腸管壁で代謝され、セフポドキシムとなり抗菌力を示す<sup>3)</sup>。

18.2.2 セフポドキシムはグラム陽性菌・陰性菌に対し広い抗菌スペクトルを有し、特にグラム陽性菌ではブドウ球菌属、レンサ球菌属、グラム陰性菌では淋菌、大腸菌、クレブシエラ属、プロテウス属、プロピデンシア属、インフルエンザ菌に対し優れた抗菌力を示した。また、嫌気性菌では、ペプトストレプトコッカス属に対し優れた抗菌力を示した<sup>19)-25)</sup> (*in vitro*)。

18.2.3 セフポドキシムは生体防御機構との協力的殺菌作用を示す<sup>17)、18)</sup>。

18.2.4 セフポドキシムは各種細菌の産生するβ-ラクタマーゼに安定で、β-ラクタマーゼ産生株に対しても強い抗菌力を示した<sup>19)-25)</sup> (*in vitro*)。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：セフポドキシム プロキセチル  
(Cefpodoxime Proxetil)

化学名：(1*RS*)-1-[(1-Methylethoxy)carbonyloxy]ethyl  
(6*R*,7*R*)-7-[(*Z*)-2-(2-aminothiazol-4-yl)-2-  
(methoxyimino)acetyl-amino]-3-methoxymethyl-  
8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-  
carboxylate

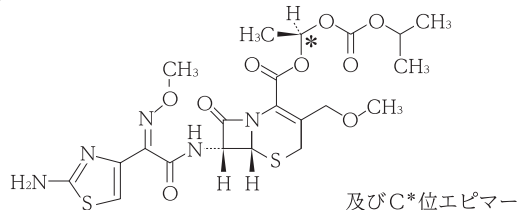
分子式：C<sub>21</sub>H<sub>27</sub>N<sub>5</sub>O<sub>9</sub>S<sub>2</sub>

分子量：557.60

性状：白色～淡褐色の粉末である。

アセトニトリル、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) に溶けやすく、水に極めて溶けにくい。

構造式：



## 22. 包装

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

## 23. 主要文献

- 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
- 山元貴雄ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 967-978
- 小林真一ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 200-214
- 社内資料：生物学的同位性試験
- 斎藤 玲：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 252-260
- 柴 孝也ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 434-441
- 丹野恭夫ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 369-374
- 畑山尚生ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 991-998
- 富澤尊儀ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 1079-1088
- 山本英雄ほか：歯薬療法 1993; 12 (1) : 39-45
- 澤江義郎ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 538-557
- 植田省吾ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 859-867
- 鈴木幹三ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 492-501
- 佐々木次郎ほか：歯薬療法 1993; 12 (1) : 17-32
- 佐々木次郎ほか：歯薬療法 1996; 15 (2) : 90-105
- 西野武志ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 72-93
- 宇津井幸男ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 146-158
- 横田 健ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 16-26
- 田島政三ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 104-145
- 宇津井幸男ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 1-15
- 五島瑛子ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 43-61
- 永山在明ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 94-103
- 小栗豊子ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy) 1988; 36 (S-1) : 27-42

- 24)安田 紘ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy)  
1988；36 (S-1)：159-172  
25)宇津井幸男ほか：日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy)  
1988；36 (S-1)：173-184

**\*24. 文献請求先及び問い合わせ先**

日本ジェネリック株式会社 お客様相談室  
〒108-0014 東京都港区芝五丁目33番11号  
TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172

**26. 製造販売業者等**

**26.1 製造販売元**

 **長生堂製薬株式会社**  
徳島市国府町府中92番地

**\*26.2 販売元**

 **日本ジェネリック株式会社**  
東京都港区芝五丁目33番11号