

経口用セフェム系抗生物質製剤

日本薬局方 セフジトレン ピボキシル細粒

# セフジトレンピボキシル小児用細粒10%「EMEC」

## Cefditoren Pivoxil fine granules 10%「EMEC」for children

承認番号	21900AMX00476000
薬価収載	2007年7月
販売開始	2007年7月
効能追加	2010年3月

〔貯法〕 室温保存、遮光した気密容器に保存  
開封後は湿気を避けて保存すること。

〔使用期限〕 外箱又はラベルに表示の使用期限内に使用すること。

〔注〕 注意—医師等の処方せんにより使用すること

### 【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

本剤の成分によるショックの既往歴のある患者

### 【原則禁忌】(次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)

本剤の成分又はセフェム系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者

### 【組成・性状】

販売名	セフジトレンピボキシル小児用細粒10%「EMEC」
有効成分 (1g中)	セフジトレン ピボキシル100mg(力価)
添加物	アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、安息香酸ベンジル、エチルパニリン、クロスカルメロースナトリウム、軽質無水ケイ酸、香料、白糖、バニリン、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、黄色5号、ラウリル硫酸ナトリウム
性状・剤形	だいたい色の細粒 芳香を有する

### 【効能・効果】

#### 1. 小児

##### 〈適応菌種〉

セフジトレン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、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、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、百日咳菌、ペプトストレプトコッカス属、バクテロイデス属、プレボテラ属、アクネ菌

##### 〈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、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、肺膿瘍、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、顎炎、猩紅熱、百日咳

#### 2. 成人(嚥下困難等により錠剤の使用が困難な場合)

##### 〈適応菌種〉

セフジトレン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、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、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、ペプトストレプトコッカス属、バクテロイデス属、プレボテラ属、アクネ菌

### 〈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、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、肺膿瘍、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、胆嚢炎、胆管炎、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、眼瞼膿瘍、涙嚢炎、麦粒腫、瞼板腺炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

### 【用法・用量】

#### 1. 小児

通常、小児にセフジトレン ピボキシルとして1回3mg(力価)／kg(本剤0.03g／kg)を1日3回食後に経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。

#### 2. 成人(嚥下困難等により錠剤の使用が困難な場合)

通常、成人にはセフジトレン ピボキシルとして1回100mg(力価)(本剤1g)を1日3回食後に経口投与する。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場合は、1回200mg(力価)(本剤2g)を1日3回食後に経口投与する。

### 〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

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。
2. 高度の腎障害のある患者には、投与間隔をあけて使用すること。〔慎重投与〕の項参照)
3. 成人での上限用量の1回200mg(力価)1日3回(1日600mg(力価))を超えないよう留意すること。
4. 本剤は小児用製剤であるが、嚥下困難等により錠剤の使用が困難な場合には成人に使用することができる。

### ※【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)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
- (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
- (3)高度の腎障害のある患者  
〔血中濃度が持続する。〕
- (4)経口摂取の不良な患者又は非経口栄養の患者、高齢者、全身状態の悪い患者  
〔ビタミンK欠乏症状があらわれることがあるので観察を十分に行うこと。〕
- (5)高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕

#### ※2. 重要な基本的注意

- (1)ショックを起こすおそれがあるので、十分な問診を行うこと。

※※(2)本剤を含むピボキシル基を有する抗生物質（セフトレンピボキシル、セフカペンピボキシル塩酸塩水和物、セフテラムピボキシル、テビペネムピボキシル）の投与により、ピバリン酸（ピボキシル基を有する抗生物質の代謝物）の代謝・排泄に伴う血清カルニチン低下が報告されている。また、小児（特に乳幼児）においては、ピボキシル基を有する抗生物質の投与により、低カルニチン血症に伴う低血糖があらわれることがあるので、ピボキシル基を有する抗生物質の投与に際してはカルニチンの低下に注意すること。〔副作用〕の項参照〕

※※3. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて使用を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1)重大な副作用（頻度不明）

- 1) 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、不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴、発汗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) 偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎があらわれることがあるので、観察を十分に行い、腹痛、頻回の下痢があらわれた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 3) 皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）、中毒性表皮壊死症（Lydell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。
- 4) 発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線像異常、好酸球増多等を伴う間質性肺炎、PIE症候群等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、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。
- 5) 黄疸、AST(GOT)、ALT(GPT)、AI-Pの著しい上昇等を伴う肝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) 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。
- 7) 無顆粒球症、溶血性貧血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。

※※(8)低カルニチン血症に伴う低血糖が、小児（特に乳幼児）に対してピボキシル基を有する抗生物質を投与した症例であらわれることがあるので、痙攣、意識障害等の低血糖症状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。〔重要な基本的注意〕の項参照〕

(2)その他の副作用

	頻度不明
過敏症 <sup>注1)</sup>	発疹、蕁麻疹、紅斑、痒疹、発熱、リンパ節腫脹、関節痛
血液 <sup>注2)</sup>	好酸球増多、顆粒球減少、血小板減少
肝臓 <sup>注2)</sup>	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、黄疸、AI-P上昇
腎臓	BUN上昇、血中クレアチニン上昇、蛋白尿
消化器	下痢、軟便、嘔気、胃不快感、腹痛、腹部膨満感、悪心、嘔吐
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（低プロトロンビン血症、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）

	頻度不明
その他	頭痛、めまい、浮腫、しびれ 投与期間が長い患者では、臨床検査値異常（AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、好酸球増多等）の発現率が高くなる傾向がみられる <sup>注3)</sup>

注1) 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。

注2) 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。

注3) このような患者には、定期的に検査を行うなど注意すること。

4. 高齢者への投与

高齢者とそれ以外の成人では副作用に差がみられなかったが、一般に高齢者では生理機能が低下しているため、次の点に注意して、投与間隔を変更するなどして投与すること。

- 1) 本剤は腎機能低下患者で排泄に遅延が認められているので、高齢者では血中濃度が高く推移する可能性がある。
- 2) 類薬で、高齢者ではビタミンK欠乏による出血傾向があらわれるとの報告がある。

※※5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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、妊娠後期にピボキシル基を有する抗生物質を投与された妊婦と、その出生児において低カルニチン血症の発現が報告されている。〕

6. 小児等への投与

低出生体重児、新生児に対する安全性は確立していない。

7. 臨床検査結果に及ぼす影響

- (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、クリニテスト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。
- (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。

【薬物動態】

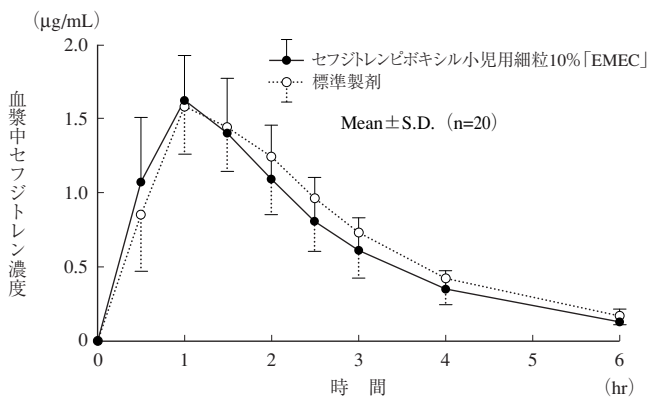
1. 生物学的同等性試験

セフトレンピボキシル小児用細粒10%「EMEC」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1g（セフトレンピボキシルとして100mg（力価））健康成人男性に絶食下単回経口投与して血漿中のセフトレン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C<sub>max</sub>）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。①

血漿中濃度並びにAUC、C<sub>max</sub>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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-6hr</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )	C <sub>max</sub> ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
セフトレンピボキシル小児用細粒10%「EMEC」	4.12±0.96	1.69±0.34	1.03±0.26	1.38±0.14
標準製剤	4.37±1.01	1.66±0.28	1.15±0.40	1.35±0.12

(Mean±S.D., n=20)



1g 投与時の平均血漿中薬物濃度推移

## 2. 溶出挙動

セフジトレンピボキシル小児用細粒10%「EMEC」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたセフジトレンピボキシル細粒の溶出規格に適合していることが確認されている。(2)

## 【薬効薬理】

セフジトレンピボキシルは、吸収時に腸管壁で代謝を受けてセフジトレンとなり、細菌の細胞壁合成阻害による抗菌作用を示す。セフジトレンは、試験管内でグラム陽性・陰性菌に対して幅広い抗菌スペクトルを有し、特に、グラム陽性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、グラム陰性の大腸菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、クレブシエラ属、プロテウス属、インフルエンザ菌及び嫌気性菌のペプトストレプトコッカス属、アクネ菌、バクテロイデス属、プレボテラ属等に対して強い作用を示す。また、試験管内で各種細菌の産生するβ-ラクタマーゼに対して安定で、β-ラクタマーゼ産生株に対しても強い抗菌力を示す。各種細菌のペニシリン結合蛋白（PBP）への親和性が高く、殺菌的に作用する。(3)

## 【有効成分に関する理化学的知見】

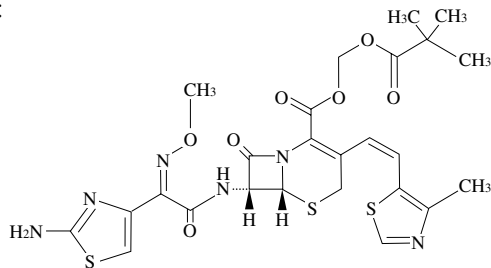
一般名：セフジトレンピボキシル（Cefditoren Pivoxil）

化学名：2,2-Dimethylpropanoyloxymethyl(6*R*,7*R*)-7-[(*Z*)-2-(2-aminothiazol-4-yl)-2-(methoxyimino)acetylamino]-3-[(1*Z*)-2-(4-methylthiazol-5-yl)ethenyl]-8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylate

分子式：C<sub>25</sub>H<sub>28</sub>N<sub>6</sub>O<sub>7</sub>S<sub>3</sub>

分子量：620.72

構造式：



物理化学的性状：

セフジトレンピボキシルは淡黄白色～淡黄色の粉末である。本品は無臭又はわずかに特異なにおいがあり、味は苦い。本品はメタノールにやや溶けにくく、アセトニトリル又はエタノール(95)に溶けにくく、ジエチルエーテルに極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。本品は希塩酸に溶ける。

## 【取扱い上の注意】

1. 防湿のため、バラ包装品は調剤後必ず密栓すること。また、分包品のアルミピロー開封後は光、湿気を避けて保存し、なるべく速やかに使用すること。
2. 長期保存試験  
長期保存試験（25℃、相対湿度60%、2年間）の結果、セフジトレンピボキシル小児用細粒10%「EMEC」（最終包装）は、通常の市場流通下において2年間安定であることが確認された。(4)

## 【包装】

セフジトレンピボキシル小児用細粒10%「EMEC」……………100g  
60g (0.5g×120)

## 【主要文献】

- ① 生物学的同等性に関する資料（メディサ新薬株式会社 社内資料）
- ② 溶出性に関する資料（メディサ新薬株式会社 社内資料）
- ③ 第十六改正日本薬局方解説書（廣川書店） C-2434（2011）
- ④ 安定性に関する資料（メディサ新薬株式会社 社内資料）

## 【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下さい。

エルメッド エーザイ株式会社 FAX 03-3980-6634  
〒170-0013 東京都豊島区東池袋3-23-5

## 【商品情報お問い合わせ先】

エルメッド エーザイ株式会社 商品情報センター ☎0120-223-698

エーザイ株式会社 お客様ホットライン ☎0120-419-497

※製造販売元



**メディサ新薬株式会社**  
大阪市淀川区宮原5丁目2-27

販売元



**エルメッド エーザイ株式会社**  
東京都豊島区東池袋3-23-5

販売提携



**エーザイ株式会社**  
東京都文京区小石川4-6-10

