

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2013に準拠して作成

経口用セフェム系抗生物質製剤

処方箋医薬品

日本薬局方 セフポドキシム プロキセチル錠

バナン[®]錠100mg

BANAN[®] TABLETS

剤形	フィルムコート錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意—医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1錠中にセフポドキシム プロキセチル（日局）100mg（力価）を含有
一般名	和名：セフポドキシム プロキセチル（JAN） 洋名：Cefpodoxime Proxetil（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2008年9月10日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2008年12月19日（販売名変更による） 発売年月日：2008年12月（販売名変更による）
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：第一三共株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	第一三共株式会社 製品情報センター TEL：0120-189-132 FAX：03-6225-1922 医療関係者向けホームページ https://www.medicallibrary-dsc.info

本IFは2020年10月改訂（第16版）の添付文書の記載に基づき改訂した。
最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ
<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要

－日本病院薬剤師会－

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

[IF の様式]

①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。

③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[IF の作成]

①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。

②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。

③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。

④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。

⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

①「IF 記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。

②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。

③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IF の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	10. 製剤中の有効成分の定量法	7
1. 開発の経緯	1	11. 力 価	7
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	12. 混入する可能性のある夾雑物	7
II. 名称に関する項目	2	13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に 関する情報	7
1. 販売名	2	14. その他	7
(1) 和 名	2	V. 治療に関する項目	8
(2) 洋 名	2	1. 効能又は効果	8
(3) 名称の由来	2	2. 用法及び用量	8
2. 一般名	2	3. 臨床成績	8
(1) 和 名 (命名法)	2	(1) 臨床データパッケージ	8
(2) 洋 名 (命名法)	2	(2) 臨床効果	8
(3) ステム	2	(3) 臨床薬理試験	15
3. 構造式又は示性式	2	(4) 探索的試験	15
4. 分子式及び分子量	2	(5) 検証的試験	16
5. 化学名 (命名法)	2	1) 無作為化並行用量反応試験	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	2) 比較試験	16
7. CAS登録番号	2	3) 安全性試験	17
4) 患者・病態別試験	17	(6) 治療的使用	17
1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・ 製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)	17	1) 承認条件として実施予定の内容 又は実施した試験の概要	17
III. 有効成分に関する項目	3	VI. 薬効薬理に関する項目	18
1. 物理化学的性質	3	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	18
(1) 外観・性状	3	2. 薬理作用	18
(2) 溶解性	3	(1) 作用部位・作用機序	18
(3) 吸湿性	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	18
(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点	3	(3) 作用発現時間・持続時間	22
(5) 酸塩基解離定数	3	VII. 薬物動態に関する項目	23
(6) 分配係数	3	1. 血中濃度の推移・測定法	23
(7) その他の主な示性値	3	(1) 治療上有効な血中濃度	23
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	(2) 最高血中濃度到達時間	23
3. 有効成分の確認試験法	4	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	23
4. 有効成分の定量法	4	(4) 中毒域	27
(5) 食事・併用薬の影響	27	(6) 母集団(ポピュレーション)解析により 判明した薬物体内動態変動要因	27
IV. 製剤に関する項目	5	2. 薬物速度論的パラメータ	27
1. 剤 形	5	(1) 解析方法	27
(1) 剤形の区別、外観及び性状	5	(2) 吸収速度定数	27
(2) 製剤の物性	5	(3) バイオアベイラビリティ	27
(3) 識別コード	5	(4) 消失速度定数	28
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、 無菌の旨及び安定なpH域等	5	(5) クリアランス	28
2. 製剤の組成	5	(6) 分布容積	28
(1) 有効成分(活性成分)の含量	5	(7) 血漿蛋白結合率	28
(2) 添加物	5		
(3) その他	5		
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5		
4. 製剤の各種条件下における安定性	5		
5. 調製法及び溶解後の安定性	6		
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6		
7. 溶出性	6		
8. 生物学的試験法	6		
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	7		

3. 吸 収	28	13. 過量投与	47
4. 分 布	29	14. 適用上の注意	47
(1) 血液－脳関門通過性	29	15. その他の注意	47
(2) 血液－胎盤関門通過性	30	16. その他	47
(3) 乳汁への移行性	31		
(4) 髄液への移行性	31	IX. 非臨床試験に関する項目	48
(5) その他の組織への移行性	31	1. 薬理試験	48
5. 代 謝	37	(1) 薬効薬理試験	48
(1) 代謝部位及び代謝経路	37	(2) 副次的薬理試験	48
(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等） の分子種	37	(3) 安全性薬理試験	48
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	37	(4) その他の薬理試験	49
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	37	2. 毒性試験	50
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	38	(1) 単回投与毒性試験	50
6. 排 泄	38	(2) 反復投与毒性試験	50
(1) 排泄部位及び経路	38	(3) 生殖発生毒性試験	50
(2) 排泄率	38	(4) その他の特殊毒性	50
(3) 排泄速度	38	X. 管理的事項に関する項目	52
7. トランスポーターに関する情報	39	1. 規制区分	52
8. 透析等による除去率	39	2. 有効期間又は使用期限	52
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	40	3. 貯法・保存条件	52
1. 警告内容とその理由	40	4. 薬剤取扱い上の注意点	52
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	40	5. 承認条件等	52
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意 とその理由	40	6. 包 装	52
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意 とその理由	40	7. 容器の材質	52
5. 慎重投与内容とその理由	40	8. 同一成分・同効薬	52
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	40	9. 国際誕生年月日	52
7. 相互作用	40	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	53
(1) 併用禁忌とその理由	40	11. 薬価基準収載年月日	53
(2) 併用注意とその理由	41	12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の 年月日及びその内容	53
8. 副作用	41	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	53
(1) 副作用の概要	41	14. 再審査期間	53
(2) 重大な副作用と初期症状	41	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	53
(3) その他の副作用	42	16. 各種コード	53
(4) 項目別副作用発現頻度及び 臨床検査値異常一覧	43	17. 保険給付上の注意	53
(5) 基礎疾患、合併症、重症度 及び手術の有無等背景別の 副作用発現頻度	44	XI. 文 献	54
(6) 薬物アレルギーに対する注意 及び試験法	45	1. 引用文献	54
9. 高齢者への投与	46	2. その他の参考文献	55
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	46	XII. 参考資料	56
11. 小児等への投与	46	1. 主な外国での発売状況	56
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	47	2. 海外における臨床支援情報	59
		XIII. 備 考	61
		その他の関連資料	61

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

バナン錠 100mg は三共株式会社（現：第一三共株式会社）が開発した経口用セフェム系抗生物質製剤である。弊社研究所は、注射剤として広く用いられている、いわゆるオキシム型セフェムに着目した。本剤は、その特長であるグラム陰性菌に対する強い抗菌力とβ-ラクタマーゼに対する抵抗性を失うことなく、ブドウ球菌属を含むグラム陽性菌にも抗菌力を有する、経口投与で有効な内服セフェムとして開発された経口用セフェム系抗生物質製剤であり、セフポドキシムの 1-[(1-Methylethyl)carboxyloxy] ethyl ester 誘導体として経口投与を可能にしたプロドラッグである。

本剤は内服後、腸管から吸収されるが、その際腸管壁のエステラーゼにより速やかに加水分解されて、抗菌活性体セフポドキシムに変換される。セフポドキシムは各種のβ-ラクタマーゼに安定で、グラム陽性菌・陰性菌に広範囲な抗菌スペクトルを有し、その作用は殺菌的であることが判明した。臨床試験の結果、各科領域感染症において有用性が確認され、1989年9月に承認された。また、1999年3月に再審査結果が公表されている。

なお、医療事故防止対策として、「バナン錠」から「バナン錠 100mg」に販売名の変更を申請し、2008年9月承認された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) ブドウ球菌をはじめ幅広い抗菌スペクトルと強い抗菌力を示す (*in vitro*、「VI.薬効薬理に関する項目」参照)。
- (2) β-ラクタマーゼに対し高い安定性を示す (*in vitro*) 。
- (3) 呼吸器感染症主要起炎菌に対するすぐれた生体内効果を示す (*in vivo*: マウス、「VI.薬効薬理に関する項目」参照) 。
- (4) 食後投与で高い血中濃度が得られる（「VII.薬物動態に関する項目」参照）。
- (5) 臨床ですぐれた除菌効果を示す（「V.治療に関する項目」参照）。
- (6) 小さな錠剤で、1日2回投与である（「IV.製剤に関する項目」及び「V.治療に関する項目」参照）。
- (7) 総症例 12,615 例中副作用の報告されたものは 317 例 (2.51%) であった。その主なものは消化器症状 (下痢・軟便: 0.40%、胃部不快感: 0.10%、嘔気・悪心・嘔吐: 0.09%) 等であった。

[再審査終了時及び効能追加時]

重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群、偽膜性大腸炎、急性腎障害、間質性肺炎、PIE 症候群、肝機能障害、黄疸、血小板減少が報告されている。また、類薬での重大な副作用は、汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血、痙攣が報告されている。

(「VIII.安全性 (使用上の注意等) に関する項目」参照)

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1)和名

バナナ[®]錠 100mg

(2)洋名

BANAN[®] TABLETS 100mg

(3)名称の由来

不明

2. 一般名

(1)和名(命名法)

セフポドキシム プロキシセチル (JAN)

(2)洋名(命名法)

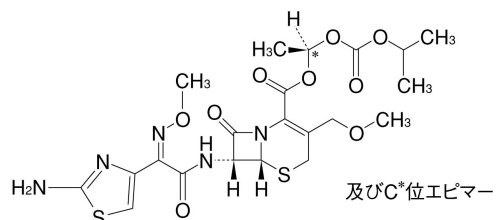
Cefpodoxime Proxetil (JAN)

cefpodoxime (INN)

(3)ステム

セファロスポラン酸誘導体抗生物質 : cef-
(antibiotics, cephalosporanic acid derivatives)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : C₂₁H₂₇N₅O₉S₂

分子量 : 557.60

5. 化学名(命名法)

(1*RS*)-1-[(1-Methylethoxy)carbonyloxy]ethyl(6*R*, 7*R*)-7-[(*Z*)-2-(2-aminothiazol-4-yl)-2-(methoxyimino)acetylamino]-3-methoxymethyl-8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4. 2. 0]oct-2-ene-2-carboxylate

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

CS-807、CPDX-PR

7. CAS登録番号

87239-81-4

80210-62-4 (Cefpodoxime)

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～淡褐白色の粉末である。

(2) 溶解性

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。

溶 媒	本品を 1g 溶かすのに 要する溶媒の量 (mL)
アセトニトリル	0.6
メタノール	0.7
アセトン	0.7
酢酸エチル	0.9
酢酸 (100)	1.1
1,2-ジクロロエタン	1.2
エタノール (99.5)	1.8
2-プロパノール	3.4
ジエチルエーテル	149
水	6600

pH1.2 : 11.1mg/mL

pH4.0 : 0.24mg/mL

pH6.8 : 0.20mg/mL

(3) 吸湿性

吸湿性なし (25℃及び 40℃、相対湿度 11～94%、デシケータ、96 時間放置で質量はほとんど変化しなかった。)

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

融点 : 明瞭な融点を示さない。

(5) 酸塩基解離定数

pKa : 3.20±0.13 ((チアゾール環) アミノ基、吸光度法)

(6) 分配係数

pH \ 溶媒	1.2	3	5	6.8	9
クロロホルム	1.60	2.79	3.08	3.12	3.18
オクタノール	0.08	1.30	1.53	1.64	1.50

分配係数 (P) = logPow = log (溶媒相のセフポドキシム プロキセチル濃度 / 水相のセフポドキシム プロキセチル濃度)

(7) その他の主な示性値

1) 旋光度 : $[\alpha]_D^{20} = +24.0 \sim +31.4^\circ$ (脱水物に換算したもの 0.1g、アセトニトリル、20mL、100mm)

2) 比吸光度 : $E_{1cm}^{1\%} (234nm) = \text{約 } 338$

3) pH : 約 6 (1→100 水懸濁液)

Ⅲ. 有効成分に関する項目

2. 有効成分の各種条件下における安定性

		保存形態	保存条件	保存期間	結果
長期 保存 試験		約 7g をガラス製薬品瓶 (JIS PS6 容量 55mL) に 入れ開栓したまま、光を遮 って保存	室温	30 ヶ月	いずれの試験項目も開始時と比較して ほとんど変化は認められなかった。
苛 酷 条 件	加 温	同上 (ただしキャップをし て保存、気密容器)	40°C/75%RH	6 ヶ月	ほとんど変化は認められなかった。
			50°C	12 週	経時的に着色し含量低下した。12 週残 存率 88~93%
	加 温 加 湿	同上 (ただし開栓したまま 保存)	40°C/31%RH	6 ヶ月	53%RH, 6 ヶ月で若干の含量低下、類 縁物質 R807-16 が 2~3%増加、75%,6 ヵ月で 4%の増加を認める。 経時的に黄色化。
			40°C/53%RH		
			40°C/75%RH		
曝 光	約 3g を膜厚 0.03mm のポ リプロピレン製の袋 (30× 40mm) に入れ曝光 (層厚約 2mm)	室内散光 (白色蛍光灯)	60 万 lx・h	外観の黄色化を認めるが、含量などそ の他の項目は殆ど変化なし。	
		キセノンランプ照射 (24 時間照射は自然 光 7 日間に相当)	24 時間		

【試験項目】 1) 性状、2) 確認試験 (呈色反応、UV、IR、NMR)、3) 吸光度 $E_{1\text{cm}}^{1\%}$ (234nm)、4) 旋光度 $[\alpha]_D^{20}$ 、
5) 重金属 (室温長期試験)、6) 含湿度、7) 毒性物質、8) 力価、9) 純度試験 (溶状、ヒ素、類縁物質、
残留溶媒)、10) 異性体比、11) 薄層クロマトグラフ法 (第 1 法、第 2 法、苛酷試験で実施)

以上の結果から、本品は温度及び湿度の影響により徐々に二重結合の転移、側鎖部分の加水分解などが起きるが、
湿度の影響を避ければ室温で長期間安定であると考えられる。

3. 有効成分の確認試験法

日局「セフポドキシム プロキセチル」による

4. 有効成分の定量法

日局「セフポドキシム プロキセチル」による

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

販売名	剤形	色	外形			識別コード
			直径 (mm)	厚さ (mm)	重さ (mg)	
バナン錠 100mg	フィルムコート錠	白色～ 微黄白色				SANKYO 676
			8.7	4.2	230	

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

上記「IV.1.(1)剤形の区別、外観及び性状」参照

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1 錠中にセフポドキシム プロキセチル（日局）100mg（力価）を含有する。

(2) 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、ステアリン酸マグネシウム、ラウリル硫酸ナトリウム、酸化チタン、タルク、ヒプロメロース

(3) その他

該当しない

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 長期保存試験

保存条件	包装形態	保存期間	結果
25°C/60%RH	PTP（乾燥剤入り）、アルミピローパック、箱	36 ヶ月	変化なし

試験項目：外観、溶出試験、含量

IV. 製剤に関する項目

(2) 苛酷試験

曝光（室内散光、キセノンランプ）、加温（50℃・12週）試験においては、50℃の条件で、わずかに含量の低下が認められたほかはいずれの試験項目にもほとんど変化は認められなかった。

加湿（40℃・6ヵ月・31%RH、53%RH、75%RH）試験においては、湿度が高くなるにしたがい含量の低下が認められる。

試験項目：乾燥減量、力価、性状、確認試験、崩壊試験

(3) <参考情報> 無包装状態における安定性

	性状	含量 (%)	硬度 (kg)	崩壊試験 (分)
スタート	白色～微黄白色のフィルムコート錠	101	13	8 (8～9)

1) 温度に対する安定性

保存条件		試験項目			
温度	保存期間	性状	含量 (%)	硬度 (kg)	崩壊試験 (分)
40℃ (遮光気密容器)	3ヵ月	白色～微黄白色のフィルムコート錠	1%低下	13	7 (6～7)
安定性		変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

2) 湿度に対する安定性

保存条件		試験項目			
温度・湿度	保存期間	性状	含量 (%)	硬度 (kg)	崩壊試験 (分)
25℃/75%RH (遮光、開放)	3ヵ月	白色～微黄白色のフィルムコート錠	2%低下	10	6 (5～8)
安定性		変化なし	変化なし	変化あるが、スタート時硬度の半分以上	変化なし

3) 光に対する安定性

保存条件		試験項目			
光	保存期間	性状	含量 (%)	硬度 (kg)	崩壊試験 (分)
1,000lx (室温、気密容器)	120万 lx・h	白色～微黄白色のフィルムコート錠	変化なし	12	7 (6～7)
安定性		変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

7. 溶出性

日局「セフポドキシム プロキシセチル錠」による

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日局「セフポドキシム プロキシセチル錠」による

10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「セフポドキシム プロキシセチル錠」による

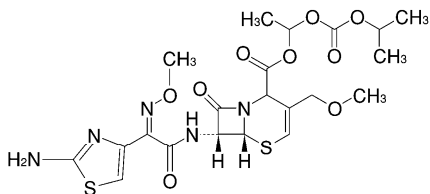
11. 力 価

日局「セフポドキシム プロキシセチル錠」による。

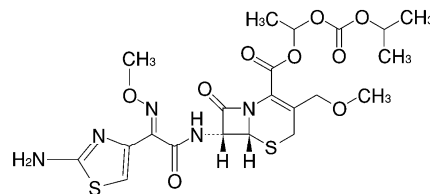
本品の力価は、セフポドキシム ($C_{15}H_{17}N_5O_6S_2$: 427.46) としての量を質量 (力価) で示す。

本品は定量するとき、表示された力価の 93.0 ~ 107.0% に対応するセフポドキシム ($C_{15}H_{17}N_5O_6S_2$: 427.46) を含む。

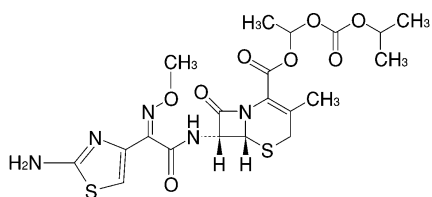
12. 混入する可能性のある夾雑物



〔1〕 Δ^3 -異性体



〔2〕 E-異性体



〔3〕 脱メトキシ体

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

<適応菌種>

セフポドキシムに感性のブドウ球菌属、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

<効能・効果に関連する使用上の注意>

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。

〔記載理由〕

咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、感染性腸炎、中耳炎又は副鼻腔炎のいずれかの効能・効果を有する抗微生物薬に共通の注意である。

（厚生労働省の指示：平成 30 年 3 月 27 日付薬生安発 0327 第 1 号、令和 2 年 9 月 8 日付薬生安発 0908 第 2 号）

2. 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。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

1. 高度の腎障害のある患者には、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（「慎重投与」及び「薬物動態」の項参照）。
2. 本剤の使用にあたっては、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。〔耐性菌の発現等を防ぐ。〕

〔記載理由〕

1. 本剤は腎排泄型の抗生物質のため排泄遅延が起こる。
2. 細菌性感染症を効能・効果とする抗菌性物質製剤に共通の注意である。

（厚生労働省の指示：平成 5 年 1 月 19 日付薬安第 5 号）

3. 臨床成績

(1)臨床データパッケージ

該当しない

(2)臨床効果^{2,3,4)}

国内の医療機関で実施された 7 種類の二重盲検比較試験（細菌性肺炎、慢性気道感染症、急性陰窩性扁桃炎、複雑性尿路感染症、軟部組織感染症、産婦人科領域感染症、化膿性中耳炎）を含む臨床試験について検討した結果、効果判定が行われた総計 3,777 例のうち適応疾患を対象とした 3,210 例（一般臨床試験 2,549 例、

二重盲検比較試験 661 例) の臨床試験成績の概要は次のとおりである。

1. 呼吸器感染症

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、慢性呼吸器病変の二次感染に対する有効率は 83.2% (480/577) であった。

また、細菌性肺炎、慢性気道感染症、急性陰窩性扁桃炎を対象とした二重盲検比較試験により、本剤の有用性が認められている。

2. 尿路感染症

膀胱炎、腎盂腎炎、尿道炎に対する有効率は 76.3% (739/968) であった。また、複雑性尿路感染症を対象とした二重盲検比較試験により、本剤の有用性が認められている。

3. 外科・整形外科領域感染症

乳腺炎に対する有効率は、84.2% (16/19) であった。

また、乳腺炎を対象とした二重盲検比較試験により、本剤の有用性が認められている。

4. 浅在性化膿性疾患

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、肛門周囲膿瘍に対する有効率は 86.8% (347/400) であった。

また、軟部組織感染症を対象とした二重盲検比較試験により、本剤の有用性が認められている。

5. 産婦人科領域感染症

バルトリン腺炎に対する有効率は 94.1% (48/51) であった。

また、バルトリン腺炎を対象とした二重盲検比較試験により、本剤の有用性が認められている。

6. 耳鼻科領域感染症

中耳炎、副鼻腔炎に対する有効率は 67.7% (153/226) であった。

また、化膿性中耳炎を対象とした二重盲検比較試験により、本剤の有用性が認められている。

7. 歯科・口腔外科領域感染症

歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎に対する有効率は 89.6% (276/308) であった。

1) 疾患別臨床効果

疾患名	有効例 /症例	有効率(%)				
		0	20	40	60	80
呼吸器感染症 小計	676/812	83.3				
肺 炎	160/183	87.4				
急性気管支炎	70/82	85.4				
慢性気管支炎	149/187	79.7				
扁桃炎	175/194	90.2				
咽喉頭炎	15/17	88.2				
気管支拡張症 (感染時)	63/86	73.3				
慢性呼吸疾患 の二次感染	44/63	69.8				

尿路感染症 小計	851/1155	73.7				
腎盂腎炎	94/166	56.6				
単純性膀胱炎	362/394	91.9				
複雑性膀胱炎	352/551	63.9				
淋病性尿道炎	43/44	97.7				

外科領域感染症 小計	20/23	87.0				
乳 腺 炎	20/23	87.0				

浅在性化膿性疾患 小計	422/494	85.4				
毛嚢(包)炎(膿疱 性座瘡を含む)	25/29	86.2				
瘡	52/55	94.5				
瘡腫症	6/8	75.0				

ここに示す成績は製造承認時の適応症・適応菌種に関するものであり、平成16年(2004年)の抗菌薬再評価結果を踏まえたものではありません。

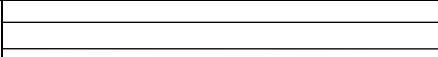
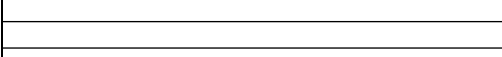
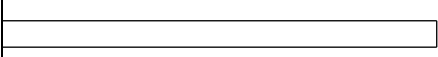
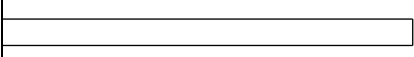
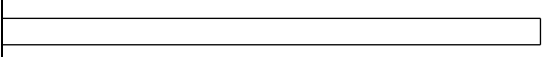
疾患名	有効例 /症例	有効率(%)				
		0	20	40	60	80
よ う	3/3	100				
丹 毒	3/3	100				
蜂 巢 炎	34/41	82.9				
リンパ管(節)炎	15/18	83.3				
瘰 癧	55/63	87.3				
化膿性爪囲(廓)炎	15/16	93.8				
皮 下 膿 瘍	60/76	78.9				
汗 腺 炎	4/4	100				
集 簇 性 座 瘡	9/15	60.0				
感 染 性 粉 瘤	103/122	84.4				
肛 門 周 囲 膿 瘍	38/41	92.7				
婦人科領域感染症 小計	79/88	89.8				
バルトリン腺炎 (膿瘍)	79/88	89.8				
耳鼻科領域感染症 小計	227/330	68.8				
中 耳 炎	169/247	68.4				
副 鼻 腔 炎	58/83	69.9				
歯科・口腔外科領域 感染症 小計	276/308	89.6				
歯 周 組 織 炎	101/115	87.8				
歯 冠 周 囲 炎	38/43	88.4				
顎 炎	137/150	91.3				
総 計	2551/3210	79.5				

ここに示す成績は製造承認時の適応症・適応菌種に関するものであり、平成16年(2004年)の抗菌薬再評価結果を踏まえたものではありません。

2) 起炎菌別臨床効果

菌種	有効例/症例	有効率(%)				
		0	20	40	60	80
(グラム陽性菌)						
ブドウ球菌属	694/879	79.0				
黄色ブドウ球菌	351/444	79.1				
表皮ブドウ球菌	197/263	74.9				
その他	146/172	84.9				
レンサ球菌属	365/416	87.7				
化膿レンサ球菌	67/73	91.8				
肺炎球菌	82/94	87.2				
その他	216/249	86.7				
(グラム陰性菌)						
淋菌	51/55	92.7				
ブランハメラ・カタラーリス	31/38	81.6				
大腸菌	589/662	89.0				
クレブシエラ属	121/143	84.6				
肺炎桿菌	94/108	87.0				
その他	27/35	77.1				
シトロバクター属	38/56	67.9				
エンテロバクター属	51/73	69.9				
プロテウス属	68/100	68.0				
プロテウス・ミラビリス	52/72	72.2				
プロテウス・ブルガリス	4/9	44.4				
プロビデンシア・レッドゲリ	9/14	64.3				
プロビデンシア・インコンスタンス	3/5	60.0				
インフルエンザ菌	126/148	85.1				

ここに示す成績は製造承認時の適応症・適応菌種に関するものであり、平成16年(2004年)の抗菌薬再評価結果を踏まえたものではありません。

菌種	有効例 /症例	有効率(%)					
		0	20	40	60	80	100
(歯科・口腔外科領域感染症適応追加時)							
ブドウ球菌属	8/10						80.0
口腔レンサ球菌	134/146						91.8
その他のレンサ球菌	27/34						79.4
グラム陰性菌	9/12						75.0
ペプトストレプト コッカス属	61/64						98.4

ここに示す成績は製造承認時の適応症・適応菌種に関するものであり、平成16年(2004年)の抗菌薬再評価結果を踏まえたものではありません。

3) 起炎菌別細菌学効果

菌種	菌消失症例 /症例	菌消失率(%)				
		0	20	40	60	80
(グラム陽性菌)						
ブドウ球菌属	674/774	87.1				
黄色ブドウ球菌	339/398	85.2				
表皮ブドウ球菌	186/215	86.5				
その他	149/161	92.5				
レンサ球菌属	368/377	97.6				
化膿レンサ球菌	68/68	100				
肺炎球菌	90/92	97.8				
その他	210/217	96.8				
(グラム陰性菌)						
淋菌	50/55	90.9				
ブランハメラ・カタラーリス	30/36	83.3				
大腸菌	560/600	93.3				
クレブシエラ属	113/126	89.7				
肺炎桿菌	82/93	88.2				
その他	31/33	93.9				
シトロバクター属	37/47	78.7				
エンテロバクター属	48/62	77.4				
プロテウス属	80/91	87.9				
プロテウス・ミラビリス	59/65	90.8				
プロテウス・ブルガリス	8/9	88.9				
プロビデンシア・レッドゲリ	11/11	100				
プロビデンシア・インコンスタンス	2/6	33.3				
インフルエンザ菌	126/136	92.6				

ここに示す成績は製造承認時の適応症・適応菌種に関するものであり、平成16年(2004年)の抗菌薬再評価結果を踏まえたものではありません。

菌種	菌消失症例 /症例	菌消失率(%)				
		0	20	40	60	80
(歯科・口腔外科領域感染症適応追加時)						
ブドウ球菌属	8/10	80.0				
口腔レンサ球菌	137/146	93.6				
その他のレンサ球菌	31/34	91.2				
グラム陰性菌	12/12	100				
ペプトストレプト コッカス属	64/64	98.4				

ここに示す成績は製造承認時の適応症・適応菌種に関するものであり、平成16年(2004年)の抗菌薬再評価結果を踏まえたものではありません。

(3)臨床薬理試験

本剤を投与したヒト循環血液中には、動物と同様、脱エステル体のセフポドキシムのみが検出された。

のべ32例の健康成人男性に本剤50mg、100mg、200mg単回あるいは2週間の連続投与を実施した。その結果、連続投与による蓄積性は認められず、連続投与時に一過性の軟便傾向、AST (GOT)、ALT (GPT)等肝機能検査値の軽度上昇が一部にみられた以外には、自他覚症状、理学的検査、一般血液検査、血液生化学検査、尿検査、腸内細菌叢に対する影響など、忍容性には特に問題はなかった^{5,6)}。

5) 小林真一ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):200-214

6) 田島政三ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):215-228

(4)探索的試験

健康成人6例に対して本剤50、100、200mgの空腹時単回投与試験を行った結果、投与量上昇に伴い、血中濃度 C_{max} 、 AUC_0 が用量に相関して上昇した。また、食事の影響について、100mg単回投与を軽い朝食後、あるいは空腹時に同一被験者を用いて行った結果、食後投与の方が血中濃度は高く、 C_{max} 、尿中回収率は有意な増加を示し、 AUC も食後投与により増大傾向が認められた(「VII.1.(3)1)①単回投与」参照)。

以上より食後投与が血中濃度、尿中排泄の点からより好ましいことから、食後投与で100mg及び200mgの2用量で調べたところ、用量相関性を示す血中濃度時間曲線が得られた。

また、薬動力学も加味した抗菌力試験⁷⁾で、1日200mg(分2)、400mg(分2)は、経口剤が対象となる軽・中等症の感染症に対して十分に効果が期待できると考えられた。

複雑性尿路感染症を対象とした至適用量設定試験⁸⁾と皮膚軟部感染症⁹⁾、複雑性尿路感染症¹⁰⁾、耳鼻科領域2種類(急性陰窩性扁桃炎¹¹⁾、化膿性中耳炎¹²⁾)の感染症、細菌性肺炎¹³⁾、慢性気道感染症¹⁴⁾、産婦人科領域感染症¹⁵⁾7種類の二重盲検比較試験でもこの用法・用量の妥当性が確認された。

一般臨床試験では、各科領域の検出頻度の高い菌種に対する本剤のMICを参考に、MICが低い菌の分離頻度の高い領域、あるいは比較的軽度～中等度の症例が多い領域では、1回100mgの1日2回投与を主体にし、起炎菌のMICが高い菌種が多い領域又は、症状が比較的重い領域には、1回200mgの1日2回投与を主体にした、2群の有効率の比較において、前者では1164/1485例78.4%、後者では663/843例78.6%とほぼ同等であった。また、副作用の発現頻度もそれぞれ33/1554例2.1%、19/881例2.2%と同程度であり、用量依存的に上昇することはなかった。

以上のことから、本剤に対する起炎菌の感受性が高い領域あるいは軽症～中等症を主体とする比較的症状の軽い症例に対しては1日200mg(分2)、重症例あるいは効果が不十分と判断された症例には1日400mg(分2)をいずれも食後経口投与することにより十分な臨床効果と高い安全性が得られることが確認された。

- 7) 岡 慎一ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):261-266
- 8) 中牟田誠一ほか：西日本泌尿器科 1988;50(6):2099-2111
- 9) 由良二郎ほか：Jpn J Antibiotics 1988;41(10):1517-1537
- 10) 尾形信雄ほか：西日本泌尿器科 1988;50(6):2077-2098
- 11) 馬場駿吉ほか：耳鼻と臨床 1988;34(5):1274-1296
- 12) 河村正三ほか：耳鼻と臨床 1988;34(5):1243-1273
- 13) 柴 孝也ほか：感染症学雑誌 1988;62(11):973-1001
- 14) 柴 孝也ほか：感染症学雑誌 1988;62(12):1166-1191
- 15) 松田静治ほか：臨床医薬 1988;4(9):1641-1685

(5) 検証的試験

1) 無作為化並行用量反応試験

至適用量設定試験での200mg群と400mg群の2群比較では、有効性、安全性に有意差は認められなかったが、UTI病態群別の比較では、第3群(単独感染、その他の上部尿路感染群)で、1日400mgが有意に優れていた⁸⁾。

- 8) 中牟田誠一ほか：西日本泌尿器科 1988;50(6):2099-2111

2) 比較試験

各領域感染症に於いて、対照薬との比較で同等の臨床効果が認められ、安全性についても有意差はなかった⁹⁻¹⁵⁾。

- 9) 由良二郎ほか：Jpn J Antibiotics 1988;41(10):1517-1537
- 10) 尾形信雄ほか：西日本泌尿器科 1988;50(6):2077-2098
- 11) 馬場駿吉ほか：耳鼻と臨床 1988;34(5):1274-1296
- 12) 河村正三ほか：耳鼻と臨床 1988;34(5):1243-1273
- 13) 柴 孝也ほか：感染症学雑誌 1988;62(11):973-1001
- 14) 柴 孝也ほか：感染症学雑誌 1988;62(12):1166-1191
- 15) 松田静治ほか：臨床医薬 1988;4(9):1641-1685

試験区分	試験の種類	対象疾患	薬剤・用量/日	臨床効果 (%) (委員会判定)	細菌学的効果	文献 No
至適用量 設定試験	無作為割付法による多施設共同群間比較試験	複雑性尿路感染症	A群 CPDX-PR100mg×2	62/94 66.0	84/116 72.4	8
			B群 CPDX-PR 200mg×2	60/88 68.2	70/93 75.3	
比較試験	二重盲検比較試験	皮膚軟部組織感染症	CPDX-PR 200mg×2	79/106 74.5	64/71 90.1	9
			CCL 250mg×3	89/116 76.7	87/95 91.6	
		複雑性尿路感染症	CPDX-PR 200mg×2	101/152 66.4	148/179 82.7	10
			L-CEX1000mg×2	106/162 65.4	156/199 78.4	
		急性陰窩性扁桃炎	CPDX-PR 100mg×2	64/82 78.0	63/64 98.4	11
			CCL 250mg×3	76/90 84.4	73/74 98.6	
		化膿性中耳炎	CPDX-PR 100mg×2	71/104 68.3	67/80 83.8	12
			CCL 250mg×3	75/110 68.2	60/85 70.6	
		細菌性肺炎	CPDX-PR 100mg×2	65/75 86.7	18/18 100	13
			CCL 500mg×3	56/69 81.2	24/28 85.7	
慢性気道感染症	CPDX-PR 200mg×2	63/84 75.0	34/42 81.0	14		
	CCL 500mg×3	66/86 76.7	18/30 60.0			
産婦人科領域感染症	CPDX-PR 100mg×2	77/106 72.6	44/50 88.0	15		
	BAPC 250mg×4	103/126 81.7	47/54 87.0			

CPDX-PR: Cefpodoxime proxetil, CCL: Cefaclor, L-CEX: Cephalexin, BAPC: Bacampicillin

3) 安全性試験

該当資料なし

<参考>

最長投与期間は183日間の症例である。

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6)治療的使用

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当しない

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

経口セフェム系抗生物質

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1)作用部位・作用機序^{16,17,18)}

抗菌活性体であるセフポドキシムは、細菌細胞壁の合成阻害により殺菌作用を示す。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。

E. coli NIHJ JC-2 の PBP に対する 50%阻害濃度 (μg/mL)

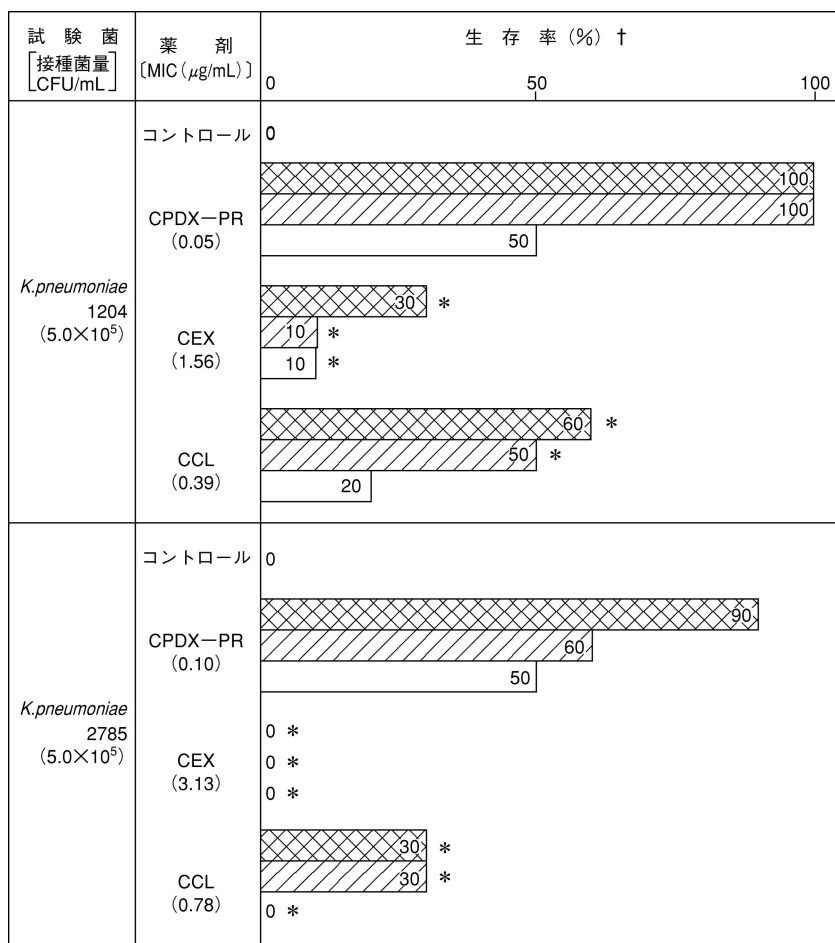
PBP	1A	1Bs	2	3	4	5	6
セフポドキシム	0.4	0.6	1.5	0.3	15.2	>100	>100

(2)薬効を裏付ける試験成績

1) マウス肺内感染症に対する治療効果¹⁹⁾

感染 5 時間目に 1 回目の投与を行い、翌日より 3 日間、2 回/日、計 7 回連続経口投与し、14 日目のマウス生存率を検討した。

K. pneumoniae 2 菌株による肺内感染症に対し、CPDX-PR はいずれの場合にも CCL (セファクロル)、CEX (セファレキシン) より優れた効果を示した。

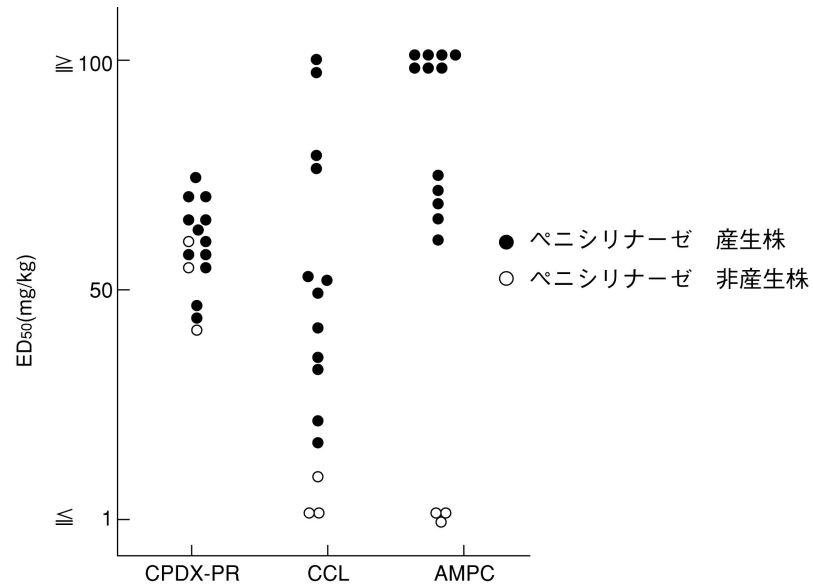


: 2mg/mouse
 : 1mg/mouse
 : 0.5mg/mouse

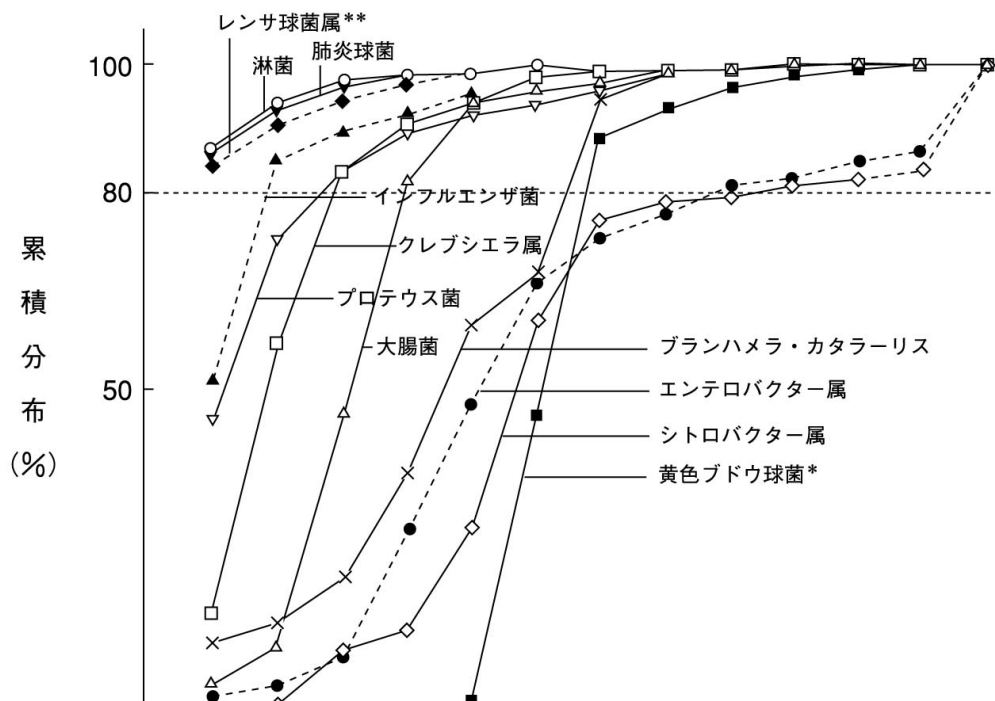
† : 感染後14日目 * : P<0.05 (CPDX-PR群との比較)

2) MSSA マウス腹腔内感染症に対する治療効果²⁰⁾

MSSA (メチシリン感性 *S. aureus*) 15 株 (ペニシリナーゼ産生 12 株、非産生 3 株) を用いたマウス腹腔内感染症に対する CPDX-PR、CCL、AMPC (アモキシシリン水和物) の治療効果 (感染直後と 4 時間後に経口投与し、5 日後の生存率より検討) を検討した。CPDX-PR はペニシリナーゼ産生株、非産生株を問わず ED₅₀ 値は 10mg/kg 前後にあるが、CCL、AMPC は産生株では ED₅₀ 値のばらつきが大きく 100mg/kg 以上の耐性を示すものもあった。



3) 感受性菌の種類及び MIC^{17,19~25)}



VI. 薬効薬理に関する項目

菌名・株数	MIC ($\mu\text{g/mL}$)													
	≤ 0.05	0.1	0.2	0.39	0.78	1.56	3.13	6.25	12.5	25	50	100	100<	
黄色ブドウ球菌*	730				4	330	312	41	14	10	6	8	5	
レンサ球菌属**	832	705	56	28	22	11	5	2	0	1	2			
肺炎球菌	285	246	23	8	5	1	0	2						
淋菌	88	77	6	3	1	0	0	1						
ブランハメラ・カタラーリス	134	14	4	9	22	31	10	37	7					
大腸菌	1077	25	76	391	387	135	26	10	10	5	4	1	3	4
クレブシエラ属	618	95	257	164	48	23	21	4	1	1	1	1	0	2
プロテウス属	514	229	148	53	31	14	6	10	5	6	7	1	1	3
シトロバクター属	174	1	0	15	5	27	57	27	5	2	2	3	2	28
エンテロバクター属	234	5	4	10	45	47	45	16	8	9	3	6	4	32
インフルエンザ菌	274	141	93	12	7	8	1	1	2	3	5	1		

* メチシリン感性黄色ブドウ球菌

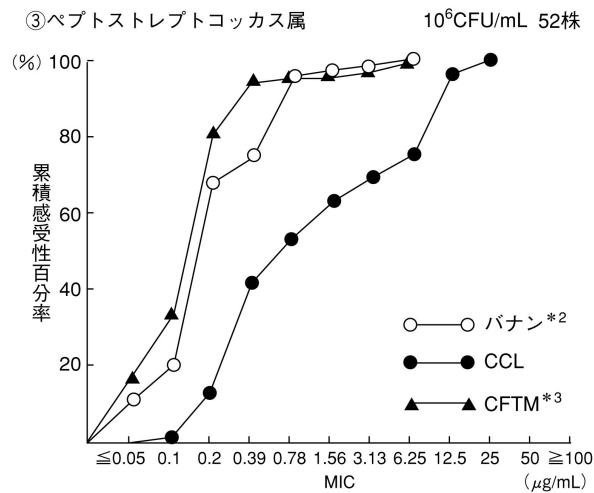
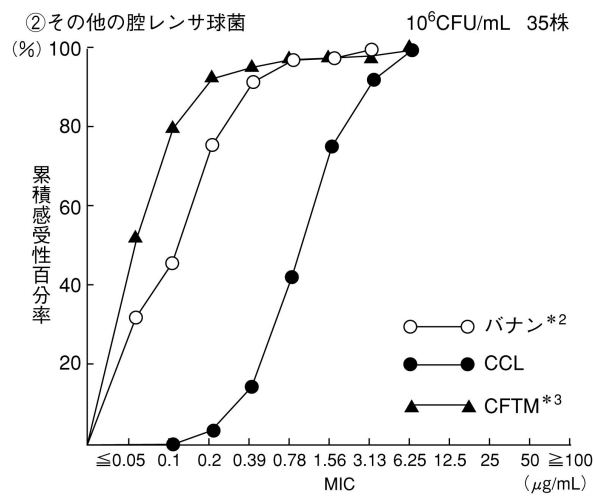
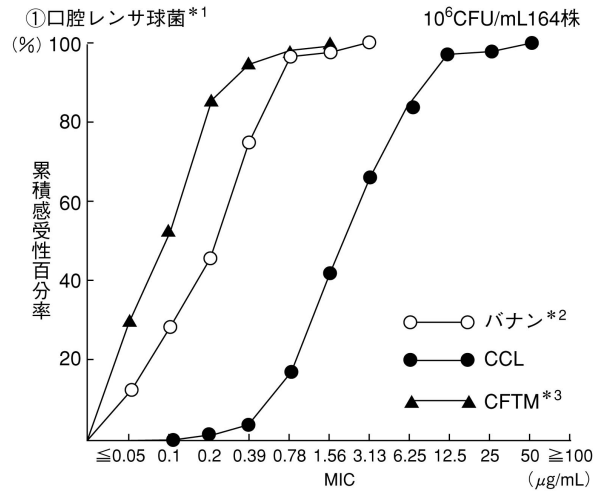
(10^6CFU/mL)

** 肺炎球菌を除く

(社内集計)

ここに示す成績は製造承認時の適応症・適応菌種に関するものであり、平成16年(2004年)の抗菌薬再評価結果を踏まえたものではありません。

4) 歯科・口腔外科領域感染症の各種起炎菌に対する抗菌力^{3,4)}



*1 *S. anginosus, S. constellatus, S. intermedius, S. milleri, S. mitis, S. mitans, S. oralis, S. salivarius, S. sanguis*
 *2 抗菌活性体セフポドキムにて測定
 *3 CFTM-PIの抗菌活性体

[佐々木次郎ほか：歯科薬物療法12(1):17(1993)
 佐々木次郎ほか：歯科薬物療法15(2):90(1996)を中心に集計]

5) 生体防御機構との協力作用 (*in vitro*)^{16,17)}

セフポドキシムは大腸菌に対しては、血清・補体、白血球と、また、黄色ブドウ球菌及び大腸菌に対しては、マウス培養マクロファージと協力的殺菌作用を示した。

(3)作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1)治療上有効な血中濃度

感染部位、起炎菌の感受性により異なる。

「VI.2.(2)薬効を裏付ける試験成績」、「VII.4.(5)その他の組織への移行性」参照。

(2)最高血中濃度到達時間

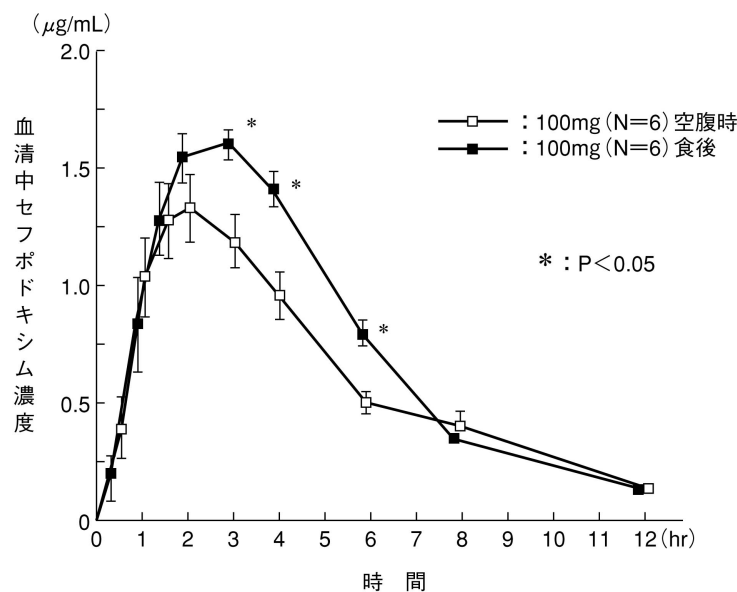
健康成人に本剤 1錠 (100mg (力価)) 及び 2錠 (200mg (力価)) を食後単回経口投与した時のセフトキシム (抗菌活性体) の最高血清中濃度は投与後 3~4 時間で得られ、それぞれ $1.5\sim 1.8\mu\text{g}/\text{mL}$ 、 $3.0\sim 3.6\mu\text{g}/\text{mL}$ の濃度を示し、dose response が認められている。血清中濃度の半減期は投与量に依存せず一定で、約 2 時間である。また、空腹時より食後投与の方が吸収は良好である^{5,26-29)}。

(3)臨床試験で確認された血中濃度

1) 健康成人

①単回投与

100mg 単回投与を軽い朝食後 30 分と空腹時について同一被験者を用いて調べた結果、食後投与の方が血中濃度は高く、 C_{max} は空腹時 $1.3\mu\text{g}/\text{mL}$ 、食後 $1.7\mu\text{g}/\text{mL}$ であった⁵⁾。



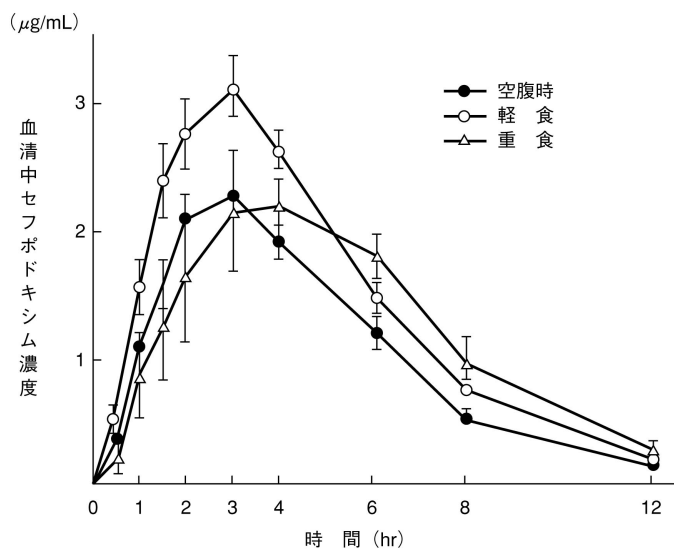
	C_{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T_{max} (hr)	AUC(0-12) ($\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$)	$t_{1/2}$ (hr)	尿中回収率 (%)
空腹時	1.3 ± 0.1	2.3 ± 0.2	7.2 ± 0.9	2.5 ± 0.2	33.7 ± 3.8
食後	1.7 ± 0.1	2.7 ± 0.3	8.7 ± 0.3	1.8 ± 0.1	$50.8 \pm 1.8^{**}$

** : $P < 0.01$ (n=6 : mean \pm SE)

健康成人における 100mg 経口投与時 (単回投与) の血清中濃度

VII. 薬物動態に関する項目

健康成人男子 6 例に本剤 200mg を空腹時又は軽食 30 分後に経口投与した。空腹時にくらべ、軽食により血中セフポドキシム濃度は高値を示した²⁶⁾。



(N=6、クロスオーバー法)

投与時期	C _{max} (µg/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)	AUC(0-12) (µg · hr/mL)
空 腹	2.1±0.5	2.7±0.4	1.8±0.2	12.5±1.8
軽 食	3.0±0.6*	2.6±0.3	1.8±0.3	16.9±3.1*
重 食	2.7±0.5	3.5±1.3	1.9±0.4	14.8±2.9

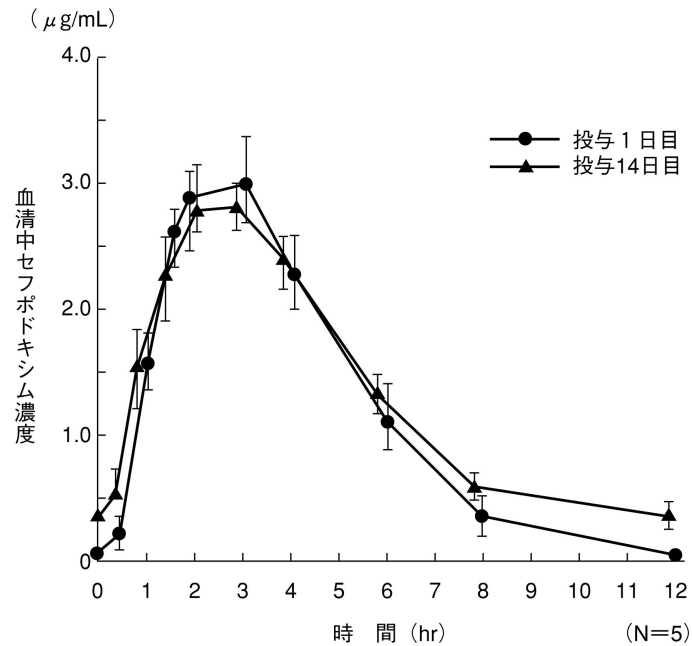
*P<0.05 (空腹時との比較)

(mean±SD)

健康成人における 200mg 経口投与時 (単回投与) の血清中濃度

②連続投与

健康成人男子 5 例に食後 30 分、本剤 200mg を 1 日 2 回、14 日間連続投与したときの血中濃度について検討した。投与 1 日目と 14 日目ではほぼ同様な結果を得たことから、蓄積性はないと考えられた⁵⁾。



投与回数 (日)	例数	C _{max} (μg/mL)	T _{max} (hr)	AUC(0-12) (μg · hr/mL)	t _{1/2} (hr)	尿中回収率 (%)
1	5	3.1 ± 0.4	2.6 ± 0.2	14.3 ± 2.2	2.0 ± 0.2	40.6 ± 4.2
14		3.0 ± 0.2	2.6 ± 0.6	15.8 ± 1.2	1.8 ± 0.2	41.2 ± 1.8

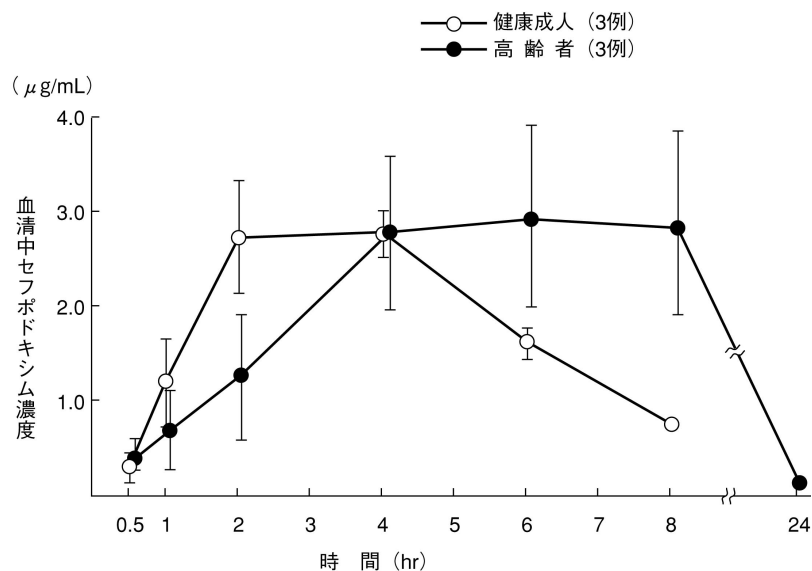
(mean ± SE)

健康成人における 200mg 経口投与時 (連続投与) の血清中濃度

2) 高齢者

平均年齢 32.7 歳の健康成人男子 3 例と重篤な基礎疾患のない平均 82.7 歳の高齢者 3 例（男性 1、女性 2 例）に本剤 200mg を食後 30 分に経口投与した。高齢者 3 例での平均血清中濃度推移は、投与 1 時間後で $0.68 \pm 0.43 \mu\text{g/mL}$ 、6 時間後にピークとなり、 $2.93 \pm 0.98 \mu\text{g/mL}$ 、8 時間後に $2.89 \pm 0.99 \mu\text{g/mL}$ 、24 時間後は 1 例が測定限界以下となり、 $0.14 \pm 0.07 \mu\text{g/mL}$ となった。

$t_{1/2}$ は平均 3.3 時間、AUC は平均 $41.14 \mu\text{g} \cdot \text{hr/mL}$ であった³⁰⁾。

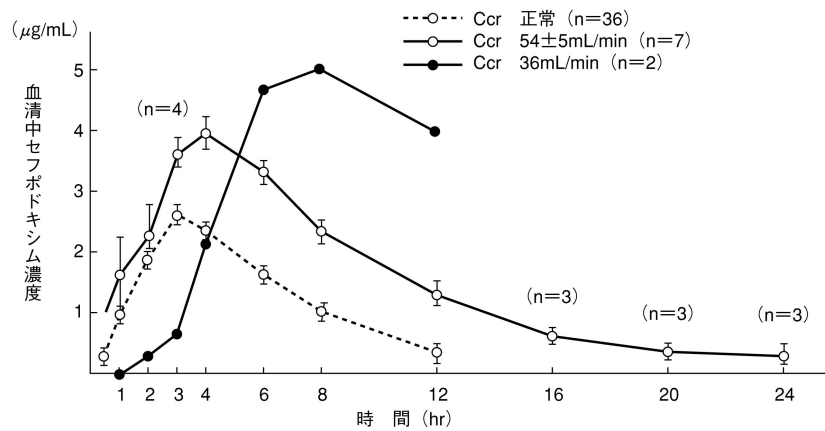


投与対象	例数	年齢	C_{\max} ($\mu\text{g/mL}$)	$t_{1/2}$ (hr)	AUC(0-12) ($\mu\text{g} \cdot \text{hr/mL}$)
健康成人	3	32.7	3.0	1.6	20.6
高齢者	3	82.7	3.3	3.3	41.1

高齢者における 200mg 経口投与時の血清中濃度

3) 腎障害患者

軽度腎機能障害患者及び中等度腎機能障害患者に本剤 200mg を食後 30 分に経口投与した時、腎機能の低下に伴い、 C_{max} の増加、 T_{max} の延長、 $AUC(0-12)$ の増加が認められた³¹⁾。



投与対象	例数	Ccr ^{注)} (mL/min)	C_{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)	$AUC(0-12)$ ($\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$)
健康成人	36	—	2.96 ± 0.11	3.2 ± 0.1	2.1 ± 0.1	15.51 ± 0.55
軽度障害	7	54 ± 5	$3.92 \pm 0.28^{**}$	3.7 ± 0.3	$3.6 \pm 0.4^{**}$	$28.34 \pm 2.16^{**}$
中等度障害	2	36	4.81	7	3.4	34.03

注) クレアチニンクリアランス ** $P < 0.01$ (健康成人との比較) (mean \pm SE)

腎機能障害患者に 200mg 食後投与時の血清中濃度

(4)中毒域

該当資料なし

(5)食事・併用薬の影響

「VII.1. (3) 1) ①単回投与」参照

(6)母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1)解析方法

コンパートメントモデル

One-compartment open model⁵⁾

(2)吸収速度定数

$K_a = 0.75 \pm 0.09 \text{ hr}^{-1}$ (mean \pm SE、 $n=6$)

(健康成人 200mg、食後 1 回投与)³²⁾

(3)バイオアベイラビリティ

$AUC : 8.7 \pm 0.3 \mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ (mean \pm SE、 $n=6$)

(健康成人 100mg、食後 1 回投与)⁵⁾

$15.2 \pm 1.8 \mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ (mean \pm SE、 $n=6$)

(健康成人 200mg、食後 1 回投与)⁵⁾

＜参考：外国人データ＞

絶対的バイオアベイラビリティ：50%

(健康成人にセフポドキシムとして 100mg を空腹時 1 回経口投与) ³³⁾

(4)消失速度定数

$Ke=0.37\pm 0.02\text{hr}^{-1}$ (mean \pm SE、n=6)

(健康成人 200mg、食後 1 回投与) ³²⁾

(5)クリアランス

該当資料なし

＜参考：外国人データ＞

全身クリアランス：9.88 \pm 0.39L/hr (健康成人にセフポドキシムとして 100mg を空腹時 1 回静脈内投与) ³³⁾

(6)分布容積

該当資料なし

＜参考：外国人データ＞

32.3 \pm 1.6L

(健康成人にセフポドキシムとして 100mg を空腹時 1 回静脈内投与) ³³⁾

(7)血漿蛋白結合率

血清蛋白結合率 (限外濾過法)

ヒトに、200mg 経口投与して、0.5 時間～12 時間後の血清蛋白結合率は経過時間に関係なく約 30%であった。

(限外濾過法) ⁵⁾

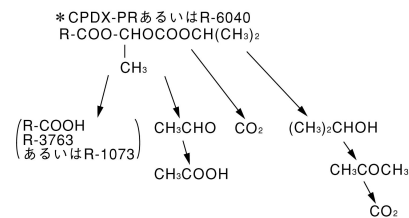
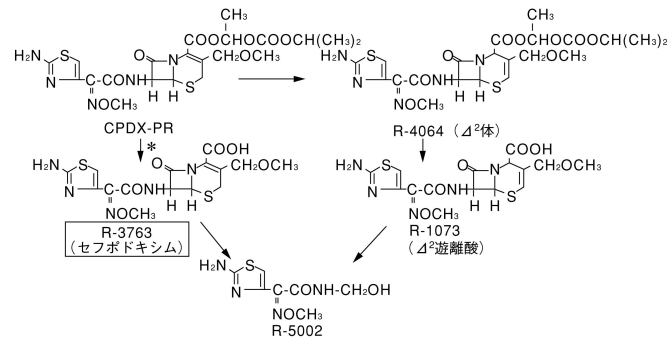
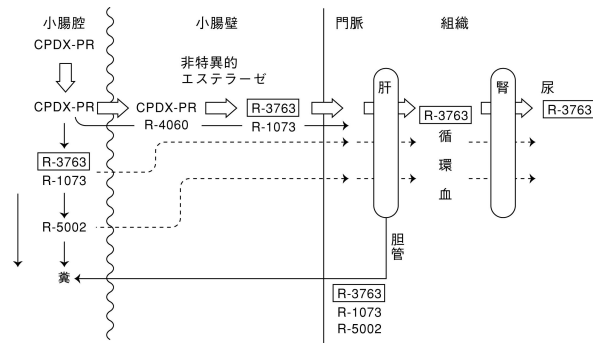
3. 吸 収

本剤は内服後、腸管より吸収される。

＜参考：動物データ＞

吸収及び代謝経路

セフポドキシム プロキシセチルは経口投与後、腸管壁の非特異的エステラーゼにより速やかに加水分解され、セフポドキシム (R-3763) として吸収された後全身に分布する。血液、尿にはセフポドキシム プロキシセチルは存在しない。未吸収のセフポドキシム プロキシセチルは腸内細菌によって代謝・分解され、セフポドキシムあるいは代謝物の R-1073 や R-5002 等として糞中に排出される ³⁴⁾。なお、ヒトの尿中主代謝物はセフポドキシムであり、R-5002 が投与量の 1%以下で検出される ⁵⁾。



推定代謝経過

4. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

<参考：動物データ>

ラットに ^{14}C -CPDX-PR を 13mg/kg 経口投与し、48 時間まで経時的に組織を採取して組織内放射能を測定した。消化管を除く組織内濃度は投与後急速に上昇し、投与 1 時間後にピーク値に達した。消化管以外で最大濃度を示したのは腎であり、血漿、肝、肺がこれに次ぐ濃度を示した。以後、血漿では半減期 1.9 時間で減少し、24 時間にはピーク時の 1% にまで低下し、他の組織でもほぼ同様の減少を示した。大脳ははじめ中枢組織への移行は低かった³⁴⁾。

VII. 薬物動態に関する項目

¹⁴C-CPDX-PR13mg/kg 経口投与後のラット組織内濃度 (n=4)

組 織	濃度 (μg/mL or g) a)							
	0.5hr	1hr b)	2hr	4hr	6hr	10hr	24hr	48hr
血 液	3.90±0.68	4.08±0.87	3.29±0.47	1.47±0.24	0.62±0.25	0.07±0.01	0.07±0.02	0.01±0.00
血 漿	7.40±1.36	8.07±2.49	5.93±0.92	2.78±0.45	1.14±0.41	0.10±0.01	0.07±0.01	0.02±0.01
脳	0.18±0.04	0.14±0.03	0.10±0.01	0.05±0.01	0.03±0.01	0.02±0.01	<0.01	<0.01
眼 球	1.05±0.24	0.80±0.11	0.66±0.11	0.46±0.14	0.32±0.17	0.09±0.02	0.04±0.01	0.02±0.01
唾 液 腺	1.75±0.36	1.80±0.40	1.57±0.49	0.71±0.14	0.54±0.22	0.06±0.01	0.04±0.01	<0.01
甲 状 腺	2.21±0.43	1.82±0.33	1.50±0.22	0.66±0.07	0.64±0.16	0.28±0.06	0.10±0.03	0.08±0.05
心 臓	1.01±0.18	1.21±0.30	0.88±0.16	0.43±0.05	0.18±0.07	0.04±0.00	0.03±0.01	0.01±0.00
胸 腺	0.48±0.09	0.56±0.15	0.48±0.07	0.22±0.03	0.13±0.04	0.09±0.05	0.03±0.01	0.02±0.00
肺	1.92±0.36	2.39±0.77	2.02±0.38	0.92±0.08	0.38±0.12	0.09±0.02	0.05±0.01	0.04±0.00
肝 臓	4.30±0.86	4.31±1.42	2.46±0.39	1.54±0.22	0.71±0.15	0.23±0.03	0.12±0.02	0.06±0.00
膵 臓	0.91±0.17	1.25±0.34	0.98±0.05	0.42±0.04	0.41±0.17	0.05±0.01	0.03±0.01	<0.01
脾 臓	0.62±0.11	0.50±0.11	0.39±0.04	0.21±0.04	0.16±0.05	0.05±0.01	0.03±0.01	0.01±0.00
胃	60.57±5.47	26.28±3.77	16.12±5.20	4.83±1.07	1.38±0.47	0.29±0.04	0.13±0.06	0.03±0.01
小 腸	116.98±21.40	59.63±6.63	40.43±4.67	15.41±6.84	2.56±1.79	0.15±0.03	0.11±0.06	<0.01
十二指腸	150.56±17.76	75.65±8.72	59.85±31.39	23.45±11.47	2.90±1.91	0.18±0.06	0.09±0.05	0.01±0.00
大 腸	4.12±2.90	1.51±0.51	0.88±0.15	1.34±0.81	2.92±1.51	2.00±0.31	0.19±0.03	0.06±0.02
盲 腸	1.69±0.47	2.13±0.05	2.04±0.76	5.43±1.96	5.95±1.01	10.81±6.60	0.85±0.26	0.24±0.10
腎臓(右)	9.09±1.39	9.86±2.05	8.08±1.29	4.25±0.86	1.83±0.88	0.33±0.04	0.17±0.04	0.08±0.01
腎臓(左)	9.50±1.53	10.21±2.31	8.02±1.04	4.63±1.04	1.77±0.83	0.32±0.04	0.19±0.04	0.08±0.00
副 腎	1.77±0.35	1.45±0.30	0.95±0.12	0.71±0.11	0.58±0.16	0.43±0.03	0.16±0.05	0.08±0.03
白色脂肪	0.62±0.10	0.73±0.22	0.57±0.11	0.27±0.03	0.15±0.05	0.08±0.05	<0.01	<0.01
精巣(右)	0.44±0.08	0.79±0.16	0.64±0.10	0.37±0.11	0.15±0.06	0.05±0.01	0.01±0.00	<0.01
精巣(左)	0.47±0.10	0.69±0.19	0.63±0.10	0.28±0.04	0.17±0.04	0.03±0.00	0.01±0.00	<0.01
骨 格 筋	0.84±0.15	0.76±0.24	0.75±0.19	0.36±0.07	0.18±0.10	0.08±0.01	0.02±0.01	<0.01
リンパ節	1.72±0.16	0.96±0.14	1.01±0.09	0.45±0.10	0.34±0.14	0.18±0.05	0.14±0.05	0.04±0.02

a) 数値はセフポドキシム換算量 (mean±SE) b) n=3

(2)血液—胎盤関門通過性

該当資料なし

<参考：動物データ>

妊娠 18 日目ラットに ¹⁴C-CPDX-PR (セフポドキシムとして 10mg/kg) を経口投与した結果、投与後 2 時間における全胎児及び胎児組織 (血液、脳、心、肺、肝、腎) はいずれも母体血漿中濃度 5.72μg/mL (セフポドキシム換算) の 1~5%であった。投与後 48 時間には全胎児及び胎児組織とも投与後 2 時間の濃度の 27%以下、あるいは検出限界以下となった³⁵⁾。

(3)乳汁への移行性

産婦人科疾患の授乳婦 3 例に本剤 200mg を単回経口投与した結果、乳汁中への移行は投与後 2 時間まで認められず、4～6 時間で 3 例中 2 例に 0.05～0.13 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 認められた³⁶⁾。

症例	血清中濃度 ($\mu\text{g}/\text{mL}$)				乳汁中濃度 ($\mu\text{g}/\text{mL}$)			
	1 hr	2 hr	4 hr	6 hr	1 hr	2 hr	4 hr	6 hr
1	0.35	1.42	1.90	0.79	N.D.	N.D.	0.12	0.13
2	0.70	2.12	2.11	1.12	N.D.	N.D.	0.05	0.10
3	1.45	2.79	2.22	1.50	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.

N.D.:Not detected

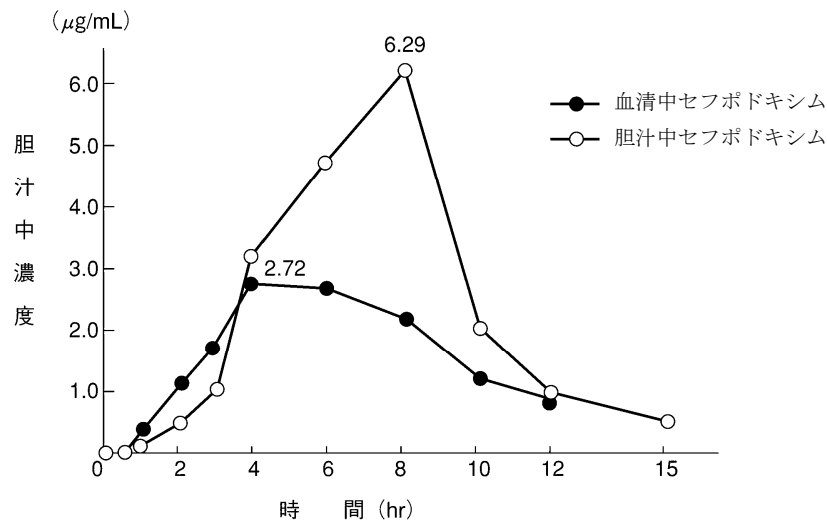
(4)髄液への移行性

該当資料なし

(5)その他の組織への移行性

1) 胆汁中濃度³⁷⁻⁴⁰⁾

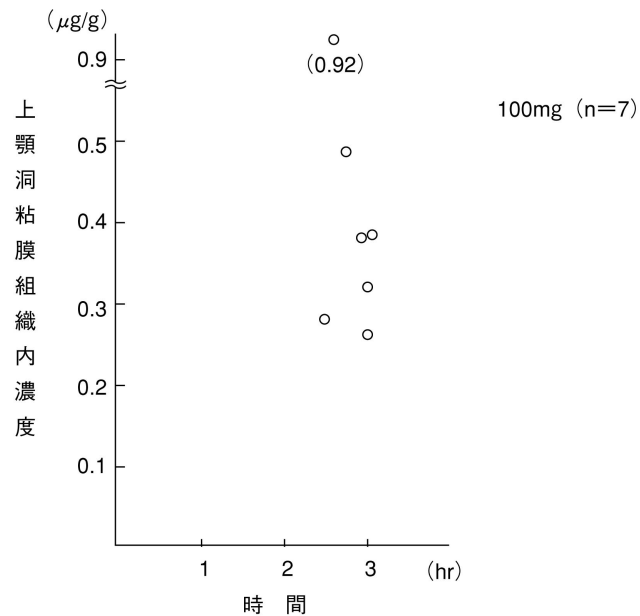
T-チューブ施行 18 例に本剤 200mg を食後 1 回経口投与した時の血清中セフポドキシム濃度は、投与 4 時間後に最高値 2.72 $\mu\text{g}/\text{mL}$ を示したのに対し、胆汁中濃度は投与 6～8 時間後に最高値 6.29 $\mu\text{g}/\text{mL}$ と良好な胆汁移行性を示した。



(社内集計)

4) 上顎洞粘膜組織内濃度^{44~46)}

耳鼻咽喉科感染症で手術施行患者 7 例に本剤 100mg を術前経口投与した時の上顎洞粘膜組織内濃度を検討した。150 分から 180 分の組織内セフトキシム濃度は 0.26~0.92 $\mu\text{g/g}$ であり、上顎洞粘膜組織内濃度/血清中濃度比は 17.8~71.7%であった。

5) 耳鼻・口腔組織内濃度^{44,46)}

鼻茸切除術施行患者 4 例及び耳鼻咽喉科感染症で手術を施行した 4 例に、術前本剤 100mg 又は 200mg を経口投与した時の血清中及び組織内セフトキシム濃度を検討した。100mg 投与後 120 分又は 150 分の血清中濃度は 1.03~4.59 (平均 3.14) $\mu\text{g/mL}$ であり、鼻茸中濃度は 0.34~3.28 (平均 1.41) $\mu\text{g/g}$ であった。また 200mg 投与後 120 分の血清中濃度は 0.14~2.08 $\mu\text{g/mL}$ 、組織内濃度は 0.14~0.34 $\mu\text{g/g}$ であった。

用量	症例	投与後時間	血清中濃度 ($\mu\text{m/mL}$)	組織内濃度 ($\mu\text{g/g}$)	組織内濃度/血清中濃度 (%)
100mg	1	120 分	1.03	鼻 茸 0.34	33.0
	2	"	3.84	" 3.28	85.4
	3	150 分	4.59	" 0.58	12.6
	4	"	3.08	" 1.42	46.1
	平均		3.14	" 1.41	44.3
200mg	1	120 分	1.44	中耳粘膜 < 0.078	—
	2	"	0.14	" "	—
	3	"	0.52	顎下腺 0.14	26.9
	4	"	2.08	下甲介粘膜 0.34	16.3

6) 前立腺組織内濃度^{47,48)}

前立腺肥大症患者に前立腺摘出術前に本剤 200mg を単回ならびに連続投与した時の前立腺組織内セフポドキシム濃度を検討した。単回投与 2 時間後の組織内濃度は 0.20~2.01 (平均 0.60) $\mu\text{g/g}$ 、対血清の百分率は 26~113%であった。また 4 日間の連続投与最終服用後 13~18 時間後の組織内セフポドキシム濃度は 0.1~0.66 (平均 0.37) $\mu\text{g/g}$ であった。

用量	症例	セフポドキシム濃度			前立腺組織内濃度/ 血清中濃度 (%)	
		血清中 ($\mu\text{g/mL}$)	前立腺組織 ($\mu\text{g/g}$)		右	左
			右	左		
単回投与 200mg	1	1.29	0.34	2.01	26	156
	2	1.37	0.65	0.57	47	42
	3	0.53	0.22	0.22	42	42
	4	0.43	0.20	0.24	47	56
	5	0.71	0.80	0.76	113	107
	平均	0.87 \pm 0.20	0.60	\pm 0.17	68	\pm 14
連続投与 200mg \times 2/日 4日間(最終日 3回)	1	NT	0.38			
	2		0.1			
	3		0.38, 0.66			
	4		0.34			
	平均	0.37				

NT:Not tested

7) 前立腺液中濃度⁴⁷⁾

慢性前立腺炎の患者に本剤 200mg \times 2/日を連続投与し、1 週及び 2 週目の前立腺液へのセフポドキシムの移行を検討した。1 週目は 1.09~1.60 $\mu\text{g/mL}$ 、2 週目は 1.17 $\mu\text{g/mL}$ であった。なお測定は服用後 2~3 時間に行った。

用量	症例	前立腺液中濃度 ($\mu\text{g/mL}$)	
		1 週目	2 週目
200mg \times 2/日	1	1.60	1.17
	2 ^{a)}	1.29	
	3 ^{a)}	1.09	
平均		1.33	1.17

a) 精液の初期分画で代用

8) 皮膚組織内濃度⁴⁹⁾

皮膚疾患患者（切除手術を必要とする者）11例に本剤 100mg を単回経口投与した時の皮膚組織内及び血清中セフポドキシム濃度を検討した。

投与後 2～4 時間における皮膚組織内濃度は 0.08～0.68（平均 0.31） $\mu\text{g/g}$ 、その時の血清中濃度は 0.05～2.85（平均 1.55） $\mu\text{g/mL}$ であり、皮膚組織/血清中の濃度比は 6～34（平均 19）%であった。

症例	セフポドキシム濃度		皮膚組織内濃度/血清中濃度 (%)
	血清中 ($\mu\text{g/mL}$)	皮膚組織 ($\mu\text{g/g}$)	
1	0.05	N.D.	-
2	2.15	0.15	7
3	0.86	0.08	9
4	1.92	0.24	13
5	0.52	0.18	34
6	1.74	0.10	6
7	2.85	0.68	24
8	1.61	0.28	17
9	1.49	0.31	21
10	1.50	0.46	31
11	2.34	0.58	25
平均	1.55	0.28	17

N.D. : Not detected

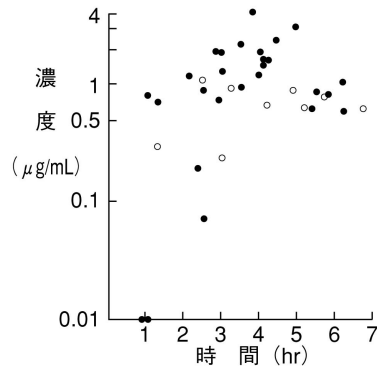
9) 子宮・子宮付属器組織内移行^{36,50,51)}

子宮筋腫で子宮全摘出術施行患者 28 例に術前本剤 100mg あるいは 200mg を単回投与した時の血清中ならびに子宮・子宮付属器組織内セフポドキシム濃度を検討した。子宮動脈血の血清中濃度は 100mg 投与で 0.17～0.94 $\mu\text{g/mL}$ 、200mg 投与では投与初期の N.D.（測定限界以下）を除くと 0.06～3.07 $\mu\text{g/mL}$ 、肘静脈血清中濃度は 100mg 投与で 0.24～1.09 $\mu\text{g/mL}$ 、200mg 投与では投与初期の N.D.を除くと 0.07～3.99 $\mu\text{g/mL}$ と動・静脈血同程度の濃度を示した。組織内には 100mg 投与で 0.12～0.42 $\mu\text{g/g}$ 、200mg 投与で N.D.～1.34 $\mu\text{g/g}$ のセフポドキシム濃度を認めた。

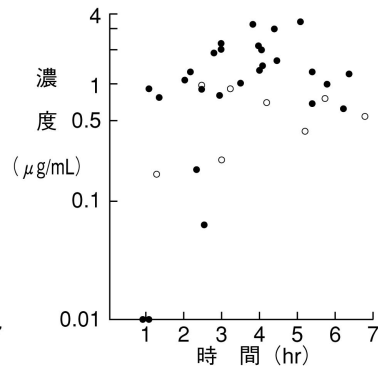
VII. 薬物動態に関する項目

○ : 100mg ● : 200mg

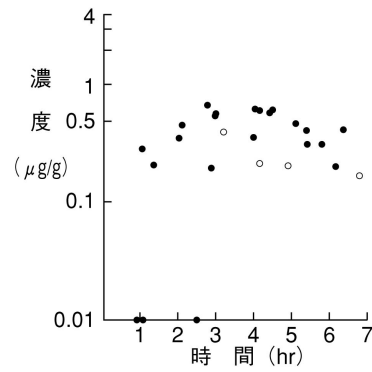
1) 末梢血 (100mg:9例,200mg:27例)



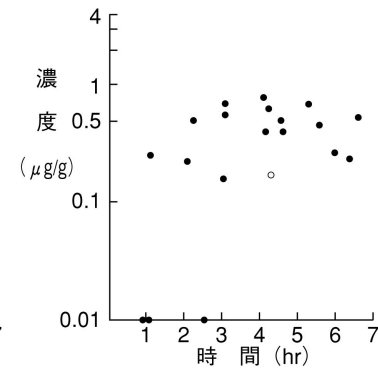
2) 子宮動脈血 (100mg:8例,200mg:27例)



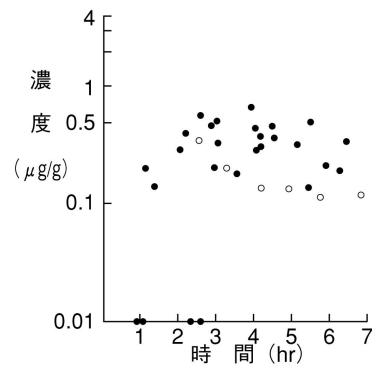
3) 卵管 (100mg:4例,200mg:22例)



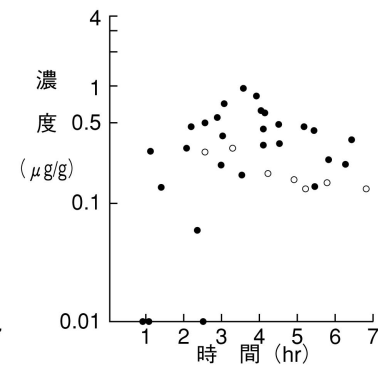
4) 卵巣 (100mg:1例,200mg:19例)



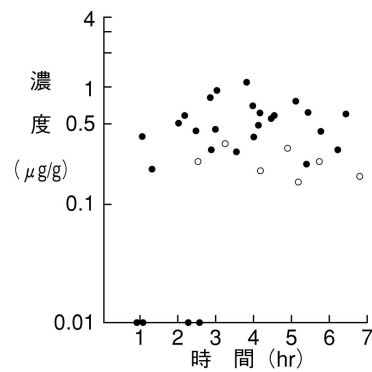
5) 子宮内膜 (100mg:6例,200mg:27例)



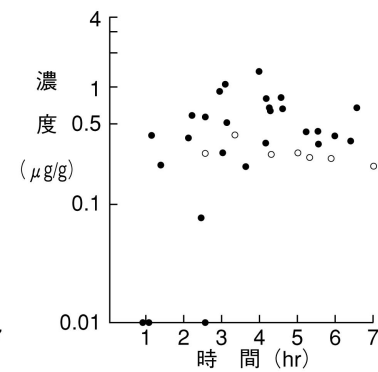
6) 子宮筋層 (100mg:7例,200mg:28例)



7) 子宮頸部 (100mg:7例,200mg:27例)



8) 子宮腔部 (100mg:7例,200mg:27例)



10) 抜歯創・口腔組織への移行⁵²⁾

抜歯創内濃度は 225 例で検討され、本剤 200mg 投与の 207 例では、投与 135～300 分において 0.78 μ g/mL 以上の濃度を示した症例は 82.8%であった。

項目	投与量 (mg)	検体数	最高値 (μ g/mL)	$\geq 0.39\mu$ g/mL の頻度 (%)	$\geq 0.78\mu$ g/mL の頻度 (%)	投与から採血までの時間
血清中濃度	100	8	2.15	100.0	87.5	180～245 分
	200	59	5.87	94.9	89.8	60～360 分
抜歯創内濃度	100	6	1.35	83.3*	50.0	150～300 分
	200	87	5.32	89.7	82.8	135～300 分

*：投与後 150～300 分間に採血した検体のうち、CPDX 濃度が 0.39 μ g/mL 以上の検体の割合 (%)。他も同様の意味

各組織内濃度を 200mg 投与例についてみると、歯肉の 23 例では最高 2.20 μ g/g、非検出例を除いた平均は 1.17 \pm 0.43 μ g/g であり、歯槽骨の 28 例では最高 1.07 μ g/g、平均は 0.57 \pm 0.24 μ g/g であり、歯小囊の 15 例では最高 2.04 μ g/g、平均は 0.97 \pm 0.54 μ g/g 及び嚢胞壁の 13 例では最高 1.77 μ g/g、平均は 0.96 \pm 0.62 μ g/g であった。

項目	投与量 (mg)	検体数 (検出例) *1	投与から組織採取までの時間	組織濃度 (μ g/g)		移行率 (%) (平均 \pm SD)
				最高値	平均 \pm SD*	
歯肉	100	3 (3)	180～210 分	0.97	0.79 \pm 0.26	—
	200	23 (21)	120～360 分	2.20	1.17 \pm 0.43	47.3 \pm 11.6
歯小囊	100	4 (4)	180～225 分	0.91	0.74 \pm 0.19	—
	200	15 (13)	85～235 分	2.04	0.97 \pm 0.54	37.5 \pm 11.4
嚢胞壁	100	3 (2)	195～210 分	0.78	0.60 \pm 0.26	—
	200	13 (11)	80～270 分	1.77	0.96 \pm 0.62	37.6 \pm 15.3**
歯槽骨	100	1 (1)	180 分	1.07	0.26	—
	200	28 (15)	70～220 分	1.07	0.57 \pm 0.24	17.7 \pm 5.5

*1：CPDX が検出できた検体数

*：検出例の平均

**：採血より組織採取が遅れた 1 例を除く

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

「VII.3.吸収」参照

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

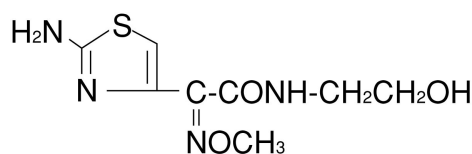
該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

本剤はプロドラッグであり、腸管吸収時に変換されるセフポドキシムが活性体である。

<参考：動物データ>

尿中における主要な代謝物はセフポドキシムである。投与量の約 3% の割合で代謝物 R-5002 が検出されたが R-5002 に薬理作用は認められない (ラット)³⁴⁾。



R-5002

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

「VII.2.薬物速度論的パラメータ」参照

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

腎を介して尿中に排泄される。

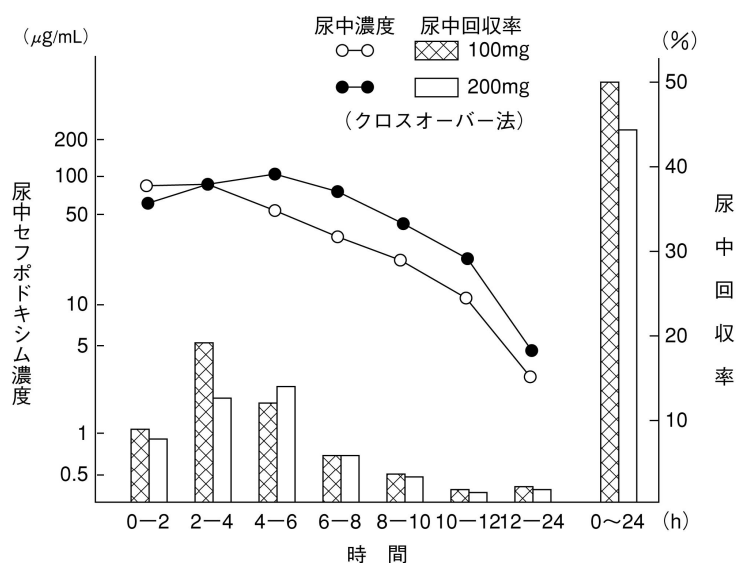
(2) 排泄率

「VII.6.(3)排泄速度」参照

(3) 排泄速度

1) 健康成人

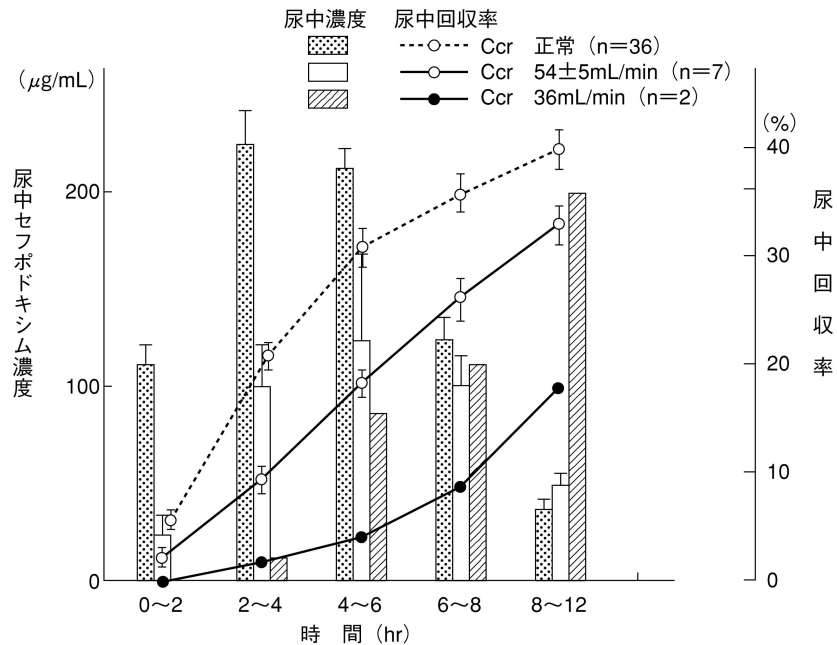
健康成人 6 例に 100mg 又は 200mg を食後 1 回経口投与した時の 24 時間までの尿中回収率はそれぞれ 50.8%、44.5%であった⁵⁾。



100mg 又は 200mg 食後投与時の尿中セフポドキシム濃度及び尿中回収率

2) 腎障害患者

腎機能障害患者に本剤 200mg を食後 30 分に経口投与した。尿中濃度は軽度腎機能障害患者群 (Ccr=54 ±5mL/min) では 4~6 時間でピークを示し、12 時間までの尿中回収率は 33.8±3.8%であった。また中等度腎機能障害患者群 (Ccr=36mL/min) では 8~12 時間でピークを示し、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³¹⁾。



腎機能障害患者にバナン 200mg 食後投与時の尿中セフポドキシム濃度及び尿中回収率

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

(1) 腹膜透析

該当資料なし

<参考：外国人データ>

セフポドキシムとして 200mg を経口投与した時、透析液中に 5.74%±3.1%回収されると報告されている⁵³⁾。

(2) 血液透析

該当資料なし

<参考：外国人データ>

2.86±0.25 時間の透析により 22.4±2.9%除去される⁵⁴⁾。また、セフポドキシムとして 200mg を経口投与後、6 時間目から 4 時間透析することにより、AUC が 43%減少すると報告されている⁵⁵⁾。

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

該当しない

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

【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

解説：β-ラクタム系抗生物質の一般的注意事項

【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）

セフェム系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者

解説：β-ラクタム系抗生物質の一般的注意事項

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

「V.1.効能又は効果」参照

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「V.2.用法及び用量」参照

5. 慎重投与内容とその理由

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ししやすい体質を有する患者

(3) 高度の腎障害のある患者〔本剤は腎排泄型の抗生物質のため排泄遅延が起こる。〕（「用法・用量に関連する使用上の注意」及び「薬物動態」の項参照）

(4) 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〔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）

解説：(1)～(5) 経口用セフェム系抗生物質の一般的注意事項

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

2. 重要な基本的注意

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。

解説：経口用セフェム系抗生物質に共通した注意事項

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2)併用注意とその理由

3. 相互作用

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。

解説：アルミニウム又はマグネシウム含有の制酸剤との併用により、本剤の吸収が阻害され、本剤の効果が減弱するとの報告がある^{56,57)}。

8. 副作用

(1)副作用の概要

4. 副作用（本項には頻度が算出できない副作用報告を含む。）

総症例 12,615 例中副作用の報告されたものは 317 例（2.51%）であった。その主なものは消化器症状（下痢・軟便：0.40%、胃部不快感：0.10%、嘔気・悪心・嘔吐：0.09%）等であった。

〔再審査終了時及び効能追加時〕

(2)重大な副作用と初期症状

4. 副作用（本項には頻度が算出できない副作用報告を含む。）

(1)重大な副作用（頻度不明）

- 1) ショック、アナフィラキシー：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、眩暈、便意、耳鳴、発汗、発疹等）を起こす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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) 中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群：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）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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 3) 偽膜性大腸炎：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ので観察を十分に行い、異常が認めら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。
- 4) 急性腎障害：急性腎障害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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 5) 間質性肺炎、PIE 症候群：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。
- 6) 肝機能障害、黄疸：AST（GOT）、ALT（GPT）、 γ -GTP 上昇等の肝機能障害、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、投与を中止し適切な処置を行うこと。
- 7) 血小板減少：血小板減少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) 汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血：他のセフェム系抗生物質で、汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血があらわれるとの報告がある。
- 2) 痙攣：他のセフェム系抗生物質で、腎不全の患者に大量投与すると痙攣等の神経症状を起こすとの報告がある。

(3)その他の副作用

4. 副作用（本項には頻度が算出できない副作用報告を含む。）

(3) その他の副作用

	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹	蕁麻疹、紅斑、そう痒、 発熱	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 (GOT) 上昇、 ALT (GPT) 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・嘔吐、軟便、胃痛、 腹痛、食欲不振、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）
その他		めまい、頭痛、浮腫	しびれ感

注) 投与を中止し適切な処置を行うこと。

(4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

再評価時の集計結果は以下の表のとおりである。

	歯科・口腔 外科効能 追加承認 時の調査	承認時迄 の調査	使用成績 調査	合計
調査症例数	320例	3,650例	8,645例	12,615例
副作用発現症例数	21例	241例	55例	317例
副作用発現率	6.56%	6.60%	0.64%	2.51%
副作用の種類	副作用の種類別発現件数 (%)			
〔皮膚・皮膚付属器障害〕				
発疹・皮疹	1 (0.31)	12 (0.33)	5 (0.06)	18 (0.14)
そう痒感・かゆみ	0	3 (0.08)	1 (0.01)	4 (0.03)
蕁麻疹	0	0	1 (0.01)	1 (0.01)
紅斑	0	0	1 (0.01)	1 (0.01)
〔中枢・末梢神経系障害〕				
めまい	1 (0.31)	1 (0.03)	1 (0.01)	3 (0.02)
頭痛	0	1 (0.03)	1 (0.01)	2 (0.02)
舌のしびれ感	0	1 (0.03)	0	1 (0.01)
〔消化管障害〕				
下痢	1 (0.31)	27 (0.74)	11 (0.13)	39 (0.31)
嘔気・悪心	1 (0.31)	15 (0.41)	1 (0.01)	17 (0.14)
胃部不快感	0	8 (0.22)	5 (0.06)	13 (0.10)
軟便	0	11 (0.30)	0	11 (0.09)
胃痛	1 (0.31)	5 (0.14)	2 (0.02)	8 (0.06)
食欲不振	0	6 (0.16)	1 (0.01)	7 (0.06)
胃重感・胃もたれ感	0	3 (0.08)	1 (0.01)	4 (0.03)
胸やけ	0	2 (0.06)	2 (0.02)	4 (0.03)
嘔吐	1 (0.31)	2 (0.06)	1 (0.01)	4 (0.03)
便秘	1 (0.31)	2 (0.06)	1 (0.01)	4 (0.03)
腹痛	0	3 (0.08)	0	3 (0.02)
舌炎	0	1 (0.03)	2 (0.02)	3 (0.02)
口内炎	0	1 (0.03)	2 (0.02)	3 (0.02)
その他	0	4 (0.11)	4 (0.05)	8 (0.06)
〔肝臓・胆管系障害〕				
ALT (GPT) 上昇	7 (2.19)	63 (1.73)	6 (0.07)	76 (0.61)
AST (GOT) 上昇	4 (1.25)	55 (1.51)	6 (0.07)	65 (0.52)
γ-GTP 上昇	3 (0.94)	7 (0.19)	1 (0.01)	11 (0.09)
その他	0	3 (0.08)	4 (0.05)	7 (0.06)
〔代謝・栄養障害〕				
ALP 上昇	0	16 (0.44)	1 (0.01)	17 (0.14)
LDH 上昇	0	13 (0.36)	2 (0.02)	15 (0.12)
その他	0	3 (0.08)	0	3 (0.02)
〔白血球・網内系障害〕				
好酸球増多	2 (0.63)	36 (0.99)	0	38 (0.30)
白血球減少	1 (0.31)	6 (0.16)	2 (0.02)	9 (0.07)
その他	2 (0.63)	4 (0.11)	0	6 (0.05)
〔血小板・出血凝血障害〕				
血小板減少	0	2 (0.06)	0	2 (0.02)
その他	0	3 (0.08)	0	3 (0.02)
〔泌尿器系障害〕				
BUN 上昇	1 (0.31)	10 (0.27)	3 (0.04)	14 (0.11)
血清クレアチニン上昇	0	3 (0.08)	1 (0.01)	4 (0.03)
その他	0	2 (0.06)	1 (0.01)	3 (0.02)
〔その他〕				
発熱	0	2 (0.06)	1 (0.01)	3 (0.02)
浮腫	0	0	1 (0.01)	1 (0.01)
その他	0	10 (0.27)	0	10 (0.08)

〔再審査終了時及び効能追加時社内集計〕

(5)基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

患者背景別要因		症例数	副作用発現			備考 (95% 信頼区間)
			症例数	件数	症例率 (%)	
性別	男	4,131	24	30	0.58	(0.6±0.2)
	女	4,513	31	42	0.69	(0.7±0.2)
	性別記載なし	1	—	—	—	—
年齢別 1	～14歳以下	309	2	3	0.65	(0.6±0.9)
	15歳～64歳	6,020	31	37	0.52	(0.5±0.2)
	65歳以上	2,315	22	32	0.95	(1.0±0.4)
	記載なし	1	—	—	—	—
年齢別 2	～15歳以下	362	2	3	0.55	(0.6±0.8)
	16歳～29歳	1,569	2	2	0.13	※ (0.1±0.2)
	30歳～39歳	1,228	9	12	0.73	(0.7±0.5)
	40歳～49歳	1,192	5	6	0.42	(0.4±0.4)
	50歳～59歳	1,301	12	14	0.92	※ (0.9±0.5)
	60歳～69歳	1,316	13	19	0.99	※ (1.0±0.5)
	70歳～79歳	1,144	6	8	0.52	(0.5±0.4)
	80歳～96歳	532	6	8	1.13	(0.1±0.9)
記載なし	1	—	—	—	—	
入院・ 外来	入院	1,050	19	25	1.81	※ (1.8±0.8)
	外来	7,475	35	46	0.47	※ (0.5±0.2)
	入院外来	120	1	1	0.83	(0.8±1.6)
重症度	軽症	3,776	23	28	0.61	(0.6±0.2)
	中等症	4,598	27	38	0.59	(0.6±0.2)
	重症	264	5	6	1.89	(1.9±1.6)
	記載なし	7	—	—	—	—
使用理由	呼吸器感染症	4,631	34	46	0.73	(0.7±0.2)
	尿路感染症	1,472	4	5	0.27	(0.3±0.3)
	外科・浅在性化膿性疾患	1,060	5	5	0.47	(0.5±0.4)
	婦人科領域感染症	29	—	—	—	—
	耳鼻科領域感染症	487	6	8	1.23	(1.2±1.0)
	承認取得効能外症例	541	2	4	0.37	(0.4±0.5)
	複合感染症	425	4	4	0.94	(0.9±0.9)
過敏症 ・ 既往歴	無	8,446	50	64	0.59	(0.6±0.2)
	有	199	5	8	2.51	(2.5±2.2)
	セフェム系抗生物質	7	1	1	14.29	(14.3±25.9)
	ペニシリン系抗生物質	22	1	3	4.55	(4.6±8.7)
	その他	171	4	7	2.34	(2.3±2.3)
最大1日 投与量	100mg	26	1	2	3.85	(3.8±7.4)
	200mg	6,430※※	37	48	0.58	(0.6±0.2)
	300mg・400mg	2,179	16	20	0.73	(0.7±0.4)
	600mg	10	1	2	10.0	(10.0±18.6)

※有意差（有）の項 ※※150mg 投与例 2 例を含む（2 例：副作用なし） —：該当値なし

患者背景別要因		症例数	副作用発現			備考 (95% 信頼区間)
			症例数	件数	症例率 (%)	
併用薬剤 (有の内訳)	無	2,213	17	21	0.77	(0.8±0.4)
	有	6,432	38	51	0.59	(0.6±0.2)
	抗生物質製剤	612	4	6	0.65	(0.7±0.6)
	化学療法剤	54	1	2	1.85	(1.9±3.6)
	中枢神経系用薬	3,464	15	20	0.43	(0.4±0.2)
	循環器官用薬	563	1	2	0.18	(0.2±0.3)
	呼吸器官用薬	2,056	11	16	0.54	(0.5±0.3)
	消化器官用薬	1,288	12	16	0.93	(0.9±0.5)
	代謝性医薬品	151	—	—	—	—
その他	3,349	20	29	0.60	(0.6±0.3)	
併用療法 (有の内訳)	無	7,479	46	61	0.62	(0.6±0.2)
	有	1,166	9	11	0.77	(0.8±0.5)
	放射線	1	—	—	—	—
	輸血	5	1	1	20.0	(20.0±35.1)
	手術	191	1	1	0.52	(0.5±1.0)
	麻酔	2	—	—	—	—
	透析	13	1	1	7.69	(7.7±14.5)
	理学・作業	23	—	—	—	—
	食餌療法	41	—	—	—	—
	ドレナージ	354	1	1	0.28	(0.3±0.6)
	尿路カテーテル留置	96	2	2	2.08	(2.1±2.9)
	洗浄	113	2	3	1.77	(1.8±2.4)
その他	408	3	4	0.74	(0.7±0.8)	
原疾患 ・ 合併症 (有の内訳)	無	6,305	30	38	0.48	※ (0.5±0.2)
	有	2,340	25	34	1.07	(1.1±0.4)
	肝障害	184	4	6	2.17	(2.2±2.1)
	腎障害	124	7	11	5.64	※ (5.6±4.1)
	血液障害	56	1	1	1.79	(1.8±3.5)
	心臓障害	286	4	4	1.40	(1.4±1.4)
	脳器質障害	411	4	5	0.97	(1.0±0.9)
	悪性腫瘍	214	3	3	1.40	(1.4±1.6)
その他	1,644	17	23	1.03	(1.0±0.5)	
病型	急性	7,202	42	55	0.58	(0.6±0.2)
	慢性	564	4	6	0.71	(0.7±0.7)
	慢性の急性増悪	870	9	11	1.03	(1.0±0.7)
	記載なし	9	—	—	—	—

※有意差（有）の項

—：該当値なし

(6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法

【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

【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）

セフェム系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者

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しやすい体質を有する患者

2. 重要な基本的注意

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。

4. 副作用（本項には頻度が算出できない副作用報告を含む。）

(1) 重大な副作用（頻度不明）

- 1) ショック、アナフィラキシー：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、眩暈、便意、耳鳴、発汗、発疹等）を起こす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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

4. 副作用（本項には頻度が算出できない副作用報告を含む。）

(3) その他の副作用

	0.1～1%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹	蕁麻疹、紅斑、そう痒、 発熱	リンパ腺腫脹、関節痛

注) 投与を中止し適切な処置を行うこと。

9. 高齢者への投与

5. 高齢者への投与

高齢者には、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。

- (1) 高齢者では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。
- (2) 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ことがある。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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) 投薬中は授乳させないように注意すること。〔母乳中へ移行する。〕

11. 小児等への投与

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（使用経験が少ない）。

解説：小児用ドライシロップ製剤が発売されているため、本剤形に関しては使用経験が少ない。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

8. 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。

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

9. 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、更には穿孔をお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。）

15. その他の注意

該当しない

16. その他

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1)薬効薬理試験（「VI.薬効薬理に関する項目」参照）

(2)副次的薬理試験

該当資料なし

(3)安全性薬理試験⁵⁸⁾

マウス、ラット、モルモット、ウサギ、ネコ及びビヌを用いて中枢神経系、呼吸・循環器系、自律神経系、平滑筋、消化器系、泌尿器系、血液及びその他に及ぼす影響を検討した。

CPDX-PR はラットに対する 2,000mg/kg 十二指腸内投与により胃液分泌抑制を、そして同量経口投与により泌尿器系に軽度な影響（尿量の減少、Na⁺・Cl⁻の排泄減少、K⁺の排泄増加、尿浸透圧の増加）を示したのみで、その他の試験に対しては影響を及ぼさなかった。

試験項目	動物種 (系、性別、例数)	投与 経路	投与量 (mg 力価/kg)	試験成績	備考 (試験方法等)	
中枢神経系に及ぼす影響	a)一般行動	マウス (ddY, 雄, n=5)	po	25, 100, 500, 1000, 2000, 4000	4000mg/kg まで 影響なし	Irwin 法
		ラット (SD, 雄, n=5)	po	25, 100, 500, 1000, 2000, 4000	4000mg/kg まで 影響なし	同上
	b)自発運動量	マウス (ddY, 雄, n=18)	po	25, 100, 500, 2000	2000mg/kg まで 有意作用なし	Photocell
	c)麻酔増強作用	マウス (ddY, 雄, n=10)	po	25, 100, 500, 2000	2000mg/kg まで 有意作用なし	Thiopental Na 30mg/kg, iv
	d)抗痙攣作用					
	抗電撃	マウス (ddY, 雄, n=10)	po	25, 100, 500, 2000	2000mg/kg まで 有意作用なし	電撃 (1000V, 12.5mA, 0.2 秒)
	抗 bemegride	マウス (ddY, 雄, n=10)	po	25, 100, 500, 2000	2000mg/kg まで 有意作用なし	Bemegride 35mg/kg, sc
	e)筋弛緩作用	マウス (ddY, 雄, n=10)	po	25, 100, 500, 2000	2000mg/kg まで 有意作用なし	懸垂試験
f)自発脳波	無麻酔無拘束 ラット (SD, n=5)	po	2000	2000mg/kg まで 有意作用なし	慢性電極植込ラット	
g)体温	ウサギ (日本白色種 雄, n=5)	po	10, 100, 1000	1000mg/kg まで 有意作用なし		
呼吸・循環器系・自律神経系に及ぼす影響	a)呼吸、 血圧、 心拍数、 血流量、 心電図	麻酔イヌ (ビーグル,雌雄 n=4)	id	25, 1000	1000mg/kg まで 有意作用なし	
	b)自律神経系応答	麻酔イヌ (ビーグル,雌雄 n=4)	id	25, 1000	1000mg/kg まで 有意作用なし	ノルエピネフリン昇圧、 アセチルコリン降圧、 両側頸動脈閉塞昇圧
	c)瞬膜収縮	麻酔ネコ (雑種, 雌雄 n=3)	po	1000	1000mg/kg まで 有意作用なし	頸部交感神経節前線維 電気刺激
	d)心収縮力 心拍数	モルモット (Hartley, 雌 n=4~5)	<i>in vitro</i> (活性体)	1×10 ⁻⁵ , 3×10 ⁻⁵ , 1×10 ⁻⁴ g/mL	1×10 ⁻⁴ g/mL まで有意作用 なし	摘出心筋 (マグヌス法)

試験項目	動物種 (系、性別、例数)	投与 経路	投与量 (mg 力価/kg)	試験成績	備考 (試験方法等)	
平滑筋に及ぼす影響	a) 摘出平滑筋 気管	モルモット (Hartley, 雄 n=5)	<i>in vitro</i> (活性体)	10 ⁻⁴ , 10 ⁻³ g/mL	10 ⁻³ g/mLまで 有意作用なし	マグヌス法
	回腸	ウサギ (日本白色種, 雄, n=5)		同 上	10 ⁻³ g/mLまで 有意作用なし	
	輸精管	ラット (SD, 雄, n=5)		10 ⁻³ g/mL	10 ⁻³ g/mLで有意 作用なし	
	非妊娠子宮	ラット (SD, 雌, n=5)		10 ⁻⁴ , 10 ⁻³ g/mL	10 ⁻³ g/mLまで 有意作用なし	
	妊娠子宮	妊娠ラット (SD, 雌, n=5)		同 上	10 ⁻³ g/mLまで 有意作用なし	
	b) 鎮痙作用 抗アセチルコリン・抗ヒスタミン 抗ノルエピネフリン	モルモット (Hartley, 雄 n=5) ラット (SD, 雄, n=5)	<i>in vitro</i> (活性体)	10 ⁻³ g/mL 10 ⁻³ g/mL	10 ⁻³ g/mLで有意 作用なし 10 ⁻³ g/mLで有意 作用なし	摘出回腸 (マグヌス法) 摘出輸精管 (マグヌス法)
及ぼす影響 消化器系に	a) 胃液分泌	ラット (SD, 雄, n=10)	id	25, 100, 500, 2000	2000mg/kgで 有意に減少	Shay ラット法
	b) 腸管内輸送能	マウス (ddY, 雄, n=10)	po	25, 100, 500, 2000	2000mg/kgまで 有意作用なし	炭末法
	c) 排便時間	マウス (ddY, 雄, n=10)	po	25, 100, 500, 2000	2000mg/kgまで 有意作用なし	炭末法
泌尿器系に及ぼす影響	a) 尿量、 電解質、 浸透圧	ラット (SD, 雄, n=9)	po	25, 100, 500, 2000	2000mg/kgで尿 量軽度減少、Na ⁺ , Cl ⁻ の排泄軽度 減少、K ⁺ の排泄 軽度増加、尿浸 透圧軽度増加	電解質は Na ⁺ , K ⁺ , Cl ⁻ を測定
血液系に及ぼす影響	a) 溶血作用	ヒト血液 (n=5)	<i>in vitro</i> (活性体)	10 ⁻⁶ , 10 ⁻⁵ , 10 ⁻⁴ , 10 ⁻³ g/mL	10 ⁻³ g/mLまで 有意作用なし	赤石法
	b) 血液凝固時間	ラット (SD, 雄, n=7~10)	po	25, 100, 500, 2000	2000mg/kgまで 有意作用なし	PT, APTT
	c) 血小板凝集	ラット (SD, 雄, n=10)	po (<i>ex vivo</i>)	25, 100, 500, 2000	2000mg/kgまで 有意作用なし	ADP 凝集 (<i>ex vivo</i>)
その他	a) 血糖値	ラット (SD, 雄, n=10)	po	25, 100, 500, 2000	2000mg/kgまで 有意作用なし	
	b) 局所麻酔作用	モルモット (Hartley, 雄 n=10)	点眼 (活性体)	0.1, 1%	1%まで有意 作用なし	角膜反射法
	c) 眼粘膜刺激性	ウサギ (日本白色種, 雄, n=3)	点眼	1, 5%溶液を 0.1mL	5%まで有意 作用なし	Draize 法
	d) 横隔膜、 神経-筋伝達	ラット (SD, 雄, n=5)	<i>in vitro</i> (活性体)	10 ⁻⁴ , 10 ⁻³ g/mL	10 ⁻³ g/mLまで 有意作用なし	マグヌス法 (ラット横隔膜神経筋 標本)

(4) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1)単回投与毒性試験⁵⁹⁾LD₅₀ 値 (mg/kg)

投与経路	動物種	マウス		ラット	
		雄	雌	雄	雌
経口		> 8,000	> 8,000	> 4,000	> 4,000
皮下		> 10,000	> 10,000	> 2,000	> 2,000
腹腔内		3,502	2,535	> 4,000	> 4,000

(2)反復投与毒性試験^{60,61)}

(ラット 30・80・200・500・1,000mg/kg/日、13週間経口及び250・500・1,000mg/kg/日、1年間経口) いずれの試験においても腸内細菌叢の変化による二次的影響とみられる軟便、盲腸重量の増加が認められた以外、本剤投与によると思われる異常所見は認められなかった。

本試験での無影響量は1,000mg/kg/日であると考えられた。

(イヌ 25・100・400mg/kg/日、13週間経口及び25・100・400mg/kg/日、6ヵ月間経口)

6ヵ月間経口投与試験において少数例で軟便・嘔吐がみられた以外、本剤投与によると思われる異常所見は認められなかった。本試験での無影響量は400mg/kg/日であると考えられた。

(3)生殖発生毒性試験

1) 妊娠前及び妊娠初期試験 (Segment I)

(ラット 20・100・500mg/kg/日 雄：5週齢から9週間～交尾成立まで、雌：10週齢から2週間～妊娠7日まで 連続経口投与)

親動物：100mg/kg 投与群の雌で摂餌量の減少、500mg/kg 群で妊娠末期の体重増加抑制、雌雄の摂餌量減少、飲水量増加がみられたが、雌雄の生殖機能に異常を招くことはなかった。胎児：生存性には影響を及ぼさなかった。本試験での親動物に対する一般毒性的な無影響量は20mg/kg、親動物の生殖並びに次世代の発生に対する無影響量は500mg/kg 以上と考えられた。

2) 器官形成期投与試験 (Segment II)

(ラット 20・100・500mg/kg/日 妊娠7～17日まで11日間 連続経口投与)

親動物：100mg/kg 以上の投与群で軟便、下痢、摂餌量の減少及び体重増加抑制が観察されたが、妊娠の維持、分娩、哺育能に影響は認められなかった。胚・胎児：500mg/kg 投与群で尾椎化骨核数の減少が見られたが、致死、催奇形作用は認められなかった。出生児：生後発育に異常は観察されなかった。本試験での親動物に対する一般毒性的な無影響量は20mg/kg、親動物の生殖に対する無影響量は500mg/kg より大きく、次世代の発生に対する無影響量は100mg/kg と考えられた。

3) 周産期及び授乳期投与試験 (Segment III)⁶²⁾

(ラット 20・100・500mg/kg/日 妊娠17日～哺育21日まで 連続経口投与)

親動物：100mg/kg 以上の投与群で妊娠末期の摂餌量減少、哺育期の摂餌・飲水量増加を伴う体重の増加、盲腸の膨大が観察された。分娩及び哺育について異常はみられなかった。出生児 (F₁)：離乳時解剖、成長試験、行動、学習機能試験、生殖機能試験のいずれにおいても影響はみられなかった。本試験での親動物に対する一般毒性的な無影響量は20mg/kg、親動物の生殖及び次世代の発生に対する無影響量は500mg/kg 以上と考えられた。

(4)その他の特殊毒性

1) 精子形成抑制試験

(幼若ラット セフポドキシムナトリウム塩として10・100・1,000mg/kg/日 36日間 皮下)

18 週齢で観察した結果、本剤投与によると思われる精巣萎縮、精子形成抑制作用は認められず、ラットの性成熟に対する無影響量は 1,000mg/kg より大きいと考えられた。

2) 抗原性試験

マウス、ウサギ、モルモットにより検討した結果、いずれの動物においても免疫原性の発現はほとんど認められなかった。また、セフメノキシム、セフォタキシムとの間に弱い免疫学的交差性が認められたのみであった。

3) 腎毒性

(ウサギ セフポドキシムナトリウム塩として 200・400・800mg/kg、耳静脈内に 1 回投与後 5 日間観察) 800mg/kg 投与群の一部 (2/6 例) に盲腸において水腫や充出血を認めたが、全例腎障害を示唆する形態学的変化は認められなかった。

4) 変異原性試験

大腸菌、サルモネラ菌を用いた復帰突然変異試験、酵母を用いた変異原性試験及びチャイニーズハムスター培養細胞である V79 細胞を用いた染色体異常試験のいずれにおいても変異原性はないものと判断された。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：処方箋医薬品：注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：該当しない

2. 有効期間又は使用期限

有効期間：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1)薬局での取扱い上の留意点について

該当資料なし

(2)薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ.14.適用上の注意」参照

くすりのしおり：有り

(3)調剤時の留意点について

該当しない

5. 承認条件等

該当しない

6. 包 装

バンナ錠 100mg （PTP）100錠

（日本薬局方セフポドキシム プロキセチル錠）

7. 容器の材質

PTP：ポリプロピレン、アルミニウム箔

8. 同一成分・同効薬

同一成分：バナンドライシロップ5%等

同 効 薬：経口セフェム系抗生物質

9. 国際誕生年月日

1989年9月29日（日本）

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2008年9月10日（販売名変更による）

承認番号：22000AMX02064

注：旧販売名：バナン錠 承認年月日：1989年9月29日

11. 薬価基準収載年月日

2008年12月19日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

1996年9月9日

追加適応菌種：ペプトストレプトコッカス属

追加効能：歯周組織炎・歯冠周囲炎・顎炎

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再審査結果公表年月日：1999年3月3日

内容：薬事法第14条第2項各号のいずれにも該当しない

再評価結果公表年月日：2004年9月30日

内容：「抗菌薬臨床評価ガイドライン」に基づく読み替え

14. 再審査期間

6年（1989年9月29日～1995年9月28日：終了）

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT（13桁）番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
バナン錠 100mg	1109245010203（PTP100錠）	6132011F1080	620008681

17. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文 献

1. 引用文献

- 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
- 2) Chemotherapy* 36(Suppl. 1) : CEFPODOXIME PROXETIL 論文特集号 (1988) を中心に集計
- 3) 佐々木次郎ほか：歯薬療法 1993;12(1):17-32
- 4) 佐々木次郎ほか：歯薬療法 1996;15(2):90-105
- 5) 小林真一ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):200-214
- 6) 田島政三ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):215-228
- 7) 岡 慎一ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):261-266
- 8) 中牟田誠一ほか：西日本泌尿器科 1988;50(6):2099-2111
- 9) 由良二郎ほか：Jpn J Antibiotics 1988;41(10):1517-1537
- 10) 尾形信雄ほか：西日本泌尿器科 1988;50(6):2077-2098
- 11) 馬場駿吉ほか：耳鼻と臨床 1988;34(5):1274-1296
- 12) 河村正三ほか：耳鼻と臨床 1988;34(5):1243-1273
- 13) 柴 孝也ほか：感染症学雑誌 1988;62(11):973-1001
- 14) 柴 孝也ほか：感染症学雑誌 1988;62(12):1166-1191
- 15) 松田静治ほか：臨床医薬 1988;4(9):1641-1685
- 16) 宇津井幸男ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):146-158
- 17) 横田 健ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):16-26
- 18) 西野武志ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):72-93
- 19) 安田 紘ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):159-172
- 20) 宇津井幸男ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):173-184
- 21) 宇津井幸男ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):1-15
- 22) 五島瑛智子ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):43-61
- 23) 小栗豊子、林 康之：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):27-42
- 24) 永山在明、田縁晴子：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):94-103
- 25) 田島政三ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):104-145
- 26) 斎藤 玲：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):252-260
- 27) 山作房之輔ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):267-273
- 28) 澤江義郎ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):538-557
- 29) 後藤俊弘ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):868-889
- 30) 鈴木幹三ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):492-501
- 31) 植田省吾ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):859-867
- 32) 柴 孝也ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):434-441
- 33) Tremblay D, et al. : J Antimicrob Chemother 1990;26(Suppl. E):21-28
- 34) 駒井 亨ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):229-240
- 35) 江角凱夫ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):241-251
- 36) 山元貴雄ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):967-978
- 37) 岩井重富ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):612-619
- 38) 中津喬義ほか：Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):653-663

- 39) 由良二郎ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):664-676
- 40) 山本 博ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):685-689
- 41) 丹野恭夫ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):369-374
- 42) 高橋 淳ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):576-588
- 43) 畑山尚生ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):991-998
- 44) 新川 敦ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):1046-1055
- 45) 島田純一郎ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):1056-1063
- 46) 深水浩三ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):1067-1073
- 47) 西村一男ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):784-787
- 48) 岸 幹雄ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):802-812
- 49) 富澤尊儀ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):1079-1088
- 50) 小原達也ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):918-922
- 51) 張 南薫ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):923-940
- 52) 山本英雄ほか : 歯薬療法 1993;12(1):39-45
- 53) Johnson CA, et al. : Antimicrob Agents Chemother 1993;37(12):2650-2655
- 54) Borin MT, et al. : J Clin Pharmacol 1992;32(11):1038-1044
- 55) Hoffler D, et al. : Infection 1990;18(3):157-162
- 56) Saathoff N, et al. : Antimicrob Agents Chemother 1992;36(4):796-800
- 57) Hughes GS, et al. : Clin Pharmacol Ther 1989;46(6):674-685
- 58) 小林晋作ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):329-349
- 59) 平野光一ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):274-279
- 60) 松沼尚史ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):280-299
- 61) 森 昌弘ほか : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):300-319
- 62) 棚瀬久雄、広瀬高一 : Chemotherapy 1988;36(Suppl. 1):320-328

* 「Chemotherapy」は1995年以降「日本化学療法学会雑誌 (Chemotherapy)」に誌名変更されている。

2. その他の参考文献

第十七改正日本薬局方解説書 2016, 廣川書店

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

セフポドキシム プロキシセチル製剤は米国、フランス、ドイツ、イタリア、スイス等、約 50 カ国で販売されている。

(2018 年 8 月現在)

主な外国での効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりである。

出典	記載内容
米国の添付文書 [CEFPODOXIME PROXETIL (cefpodoxime proxetil tablet, film coated); Sandoz Inc, 2014 年 7 月]	<p>INDICATIONS AND USAGE</p> <p>Cefpodoxime proxetil is indicated for the treatment of patients with mild to moderate infections caused by susceptible strains of the designated microorganisms in the conditions listed below.</p> <p>Recommended dosages, durations of therapy, and applicable patient populations vary among these infections. Please see DOSAGE AND ADMINISTRATION for specific recommendations.</p> <p>Acute otitis media caused by <i>Streptococcus pneumoniae</i> (excluding penicillin-resistant strains), <i>Streptococcus pyogenes</i>, <i>Haemophilus influenzae</i> (including beta-lactamase-producing strains), or <i>Moraxella (Branhamella) catarrhalis</i> (including beta-lactamase-producing strains).</p> <p>Pharyngitis and/or tonsillitis caused by <i>Streptococcus pyogenes</i>.</p> <p>NOTE: Only penicillin by the intramuscular route of administration has been shown to be effective in the prophylaxis of rheumatic fever. Cefpodoxime proxetil is generally effective in the eradication of streptococci from the oropharynx. However, data establishing the efficacy of cefpodoxime proxetil for the prophylaxis of subsequent rheumatic fever are not available.</p> <p>Community-acquired pneumonia caused by <i>S. pneumoniae</i> or <i>H. Influenzae</i> (including beta-lactamase-producing Strains).</p> <p>Acute bacterial exacerbation of chronic bronchitis caused by <i>S. pneumoniae</i>, <i>H. influenzae</i> (non-betalactamase-producing strains only), or <i>M. catarrhalis</i>. Data are insufficient at this time to establish efficacy in patients with acute bacterial exacerbations of chronic bronchitis caused by beta-lactamase-producing strains of <i>H. influenzae</i>.</p> <p>Acute, uncomplicated urethral and cervical gonorrhoea caused by <i>Neisseria gonorrhoeae</i> (including penicillinase-producing strains).</p> <p>Acute, uncomplicated ano-rectal infections in women due to <i>Neisseria gonorrhoeae</i> (including penicillinase-producing strains).</p> <p>NOTE: The efficacy of cefpodoxime in treating male patients with rectal</p>

infections caused by *N. gonorrhoeae* has not been established. Data do not support the use of cefpodoxime proxetil in the treatment of pharyngeal infections due to *N. gonorrhoeae* in men or women.

Uncomplicated skin and skin structure infections caused by *Staphylococcus aureus* (including penicillinase-producing strains) or *Streptococcus pyogenes*. Abscesses should be surgically drained as clinically indicated.

NOTE: In clinical trials, successful treatment of uncomplicated skin and skin structure infections was dose-related. The effective therapeutic dose for skin infections was higher than those used in other recommended indications. (See **DOSAGE AND ADMINISTRATION**.)

Acute maxillary sinusitis caused by *Haemophilus influenzae* (including beta-lactamase-producing strains), *Streptococcus pneumoniae*, and *Moraxella catarrhalis*.

Uncomplicated urinary tract infections (cystitis) caused by *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Proteus mirabilis*, or *Staphylococcus saprophyticus*.

NOTE: In considering the use of cefpodoxime proxetil in the treatment of cystitis, cefpodoxime proxetil's lower bacterial eradication rates should be weighed against the increased eradication rates and different safety profiles of some other classes of approved agents. (See **CLINICAL STUDIES** section.)

Appropriate specimens for bacteriological examination should be obtained in order to isolate and identify causative organisms and to determine their susceptibility to cefpodoxime. Therapy may be instituted while awaiting the results of these studies. Once these results become available, antimicrobial therapy should be adjusted accordingly.

To reduce the development of drug-resistant bacteria and maintain the effectiveness of Cefpodoxime Proxetil Tablets, USP and other antibacterial drugs, Cefpodoxime Proxetil Tablets, USP should be used only to treat or prevent infections that are proven or strongly suspected to be caused by susceptible bacteria. When culture and susceptibility information are available, they should be considered in selecting or modifying antibacterial therapy. In the absence of such data, local epidemiology and susceptibility patterns may contribute to the empiric selection of therapy.

DOSAGE AND ADMINISTRATION
(See **INDICATIONS AND USAGE** for indicated pathogens.)

Film-coated Tablets

Cefpodoxime Proxetil Tablets, USP should be administered orally with food to enhance absorption.
(See **CLINICAL PHARMACOLOGY**.)

The recommended dosages, durations of treatment, and applicable patient population are as described in the following chart:

Adults and Adolescents (age 12 years and older)			
Type of Infection	Total Daily Dose	Dose Frequency	Duration
Pharyngitis and/or tonsillitis	200mg	100mg Q 12 hours	5 to 10 days
Acute community-acquired pneumonia	400mg	200mg Q 12 hours	14 days
Acute bacterial exacerbations of chronic bronchitis	400mg	200mg Q 12 hours	10 days
Uncomplicated gonorrhoea (men and women) and rectal gonococcal infections (women)	200mg	single dose	
Skin and skin structure	800mg	400mg Q 12 hours	7 to 14 days
Acute maxillary sinusitis	400mg	200mg Q 12 hours	10 days
Uncomplicated urinary tract infection	200mg	100mg Q 12 hours	7 days

Patients with Renal Dysfunction

For patients with severe renal impairment (<30 mL/min creatinine clearance), the dosing intervals should be increased to Q 24 hours. In patients maintained on hemodialysis, the dose frequency should be 3times/week after hemodialysis.

When only the serum creatinine level is available, the following formula (based on sex, weight, and age of the patient) may be used to estimate creatinine clearance (mL/min). For this estimate to be valid, the serum creatinine level should represent a steady state of renal function.

Males:
(mL/min) $\frac{\text{Weight (kg)} \times (140 - \text{age})}{72 \times \text{serum creatinine (mg/100 mL)}}$

Females:
(mL/min) 0.85 × above value

Patients with Cirrhosis

Cefpodoxime pharmacokinetics in cirrhotic patients (with or without ascites) are similar to those in healthy subjects. Dose adjustment is not necessary in this population.

本邦における本剤 100mg の効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりである。国内の承認内容の範囲で本剤を使用すること。

【効能・効果】

<適応菌種>

セフポドキシムに感性のブドウ球菌属、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

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

<効能・効果に関連する使用上の注意>

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、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」⁹⁾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、成人にはセフポドキシム プロキシセチルとして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。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

1. 高度の腎障害のある患者には、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（「慎重投与」及び「薬物動態」の項参照）。
2. 本剤の使用にあたっては、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。〔耐性菌の発現等を防ぐ。〕

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（FDA 分類）

	分類	参考：分類の概要
FDA:Pregnancy Category	B [CEFPODOXIME PROXETIL (cefpodoxime proxetil tablet, film coated); Sandoz Inc, 2014年7月]	1. Animal reproduction studies have failed to demonstrate a risk to the fetus and there are no adequate and well-controlled studies in pregnant women 2. Animal reproduction studies have shown an adverse effect (other than decrease in fertility), but adequate and well-controlled studies in pregnant women have failed to demonstrate a risk to the fetus during the first trimester of pregnancy (and there is no evidence of a risk in later trimesters)

妊婦、産婦、授乳婦等に関する記載

出典	記載内容
米国の添付文書 [CEFPODOXIME PROXETIL (cefpodoxime proxetil tablet, film coated); Sandoz Inc, 2014年7月]	PRECAUTIONS Pregnancy Teratogenic Effects Cefpodoxime proxetil was neither teratogenic nor embryocidal when administered to rats during organogenesis at doses up to 100 mg/kg/day (2 times the human dose based on mg/m ²) or to rabbits at doses up to 30 mg/kg/day (1 to 2 times the human dose based on mg/m ²). There are, however, no adequate and well-controlled studies of cefpodoxime proxetil use in pregnant women. Because animal reproduction studies are not

	<p>always predictive of human response, this drug should be used during pregnancy only if clearly needed.</p> <p>Labor and Delivery</p> <p>Cefpodoxime proxetil has not been studied for use during labor and delivery. Treatment should only be given if clearly needed.</p> <p>Nursing Mothers</p> <p>Cefpodoxime is excreted in human milk. In a study of 3 lactating women, levels of cefpodoxime in human milk were 0%, 2% and 6% of concomitant serum levels at 4 hours following a 200 mg oral dose of cefpodoxime proxetil. At 6 hours post-dosing, levels were 0%, 9% and 16% of concomitant serum levels. Because of the potential for serious reactions in nursing infants, a decision should be made whether to discontinue nursing or to discontinue the drug, taking into account the importance of the drug to the mother.</p>
--	---

本邦における本剤の使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりである。

【使用上の注意】「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) 投薬中は授乳させないように注意すること。 [母乳中へ移行する。]

小児等に関する記載

出典	記載内容
米国の添付文書 [CEFPODOXIME PROXETIL (cefpodoxime proxetil tablet, film coated); Sandoz Inc, 2014年7月]	<p>PRECAUTIONS</p> <p>Pediatric Use</p> <p>Safety and efficacy in infants less than 2 months of age have not been established.</p>

本邦における本剤の使用上の注意「小児等への投与」の項の記載は以下のとおりである。

【使用上の注意】「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（使用経験が少ない）。

XIII. 備 考

その他の関連資料

〔文献請求先・製品情報お問い合わせ先〕
第一三共株式会社 製品情報センター
〒103-8426 東京都中央区日本橋本町 3-5-1
TEL:0120-189-132