

※※印：2011年6月改訂(第4版)  
 ※印：2010年5月改訂

|            |
|------------|
| 日本標準商品分類番号 |
| 876132     |

貯 法：室温保存(吸湿しやすいので開封後は必ず湿気を避けて保存すること)  
 使用期限：外装に表示の使用期限内に使用すること。  
 取扱い上の注意：「**取扱い上の注意**」の項参照  
 ※ 規制区分：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)

|      |                  |
|------|------------------|
| 承認番号 | 21800AMZ10133000 |
| 薬価収載 | 2006年7月          |
| 販売開始 | 2006年7月          |

経口用セフェム系抗生物質製剤

# セフポドキシムプロキセチル ドライシロップ5%「タイヨー」

CEFPODOXIME PROXETIL  
 セフポドキシム プロキセチルドライシロップ

**【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】

|     |                                                                                                                                                                                                                          |
|-----|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 組 成 | 1g中：セフポドキシム プロキセチル…50mg(力価)<br><small>〈添加物〉</small><br>アスパルテム(L-フェニルアラニン化合物)、安息香酸ナトリウム、塩化ナトリウム、カルメロースカルシウム、カルメロースナトリウム、L-グルタミン酸ナトリウム水和物、軽質無水ケイ酸、サッカリンナトリウム水和物、シリコーン樹脂、精製白糖、タルク、乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、pH調整剤、黄色三酸化鉄、三酸化鉄、香料 |
| 性 状 | わずかに芳香があり、味は初め甘く、後にわずかな苦味がある、だいたい色の粉末                                                                                                                                                                                    |

【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、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  
 ＜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、膀胱炎、腎盂腎炎、中耳炎、副鼻腔炎、猩紅熱

【用法・用量】

通常、幼小児に対しては、セフポドキシム プロキセチルとして1回3mg(力価)/kgを1日2～3回、用時懸濁して経口投与する。  
 なお、年齢、体重、症状等に応じて適宜増減するが、重症または効果不十分と思われる症例には、1回4.5mg(力価)/kgを1日3回経口投与する。

＜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**」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]

【使用上の注意】

- 慎重投与** (次の患者には慎重に投与すること)
  - 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
  - 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
  - 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**」の項参照)
  - 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]
- 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。

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。

(1)重大な副作用 (頻度不明)

- ショック、アナフィラキシー様症状** ショック、アナフィラキシー様症状(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。
- 皮膚粘膜眼症候群、中毒性表皮壊死症** 皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、中毒性表皮壊死症(Lyell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。
- 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。
- 急性腎不全** 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直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 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。
- 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。
- 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) (頻度不明)

- 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。
- 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おこすとの報告がある。

(3)その他の副作用

|                   | 頻 度 不 明                                                |
|-------------------|--------------------------------------------------------|
| 過敏症 <sup>注)</sup> | 発疹、蕁麻疹、紅斑、痒疹、発熱、リンパ腺腫脹、関節痛                             |
| 血液                | 好酸球増多、血小板減少、血小板増多、顆粒球減少                                |
| 肝臓                | AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、AI-P上昇、肝機能障害、LDH上昇               |
| 腎臓                | BUN上昇、血中クレアチニン上昇、血尿                                    |
| 消化器               | 下痢、悪心・嘔吐、軟便、腹痛、胃痛、食欲不振、胃部不快感、便秘                        |
| 菌交代症              | カンジダ症、口内炎                                              |
| ビタミン欠乏症           | ビタミンK欠乏症(低プロトロンビン血症、出血傾向等)、ビタミンB群欠乏症(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 小児等への投与

新生児、低出生体重児に対する安全性は確立していない。

## 5 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。

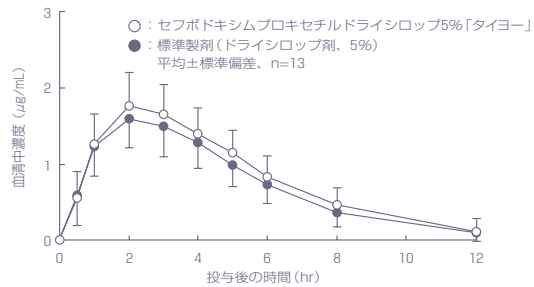
## 6 適用上の注意

- (1) 保存時：懸濁液に調製後は冷所に保存し、2週間以内に使用すること。
- (2) 投与時：使用時十分に振り混ぜること。

### 【薬物動態】

#### 1. 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

セフポドキシムプロキセチルドライシロップ5%「タイヨー」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2g [セフポドキシムプロキセチルとして100mg(力価)]健康成人男子に絶食単回経口投与して血清中活性代謝物(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、C<sub>max</sub>)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。(対象適用外)



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=13)

|                                  | 投与量*<br>[mg(力価)] | AUC <sub>0-12</sub><br>(μg·hr/mL) | C <sub>max</sub><br>(μg/mL) | T <sub>max</sub><br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) |
|----------------------------------|------------------|-----------------------------------|-----------------------------|--------------------------|--------------------------|
| セフポドキシムプロキセチル<br>ドライシロップ5%「タイヨー」 | 100              | 10.0±2.6                          | 1.8±0.4                     | 2.4±0.7                  | 2.5±1.2                  |
| 標準製剤<br>(ドライシロップ剤, 5%)           | 100              | 8.9±2.4                           | 1.6±0.4                     | 2.2±0.4                  | 2.4±1.1                  |

\*セフポドキシムプロキセチルとしての投与量

血清中濃度並びに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。

#### 2. 溶出性<sup>2)</sup>

本剤の溶出性は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた規格に適合していることが確認されている。

### 【薬効薬理】<sup>3)</sup>

#### 1. 作用機序

セフポドキシムプロキセチルはエステル型のプロドラッグであり、腸管壁で代謝され、セフポドキシムとなって抗菌力を現す。

主に細菌細胞壁の合成阻害により殺菌作用を示す。作用点は菌種により異なるが、ペニシリン結合たん白(PBP)の1,3に親和性が高い。

#### 2. 抗菌作用

セフポドキシムは、グラム陽性菌及びグラム陰性菌に対して広範な抗菌スペクトルを有する。特にグラム陽性菌ではブドウ球菌属、レンサ球菌属、グラム陰性菌では大腸菌、クレブシエラ属、プロテウス属、インフルエンザ菌に対して優れた抗菌力を発揮する。生体防御機構と協力して殺菌作用を発揮する。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有する。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：セフポドキシムプロキセチル(Cefpodoxime proxetil)  
略号：CPDX-PR

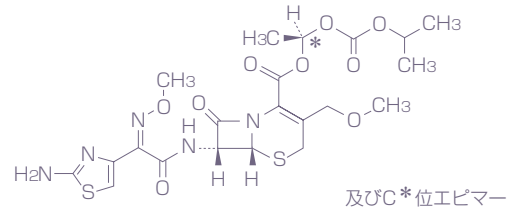
※※化学名：(1*RS*)-1-[(1-methylethoxy)carbonyloxy]ethyl(6*R*,7*R*)-7-[(*Z*)-2-(2-aminothiazol-4-yl)-2-(methoxyimino)acetylamino]-3-methoxymethyl-8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylate

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：セフポドキシムプロキセチルは白色～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：



### 【取扱い上の注意】<sup>4)</sup>

安定性試験結果の概要

加速試験(40°C、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、セフポドキシムプロキセチルドライシロップ5%「タイヨー」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

### 【包装】

セフポドキシムプロキセチルドライシロップ5%「タイヨー」  
バラ包装：100g

### 【主要文献】

- 1) 大洋薬品工業(株)社内資料(生物学的同等性試験)
- 2) 大洋薬品工業(株)社内資料(溶出試験)
- 3) 第十五改正日本薬局方解説書
- 4) 大洋薬品工業(株)社内資料(安定性試験)

### 【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。  
大洋薬品工業株式会社 タイヨーDIセンター  
〒453-0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号  
TEL 0120-080-601 FAX 052-459-2853

製造販売元

 大洋薬品工業株式会社  
名古屋市中村区太閤一丁目24番11号