

▼エリスロシン点滴静注用 [注], ○エリスロシン錠・▼W 顆粒・△ドライシロップ [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】注射:エリスロマイシンラクトビオン酸塩, 内服:エリスロマイシンステアリン酸塩 (EM) (U) erythromycin lactobionate/erythromycin stearate 【分類】マクロライド系抗生物質

【単位】▼500mg/V, △100mg・○200mg錠, ▼20%W 顆粒, △10%DS, ▼20%WDS

【常用量】■注射: 600~1500mg/日 ■内服: 800~1200mg/日

【用法】■注射: 1日2~3回, 1回2hr以上かけて点滴静注 [必ず注射用水10mLで溶解し, ブドウ糖注射液, 生理食塩液等で希釈] ■内服: 分4~分6

【透析患者への投与方法】内服薬では透析患者では全身クリアランス, Vdともに低下し, 半減期は延長しないもののFの上昇が認められるため (Kanfer A, et al: Clin Nephrol 27: 147-50,1987) 1/3に減量するが注射薬の減量の必要なし (5)

【その他の報告】減量の必要なし (12) 50~75%に減量 (3,4) 内服で0.25~0.5g/6hr (7) 注射薬は減量の必要なし (6) ESRDでは高用量で聴器毒性 (サンフォード感染症治療ガイド) ESRDでは腎外クリアランスの変化が示唆 (Ma TKW, et al: Clin Kidney J 7: 507-12, 2014)

【PD】出口部およびトンネル感染に1回500mg1日4回 (Li PK, et al: Perit Dial Int 30: 393-423, 2010)

【保存期CKD患者への投与方法】■内服: Fが4倍上昇するため (Kanfer A, et al: Clin Nephrol 27: 147-50,1987)

【その他の報告】Ccr>50mL/min: 600~1000mg/日, Ccr10~50mL/min: 400~600mg/日, Ccr<10mL/min: 300~400mg/日 (5)

減量の必要なし (7,12, Ma TKW, et al: Clin Kidney J 7: 507-12, 2014)

■注射: 減量の必要なし (Disse B, et al: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 24: 460-464, 1986)

【その他の報告】Ccr>50mL/min: 0.5~1g/6hr, Ccr10~50mL/min: 0.5~1g/6hr, Ccr<10mL/min: 0.25~0.5g/6hr (7)

Ccr10mL/min以上: 常用量, Ccr10mL/min未満: 50~75%に減量 (3,サンフォード感染症治療ガイド)

Ccr>10mL/min: 減量の必要なし, Ccr<10mL/min: 50~75%に減量 (10)

末期腎臓病では高用量で聴覚毒性がある (サンフォード感染症治療ガイド)

【特徴】14員環マクロライドで作用機序は細菌の蛋白合成阻害 (70S系のリボソームの50Ssubunitと結合する)。好気性グラム陽性菌・陰性球菌、嫌気性菌等に抗菌力を有しているが、グラム陰性桿菌には抗菌力を有しない。他剤では抗菌力の弱いキャンピロバクターやレジオネラ、マイコプラズマ、クラミジア等に抗菌力を有する。血中濃度は低いが肺、肝への移行性はよく、静菌的な抗菌作用を示す。びまん性汎細気管支炎に少量長期投与で炎症反応の抑制に働く。

【主な副作用・毒性】偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎, 心室頻拍, 心室細動, QT延長, ショック, アナフィラキシー, 急性腎不全, 間質性腎炎, 肝機能障害, 黄疸など

【吸収】製剤により吸収率が異なる (U)

【F】30~65% (U) 腸溶錠35% (13) 40% (14) 経口投与後のAUCは健常者4.7mg・hr/Lに対し透析患者で20.1~20.9mg・hr/Lと有意に上昇している (Kanfer A, et al: Clin Nephrol 27: 147-150,1987)

【tmax】2~4hr [製剤により異なる] (U) 腸溶遊離型塩基錠2.1~3.9hr, ステアリン酸塩のフィルムコート錠2~3hr (13) 【Cmax】腸溶遊離型塩基錠250mgを5~13回投与後のCmaxは0.9~3.5μg/mL, ステアリン酸塩のフィルムコート錠250mgを5~12回投与後のCmaxは0.5~1.4μg/mL (13)

【代謝】肝代謝で90%以上が非拮抗性代謝物になる (U) CYP3A4によって代謝 (N-脱メチル化) される (1,9) 肝でN-脱メチル化されるが腸肝循環し, 未変化体も胆汁排泄される (11)

【排泄】主に胆汁排泄 (U) 尿中未変化体排泄率12~15% [iv] (U) 15% (12,14) 12% (13) 7.5%未満 (Ma TKW, et al: Clin Kidney J 7: 507-12, 2014) 胆汁排泄にはP-gpが関与している (13) 尿中回収率7.5% (Disse B, et al: Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol 24: 460-4,1986)

【CL】6.30mL/min/kg (7) 9.1mL/min/kg (13) 【透析患者のCL】4.01mL/min/kg (7) 【非腎CL/総CL】80% (10)

【t1/2】1.4~2hr (U) 1~1.5hr (11) 1.4hr (12,14) 1.6hr (13) 【透析患者のt1/2】5hr (U) 5~6hr (12)

【蛋白結合率】64.5% (1) 70~90% (U) 73~93% (11) 84% (13) 60~95% (12) 【透析患者の蛋白結合率】67~89% (7)

【Vd】0.9L/kg (U) 0.5~1.0L/kg (10) 0.75L/kg (11) 0.6L/kg (14) 0.6~1.2L/kg (12) 腎不全でVdが低下するという報告もある (Clin Nephrol 27: 147-50, 1987) 0.78L/kg, 腎障害で上昇 (13) 【透析患者のVd】1.15L/kg (7) 腎不全で上昇 (蛋白結合率の低下による) (J Pharmaceut Sci 67,1978) 【分布】脳脊髄液および咽頭以外に広範囲に分布する。本剤を270mg静注すると感染した肺濃度は5.5μg/mLになり, ほとんどの市中肺炎の原因菌に有効。肺胞マクロファージ内では血漿濃度の20~30倍になるためレジオネラ感染症などにも有効 (11)

【MW】1092.22

【透析性】除去されない (1) 除去率5~10% (6) 透析後投与に必要なし (7) 除去率5~20% (Ma TKW, et al: Clin Kidney J 7: 507-12, 2014) 【透析CL】28.5mL/min (7) 【透析時t1/2】2.1hr (8)

【TDMのポイント】有効治療域0.5~2.5μg/mL (14) TDMの対象にならない (5)

【O/W係数】資料なし (1)

【相互作用】CYP3A4阻害作用が強いため相互作用に注意 (1) P-gp阻害作用を有するため, P-gpの基質薬と併用時に併用薬剤の排出が阻害され, 血中濃度が上昇する可能性 (1) 主に腎障害患者において, コルヒチンとマクロライド系抗生物質 (CAM,EM) との併用により汎血球減少や消化器障害などの致死性のコルヒチン毒性が増強されるため, これらの併用は避けるべきである (Hung IF, et al: Clin Infect Dis 41: 291-300, 2005) ジゴキシン投与患者へのEM併用はジゴキシン中毒による入院リスクを3.7倍上昇させる (Gomes T, et al: Clin Pharmacol Ther 86: 383-6, 2009) CYP3A4を阻害するので, ベラパミル, プロナンセリン, エプレレノン, エベロリムス, サキナビルなどの代謝を抑制することがある (1)

【備考】5%溶液は冷蔵庫内で2週間安定（1）

【更新日】20200523

---

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。