



LTLファーマ株式会社

日本標準商品分類番号

876132

2020年10月改訂(第20版)

## 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

経口用セフェム系製剤

日本薬局方セフジニルカプセル

セフゾン<sup>®</sup>カプセル50mg

セフゾン<sup>®</sup>カプセル100mg

Cefzon<sup>®</sup> Capsules 50mg・100mg

剤形	硬カプセル剤
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	カプセル 50mg: 1カプセル中に日局セフジニル 50mg(力価)を含有する。 カプセル 100mg: 1カプセル中に日局セフジニル 100mg(力価)を含有する。
一般名	和名: セフジニル (JAN) 洋名: Cefdinir (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: 1991年10月4日 製造販売一部変更承認年月日: 2005年1月12日(効能・効果等の一部変更による) 薬価基準収載年月日: 1991年11月29日 発売年月日: 1991年12月10日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売: LTLファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	LTLファーマ株式会社 LTLファーマコールセンター TEL 0120-303-711 医療従事者向け情報サイト <a href="https://www.ltl-pharma.com/">https://www.ltl-pharma.com/</a>

本IFは2020年9月改訂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、PMDAホームページ「医薬品に関する情報」  
<http://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、薬価基準記載にあわせて 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。
- ② IF 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]

- ① IF 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。
- ② IF 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料であり、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

<b>I . 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>VII . 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>20</b>
1. 開発の経緯.....	1	1. 血中濃度の推移・測定法.....	20
2. 製品の治療学的・製剤学的特性.....	1	2. 薬物速度論的パラメータ.....	24
		3. 吸収.....	25
<b>II . 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	4. 分布.....	25
1. 販売名.....	2	5. 代謝.....	29
2. 一般名.....	2	6. 排泄.....	31
3. 構造式又は示性式.....	2	7. トランスポーターに関する情報.....	31
4. 分子式及び分子量.....	2	8. 透析等による除去率.....	32
5. 化学名（命名法）.....	2		
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号.....	2	<b>VIII . 安全性(使用上の注意等)に関する項目</b> .....	<b>33</b>
7. CAS登録番号.....	2	1. 警告内容とその理由.....	33
		2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）.....	33
<b>III . 有効成分に関する項目</b> .....	<b>3</b>	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意と その理由.....	33
1. 物理化学的性質.....	3	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意と その理由.....	33
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	3	5. 慎重投与内容とその理由.....	33
3. 有効成分の確認試験法.....	4	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法.....	33
4. 有効成分の定量法.....	4	7. 相互作用.....	34
		8. 副作用.....	34
<b>IV . 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>	9. 高齢者への投与.....	37
1. 剤形.....	5	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与.....	37
2. 製剤の組成.....	5	11. 小児等への投与.....	37
3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意.....	5	12. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	37
4. 製剤の各種条件下における安定性.....	6	13. 過量投与.....	37
5. 調製法及び溶解後の安定性.....	6	14. 適用上の注意.....	37
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	6	15. その他の注意.....	37
7. 溶出性.....	6	16. その他.....	37
8. 生物学的試験法.....	7		
9. 製剤中の有効成分の確認試験法.....	7	<b>IX . 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>38</b>
10. 製剤中の有効成分の定量法.....	7	1. 薬理試験.....	38
11. 力価.....	7	2. 毒性試験.....	38
12. 混入する可能性のある夾雑物.....	7		
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に 関する情報.....	7	<b>X . 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>40</b>
14. その他.....	7	1. 規制区分.....	40
		2. 有効期間又は使用期限.....	40
<b>V . 治療に関する項目</b> .....	<b>8</b>	3. 貯法・保存条件.....	40
1. 効能又は効果.....	8	4. 薬剤取扱い上の注意点.....	40
2. 用法及び用量.....	8	5. 承認条件等.....	40
3. 臨床成績.....	9	6. 包装.....	40
		7. 容器の材質.....	40
<b>VI . 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>14</b>	8. 同一成分・同効薬.....	40
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群.....	14		
2. 薬理作用.....	14		

## 目次

---

9.	国際誕生年月日	40
10.	製造販売承認年月日及び承認番号	41
11.	薬価基準収載年月日	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	41
13.	再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	41
14.	再審査期間	42
15.	投薬期間制限医薬品に関する情報	42
16.	各種コード	42
17.	保険給付上の注意	42
<b>X I .</b>	<b>文献</b>	<b>43</b>
1.	引用文献	43
2.	その他の参考文献	44
<b>X II .</b>	<b>参考資料</b>	<b>45</b>
1.	主な外国での発売状況	45
2.	海外における臨床支援情報	45
<b>X III .</b>	<b>備考</b>	<b>46</b>
	その他の関連資料	46

# I. 概要に関する項目

---

## 1. 開発の経緯

セフゾン<sup>®</sup>は藤沢薬品(現 アステラス)研究所において開発された経口用セフェム系抗生物質で、7-アミノセファロスポラン酸の3位にビニル基を、7位に2-アミノチアゾリルヒドロキシミノ基を有する。

本剤は各種 $\beta$ -lactamaseに安定で、グラム陽性菌・陰性菌に対し広範囲な抗菌スペクトルを有し、各種グラム陰性菌の他、特にブドウ球菌属、レンサ球菌属等グラム陽性菌に対し、既存の経口用セフェム剤に比べ優れた抗菌力を示し、その作用は殺菌的である。

非臨床試験から安全性と有効性が推定されたため、1986年より健康成人を対象に第I相試験を開始した。その結果、忍容性は問題なく、また、血漿中及び尿中濃度と抗菌力の関係より臨床的有用性が期待されたため、引き続き臨床試験へ移行した。各種感染症における基礎的・臨床的検討が行われた結果、本剤の感性菌による各種感染症に対し優れた有用性が確認され、1991年10月4日に承認を得た。1991年より使用成績調査を実施し11,352例を収集し、1997年12月に再審査申請を行った結果、1999年3月「薬事法第14条第2項各号(承認拒否事由)のいずれにも該当しない」との再審査結果を得た。

また、抗菌剤について、薬事法第14条の5の規定による再評価が行われ、2004年9月に再評価結果が通知された。そして、「効能・効果」を一部改めることにより、薬事法第14条の第2項各号(承認拒否事由)のいずれにも該当しないことが確認され、再評価結果に合わせて、「効能・効果」等の一部変更した。セフジニルカプセルは、第15改正日本薬局方(2006)より記載された。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) 黄色ブドウ球菌(MSSA)、化膿レンサ球菌、肺炎球菌、インフルエンザ菌、大腸菌など急性感染症の主要起炎菌に優れた抗菌力を発揮する。

(「VI.2.(1)作用部位・作用機序」の項参照)

(2) 上気道感染症をはじめ、各種の急性感染症に幅広い効能・効果が認められている。

(「V.1.効能又は効果」の項参照)

(3) 各科領域感染症に優れた臨床効果を示す。

(「V.3.臨床成績」の項参照)

(4) 総症例13,715例中354例(2.58%)に臨床検査値異常変動を含む副作用が認められた。その副作用症状は、下痢、腹痛等の消化器症状110例(0.80%)、発疹、そう痒感等の皮膚症状31例(0.23%)等であった。また、主な臨床検査値異常変動は、ALT(GPT)上昇126件(0.92%)、AST(GOT)上昇89件(0.65%)、好酸球増多41件(0.30%)等であった。

重大な副作用としてショック、アナフィラキシー、皮膚障害、血液障害、大腸炎、間質性肺炎、PIE症候群、腎障害、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸が報告されている。

(再審査結果通知：1999年3月)

(「VIII.8.副作用」の項参照)

## Ⅱ. 名称に関する項目

---

### 1. 販売名

#### (1) 和名

セフゾンカプセル 50mg、セフゾンカプセル 100mg

#### (2) 洋名

Cefzon Capsules 50mg、Cefzon Capsules 100mg

#### (3) 名称の由来

特になし

### 2. 一般名

#### (1) 和名（命名法）

セフジニル（JAN）

#### (2) 洋名（命名法）

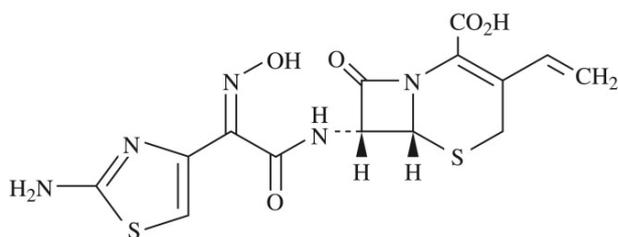
Cefdinir（JAN）

cefdinir（INN）

#### (3) ステム

抗生物質、セファロsporin酸誘導体：cef-

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>14</sub>H<sub>13</sub>N<sub>5</sub>O<sub>5</sub>S<sub>2</sub>

分子量：395.41

### 5. 化学名（命名法）

(6*R*,7*R*)-7-[(*Z*)-2-(2-Aminothiazol-4-yl)-2-(hydroxyimino)acetylamino]-8-oxo-3-vinyl-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylic acid (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：CFDN（日本化学療法学会制定）

開発番号：FK482

### 7. CAS登録番号

91832-40-5

### 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～淡黄色の結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

水、エタノール (95) 又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。pH7.0 の 0.1mol/L リン酸塩緩衝液に溶ける。

測定温度：20±5℃

溶媒	セフジニル 1g を溶解するのに要する溶媒量 (mL)	日本薬局方の溶解性の表現
炭酸水素ナトリウム溶液 (1→50)	12	やや溶けやすい
水	10000 以上	ほとんど溶けない
エタノール (95)	10000 以上	ほとんど溶けない
ジエチルエーテル	10000 以上	ほとんど溶けない

溶解度 37℃：pH1.2：1.94mg/mL、pH4.0：0.988mg/mL、pH6.8：5.03mg/mL、水：0.381mg/mL

##### (3) 吸湿性

25℃、相対湿度 75%において、ほとんど吸湿性は認められない。

##### (4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

融点：不明瞭。150℃付近から黄色味を帯び、その後徐々に褐色味を増し、220℃付近で黒色となり分解する。

##### (5) 酸塩基解離定数

pKa<sub>1</sub>：1.9 (カルボキシル基)、pKa<sub>2</sub>：3.3 (アミノ基)、pKa<sub>3</sub>：9.9 (ヒドロキシイミノ基)

##### (6) 分配係数

4.0×10<sup>-2</sup>(1-オクタノール / 水系)

##### (7) その他の主な示性値

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>20</sup>：-58～-66°(0.25g、pH7.0 の 0.1mol/L リン酸塩緩衝液、25mL、100mm)

吸光度 E<sub>1cm</sub><sup>1%</sup>(287nm)：570～610(0.05g、pH7.0 の 0.1mol/L リン酸塩緩衝液、5000mL)

pH：2.5～4.5 (飽和水溶液)

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

試験	保存条件		保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	室温		ポリエチレン袋 —スチール缶 包装	27 箇月	類縁物質量のわずかな増加、TLC でわずかな分解物の生成を認める以外ほとんど変化なし
加速試験	40℃、75% RH			6 箇月	褐色味を帯び、わずかな異臭、わずかな力価の低下、TLC でわずかな分解物の生成及び類縁物質量の増加を認める。
苛酷試験	熱	40℃		6 箇月	わずかな黄色味の増加、類縁物質量のわずかな増加及び TLC 上でわずかな変化を認める以外ほとんど変化なし
		30℃	12 箇月	変化なし	
	湿度	30℃、75% RH	ガラス瓶 (開放)	3 箇月	わずかな黄色味の増加、水分量及び類縁物質量のわずかな増加及び TLC 上でわずかな変化を認める以外ほとんど変化なし
光	1000lx	シャーレ (開放)	40 日	わずかな黄色味の増加、類縁物質量のわずかな増加を認める以外ほとんど変化なし	

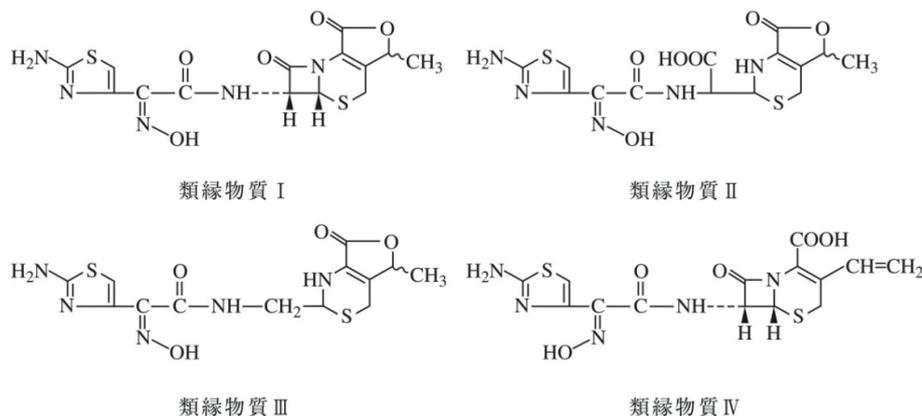
### Ⅲ. 有効成分に関する項目

試験	保存条件		保存形態	保存期間	結果
強制劣化試験	固体状態	熱 (80℃)	バイアル瓶 (密封)	6 週	わずかに褐色味を帯び、類縁物質量の増加、TLC 上での変化を認める以外ほとんど変化なし
		光 (30000lx)	シャーレ (開放)	4 週	褐色味を帯び、力価のわずかな低下、類縁物質量の増加及び TLC 上での変化を認める。
	溶液状態	pH1.0 の緩衝液	濃度：1mg/mL 無色透明 バイアル (密封) 〔遮光条件はアルミラッピング〕	3 日	経時的に力価の低下、類縁物質量の増加及び TLC 上での変化を認める。
	〔遮光及び 500lx〕	pH6.0 の緩衝液		21 日	経時的にわずかな黄色味の増加、力価の低下、類縁物質量の増加及び TLC 上での変化を認める。
pH9.0 の緩衝液		8 時間		経時的にわずかな黄色味の増加、力価の低下、類縁物質量の増加及び TLC 上での変化を認める。	

測定項目：性状、類縁物質、水分、力価、TLC

強制劣化（固体状態）による主たる生成物

(1) 熱 (80℃)・6 週間



(2) 光 (約 30000lx)・4 週間

類縁物質 I、II、VII

### 3. 有効成分の確認試験法

日局「セフジニル」の確認試験法による。

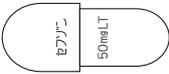
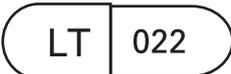
### 4. 有効成分の定量法

日局「セフジニル」の定量法による。

## 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・号数・重量	識別コード	
セフゾンカプセル 50mg	硬カプセル剤	淡赤色		—	
			号数		重量
			5号		約90mg
セフゾンカプセル 100mg	硬カプセル剤	淡赤色		LT 022	
			号数		重量
			4号		約160mg

#### (2) 製剤の物性

##### 崩壊試験

販売名	崩壊試験	
	日局第1液	水
セフゾンカプセル 50mg	2～3分	2～3分
セフゾンカプセル 100mg	2～3分	2～3分

#### (3) 識別コード

「(1) 剤形の区別、外観及び性状」の項参照

#### (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

セフゾンカプセル 50mg：1 カプセル中に日局 セフジニル 50mg（力価）を含有する。

セフゾンカプセル 100mg：1 カプセル中に日局 セフジニル 100mg（力価）を含有する。

#### (2) 添加物

「医薬品添加物の記載に関する申し合わせについて」（平成13年10月1日 日薬連発第712号）並びに「『医薬品添加物の記載に関する自主申し合わせ』の実施について」（平成14年3月13日 日薬連発第170号）に基づき全添加物について記載した。添加物は以下のとおり。

販売名	添加物
セフゾンカプセル 50mg	カルメロースカルシウム、ステアリン酸ポリオキシシル40、ステアリン酸マグネシウム、ゼラチン、ラウリル硫酸ナトリウム
セフゾンカプセル 100mg	

#### (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

IV. 製剤に関する項目

4. 製剤の各種条件下における安定性

試験	保存条件		保存形態	保存期間	結果
長期保存試験	25℃、60% RH		PTP 包装及び ポリエチレン瓶包装	24 箇月	変化なし。
苛酷試験	熱	40℃	PTP 包装	6 箇月	内容物が帯褐白色に変化し、力価のわずかな低下、TLC においてわずかな分解物の生成を認める以外変化なし。
		30℃		12 箇月	力価のわずかな低下及び TLC においてわずかな分解物の生成を認める以外変化なし。
	湿度	30℃、75% RH	ポリエチレン瓶 (開放)	3 箇月	乾燥減量のわずかな増加及び TLC においてわずかな分解物の生成を認める以外ほとんど変化なし。
	光	1000lx	シャーレ (開放)	40 日	変化なし。

測定項目：性状、溶出性、乾燥減量、類縁物質、含量

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

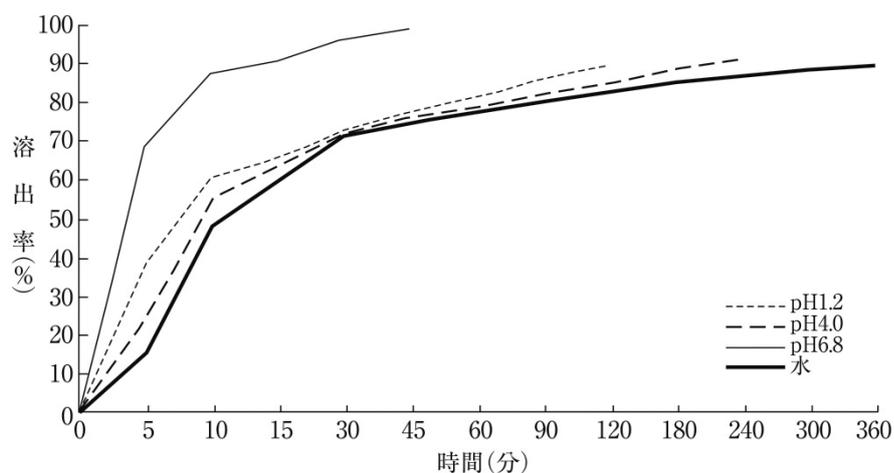
<セフジニルカプセル 50mg >

方 法：日局 溶出試験法第 2 法 (シンカーを用いる)

条 件：回転数 50rpm

試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水

溶出率：30 分間で 80%以上



#### IV. 製剤に関する項目

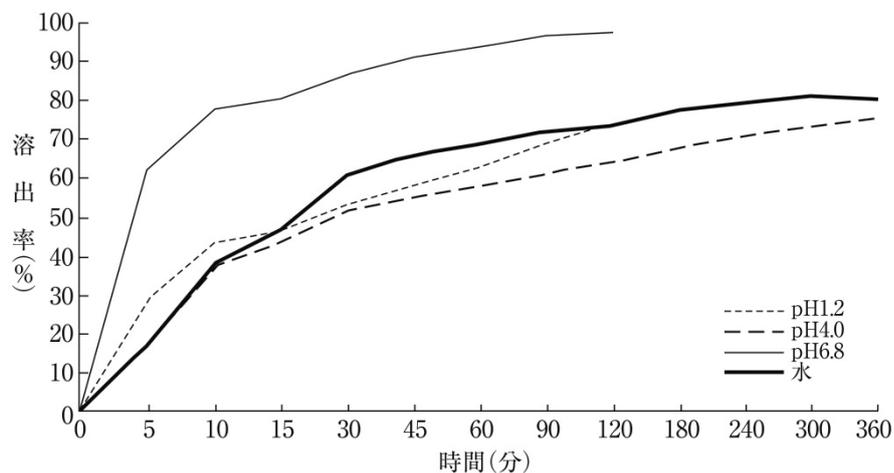
<セフジニルカプセル 100mg >

方 法：日局 溶出試験法第2法（シンカーを用いる）

条 件：回転数 50rpm

試験液：pH1.2、pH4.0、pH6.8、水

溶出率：45分間で75%以上



#### 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「セフジニルカプセル」の確認試験法による。

#### 10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「セフジニルカプセル」の定量法による。

#### 11. 力価

セフジニルの 1mg は 1mg(力価)を含有する。

#### 12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

#### 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

#### 14. その他

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### <適応菌種>

本剤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、クレブシエラ属、プロテウス・ミラビリス、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、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、急性気管支炎、肺炎、膀胱炎、腎盂腎炎、尿道炎、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、麦粒腫、瞼板腺炎、外耳炎、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、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」<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。

#### (解説)

抗微生物薬の適正使用の推進を目的として、平成29年6月1日に厚生労働省健康局結核感染症課より「抗微生物薬適正使用の手引き 第一版」<sup>1)</sup>が発出された。これを受け、平成30年3月27日付で厚生労働省医薬・生活衛生局医薬安全対策課長通知（抗微生物薬の「使用上の注意」の改訂について）が発出されたため、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、感染性腸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ついて、「抗微生物薬適正使用の手引き」に基づき適正使用がなされるよう、<効能・効果に関連する使用上の注意>の項を新設し、注意喚起することとした。

### 2. 用法及び用量

通常、セフジニルとして成人1回100mg（力価）を1日3回経口投与する。

なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。

#### <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では血中濃度が持続するので、腎障害の程度に応じて投与量を減量し、投与の間隔をあけて使用すること。血液透析患者では1日100mg 1回投与が望ましい。（「薬物動態」の項参照）
- (3) 鉄剤との併用は避けることが望ましい。  
やむを得ず併用する場合には、本剤の投与後3時間以上間隔をあけて投与する。（「相互作用」の項参照）

#### (解説)

- (1) 細菌性感染症を効能・効果とする抗菌性物質製剤一般の注意事項である。  
細菌性感染症に抗菌剤を使用する場合には、起炎菌を同定し、その感受性等により抗菌剤を選択し、治療効果により、投与中止、投与継続、抗菌剤の変更を決定することが原則である。しかしながら、実際の臨床の場において、急性感染症では、起炎菌の同定、感受性の確認以前に抗菌剤の投与を開始しなければならないことがしばしばあり、検出頻度の高い細菌を感染症の起炎菌と想定し、治療を開始（empiric therapy）しなければならないことが多い。この場合には、選択した抗菌剤を漫然と継続投与するのではなく、1) 感受性試験の結果に基づき、抗菌剤の変更を考慮するか、2) 選択した抗菌剤の有効性を72時間程度で、発熱、白血球数、CRP等の推移により判定し、①改善が得られていれば治療を継続、②改善が得られていなければ起炎菌の推定、あるいは同定と感受性、患者の病態、薬剤の使用量・使用方法等につき再検討を行い、薬剤の継続、変更を決定する必要がある。また、薬剤の中止時期は上記所見の改善をもって決定することが一般的のようである。
- (2) 腎機能障害のみられる患者では、障害の程度に応じて血漿中濃度半減期が延長し、血漿中濃度が長時間持続することから慎重に投与すべきである。血液透析患者では1日1回100mg投与で十分な臨床効果が期待できると考えられる。
- (3) 鉄剤との同時服用により本剤の吸収が約10分の1まで低下し、本剤投与3時間後に鉄剤を服用した場合には、同時服用に比べて吸収低下が約75%まで軽減する。

V. 治療に関する項目

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

1,638 例の一般臨床試験における成績概要は次のとおりである。なお、一般臨床試験における 1 日投与量は主として 300mg(力価)(食後分 3) であり、最大 600mg(力価)(食後分 3) であった。また、3 種類の二重盲検比較試験(浅在性化膿性疾患<sup>2)</sup>、肺炎<sup>3)</sup>、複雑性尿路感染症<sup>4)</sup>) において本剤の有用性が認められている。

疾患名		有効例 / 症例数	有効率(%)
皮膚感染症	表在性皮膚感染症	22/25	88.0
	毛嚢(包)炎	20/23	87.0
	伝染性膿痂疹	2/2	—
	深在性皮膚感染症	96/110	87.3
	せつ、せつ腫症、よう	46/52	88.5
	丹毒、蜂巣炎、ひょう疽、化膿性爪囲(廓)炎	50/58	86.2
リンパ管・リンパ節炎	13/14	92.9	
慢性膿皮症(皮下膿瘍、汗腺炎、感染性粉瘤、慢性膿皮症)	91/107	85.0	
外科領域感染症	外傷・熱傷及び手術創等の二次感染	31/36	86.1
	乳腺炎	11/13	84.6
	肛門周囲膿瘍	12/12	100
呼吸器感染症	咽頭・喉頭炎	27/31	87.1
	扁桃炎	65/67	97.0
	急性気管支炎	108/133	81.2
	肺炎	139/174	79.9
尿路感染症	膀胱炎	271/327	82.9
	腎盂腎炎	60/76	78.9
	尿道炎(淋菌性尿道炎)	45/45	100
婦人科感染症	バルトリン腺炎	37/40	92.5
	子宮内感染	69/78	88.5
	子宮付属器炎	21/25	84.0
眼科領域感染症	麦粒腫	18/18	100
	瞼板腺炎	11/14	78.6
耳鼻科感染症	外耳炎	22/26	84.6
	中耳炎	43/60	71.7
	副鼻腔炎	23/33	69.7
歯科口腔外科感染症	歯周組織炎	54/59	91.5
	歯冠周囲炎	35/40	87.5
	顎炎	69/75	92.0
合計		1,393/1,638	85.0

[荒田 次郎 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：1016, 1989]

[原 耕平 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：634, 1989]

[河田 幸道 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：893, 1989]

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

## V. 治療に関する項目

### (3) 臨床薬理試験

第 I 相試験として健康成人男子 30 例を対象にセフジニル 50～200mg の単回投与試験<sup>5,\*</sup>、1 回 100mg、1 日 3 回、3 日間の連続投与試験<sup>\*)</sup> 及び 1 回 200mg、1 日 3 回、15 日間の連続投与試験<sup>5)</sup> を実施し、忍容性を検討した。その結果、軽度の副作用及び臨床検査値異常変動がみられたが、第 II 相試験への移行は可能と判断された。  
(\*：未公表資料)

[島田 馨 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：208, 1989]

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg (力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

### (4) 探索的試験

下記「(5)1) 無作為化並行用量反応試験」の項参照

### (5) 検証的試験

#### 1) 無作為化並行用量反応試験

##### ① 浅在性化膿性疾患<sup>6)</sup>

浅在性化膿性疾患 (111 例) を対象にセフジニル 150mg/日及び 300mg/日、対照薬 750mg/日 を 7 日間経口投与し有効性並びに安全性を比較検討した。なお、セフジニルの 2 用量間は二重盲検法とし、セフジニルと対照薬間是非盲検法とした。有効率はセフジニル 150mg 群 91.2% (31/34)、300mg 群 88.2% (30/34)、対照薬 750mg 群 84.8% (28/33) であり 3 薬剤群間に有意差は認められなかった。副作用はそれぞれ 5.6% (2/36)、5.4% (2/37)、11.4% (4/35) に認められた。

##### ② 肺炎<sup>7)</sup>

肺炎 (87 例) を対象にセフジニル 300mg/日及び 600mg/日を 14 日間経口投与し、有効性並びに安全性を二重盲検法により比較検討した。有効率はセフジニル 300mg/日群 93.8% (28/32)、600mg/日群 78.4% (29/37) で 300mg/日群が有意に優れていた。副作用はそれぞれ 2.6% (1/39)、4.8% (2/42) に認められた。

##### ③ 複雑性尿路感染症<sup>8)</sup>

複雑性尿路感染症 (151 例) を対象にセフジニル 300mg/日及び 600mg/日、対照薬 1,500mg/日 を 5 日間経口投与し有効性並びに安全性を比較検討した。なお、セフジニルの 2 用量間は二重盲検法とし、セフジニルと対照薬間是非盲検法とした。有効率はセフジニル 300mg 群 78.1% (25/32)、600mg 群 80.6% (29/36)、対照薬 1,500mg 群 78.1% (25/32) であり 3 薬剤群間に有意差は認められなかった。副作用はそれぞれ 4.1% (2/49)、3.9% (2/51)、2.0% (1/49) に認められた。

[荒田 次郎 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：996, 1989]

[原 耕平 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：612, 1989]

[河田 幸道 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：874, 1989]

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg (力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

## V. 治療に関する項目

### 2) 比較試験

浅在性化膿性疾患 (300 例)<sup>2)</sup>、肺炎 (211 例)<sup>3)</sup>、複雑性尿路感染症 (298 例)<sup>4)</sup> を対象に対照薬と二重盲検比較試験を実施した。

対象疾患	浅在性化膿性疾患		肺炎		複雑性尿路感染症	
	セフジニル	対照薬	セフジニル	対照薬	セフジニル	対照薬
用法・用量	300 (mg/日)	750 (mg/日)	300 (mg/日)	1,500 (mg/日)	600 (mg/日)	1,500 (mg/日)
	7～10日間経口投与		14日間経口投与		5日間経口投与	
臨床効果* (%) [検定]	117/131 (89.3)	105/134 (78.4)	70/85 (82.4)	67/81 (82.7)	78/95 (82.1)	87/107 (81.3)
	[P < 0.01 : U]		[N.S.]		[N.S.]	
細菌学的効果** (%) [検定]	78/86 (90.7)	66/79 (83.5)	13/15 (86.7)	24/27 (88.9)	137/151 (90.7)	142/167 (85.0)
	[N.S.]		[N.S.]		[N.S.]	
有用性*** (%) [検定]	83/93 (89.2)	75/105 (71.4)	63/81 (77.8)	64/78 (82.1)	有用性のスコア平均値 77.3±27.3 73.8±30.8	
	[P < 0.01 : U]		[N.S.]		[N.S.]	
副作用 (%) [検定]	9/142 (6.3)	4/145 (2.8)	5/102 (4.9)	3/96 (3.1)	7/147 (4.8)	6/147 (4.1)
	[N.S.]		[N.S.]		[N.S.]	

\* 臨床効果：著効・有効例 / 臨床効果判定例

\*\* 細菌学的効果：消失・菌交代例 / 細菌学的効果判定例、又は消失菌株数 / 検出菌株数

\*\*\* 有用性：極めて有用・有用例 / 有用性判定例、又は非常に満足を 100、非常に不満を 0 としたスコアの平均値

[荒田 次郎 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：1016,1989]

[原 耕平 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：634,1989]

[河田 幸道 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：893,1989]

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

### 3) 安全性試験

該当資料なし

### 4) 患者・病態別試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

(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）

① 使用成績調査<sup>9)</sup>

2,448 施設から 11,352 例を収集した。

有効性の判定は、「著明改善、改善、やや改善、不変、悪化」の 5 段階で行い、「改善」以上の症例を「有効例」として有効率を算出した。有効性解析対象症例 9,449 例における使用理由別の有効率は、次表に示すように 82.5～100% であり、全適応疾患でみると 89.8% (8,428/9,388) であった。また、安全性について、臨床検査値の異常を含む副作用発現率は 1.12% (124/11,082) であった。副作用の種類別では、AST(GOT) 上昇・ALT(GPT) 上昇等の肝臓・胆管系障害 (0.51%)、下痢等の消化管障害 (0.39%) が多く、ついで発疹などの皮膚・皮膚付属器障害、Al-P 上昇の代謝・栄養障害などが認められた。

使用理由	有効率 (%)	使用理由	有効率 (%)
表在性皮膚感染症	187/202 (92.6)	急性気管支炎	1,255/1,420 (88.4)
毛嚢(包)炎	126/138 (91.3)	肺炎	305/369 (82.7)
伝染性膿痂疹	61/64 (95.3)	膀胱炎	1,537/1,691 (90.9)
深在性皮膚感染症	— (—)	腎盂腎炎	186/209 (89.0)
せつ、せつ腫症、よう	227/243 (93.4)	尿道炎(淋菌性尿道炎)	75/75 (100)
丹毒、蜂巣炎、ひょう疽、化膿性爪囲(廓)炎	363/404 (89.9)	バルトリン腺炎	89/98 (90.8)
		子宮内感染	92/98 (93.9)
		子宮付属器炎	68/75 (90.7)
リンパ管・リンパ節炎		麦粒腫	184/207 (88.9)
慢性膿皮症(皮下膿瘍、汗腺炎、感染性粉瘤、慢性膿皮症)	489/526 (93.0)	瞼板腺炎	43/44 (97.7)
		外耳炎	114/129 (88.4)
		中耳炎	411/498 (82.5)
外傷・熱傷及び手術創等の二次感染	215/240 (89.6)	副鼻腔炎	226/272 (83.1)
		歯周組織炎	163/178 (91.6)
乳腺炎	74/76 (97.4)	歯冠周囲炎	40/43 (93.0)
肛門周囲膿瘍	66/72 (91.7)	顎炎	144/156 (92.3)
咽頭・喉頭炎、扁桃炎	1,875/2,063 (90.9)	合計	8,428/9,388 (89.8)

[濱本 季子 他：日本化学療法学会雑誌 49(8)：500, 2001]

② 特別調査

i) 細菌感受性調査

セフジニルの承認時の感受性を対照として 5 年間にわたって 3 回の調査をした結果、ほとんどの菌種において感受性の変動は認められなかった。*S.pneumoniae* に関しては、ペニシリン耐性菌 (PRSP) が増加傾向にあり、PRSP が 33/95 株 (34.7%) を占めたため感受性は低下した。しかし、これらの PRSP に対するセフジニルの MIC の上限は 6.25μg/mL であり、耐性化は認められなかった。

グラム陰性菌においては、セフジニル感受性分布にほとんど変化はなかったが、耐性傾向を示した株は染色体由来あるいは TEM 型と推定されるプラスミド由来の β-lactamase を産生しており、開発当初に知られていなかった機作で耐性化していると考えられる株はなかった。

ii) 妊婦に対する調査

収集した 113 例のうち、分娩調査解析対象の 48 例について解析を行った。分娩異常の発現頻度が 37.5% と高かったが、帝王切開等そのほとんどが産科的原因によるものであり、対象患者にハイリスク妊婦が多かったことが原因と考えられた。一方、新生児の出生体重及び身長は一般の分布と同様であったが、異常発現頻度は 22.4% と高かった。しかし、これは三胎の早産等、前述の分娩異常に起因するものと考えられた。

iii) 血液透析患者におけるセフゾンの体内動態の検討

「Ⅶ. 1. (3)3 腎機能障害患者」の項参照

V. 治療に関する項目

---

③ 市販後臨床試験  
実施していない。

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

セフェム系抗生物質

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

細菌の細胞壁合成阻害であり、ペプチドグリカン架橋酵素であるペニシリン結合蛋白 (PBP) と強く結びつき、架橋反応を阻害する。その作用点は菌種により異なるが、PBP の 1(1a、1bs)、2 及び 3 に親和性が高い<sup>10,11)</sup>。

その作用は殺菌的であり<sup>11-15)</sup>、また食細胞、血清補体等生体防御因子と協力的に作用する<sup>10,11)</sup>。

#### 1) 抗菌スペクトル (標準菌株)<sup>12-16)</sup>

##### 好気性菌の抗菌スペクトル<sup>14)</sup>

(10<sup>6</sup> cells/mL)

標準菌株	MIC(μg/mL)			
	セフジニル	セフィキシム	セファクロル	アモキシシリン
<b>グラム陽性菌</b>				
<i>Staphylococcus aureus</i> 209-PJC	0.05	25	0.78	0.10
<i>Staphylococcus aureus</i> Smith	0.20	12.5	0.78	0.20
<i>Staphylococcus aureus</i> Terajima	0.20	25	6.25	0.39
<i>Staphylococcus aureus</i> Neumann	0.20	12.5	1.56	0.20
<i>Staphylococcus aureus</i> E-46	0.20	6.25	1.56	0.20
<i>Staphylococcus aureus</i> No.80	0.20	12.5	1.56	0.20
<i>Staphylococcus epidermidis</i>	1.56	> 100	1.56	0.39
<i>Streptococcus pyogenes</i> S-23	0.012	0.10	0.10	0.012
<i>Streptococcus pyogenes</i> Cook	0.012	0.10	0.20	0.012
<i>Streptococcus pyogenes</i> C-203	≦ 0.006	0.10	0.025	≦ 0.006
<i>Enterococcus faecalis</i>	50	> 100	25	0.78
<i>Viridans group Streptococcus</i>	50	> 100	25	0.78
<i>Streptococcus pneumoniae</i> type I	0.05	0.20	0.39	0.39
<i>Streptococcus pneumoniae</i> type II	0.05	0.20	0.39	≦ 0.006
<i>Streptococcus pneumoniae</i> type III	0.025	0.20	0.78	0.025
<i>Corynebacterium diphtheriae</i>	0.20	25	0.39	0.20
<i>Corynebacterium diphtheriae</i> Toronto	0.012	≦ 0.006	≦ 0.006	≦ 0.006
<i>Micrococcus luteus</i> ATCC 9341	0.025	1.56	0.025	≦ 0.006
<i>Bacillus subtilis</i> ATCC 6633	0.05	0.78	0.05	0.012
<i>Bacillus anthracis</i>	1.56	> 100	0.39	0.012
<b>グラム陰性菌</b>				
<i>Neisseria gonorrhoeae</i>	≦ 0.006	≦ 0.006	0.10	0.10
<i>Neisseria meningitidis</i>	≦ 0.006	≦ 0.006	0.20	0.05
<i>Escherichia coli</i> NIH JC-2	0.39	0.39	1.56	6.25
<i>Escherichia coli</i> NIH	0.10	0.39	0.78	6.25
<i>Escherichia coli</i> K-12	0.10	0.20	0.78	3.13
<i>Escherichia coli</i> KC-14	0.20	0.39	0.78	6.25
<i>Citrobacter freundii</i> NIH 10018-68	100	50	> 100	> 100
<i>Klebsiella pneumoniae</i> NCTC 9632	0.10	0.025	0.39	50
<i>Klebsiella pneumoniae</i> KC-1	0.10	0.025	0.39	0.78
<i>Klebsiella pneumoniae</i> DT-S	0.10	0.05	0.39	0.78
<i>Enterobacter cloacae</i> NCTC 9394	6.25	1.56	> 100	> 100
<i>Enterobacter aerogenes</i> NCTC 10006	12.5	6.25	> 100	> 100
<i>Enterobacter aerogenes</i>	0.20	0.05	50	100
<i>Hafnia alvei</i> NCTC 9540	3.13	0.78	100	100
<i>Serratia marcescens</i> IFO 37361	3.13	0.20	> 100	50
<i>Serratia marcescens</i> T-55	6.25	0.78	> 100	25
<i>Proteus vulgaris</i> OX-19	0.39	≦ 0.006	25	50
<i>Proteus mirabilis</i> 1287	0.10	≦ 0.006	0.78	0.39
<i>Proteus mirabilis</i> 181	0.10	≦ 0.006	1.56	1.56
<i>Morganella morganii</i> Kono	3.13	0.39	100	> 100
<i>Providencia rettgeri</i> NIH 96	≦ 0.006	≦ 0.006	0.20	0.39
<i>Providencia stuartii</i> NIH 118	0.05	≦ 0.006	6.25	100
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> No.12	> 100	50	> 100	> 100
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> Nc-5	> 100	100	> 100	> 100
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> E-2	> 100	100	> 100	> 100
<i>Haemophilus influenzae</i> ATCC 10211	0.20	0.012	0.78	0.20
<i>Acinetobacter calcoaceticus</i> Ac-54	1.56	6.25	12.5	12.5
<i>Alcaligenes faecalis</i> IFO 1311	1.56	3.13	0.78	6.25

VI. 薬効薬理に関する項目

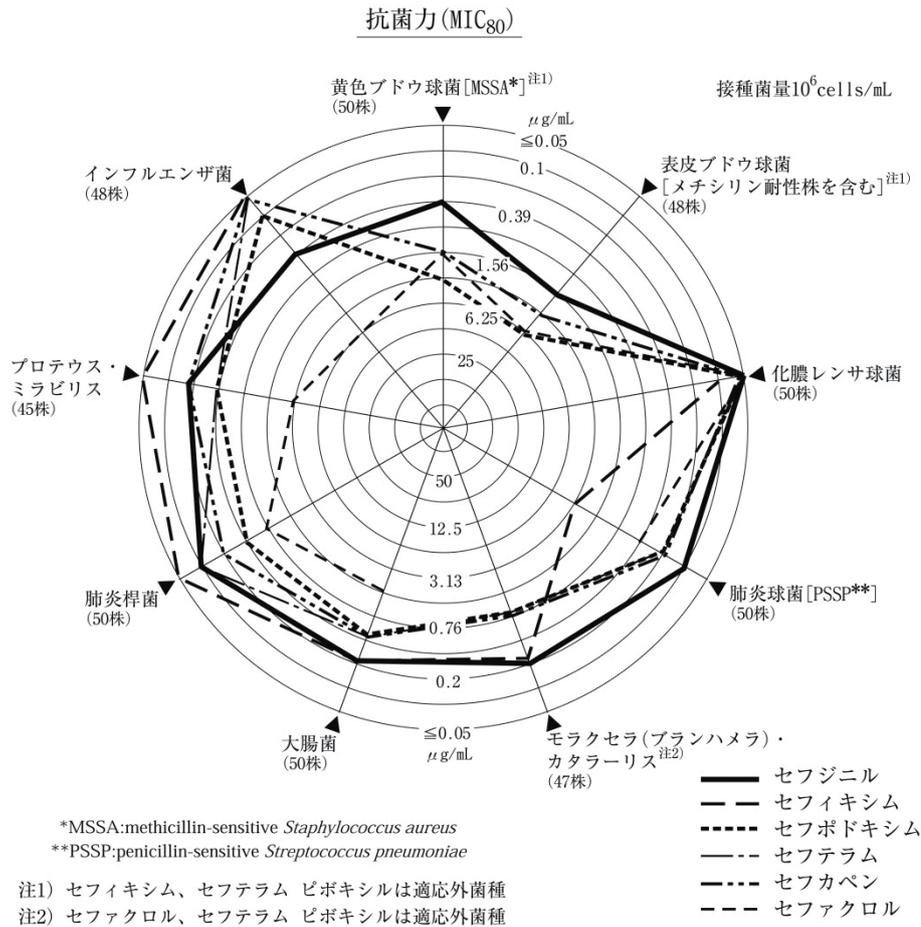
嫌気性菌の抗菌スペクトル<sup>15)</sup>

(10<sup>6</sup>cells/mL)

標準菌株	MIC(μg/mL)			
	セフジニル	セフィキシム	セファクロル	アモキシシリン
<b>グラム陽性菌</b>				
<i>Peptostreptococcus anaerobius</i> ATCC 27337	0.78	3.13	0.39	0.39
<i>Peptostreptococcus magnus</i> ATCC 29328	0.20	6.25	1.56	0.20
<i>Peptostreptococcus asaccharolyticus</i> WAL 3218	0.10	0.78	1.56	0.20
<i>Peptostreptococcus prevotii</i> ATCC 9321	0.05	0.78	0.39	≦ 0.025
<i>Streptococcus intermedius</i> ATCC 27335	0.39	3.13	1.56	0.39
<i>Staphylococcus saccharolyticus</i> ATCC 13953	≦ 0.025	3.13	0.10	≦ 0.025
<i>Propionibacterium acnes</i> ATCC 11828	0.39	1.56	3.13	0.78
<i>Bifidobacterium adolescentis</i> ATCC 15703	0.39	6.25	3.13	0.20
<i>Eubacterium lentum</i> ATCC 25559	25	> 200	50	3.13
<i>Clostridium perfringens</i> GAI 5526	0.78	6.25	1.56	0.20
<i>Clostridium ramosum</i> ATCC 25582	0.39	0.78	0.10	≦ 0.025
<i>Clostridium septicum</i> ATCC 12464	3.13	> 200	0.05	0.05
<i>Clostridium difficile</i> GAI 10029	6.25	25	50	25
<i>Clostridium difficile</i> GAI 10038	25	> 200	50	0.78
<b>グラム陰性菌</b>				
<i>Bacteroides fragilis</i> GAI 0558	> 200	> 200	> 200	> 200
<i>Bacteroides fragilis</i> GAI 5562	6.25	12.5	100	25
<i>Bacteroides distasonis</i> ATCC 8503	0.10	0.39	3.13	0.78
<i>Bacteroides ovatus</i> ATCC 8483	25	50	> 200	50
<i>Bacteroides thetaiotaomicron</i> ATCC 29741	25	100	200	25
<i>Bacteroides uniformis</i> GAI 5466	1.56	3.13	6.25	3.13
<i>Bacteroides oris</i> ATCC 33573	0.10	0.39	0.78	0.10
<i>Bacteroides oralis</i> ATCC 33269	0.10	0.39	1.56	0.10
<i>Bacteroides melaninogenicus</i> ATCC 29147	≦ 0.025	0.10	0.39	0.05
<i>Bacteroides bivius</i> ATCC 29303	0.20	1.56	1.56	0.39
<i>Bacteroides intermedius</i> ATCC 25611	0.05	0.20	0.20	0.10
<i>Bacteroides ureolyticus</i> NCTC 10941	0.20	≦ 0.025	0.39	0.05
<i>Fusobacterium nucleatum</i> ATCC 25586	0.39	1.56	1.56	0.10
<i>Fusobacterium varium</i> ATCC 8501	1.56	3.13	50	1.56
<i>Fusobacterium mortiferum</i> GAI 5576	3.13	0.78	12.5	0.78
<i>Veillonella parvula</i> ATCC 10790	0.20	0.78	0.20	0.10
<i>Capnocytophaga ochracea</i> Lo-ori	0.10	0.05	1.56	0.20

VI. 薬効薬理に関する項目

2) 各種臨床分離株の感受性分布 (1996年分離株)<sup>17)</sup>



3) 最小発育阻止濃度 (MIC) / 最小殺菌濃度 (MBC)<sup>12, 15, 16)</sup>

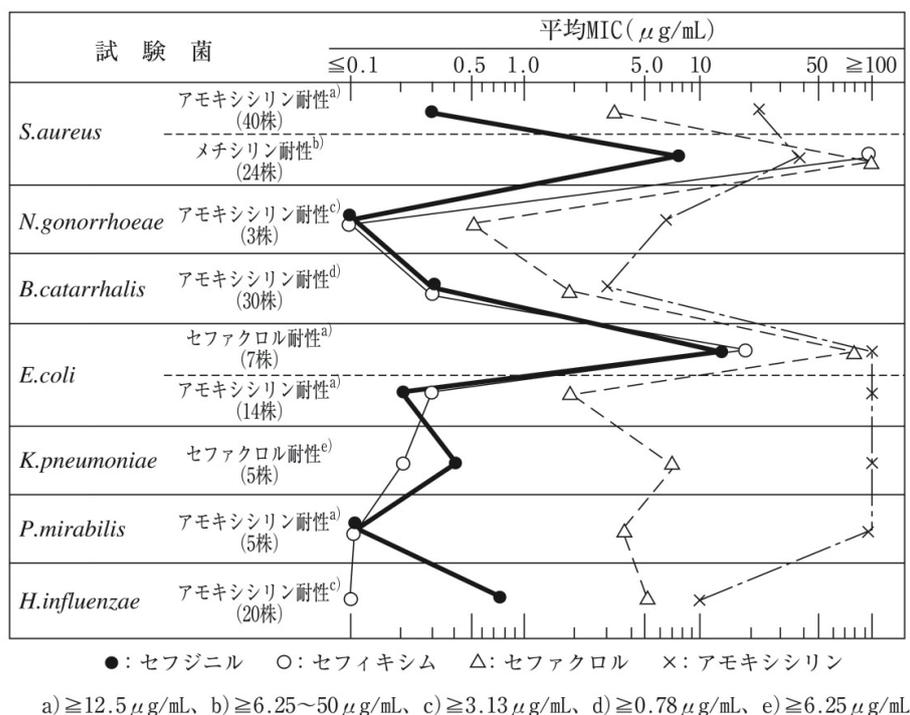
MBC は MIC と近似し、強い殺菌作用を示す。

試験菌	薬剤名	MIC→MBC (μg/mL)					
		≤0.1	0.39	1.56	6.25	25	≥100
好気性菌	<i>S.aureus</i> FDA 209P JC-1		●→●		△→△		○
	<i>E.coli</i> NIHJ JC-2			○		△→△	
	<i>K.pneumoniae</i> PCI 602	●			△		×
嫌気性菌	<i>P.magnus</i> ATCC 29328		●			○→○	●
	<i>P.acnes</i> ATCC 11828	●→●		○→○			

VI. 薬効薬理に関する項目

4) 交差耐性<sup>16)</sup>

セファクロル及びアモキシシリン耐性の各菌株に対し強い抗菌力を示し、交差耐性は認められない。しかし、セファクロル耐性大腸菌に対しては耐性を示した。



(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) ペニシリン結合蛋白 (PBP) 親和性<sup>10, 11)</sup>

黄色ブドウ球菌の PBP 1、2、3、肺炎球菌の PBP 1a、1b、2a 及び大腸菌の PBP 1a、1bs、2、3 に親和性を示す。

試験菌	PBP	ID <sub>50</sub> (μg/mL)*		
		セフジニル	セフィキシム	セファクロル
<i>S. aureus</i> 209P JC-1	1	0.58	2.9	0.2
	2	0.17	< 0.2	125
	3	0.12	6.2	< 0.2
	4	28	25	> 125
	MIC(μg/mL)	0.2	25	0.78
<i>E. coli</i> NIHJ JC-2	1a	0.09	< 0.2	1.6
	1bs	2.3	≤ 0.2	7.2
	2	1.6	16	27
	3	0.07	0.2	1.6
	4	1.1	> 125	1.6
	5	> 125	> 125	> 25
	6	> 125	13	> 25
MIC(μg/mL)	0.2	0.2	3.13	

\*<sup>14</sup>C-PCG の結合を 50% 阻止させる被検薬濃度

VI. 薬効薬理に関する項目

2)  $\beta$ -lactamase に対する安定性<sup>10-13, 15)</sup>、結合親和性<sup>10, 18)</sup> 及び誘導能<sup>11)</sup>

- 各種セファロスポリナーゼ、ペニシリナーゼに対して安定であるが、バクテロイデス・フラジリスの産生するセフロキシマーゼに不安定である。
- 各種ペニシリナーゼ、セファロスポリナーゼに対し結合親和性は低いが、一部のセファロスポリナーゼに高い親和性を示す。
- $\beta$ -lactamase 誘導活性は強くなく、既存のセファレキシン、セファクロル、セフィキシム等と同程度である。

	薬剤	セファロスポリナーゼ						ペニシリナーゼ				
		Ia(1)	Ia(2)	Ib	Ic	Id	CX <sub>ase</sub>	II	III	IV	V	<i>S.aureus</i>
安 <sup>**</sup> 定 性	セフジニル	3.2	0.5	3.5	27	18	320	< 0.1	0.1	0.1	1.0	< 0.1
	セフィキシム	4.4	0.3	1.0	2.6	0.9	12	< 0.1	0.4	< 0.1	0.1	< 0.1
	セファクロル	140	45	102	292	31	46	0.1	2.7	3.2	0.3	2.2
親 <sup>**</sup> 和 性	セフジニル	183	0.05	0.17	18	1.5	<u>95</u>	15	80	24	<u>79</u>	407
	セフィキシム	12	0.03	0.03	74	0.37	110	250	> 1000	> 1000	420	> 1000
	セファクロル	168	3.8	2.5	33	6.1	<u>9.2</u>	536	> 1000	> 1000	> 1000	54

※ 相対水解速度：セファロスポリナーゼはセファロジリン、ペニシリナーゼはアンピシリンの水解速度を 100 とした時の相対値  
 ※※親和性：下線を付した値は Km 値、それ以外は Ki 値を示す。

3) 外膜透過性<sup>11)</sup>

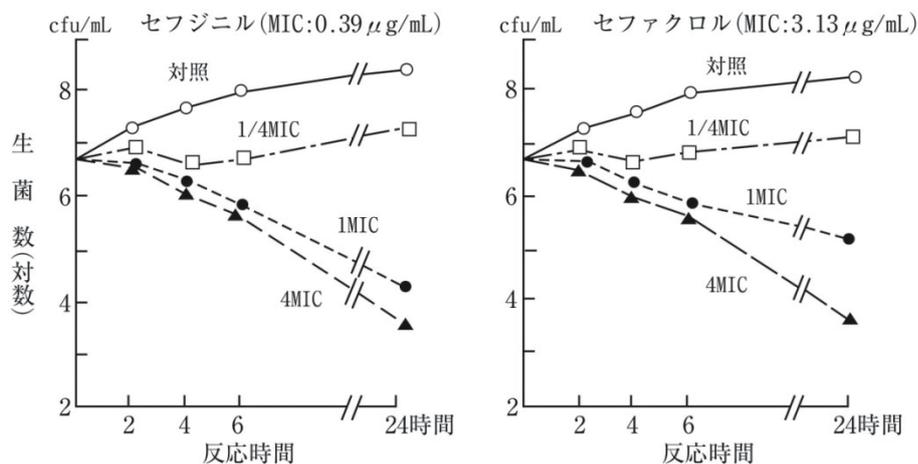
大腸菌における外膜透過性はセフィキシムより優れるものの、セファレキシン、セファクロルより劣る。

4) 殺菌作用<sup>12-16)</sup>

黄色ブドウ球菌、溶血レンサ球菌、大腸菌、肺炎桿菌に対し MIC 以上の濃度で殺菌的に作用する。

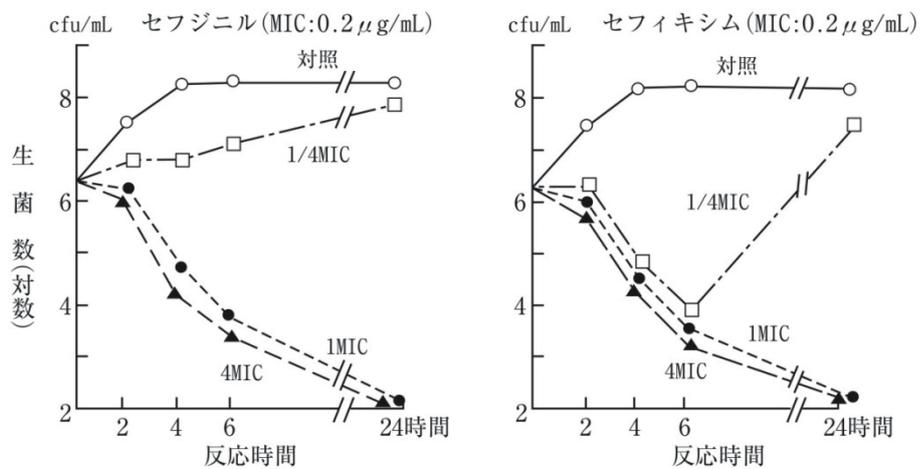
[増殖曲線に及ぼす影響]

*S. aureus* 2558



VI. 薬効薬理に関する項目

*E. coli* 3147



- (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

起炎菌の MIC (最小発育阻止濃度) 以上の濃度

#### (2) 最高血中濃度到達時間

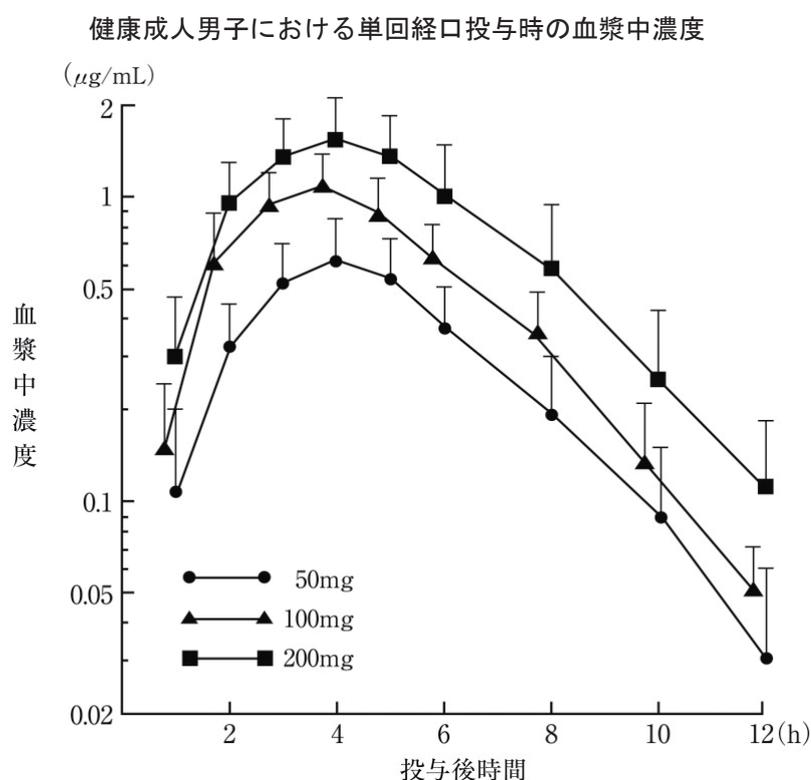
約 4 時間 (「(3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照)

#### (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<sup>5)</sup>

健康成人 6 例に 50、100、200mg (力価) を空腹時単回経口投与すると約 4 時間後にそれぞれ 0.64、1.11、1.74 $\mu\text{g}/\text{mL}$  の最高血漿中濃度が得られ、その消失半減期は 1.6 ~ 1.8 時間であった。



投与量 (mg)	C <sub>max</sub> (μg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-∞</sub> (μg · h/mL)
50	0.64 ± 0.20	4.3 ± 0.5	1.75 ± 0.29	3.40 ± 1.12
100	1.11 ± 0.31	3.8 ± 0.4	1.59 ± 0.14	5.78 ± 1.62
200	1.74 ± 0.40	3.7 ± 1.0	1.78 ± 0.22	9.23 ± 2.59

(生物学的定量法、クロスオーバー法、n=6、平均± S.D.)

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg (力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

VII. 薬物動態に関する項目

② 連続投与<sup>5)</sup>

健康成人 6 例に 1 回 200mg(力価)を 1 日 3 回 14 日間と 15 日目 1 回の計 43 回食後連続経口投与したところ、初回投与時と最終投与時の最高血漿中濃度、最高血漿中濃度到達時間及び AUC 等両投与時の体内動態に有意な差はみられず、蓄積性は認められなかった。

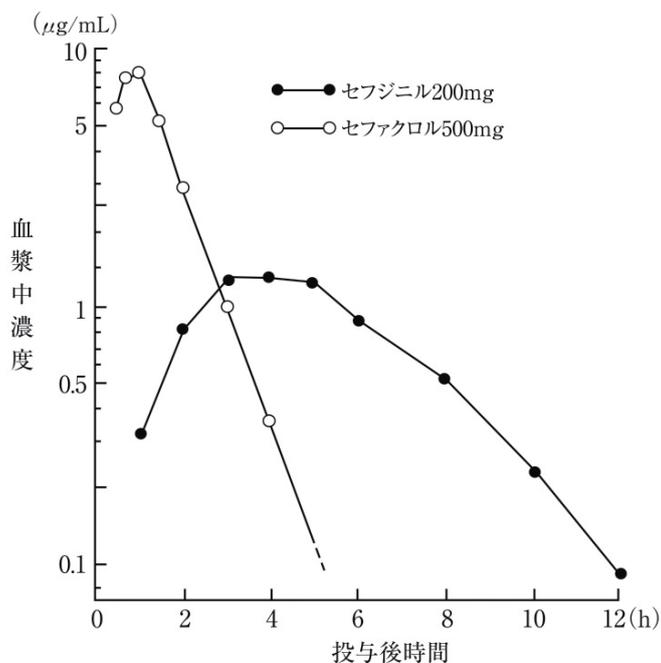
測定時期	C <sub>max</sub> (µg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-6</sub> (µg · h/mL)
初回投与時	1.36 ± 0.22	3.8 ± 0.4	—	4.99 ± 0.78
最終投与時	1.37 ± 0.23	3.5 ± 0.5	1.88 ± 0.51	5.84 ± 0.88

(生物学的定量法、n=6、平均±S.D.)

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

③ 類薬との比較<sup>19)</sup>

健康成人 6 例にセフジニル 1 回 200mg(力価)又はセファクロル 1 回 500mg(力価)をクロスオーバー法で空腹時に単回経口投与した。



薬剤	C <sub>max</sub> (µg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	尿中回収率 (%)
セフジニル	1.35 ± 0.12	3.70 ± 0.45	1.25 ± 0.17	28.7 ± 3.9 <sup>(0-12h)</sup>
セファクロル	8.50 ± 2.69	0.86 ± 0.24	0.42 ± 0.08	69.0 ± 9.8 <sup>(0-6h)</sup>

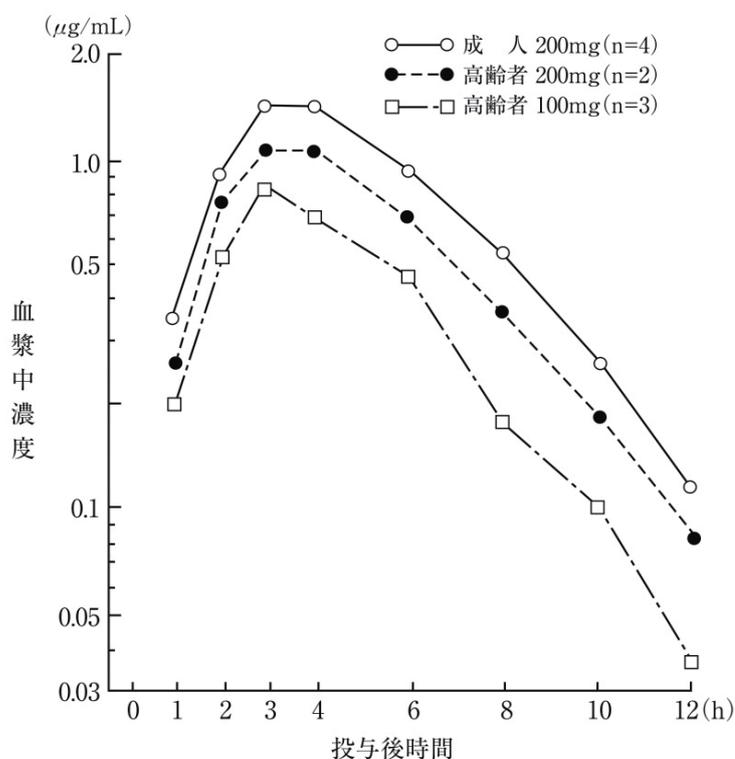
(生物学的定量法、クロスオーバー法、n=6、平均±S.D.)

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

VII. 薬物動態に関する項目

2) 高齢者

高齢患者 (72 ~ 83 歳) 5 例に 100 又は 200mg (力価) を空腹時単回経口投与したとき、最高血漿中濃度及び AUC は健康成人男子と比較するとやや低下しているが、他のパラメータはほぼ同様であり、加齢による体内動態の著明な変化は認めなかった<sup>20)</sup>。



対象	投与量 (mg)	年齢	Ccr (mL/min)	C <sub>max</sub> (µg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-∞</sub> (µg · h/mL)
成人	200	48.3 ± 10.9	—	1.51 ± 0.04	3.5 ± 0.6	1.76 ± 0.17	8.66 ± 0.32
高齢者	100	77.0 ± 5.6	92.2 ± 3.7	0.85 ± 0.06	3.0 ± 0.0	1.76 ± 0.21	4.23 ± 0.37
	200	74.5 ± 3.5	98.9 ± 0.7	1.15 ± 0.04	3.5 ± 0.7	1.90 ± 0.01	6.60 ± 0.29

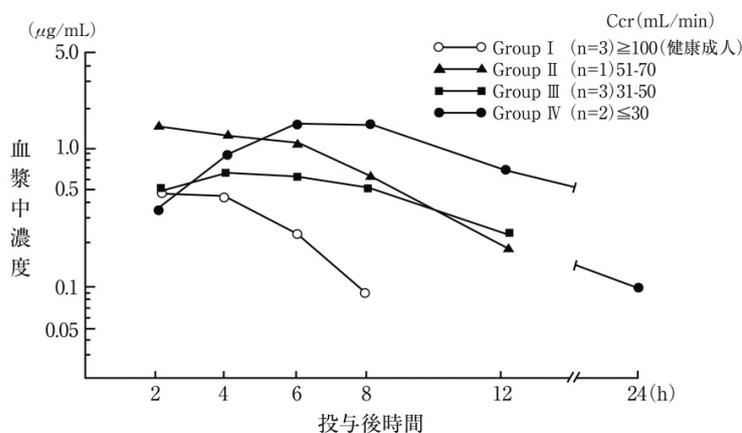
(生物学的定量法、平均 ± S.D.)

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg (力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

VII. 薬物動態に関する項目

3) 腎機能障害患者

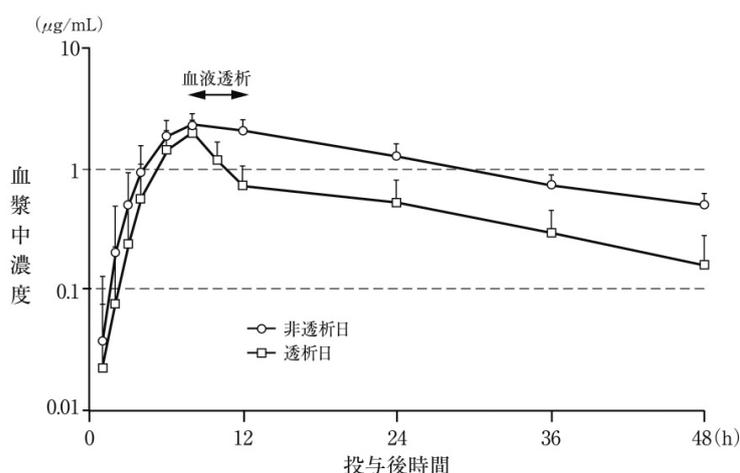
①腎機能障害患者 (Ccr12~51mL/min) 6 例に 100mg (力価) を空腹時に単回経口投与したとき、腎機能 (Ccr) の低下に伴い血漿中濃度の消失半減期の延長、AUC の上昇が認められた<sup>21)</sup>。



群	Ccr (mL/min)	例数	血漿中濃度 (μg/mL)					t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-∞</sub> (μg · h/mL)	
			2	4	6	8	12			24 時間
I	≥ 100	3	0.49 ± 0.08	0.47 ± 0.08	0.24 ± 0.09	0.09 ± 0.04	—	—	1.66 ± 0.26	2.76 ± 0.68
II	51-70	1	1.49	1.25	1.12	0.64	0.20	—	2.41	10.74
III	31-50	3	0.49 ± 0.25	0.73 ± 0.31	0.65 ± 0.25	0.55 ± 0.23	0.26 ± 0.14	—	2.92 ± 0.53	7.48 ± 3.44
IV	≤ 30	2	0.36 ± 0.23	0.97 ± 0.35	1.55 ± 0.11	1.59	0.73 ± 0.09	0.10 ± 0.04	4.06 ± 0.55	16.94 ± 0.94

(生物学的定量法、平均 ± S.E.) — : 測定せず

②血液透析患者 6 例に 100mg (力価) を食後に単回経口投与したとき、血漿中濃度の消失半減期は健康成人の約 11 倍に増加した。同じ患者に 100mg (力価) を食後に単回経口投与し、ほぼ最高血漿中濃度に達した時間より 4 時間透析を施行したとき、透析中の半減期は非透析日の約 1/6 に短縮し、透析による除去率は 61% であった<sup>22)</sup>。



測定時期	C <sub>max</sub> (μg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-∞</sub> (μg · h/mL)	除去率 (%)
非透析日	2.36 ± 0.53	9.00 ± 2.45	16.95 ± 1.20	69.05 ± 14.84	—
透析日	2.03 ± 0.54	—	2.76 ± 1.01 <sup>注)</sup>	30.18 ± 12.03	61 ± 6

注) 透析中の半減期

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

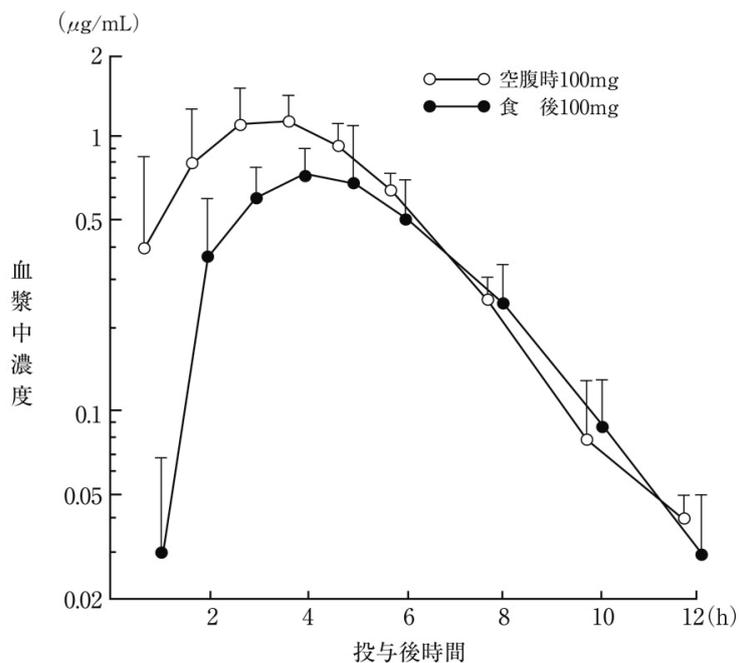
(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響<sup>23)</sup>

健康成人6例に100mg(力価)を空腹時及び食後に単回経口投与し比較したとき、最高血漿中濃度到達時間及び半減期に差はみられなかったが、最高血漿中濃度、AUC<sub>0-∞</sub>及び尿中排泄率が食後投与群で有意に低下し、食後投与では吸収率がやや低下した。



(食事内容：ロールパン2個(70g)、マーガリン(5g)、チーズ(20g)、  
半熟卵1個、オレンジジュース(100mL)、低脂肪ミルク(150mL))

投与条件	C <sub>max</sub> (μg/mL)	T <sub>max</sub> (h)	t <sub>1/2</sub> (h)	AUC <sub>0-∞</sub> (μg・h/mL)	尿中排泄率 (0-12h、%)
空腹時(100mg)	1.25 ± 0.33	3.5 ± 0.5	1.44 ± 0.12	6.16 ± 1.65	36.7 ± 8.6
食後(100mg)	0.79* ± 0.19	4.3 ± 0.5	1.48 ± 0.12	4.04* ± 0.72	24.8* ± 4.6

(生物学的定量法、クロスオーバー法、n=6、平均±S.D.)

\* : P < 0.05

2) 併用薬の影響

「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照

(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

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

### (3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

### (4) 消失速度定数

単回投与：0.396 ～ 0.440h<sup>-1</sup>

連続投与：0.391h<sup>-1</sup>

### (5) クリアランス

単回投与：健康成人 6 例に 50、100 及び 200mg(力価)をクロスオーバー法により空腹時単回経口投与したとき、12 時間までの腎クリアランスはそれぞれ 85.4 ± 12.7、89.2 ± 6.0、93.5 ± 23.1mL/min であった<sup>5)</sup>。

連続投与：健康成人 6 例に 1 回 200mg(力価)を 1 日 3 回 14 日間と 15 日目 1 回の計 43 回食後連続経口投与したとき、投与終了後から 6 時間までの腎クリアランスは 118 ± 15mL/min であった<sup>5)</sup>。

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

### (6) 分布容積

該当資料なし

### (7) 血漿蛋白結合率

73.1 ± 2.2% (限外濾過法)<sup>24)</sup>

## 3. 吸収

吸収部位：腸管

吸収率：健康成人 6 例に 50、100 及び 200mg(力価)を単回経口投与したとき、投与 24 時間後までに尿中未変化体が投与量の約 30%排泄される<sup>5)</sup>ことから、吸収率は少なくとも 30%以上と推定される。

腸管循環：ヒトの胆汁中移行は殆ど認められないことから、腸肝循環の体内動態に及ぼす影響はないと考えられる<sup>25)</sup>。

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

## 4. 分布

### (1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

### (2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

### (3) 乳汁への移行性

1) 授乳中の褥婦 4 例に 200mg(力価)単回経口投与したとき、投与後 6 時間までの母乳中には検出されなかった<sup>26)</sup>。

2) 授乳中の初産婦、経産婦各 10 例に 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回 5 日間経口投与したとき、100mg 投与後 4 時間までの母乳中への移行は認められず、また 5 日間連続投与においても検出されなかった<sup>27)</sup>。

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価)を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

VII. 薬物動態に関する項目

(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) 喀痰中への移行<sup>20, 28-33)</sup>

下気道感染症患者に 100 又は 200mg (力価) を単回又は 1 日 3 回、1 ~ 7 日間連続投与したとき、31 例中 21 例において、喀痰中に 0.02 ~ 0.09µg/mL 検出された。

投与量	投与方法	最高濃度 (µg/mL)		喀痰 / 血漿 (%)
		喀痰	血漿	
100mg	連続投与 (n=6)	0.02 ~ 0.05	0.29 ~ 1.75	1.7 ~ 16.7
	3 回 / 日、2 ~ 7 日間			
200mg	単回投与 (n=7)	0.02 ~ 0.09	0.84 ~ 3.39	0.9 ~ 9.5
	連続投与 (n=8)			
	3 回 / 日、1 ~ 7 日間	0.02 ~ 0.06	0.18 ~ 2.15	0.9 ~ 15.6

(生物学的定量法)

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg (力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

2) 扁桃組織への移行<sup>34, 35)</sup>

扁桃摘出施行患者に 100mg (力価) を単回経口投与したとき、14 例中 13 例において投与後 1.5 ~ 6 時間の扁桃組織中に 0.06 ~ 0.41µg/g 検出された。

投与量・投与方法	投与後時間	濃度 (µg/g 又は mL)		組織 / 血漿 (%)
		扁桃組織	血漿	
100mg 単回投与	1 時間 30 分	0.41	0.57	71.7
	3 時間	0.17	0.86	20.3
	3 時間 10 分	0.06	0.45	13.3
	3 時間 10 分	0.13	1.26	10.7
	3 時間 20 分	0.30	1.02	29.4
	3 時間 30 分	0.08	0.87	9.7
	3 時間 40 分	0.25	0.88	27.8
	3 時間 45 分	0.17	1.13	15.4
	4 時間	0.18	0.75	24.0
	4 時間	0.21	1.13	18.6
	4 時間 25 分	0.23	1.25	18.7
	5 時間	0.10	0.45	22.2
	5 時間 20 分	0.12	0.41	29.3

(生物学的定量法)

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

3) 上顎洞粘膜組織への移行<sup>34, 35)</sup>

副鼻腔炎患者 7 例に 100mg (力価) を単回経口投与したとき、投与後 2.5 ～ 5 時間の上顎洞粘膜中に 0.06 ～ 0.60 $\mu$ g/g 検出された。

投与量・ 投与方法	投与後時間	濃度 ( $\mu$ g/g 又は mL)		組織/血漿 (%)
		上顎洞粘膜組織	血漿	
100mg 単回投与	2 時間 30 分	0.19	0.75	25.5
	3 時間 30 分	0.39	0.54	72.1
	3 時間 30 分	0.06	0.82	7.7
	4 時間 5 分	0.32	0.82	39.0
	4 時間 25 分	0.20	0.76	26.3
	4 時間 35 分	0.55	2.11	26.1
	5 時間	0.60	0.92	65.2

(生物学的定量法)

4) 中耳分泌物中への移行<sup>34, 35)</sup>

中耳炎患者に 100mg (力価) を単回又は 1 日 3 回連続経口投与したとき、6 例中 4 例において投与後 3.5 ～ 8 時間の中耳分泌物中に 0.02 ～ 0.12 $\mu$ g/mL 検出された。

投与量	投与方法	投与後時間	濃度 ( $\mu$ g/mL)		分泌物/血漿 (%)
			中耳分泌物	血漿 [投与後時間]	
100mg	単回投与	4 時間	0.02	0.16 [4 時間]	12.5
		8 時間	0.05	0.36 [4 時間]	13.9
	3 回 / 日 1 日間 連続投与	3 時間 30 分	0.12	0.26 [3 時間 30 分]	46.2
		3 時間 30 分	0.03	0.07 [3 時間 30 分]	42.9

(生物学的定量法)

5) 皮膚組織への移行<sup>36-38)</sup>

皮膚切除施行患者に 100mg (力価) を単回経口投与したとき、17 例中 12 例において、投与後約 3 ～ 4 時間の皮膚組織中に 0.07 ～ 0.37 $\mu$ g/g 検出された。

投与量・ 投与方法	投与後時間	濃度 ( $\mu$ g/g 又は mL)		組織/血漿 (%)
		皮膚組織	血漿	
100mg 単回投与	2 時間 40 分	0.07	0.96	6.9
	3 時間	0.37	0.77	48.1
	3 時間 10 分	0.14	0.62	22.6
	3 時間 30 分	0.31	0.58	53.4
	3 時間 30 分	0.32	0.44	72.7
	3 時間 50 分	0.22	0.50	44.0
	4 時間	0.35	1.00	35.0
	4 時間	0.33	0.73	45.2
	4 時間	0.23	0.47	48.9
	4 時間	0.12	0.31	38.7
	4 時間 13 分	0.16	1.01	15.4
	4 時間 20 分	0.35	1.07	33.1

(生物学的定量法)

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

6) 尿道分泌物中への移行<sup>39)</sup>

淋菌感染症（淋疾）患者 3 例に 200mg（力価）を単回経口投与したとき、投与後 1～3 時間の尿道分泌物中に 0.06～2.50 $\mu$ g/g 検出された。

投与量・ 投与方法	投与後時間	濃度 ( $\mu$ g/g 又は mL)		組織 / 血清 (%)
		尿道分泌物	血清	
200mg 単回投与	1 時間	0.06	—	—
	2 時間	2.50	3.14	79.6
	3 時間	0.50	1.07	46.7

（生物学的定量法）—：測定せず

注）本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg（力価）を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

7) 女性性器への移行<sup>26, 40, 41)</sup>

子宮全摘術施行患者に 100mg 又は 200mg（力価）を単回経口投与したとき、69 例中 68 例において投与後約 2～9 時間に女性性器組織中への移行が認められた。

( $\mu$ g/mL or g)

投与量	肘静脈血	子宮動脈血	子宮内膜	子宮体部	子宮頸部	膣部	卵巣	卵管
100mg (n=21)	0.15～1.81	0.15～1.88	0.07～0.71	0.12～0.60	0.09～0.73	0.14～0.94	0.12～0.49	0.09～0.69
200mg (n=47)	0.05～2.84	0.03～3.15	0.10～1.78	0.09～1.11	0.07～2.02	0.08～1.31	0.13～0.99	0.08～1.13

（生物学的定量法）

注）本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg（力価）を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

8) 涙液中への移行<sup>42)</sup>

健康成人男子 6 例に 100mg（力価）を単回経口投与したとき、投与後 2～8 時間の涙液中に 0.02～0.06 $\mu$ g/mL 検出された。

投与量・ 投与方法	投与後時間	2 3 4 5 6 8 (時間)					
		100mg 単回投与	涙液中濃度 ( $\mu$ g/mL)	0.02 ± 0.01	0.02 ± 0.01	0.04 ± 0.02	0.06 ± 0.03
	血漿中濃度 ( $\mu$ g/mL)	0.26 ± 0.06	0.43 ± 0.11	0.47 ± 0.10	0.63 ± 0.08	0.45 ± 0.05	0.16 ± 0.03

（生物学的定量法、n=3、平均±S.E.）

9) 瞼板腺組織への移行<sup>43)</sup>

霰粒腫患者 5 例に 200mg（力価）を単回経口投与したときの瞼板腺組織への移行は投与後 2 時間目の 3 例では検出されず、投与後 4 時間目の 2 例で 0.37～0.77 $\mu$ g/g（組織/血清比：43.5～49.7%）が検出された。

注）本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg（力価）を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

10) 口腔組織中への移行<sup>44, 45)</sup>

歯肉等の摘出施行患者に 100mg 又は 200mg(力価) を単回経口投与したとき、45 例中 42 例において、投与後約 2～8 時間に口腔組織中への移行が認められた。

投与量・ 投与方法	(μg/mL or g)					
	歯肉	嚢胞壁	顎骨	顎下腺	耳下腺	筋組織
100mg 単回投与 (n=34)	0.04 ～ 0.96	0.09 ～ 0.52	0.12 ～ 0.75	0.23 ～ 0.43	0.04	0.08 ～ 0.28
200mg 単回投与 (n=8)	—	0.65 ～ 1.53	0.12 ～ 1.27	0.15 ～ 0.17	—	0.45

(生物学的定量法) — : 測定せず

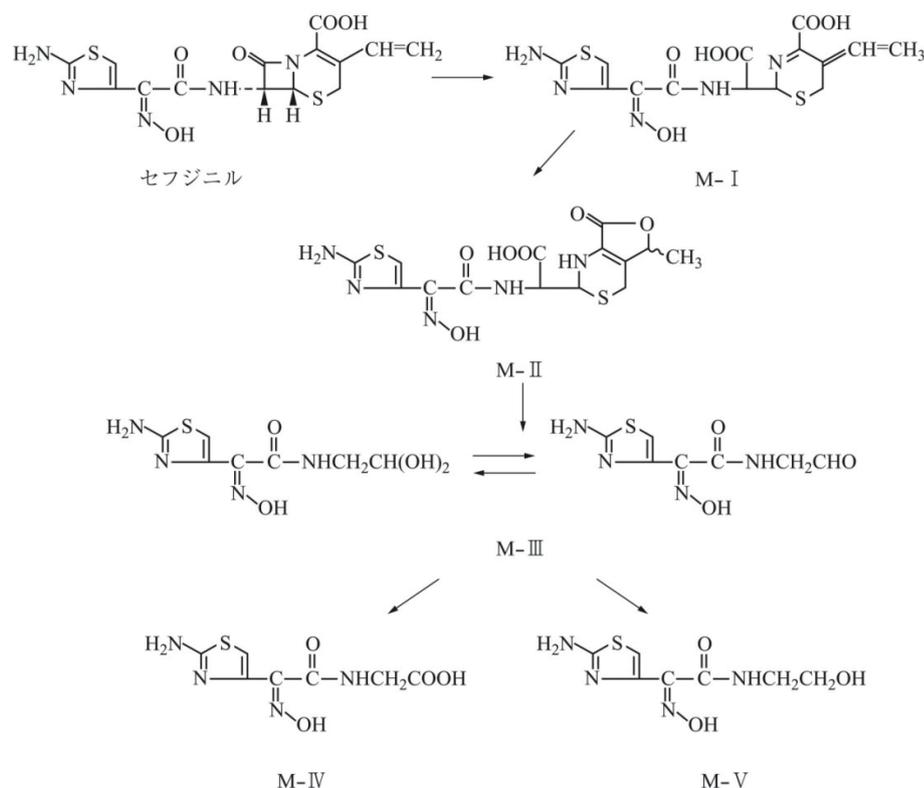
注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

代謝部位：大腸(腸内細菌)

推定代謝経路：



健康成人男子 6 例に 100mg(力価) を単回投与したとき、投与後 24 時間までの尿中に代謝物 M- III、IV、V が検出されたが、それらの各排泄率は投与量の 0.5% 以下と低かった<sup>46)</sup>。

## Ⅶ. 薬物動態に関する項目

---

### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種 (ラット)

ラットにセフジニル 10mg/kg 又は 100mg/kg を 3 日間経口投与し、チトクロム P-450 含量、アミノピリン脱メチル化活性、アニリン水酸化活性及びエトキシレゾルフィン脱エチル化活性を測定したが、いずれも対照群と比較して有意な変動は認められなかった。

ラットにセフジニル 100mg/kg を経口投与後 24 時間の肝ミトコンドリア画分のアルデヒド脱水素酵素活性をアセトアルデヒドを基質として測定したが、対照群での活性と有意な差は認められなかった。なお、セフォペラゾン及びジスルフィラム投与群でのアルデヒド脱水素酵素活性は、対照群と比較して有意に阻害された。

したがって、セフジニルは薬物代謝酵素誘導作用及びアンタビューズ様作用を有しないと推察された。

### (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

健康成人 12 例に 100mg (力価) を単回又は 200mg (力価) を 1 日 3 回 15 日間連続経口投与したとき、血漿、尿及び糞便中に抗菌活性代謝物は検出されなかった<sup>5)</sup>。

注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg (力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

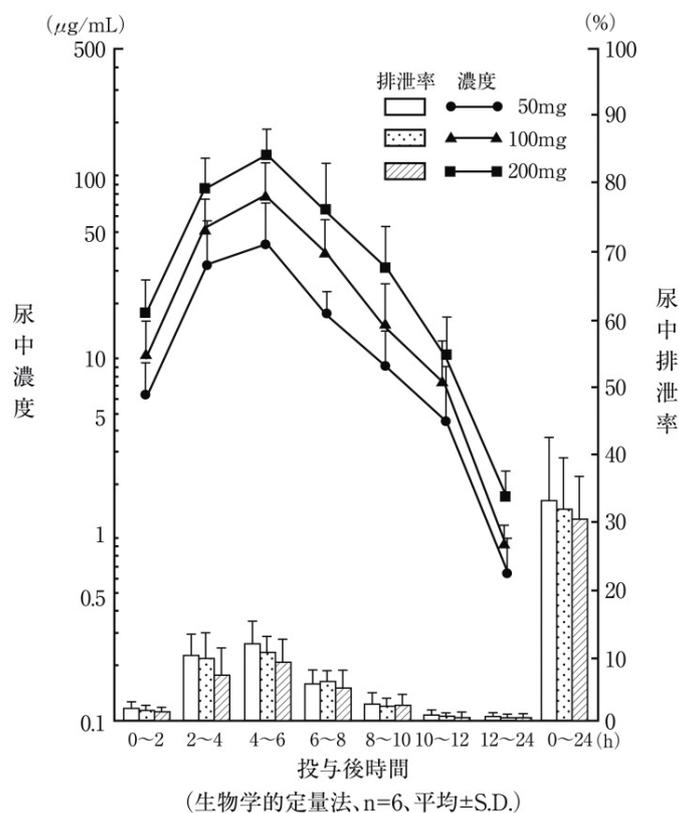
該当しない

## 6. 排泄

### (1) 排泄部位及び経路

主として腎より排泄される。

健康成人 6 例に 50、100 及び 200mg(力価) をクロスオーバー法により空腹時単回経口投与したとき、24 時間までの尿中排泄率はそれぞれ  $33.3 \pm 8.3\%$ 、 $30.8 \pm 8.2\%$ 、 $25.9 \pm 10.2\%$  で、最高尿中濃度は投与後 4～6 時間でそれぞれ  $44.3 \pm 31.0$ 、 $81.5 \pm 55.5$  及び  $132 \pm 55\mu\text{g/ml}$  であった<sup>5)</sup>。



注) 本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg(力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

### (2) 排泄率

「(1) 排泄部位及び経路」の項参照

### (3) 排泄速度

健康成人 3 例及び腎機能障害患者 6 例に 100mg(力価) を単回経口投与したとき、健康成人では 0～24 時間全排泄量の 82.9% が 6 時間までに排泄されたが、腎機能障害例では Ccr51～70mL/min で 57.7%、31～50mL/min で 53.2%、 $\leq 30\text{mL/min}$  で 42.9% と Ccr の低下に伴い排泄の遅延が認められた<sup>21)</sup>。

## 7. トランスポーターに関する情報

セフジニルは、organic anion transporter (OAT)3 の基質である<sup>47)</sup>。

**8. 透析等による除去率**

(1) 腹膜透析

CAPD 施行患者 (BUN34-90mg/dL、S-Cr2.3-17mg/dL)4 例に CAPD 施行 2 時間前に 100mg(力価)を単回経口投与したとき、投与後 23-25 時間で透析液へ 1.45-5.23mg 移行した<sup>48)</sup>。

(2) 血液透析

61%<sup>22)</sup>(「1. (3)3 腎機能障害患者」の項参照)

## 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

#### 【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）

$\beta$ -ラクタム系抗生物質一般の注意事項であり、本剤の成分によるショックの既往歴のある患者に本剤が再投与された場合、ショック等の重篤な副作用を発現する可能性が高い。また、セフェム系抗生物質による過敏症の既往歴のある患者に本剤が投与された場合、過敏症状を発現する可能性が高く、ショック等の重篤な副作用を生じるおそれがある。

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

### 5. 慎重投与内容とその理由

#### 慎重使用（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（＜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)(2) $\beta$ -ラクタム系抗生物質一般の注意事項であり、セフェム系抗生物質による過敏症の発現頻度がペニシリンアレルギーの既往歴のある患者で高いとする報告があり、また本人又はその家族に薬剤アレルギー歴、アレルギー疾患などがある患者では、それらの素因を持たない患者に比べ $\beta$ -ラクタム剤に対する過敏症状の発現頻度が高いことから、アレルギー歴、アレルギー素因のある患者には慎重に投与すべきである。
- (4) 抗生物質一般の注意事項であり、抗生物質の投与により腸内細菌叢が変動しビタミンKの合成が阻害されるため、経口的なビタミンKの摂取が不良な患者では出血傾向などの注意が必要である。

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

#### 重要な基本的注意

ショックがあらわれるおそれがあるため、十分な問診を行うこと。

（解説）

$\beta$ -ラクタム系抗生物質一般の注意事項であり、同系統の薬剤によるショックなどの過敏症状が多数報告されており、本剤においても過敏症状の発現に留意する必要がある。  
アナフィラキシーショックをはじめとする過敏症状を的確に予防する方法は現在のところ確立されておらず、最も重要なことは問診による予防である。なお、過敏症状が発現した場合には、投与は中止し、必要に応じ対症療法を行うこと。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

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

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
鉄剤	本剤の吸収を約 10 分の 1 まで阻害するので、併用は避けることが望ましい。やむを得ず併用する場合には、本剤の投与後 3 時間以上間隔をあけて投与する。	腸管内において鉄イオンとほとんど吸収されない錯体を形成する。
ワルファリンカリウム	ワルファリンカリウムの作用が増強されるおそれがある。ただし、本剤に関する症例報告はない。	腸内細菌によるビタミン K の産生を抑制することがある。
制酸剤 (アルミニウム又はマグネシウム含有)	本剤の吸収が低下し、効果が減弱されるおそれがあるので、本剤の投与後 2 時間以上間隔をあけて投与する。	機序不明

(解説)

**鉄剤**

鉄剤との併用により本剤の吸収が低下することは動物実験により確認されている<sup>49)</sup>。またヒトでの試験成績でも、鉄剤との同時服用により本剤の吸収が約 10 分の 1 まで低下すること、本剤の投与 3 時間後に鉄剤を投与した場合には、同時服用時に比べて吸収の低下が軽減することが報告されている<sup>50)</sup>。

**ワルファリンカリウム**

セフェム系抗生物質でビタミン K 欠乏による出血傾向があらわれることが知られている。一方、ワルファリンはビタミン K に拮抗して抗凝固作用を示す薬剤であり、併用した場合、抗凝固作用が増強されるおそれがある。

**制酸剤（アルミニウム又はマグネシウム含有）**

外国で健康成人にセフジニル 300mg と制酸剤 (Maalox TC) 30mL (水酸化アルミニウム 120mg/mL、水酸化マグネシウム 60mg/mL) とを同時に経口投与したとき、セフジニルの吸収が約 40% 減少したとの報告がある<sup>51)</sup>。

注) 本邦において本剤の承認された用法・用量は、「通常、セフジニルとして成人 1 回 100mg (力価) を 1 日 3 回経口投与する。なお、年齢及び症状に応じて適宜増減する。」である。

8. 副作用

(1) 副作用の概要

総症例 13,715 例中 354 例 (2.58%) に臨床検査値異常変動を含む副作用が認められた。その副作用症状は、下痢、腹痛等の消化器症状 110 例 (0.80%)、発疹、そう痒感等の皮膚症状 31 例 (0.23%) 等であった。また、主な臨床検査値異常変動は、ALT(GPT) 上昇 126 件 (0.92%)、AST(GOT) 上昇 89 件 (0.65%)、好酸球増多 41 件 (0.30%) 等であった。  
(再審査結果通知: 1999 年 3 月)

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用	
1) ショック	ショック(0.1%未満)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。
2) アナフィラキシー	アナフィラキシー(呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等)(0.1%未満)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。
3) 皮膚障害	中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis : TEN、0.1%未満)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson 症候群、0.1%未満)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、発熱、頭痛、関節痛、皮膚や粘膜の紅斑・水疱、皮膚の緊張感・灼熱感・疼痛等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) 血液障害	汎血球減少(0.1%未満)、無顆粒球症(0.1%未満、初期症状：発熱、咽頭痛、頭痛、倦怠感等)、血小板減少(0.1%未満、初期症状：点状出血、紫斑等)、溶血性貧血(0.1%未満、初期症状：発熱、ヘモグロビン尿、貧血症状等)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。
5) 大腸炎	偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎(0.1%未満)があらわれることがある。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。
6) 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(各 0.1%未満)等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。
7) 腎障害	急性腎障害等の重篤な腎障害(0.1%未満)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) 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸	劇症肝炎等の重篤な肝炎(0.1%未満)、著しい AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P の上昇等を伴う肝機能障害(0.1%未満)、黄疸(0.1%未満)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。

(3) その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症 <sup>注)</sup>	発疹	蕁麻疹、そう痒、発熱、浮腫	紅斑
血液	好酸球増多	顆粒球減少	
腎臓		BUN 上昇	
消化器	下痢、腹痛、胃部不快感	悪心、嘔吐、胸やけ、食欲不振、便秘	
菌交代症		口内炎	カンジダ症、黒毛舌
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、胸部圧迫感	しびれ

注) 発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

時 期	承認時	使用成績調査	計
調 査 施 設 数	264	2,435	2,654
調 査 症 例 数	2,633	11,082	13,715
副 作 用 発 現 症 例 数	230	124	354
副 作 用 発 現 件 数	321	188	509
副 作 用 発 現 症 例 率 ( % )	8.74	1.12	2.58

副作用等の種類	発現件数 (%)			副作用等の種類	発現件数 (%)		
皮膚・皮膚付属器官障害	18(0.68)	13(0.12)	31(0.23)	ビリルビン値上昇	2(0.08)	1(0.01)	3(0.02)
肛囲そう痒	0	1(0.01)	1(0.01)	*ウロビリノーゲン陽性	0	1(0.01)	1(0.01)
湿疹	0	1(0.01)	1(0.01)	*γ-GTP 上昇	4(0.15)	1(0.01)	5(0.04)
蕁麻疹	2(0.08)	1(0.01)	3(0.02)	代謝・栄養障害	14(0.53)	11(0.10)	25(0.18)
そう痒(感)	2(0.08)	0	2(0.01)	Al-P 上昇	12(0.46)	11(0.10)	23(0.17)
発疹	13(0.49)	6(0.05)	19(0.14)	*LDH 上昇	1(0.04)	0	1(0.01)
顔面皮疹	0	1(0.01)	1(0.01)	*尿糖陽性	1(0.04)	0	1(0.01)
中毒疹	1(0.04)	1(0.01)	2(0.01)	赤血球障害	3(0.11)	2(0.02)	5(0.04)
皮疹	0	2(0.02)	2(0.01)	*赤血球減少	3(0.11)	2(0.02)	5(0.04)
中枢・末梢神経系障害	2(0.08)	1(0.01)	3(0.02)	*ヘマトクリット値減少	3(0.11)	2(0.02)	5(0.04)
ふらつき(感)	2(0.08)	1(0.01)	3(0.02)	*ヘモグロビン減少	3(0.11)	2(0.02)	5(0.04)
精神障害	1(0.04)	0	1(0.01)	白血球・網内系障害	44(1.67)	3(0.03)	47(0.34)
*眠気	1(0.04)	0	1(0.01)	好中球減少	1(0.04)	0	1(0.01)
消化管障害	67(2.54)	43(0.39)	110(0.80)	好酸球増多(症)	40(1.52)	1(0.01)	41(0.30)
嘔気	5(0.19)	3(0.03)	8(0.06)	白血球減少(症)	3(0.11)	2(0.02)	5(0.04)
悪心	0	3(0.03)	3(0.02)	*リンパ球増多	1(0.04)	0	1(0.01)
吐き気	0	1(0.01)	1(0.01)	血小板・出血凝血障害	1(0.04)	0	1(0.01)
嘔吐	1(0.04)	1(0.01)	2(0.01)	*プロトロンビン時間延長	1(0.04)	0	1(0.01)
*口角炎	0	1(0.01)	1(0.01)	泌尿器系障害	9(0.34)	6(0.05)	15(0.11)
下痢	30(1.14)	23(0.21)	53(0.39)	*血清クレアチニン上昇	1(0.04)	0	1(0.01)
軟便	10(0.38)	3(0.03)	13(0.09)	*尿蛋白陽性	2(0.08)	0	2(0.01)
口内炎	5(0.19)	2(0.02)	7(0.05)	*尿沈渣陽性	3(0.11)	0	3(0.02)
胃もたれ感	2(0.08)	2(0.02)	4(0.03)	*尿円柱	0	1(0.01)	1(0.01)
胸やけ	1(0.04)	0	1(0.01)	*尿中 WBC 増加	0	1(0.01)	1(0.01)
食欲不振	3(0.11)	1(0.01)	4(0.03)	BUN 上昇	4(0.15)	4(0.04)	8(0.06)
腹痛	5(0.19)	5(0.05)	10(0.07)	一般的全身障害	4(0.15)	3(0.03)	7(0.05)
胃不快感	11(0.42)	4(0.04)	15(0.11)	悪寒	0	1(0.01)	1(0.01)
下腹部痛	1(0.04)	1(0.01)	2(0.01)	顔面浮腫	0	1(0.01)	1(0.01)
便秘	2(0.08)	0	2(0.01)	胸部圧迫感	2(0.08)	0	2(0.01)
心窩部痛	1(0.04)	2(0.02)	3(0.02)	頭重感	2(0.08)	0	2(0.01)
*歯肉炎	0	1(0.01)	1(0.01)	発熱	1(0.04)	0	1(0.01)
変色便	1(0.04)	0	1(0.01)	*全身倦怠(感)	1(0.04)	1(0.01)	2(0.01)
肝臓・胆管系障害	90(3.42)	56(0.51)	146(1.06)	抵抗機構障害	0	1(0.01)	1(0.01)
*LAP 上昇	1(0.04)	0	1(0.01)	菌交代症	0	1(0.01)	1(0.01)
肝機能障害	0	3(0.03)	3(0.02)				
肝障害	0	1(0.01)	1(0.01)				
AST(GOT) 上昇	54(2.05)	35(0.32)	89(0.65)				
ALT(GPT) 上昇	77(2.92)	49(0.44)	126(0.92)				

\*：使用上の注意から予測されないもの

(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  
該当しない

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）」、「5. 慎重投与内容とその理由 (1) (2)」、「6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」、「(2) 重大な副作用と初期症状 1) 2)」及び「(3) その他の副作用」の項参照

### 9. 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

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。]

### 11. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。（使用経験が少ない。）

### 12. 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

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、更には穿孔を起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。]

（解説）

日薬連発第 240 号（平成 8 年 3 月 27 日付）及び第 304 号（平成 8 年 4 月 18 日付）「PTP 誤飲対策について」に従い設定した。

### 15. その他の注意

- (1) 粉ミルク、経腸栄養剤など鉄添加製品との併用により、便が赤色調を呈することがある。
- (2) 尿が赤色調を呈することがある。

### 16. その他

該当しない

## 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

マウス、ラット、モルモット、ウサギ、ネコ、イヌ及びヒト血液標本を用いて中枢神経系、呼吸・循環器系、自律神経・運動神経系、消化器系、泌尿器・生殖器系、血液系、その他に及ぼす影響を *in vitro* 試験は静脈内投与で 1,000mg/kg を、*in vitro* 試験は  $1.0 \times 10^{-2}$ g/mL を最高用量として検討した。

*In vitro* 試験では、覚醒イヌの嘔吐が 320mg/kg 以上で、また麻酔イヌの生体位空腸自動運動の亢進、ラットの胆汁分泌の亢進及びラットの尿量、尿中  $\text{Na}^+$ 、 $\text{K}^+$  排泄量の増加が最高用量で認められた。

*In vitro* 試験では、モルモットの摘出心房の収縮力増強が最高用量で、またモルモットの摘出気管筋の弛緩、ヒト血小板の ADP 及び collagen 誘発凝集の抑制が  $1.0 \times 10^{-3}$ g/mL 以上で認められた。

なお、麻酔イヌの生体位空腸自動運動に対して、十二指腸投与の 1,000mg/kg では何ら影響を示さなかった<sup>52)</sup>。

(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

動物種	性	単回投与毒性 (LD <sub>50</sub> 値) <sup>53)</sup>			
		経口	皮下	腹腔内	静脈内
マウス	雄	> 5,600	> 5,600	> 5,600	> 2,000
	雌	> 5,600	> 5,600	> 5,600*	> 2,000
ラット	雄	> 5,600	> 5,600	> 5,600	> 2,000
	雌	> 5,600	> 5,600	> 5,600	> 2,000
イヌ	雄	> 1,000	—	—	—
	雌	> 1,000	—	—	—

\*1/5 例死亡

(2) 反復投与毒性試験

ラット及びイヌに 100、320、1,000mg/kg を 13 週間それぞれ経口投与したとき 1,000mg/kg 投与群でラットは白血球数の軽度減少が、イヌでは摂餌量の減少及びそれに伴う体重減少が認められたが、320mg/kg 以下の投与群では薬物投与によると思われる異常所見は認められなかった。

その他、ラットでは軟便、盲腸膨満など、イヌでは嘔吐及び流涎など、抗生物質投与で一般に観察される変化が認められた<sup>54)</sup>。

(無影響量：ラット及びイヌ共 320mg/kg)

ラットに 100、320 及び 1,000mg/kg を、またイヌには 200、400 及び 800mg/kg を 26 週間経口投与したとき、ラットの 1,000mg/kg 投与群において加齢による慢性腎症の増強とこれに伴う腎重量及び尿蛋白の増加傾向、白血球数の減少が、イヌの 800mg/kg 投与群で胆嚢内胆汁量の増加が認められた。その他、亜急性毒性試験と同様にラット及びイヌに抗生物質で一般に観察される変化が認められた<sup>54)</sup>。

(無影響量：ラット 320mg/kg、イヌ 400mg/kg)

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

---

### (3) 生殖発生毒性試験

ラットの妊娠前及び妊娠初期、胎児の器官形成期に 100～1,000mg/kg を、周産期及び授乳期に 32～320mg/kg 並びにウサギの胎児の器官形成期に 1～10mg/kg を経口投与して生殖に及ぼす影響を検討したところ、ラットの器官形成期投与試験において、臨床用量 6mg/kg/日に対して 100mg/kg 以上の高用量で胎児体重の低値がみられたが、新生児の成長、発育、生殖能等に異常は認められず、また親動物の繁殖能への影響や催奇形性は認められなかった<sup>55)</sup>。

### (4) その他の特殊毒性

#### 1) 抗原性<sup>56)</sup>

ウサギ、モルモット、マウスを用いて検討した結果、アナフィラキシー惹起性、IgE 抗体産生は認められず、本剤の免疫原性は弱いものと考えられた。また、本剤は誘発抗原性を持たず、セファレキシム、セファクロル及びセファロチンとの免疫学的交差性は認められなかった。

#### 2) 腎毒性<sup>56)</sup>

ウサギに 100～1,000mg/kg を単回経口投与し、腎への影響を検討した結果、薬物による異常所見は認められなかった。

ラットに 180～560mg/kg を単独ないし利尿剤と併用して 2 週間連続経口投与したが薬物による異常所見は認めず、利尿剤による腎障害を増悪させることもなかった。

#### 3) 遺伝毒性<sup>56)</sup>

細菌を用いた復帰変異試験、哺乳類の培養細胞を用いた染色体異常試験及びマウスを用いた小核試験で遺伝毒性は認められなかった。

## X. 管理的事項に関する項目

---

### 1. 規制区分

製 剤：セフゾンカプセル 50mg、セフゾンカプセル 100mg  
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：セフジニル  
該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：ケース等に表示（製造後 2 年）

### 3. 貯法・保存条件

室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当しない

#### (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」の項参照

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

カプセル 50mg：100 カプセル (10 カプセル×10)

カプセル 100mg：100 カプセル (10 カプセル×10)、500 カプセル (10 カプセル×50)

### 7. 容器の材質

PTP シート：表－ポリ塩化ビニル、裏－アルミニウム

ボトル (100mg)：ポリエチレン（酸化チタン入り）、キャップ：ポリプロピレン

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：セフゾン細粒小児用 10%

同 効 薬：セファクロル、セフポドキシムプロキシセチル、セフロキシムアキシセチル、セフィキシム、  
セフテラムピボキシル

### 9. 国際誕生年月日

1991 年 10 月 4 日（国内開発）

X. 管理的事項に関する項目

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造販売承認年月日	承認番号
セフゾンカプセル 50mg	1991年10月4日	20300AMZ00748
セフゾンカプセル 100mg		20300AMZ00749

製造販売一部変更承認年月日：1993年3月3日（効能・効果の追加による）  
2005年1月12日（効能・効果等の一部変更による）

11. 薬価基準収載年月日

販売名	薬価基準収載年月日
セフゾンカプセル 50mg	1991年11月29日
セフゾンカプセル 100mg	

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

1993年3月3日：「歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎」の効能・効果追加。  
2005年1月12日：2004年9月30日の再評価結果に合わせて、「効能・効果」等の一部変更。（「13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容」の項参照）

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（承認拒否事由）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：「効能・効果」を一部改めることにより、薬事法第14条の第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないことが確認されたため、「効能・効果」の項を下記のとおり変更した。

「旧効能・効果」

ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、ペプトストレプトコッカス属、プロピオニバクテリウム、淋菌、ブランハメラ・カタラーリス、大腸菌、クレブシエラ属、プロテウス・ミラビリス、プロビデンシア属、インフルエンザ菌のうちセフジニル感性菌による下記感染症  
○毛嚢(包)炎、せつ、せつ腫症、よう、伝染性膿痂疹、丹毒、蜂巣炎、リンパ管(節)炎、ひょう疽、化膿性爪囲(廓)炎、皮下膿瘍、汗腺炎、感染性粉瘤、慢性膿皮症  
○乳腺炎、肛門周囲膿瘍、外傷及び手術創の表在性二次感染  
○咽喉頭炎、急性気管支炎、扁桃炎、肺炎  
○腎盂腎炎、膀胱炎、淋菌性尿道炎  
○子宮付属器炎、子宮内感染、バルトリン腺炎  
○眼瞼炎、麦粒腫、瞼板腺炎  
○外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎  
○歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

「新効能・効果」

<適応菌種>  
本剤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、クレブシエラ属、プロテウス・ミラビリス、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、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、咽喉頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、膀胱炎、腎盂腎炎、尿道炎、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、麦粒腫、瞼板腺炎、外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

## X. 管理的事項に関する項目

---

### 14. 再審査期間

平成3年(1991年)10月4日～平成9年(1997年)10月3日(6年、終了)

### 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

「療担規則及び薬担規則並びに療担基準に基づき厚生労働大臣が定める掲示事項等」(厚生労働省告示第107号:平成18年3月6日付)とその一部改正(厚生労働省告示第97号:平成20年3月19日付)により「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

ただし、使用上の注意には以下の記載がある。

#### <用法・用量に関連する使用上の注意>

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。

### 16. 各種コード

販売名	HOT(9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
セフゾンカプセル 50mg	110929003	6132013M1029	616130531
セフゾンカプセル 100mg	110930603	6132013M2025	616130532

### 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 [R-07700]
- 2) 荒田 次郎 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：1016, 1989 [CFN 00110]
- 3) 原 耕平 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：634, 1989 [CFN 00080]
- 4) 河田 幸道 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：893, 1989 [CFN 00099]
- 5) 島田 馨 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：208, 1989 [CFN 00031]
- 6) 荒田 次郎 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：996, 1989 [CFN 00109]
- 7) 原 耕平 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：612, 1989 [CFN 00079]
- 8) 河田 幸道 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：874, 1989 [CFN 00098]
- 9) 濱本 季子 他：日本化学療法学会雑誌 49(8)：500, 2001 [CFN 00541]
- 10) 横田 健 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：16, 1989 [CFN 00017]
- 11) 峯 靖弘 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：122, 1989 [CFN 00024]
- 12) 井上 栄子 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：1, 1989 [CFN 00016]
- 13) 五島 瑳智子 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：30, 1989 [CFN 00018]
- 14) 西野 武志 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：77, 1989 [CFN 00021]
- 15) 加藤 直樹 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：65, 1989 [CFN 00020]
- 16) 峯 靖弘 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：100, 1989 [CFN 00023]
- 17) 横田 好子 他：Pharm. Med.16(7)：121, 1998 [CFN 00448]
- 18) 社内報告書 (DIR 910006)
- 19) 前田 浩志 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：806, 1989 [CFN 00093]
- 20) 松本 文夫 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：426, 1989 [CFN 00056]
- 21) 西谷 嘉夫 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：823, 1989 [CFN 00094]
- 22) Hishida, A. et al. : Antimicrob. Agents. Chemother. 42(7)：1718, 1998 [CFN 00452]
- 23) 島田 馨 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：246, 1989 [CFN 00032]
- 24) 坂本 博 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：165, 1989 [CFN 00028]
- 25) 酒井 克治 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：708, 1989 [CFN 00085]
- 26) 山元 貴雄 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：940, 1989 [CFN 00102]
- 27) 山田 光興 他：産科と婦人科 64(10)：1471, 1997 [CFN 00420]
- 28) 大野 勲 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：304, 1989 [CFN 00040]
- 29) 渡辺 彰 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：312, 1989 [CFN 00041]
- 30) 石岡 伸一 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：536, 1989 [CFN 00071]
- 31) 中西 洋一 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：560, 1989 [CFN 00074]
- 32) 林 敏明 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：565, 1989 [CFN 00075]
- 33) 伊良部 勇栄 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：603, 1989 [CFN 00078]
- 34) 河村 正三 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：1043, 1989 [CFN 00111]
- 35) 征矢野 薫 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：1053, 1989 [CFN 00112]
- 36) 乃木田 俊辰 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：955, 1989 [CFN 00104]
- 37) 赤木 理 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：982, 1989 [CFN 00107]
- 38) 山本 康生 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：992, 1989 [CFN 00108]
- 39) 社内報告書 (DIR 910010)
- 40) 松田 静治 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：915, 1989 [CFN 00100]
- 41) 張 南薫 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：922, 1989 [CFN 00101]
- 42) 川嶋 尚平 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：1096, 1989 [CFN 00117]
- 43) 大石 正夫 他：日本化学療法学会雑誌 37(S-2)：1101, 1989 [CFN 00118]
- 44) 佐々木 次郎 他：歯科薬物療法 11(2)：86, 1992 [CFN 00208]
- 45) 大塚 芳基 他：日本化学療法学会雑誌 40(10)：1237, 1992 [CFN 00217]
- 46) 社内報告書 (DIR 910011)
- 47) Ueo, H. et al. : Biochem. Pharmacol. 70(7)：1104, 2005 [CFN 00788]
- 48) Tomino, Y. et al. : Arzneimittel-Forschung 48(8)：862, 1998 [CFN 00458]
- 49) 社内報告書 (DIR 910007)
- 50) Ueno, K. et al. : Clin. Pharmacol. Ther. 54(5)：473, 1993 [CFN 00253]

## XI. 文献

---

- 51) 社内報告書 (DIR 980049)
- 52) 社内報告書 (DIR 910012)
- 53) 中岡 農 他：基礎と臨床 23(15)：141, 1989 [CFN 00119]
- 54) 谷本 純一 他：基礎と臨床 23(15)：147, 1989 [CFN 00120]
- 55) 島津 宏 他：基礎と臨床 23(15)：191, 1989 [CFN 00121]
- 56) 小原 要 他：基礎と臨床 23(15)：203, 1989 [CFN 00122]

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## XII. 参考資料

---

### 1. 主な外国での発売状況

米国、欧州において、セフゾンの提携品は現在発売していない。(2017年1月現在)

### 2. 海外における臨床支援情報

#### (1) 妊婦に関する海外情報 (FDA)

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項は以下のとおりであり、米FDAとは異なる。

#### 【使用上の注意】「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。]

	分類
FDA : Pregnancy Category	B(2015年11月)

参考：分類の概要

FDA : Pregnancy Category

B : 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) 小児等に関する記載

米国、欧州において、セフゾンの提携品は現在発売していない。(2017年1月現在)

## XIII. 備考

---

その他の関連資料  
該当資料なし

製造販売  
**LTLファーマ株式会社**  
東京都新宿区西新宿6丁目10番1号