2022年11月改訂（第12版）

日本標準商品分類番号　876132

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2018（2019年更新版）に準拠して作成

経口用セフェム系抗生物質製剤

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・ 販売開始年月日	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） 販売開始年月日：1989年12月
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 販　売　元：グラクソ・スミスクライン株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	グラクソ・スミスクライン株式会社　カスタマー・ケア・センター TEL：0120-561-007（9:00～17:45/土日祝日及び当社休業日を除く） FAX：0120-561-047（24時間受付） 医療関係者向けホームページ https://gskpro.com

本IFは2022年2月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要

―日本病院薬剤師会―

（2020年4月改訂）

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、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・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、「IF 記載要領 2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・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、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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 の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IF の利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索の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IFを作成・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利用者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、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供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PMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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いただきたい。IF は日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR 等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らが IF の内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IF を利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目　　次

Ⅰ．概要に関する項目 …… 1
1. 開発の経緯 …… 1
2. 製品の治療学的特性 …… 1
3. 製品の製剤学的特性 …… 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性 …… 2
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 …… 2
(1) 承認条件 …… 2
(2) 流通・使用上の制限事項 …… 2
6. RMPの概要 …… 2

Ⅱ．名称に関する項目 …… 3
1. 販売名 …… 3
(1) 和名 …… 3
(2) 洋名 …… 3
(3) 名称の由来 …… 3
2. 一般名 …… 3
(1) 和名（命名法） …… 3
(2) 洋名（命名法） …… 3
(3) ステム（stem） …… 3
3. 構造式又は示性式 …… 3
4. 分子式及び分子量 …… 3
5. 化学名（命名法）又は本質 …… 3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 …… 4

Ⅲ．有効成分に関する項目 …… 5
1. 物理化学的性質 …… 5
(1) 外観・性状 …… 5
(2) 溶解性 …… 5
(3) 吸湿性 …… 5
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点 …… 5
(5) 酸塩基解離定数 …… 5
(6) 分配係数 …… 5
(7) その他の主な示性値 …… 5
2. 有効成分の各種条件下における安定性 …… 6
3. 有効成分の確認試験法、定量法 …… 6

Ⅳ．製剤に関する項目 …… 7
1. 剤形 …… 7
(1) 剤形の区別 …… 7
(2) 製剤の外観及び性状 …… 7
(3) 識別コード …… 7
(4) 製剤の物性 …… 7
(5) その他 …… 7
2. 製剤の組成 …… 7
(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤 …… 7
(2) 電解質等の濃度 …… 7
(3) 熱量 …… 7
3. 添付溶解液の組成及び容量 …… 7
4. 力価 …… 8
5. 混入する可能性のある夾雑物 …… 8
6. 製剤の各種条件下における安定性 …… 8
7. 調製法及び溶解後の安定性 …… 9
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 9
9. 溶出性 …… 9
10. 容器・包装 …… 9
(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報 …… 9
(2) 包装 …… 9
(3) 予備容量 …… 9
(4) 容器の材質 …… 10
11. 別途提供される資材類 …… 10
12. その他 …… 10

Ⅴ．治療に関する項目 …… 11
1. 効能又は効果 …… 11
2. 効能又は効果に関連する注意 …… 11
3. 用法及び用量 …… 11
(1) 用法及び用量の解説 …… 11
(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠 …… 11
4. 用法及び用量に関連する注意 …… 11
5. 臨床成績 …… 11
(1) 臨床データパッケージ …… 11
(2) 臨床薬理試験 …… 12
(3) 用量反応探索試験 …… 12
(4) 検証的試験 …… 13
(5) 患者・病態別試験 …… 20
(6) 治療的使用 …… 20
(7) その他 …… 20

Ⅵ．薬効薬理に関する項目 …… 21
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …… 21
2. 薬理作用 …… 21
(1) 作用部位・作用機序 …… 21
(2) 薬効を裏付ける試験成績 …… 21
(3) 作用発現時間・持続時間 …… 26

Ⅶ．薬物動態に関する項目 …… 27
1. 血中濃度の推移 …… 27
(1) 治療上有効な血中濃度 …… 27
(2) 臨床試験で確認された血中濃度 …… 27
(3) 中毒域 …… 28
(4) 食事・併用薬の影響 …… 29
2. 薬物速度論的パラメータ …… 29
(1) 解析方法 …… 29
(2) 吸収速度定数 …… 29
(3) 消失速度定数 …… 29
(4) クリアランス …… 30
(5) 分布容積 …… 30
(6) その他 …… 30
3. 母集団（ポピュレーション）解析 …… 30
(1) 解析方法 …… 30
(2) パラメータ変動要因 …… 30

4. 吸収 ･･････････････････････････････ 30
5. 分布 ･･････････････････････････････ 32
(1) 血液－脳関門通過性 ･････････････････ 32
(2) 血液－胎盤関門通過性 ･･････････････ 33
(3) 乳汁への移行性 ･･････････････････ 33
(4) 髄液への移行性 ･･････････････････ 33
(5) その他の組織への移行性 ･･････････ 33
(6) 血漿蛋白結合率 ･･････････････････ 39
6. 代謝 ･･････････････････････････････ 39
(1) 代謝部位及び代謝経路 ･･････････････ 39
(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の
分子種、寄与率 ･･････････････････ 39
(3) 初回通過効果の有無及びその割合 ･･ 39
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、
存在比率 ･･････････････････････ 40
7. 排泄 ･･････････････････････････････ 40
8. トランスポーターに関する情報 ･･････ 41
9. 透析等による除去率 ･･････････････････ 41
10. 特定の背景を有する患者 ･･････････････ 42
11. その他 ･･････････････････････････････ 43

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目･･ 44
1. 警告内容とその理由 ･･････････････････ 44
2. 禁忌内容とその理由 ･･････････････････ 44
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由
･･････････････････････････････････ 44
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由
･･････････････････････････････････ 44
5. 重要な基本的注意とその理由 ･･････････ 44
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 ･ 45
(1) 合併症・既往歴等のある患者 ･･････ 45
(2) 腎機能障害患者 ･･････････････････ 45
(3) 肝機能障害患者 ･･････････････････ 45
(4) 生殖能を有する者 ･･････････････････ 45
(5) 妊婦 ･･････････････････････････････ 45
(6) 授乳婦 ･･････････････････････････ 45
(7) 小児等 ･･････････････････････････ 46
(8) 高齢者 ･･････････････････････････ 46
7. 相互作用 ･･････････････････････････ 46
(1) 併用禁忌とその理由 ･･････････････ 46
(2) 併用注意とその理由 ･･････････････ 46
8. 副作用 ･･････････････････････････････ 46
(1) 重大な副作用と初期症状 ･･････････ 47
(2) その他の副作用 ･･････････････････ 47
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 ･･････････ 51
10. 過量投与 ･･････････････････････････ 51
11. 適用上の注意 ･･････････････････････ 51
12. その他の注意 ･･････････････････････ 51
(1) 臨床使用に基づく情報 ･･････････････ 51
(2) 非臨床試験に基づく情報 ･･････････ 51

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目･････････････････ 52
1. 薬理試験 ･･････････････････････････ 52
(1) 薬効薬理試験 ･･････････････････････ 52
(2) 安全性薬理試験･････････････････････ 52
(3) その他の薬理試験･･････････････････ 54
2. 毒性試験 ･･････････････････････････ 54
(1) 単回投与毒性試験･･････････････････ 54
(2) 反復投与毒性試験･･････････････････ 54
(3) 遺伝毒性試験･･････････････････････ 54
(4) がん原性試験･･････････････････････ 54
(5) 生殖発生毒性試験･･････････････････ 55
(6) 局所刺激性試験･････････････････････ 55
(7) その他の特殊毒性･･････････････････ 55

Ⅹ. 管理的事項に関する項目 ･･････････････････ 56
1. 規制区分 ･･････････････････････････ 56
2. 有効期間 ･･････････････････････････ 56
3. 包装状態での貯法･･････････････････････ 56
4. 取扱い上の注意 ･･････････････････････ 56
5. 患者向け資材 ･･････････････････････ 56
6. 同一成分・同効薬･･････････････････････ 56
7. 国際誕生年月日 ･･････････････････････ 56
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、
薬価基準収載年月日、販売開始年月日･･ 56
9. 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･････ 56
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日
及びその内容 ･･････････････････････ 57
11. 再審査期間 ･･････････････････････ 57
12. 投薬期間制限に関する情報･････････････ 57
13. 各種コード ･･････････････････････ 57
14. 保険給付上の注意･････････････････････ 57

ⅩⅠ. 文献 ･･････････････････････････････ 58
1. 引用文献 ･･････････････････････････ 58
2. その他の参考文献･･････････････････････ 59

ⅩⅡ. 参考資料 ･･････････････････････････ 60
1. 主な外国での発売状況･･････････････････ 60
2. 海外における臨床支援情報･･････････････ 63
(1) 妊婦に関する海外情報･･････････････ 63
(2) 小児等に関する記載･･････････････････ 63

ⅩⅢ. 備考 ･･････････････････････････････ 64
1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を
行うにあたっての参考情報･････････････ 64
(1) 粉砕 ･･････････････････････････ 64
(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの
通過性 ･･････････････････････････ 64
2. その他の関連資料･･････････････････････ 64

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。三共株式会社研究所は、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用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)carbonyloxy]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 月には、薬事法第 14 条第 2 項各号のいずれにも該当しない、との再審査結果を得た。

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」の項参照）

2. *β*-ラクタマーゼに対し安定性を示す（*in vitro*）[1), 2), 3)]。
3. 呼吸器感染症主要起炎菌に対する生体内効果を示す（*in vivo*：マウス）。

（「Ⅵ．薬効薬理に関する項目」の項参照）

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」の項参照）

5. 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（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 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、汎血球減少症、無顆粒球症、溶血性貧血、血小板減少、痙攣があらわれることがある。

（「Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

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」の項参照）

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、 最適使用推進ガイドライン等	有 無	タイトル、参照先等
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無	
最適使用推進ガイドライン	無	
保険適用上の留意事項通知	無	

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMP の概要

該当しない

Ⅱ．名称に関する項目

1．販売名

（1）和名

バナン®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　プロキセチル（JAN）

（2）洋名（命名法）

Cefpodoxime Proxetil（JAN）

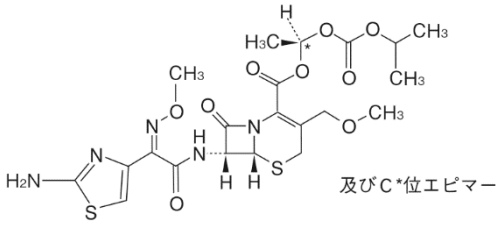
cefpodoxime（INN）

（3）ステム（stem）

セファロスポラン酸誘導体抗生物質：cef-

（antibiotics, cefalosporanic acid derivatives）

3．構造式又は示性式



4．分子式及び分子量

分子式：$C_{21}H_{27}N_5O_9S_2$

分子量：557.60

5．化学名（命名法）又は本質

(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

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

各種 pH 条件の溶解性
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%、デシケータ中、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

溶媒＼pH	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**：〔α〕$^{20}_{D}$=+24.0～+31.4°（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**：$E^{1\%}_{1cm}$（234nm）=約 338
3）pH：約 6（1→100 水懸濁液）

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ヵ月	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℃/75%RH	6ヵ月	ほとんど変化は認められなかった。
			50℃	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℃/31%RH	6ヵ月	53%RH、6ヵ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℃/53%RH		
			40℃/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ほとんど変化なし。
			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$E^{1\%}_{1cm}$（234nm）、4）旋光度［α］$^{20}_{D}$、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、定量法

確認試験法：日局「セフポドキシム　プロキセチル」による
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

フィルムコート錠

（2）製剤の外観及び性状

販売名	剤　形	色	外　形		
			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			
			8.7	約 4.2	約 230

（3）識別コード

販売名	識別コード
バナン錠 100mg	SANKYO676

（4）製剤の物性

該当資料なし

（5）その他

該当しない

2．製剤の組成

（1）有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	有効成分	添加剤
バナン 錠 100mg	1 錠中 セフポドキシム プロキセチル（日局） 100mg（力価）	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

（2）電解質等の濃度

該当資料なし

（3）熱量

該当資料なし

3．添付溶解液の組成及び容量

該当しない

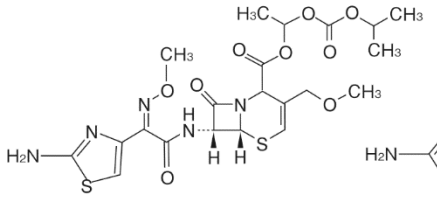
4. 力価

日局「セフポドキシム　プロキセチル錠」による。

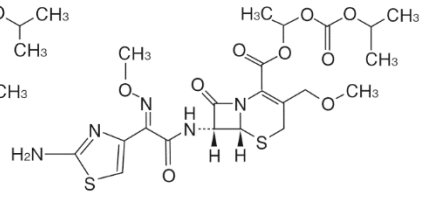
本品の力価は、セフポドキシム（$C_{15}H_{17}N_5O_6S_2$：427.46）としての量を質量（力価）で示す。

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。

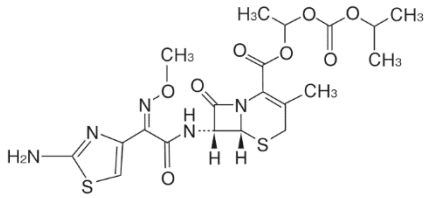
5. 混入する可能性のある夾雑物



〔1〕Δ^3－異性体



〔2〕*E*－異性体



〔3〕脱メトキシ体

6. 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℃/60%RH	PTP（乾燥剤入り）、アルミピローパック、箱	36 ヵ月	変化なし

試験項目：外観、溶出試験、含量

(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た。

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

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当しない

9. 溶出性

日局「セフポドキシム　プロキセチル錠」による

10. 容器・包装

（1）注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

（2）包装

（PTP：乾燥剤入り）　100 錠（10 錠×10）

（3）予備容量

該当しない

（4）容器の材質

PTP：ポリプロピレン、アルミニウム箔

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. 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

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能又は効果に関連する注意

＜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＞

「抗微生物薬適正使用の手引き」[4] 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）

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又は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）

3. 用法及び用量

（1）用法及び用量の解説

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。

（2）用法及び用量の設定経緯・根拠

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

（1）臨床データパッケージ

該当しない

（2）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、ALT 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)]。

（3）用量反応探索試験

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}、$AUC_{0\text{-}12}$ 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検討した結果、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．薬物動態に関する項目　1．血中濃度の推移　（2）臨床試験で確認された血中濃度」の項 1）単回投与及び「（4）食事・併用薬の影響」の項参照）。

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及び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。

（4）検証的試験

1）有効性検証試験

①　無作為化並行用量反応試験

尿路に基礎疾患を有する複雑性尿路感染症患者を対象に、総合臨床効果に対する効果及び細菌学的効果を検討した。至適用量設定試験での 200mg 群（103 例）と 400mg 群（96 例）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、Urinary Tract Infection 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（P<0.05, Mann-Whitney の U 検定）[8]。

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-PR 100mg×2	46/76	60.5	84/116	72.4	8
			B 群 CPDX-PR 200mg×2	50/72	69.4	70/93	75.3	

CPDX-PR: Cefpodoxime proxetil

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)]。

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
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-CEX 1000mg×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 国内臨床試験[16)，17)，18)]

a）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 例）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、セフポドキシム プロキセチル錠の有用性が認められている。

b）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 例）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、セフポドキシム プロキセチル錠の有用性が認められている。

c）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 例）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、セフポドキシム プロキセチル錠の有用性が認められている。

d）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 例）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、セフポドキシム プロキセチル錠の有用性が認められている。

e）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 例）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、セフポドキシム プロキセチル錠の有用性が認められている。

f）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 例）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、セフポドキシム プロキセチル錠の有用性が認められている。

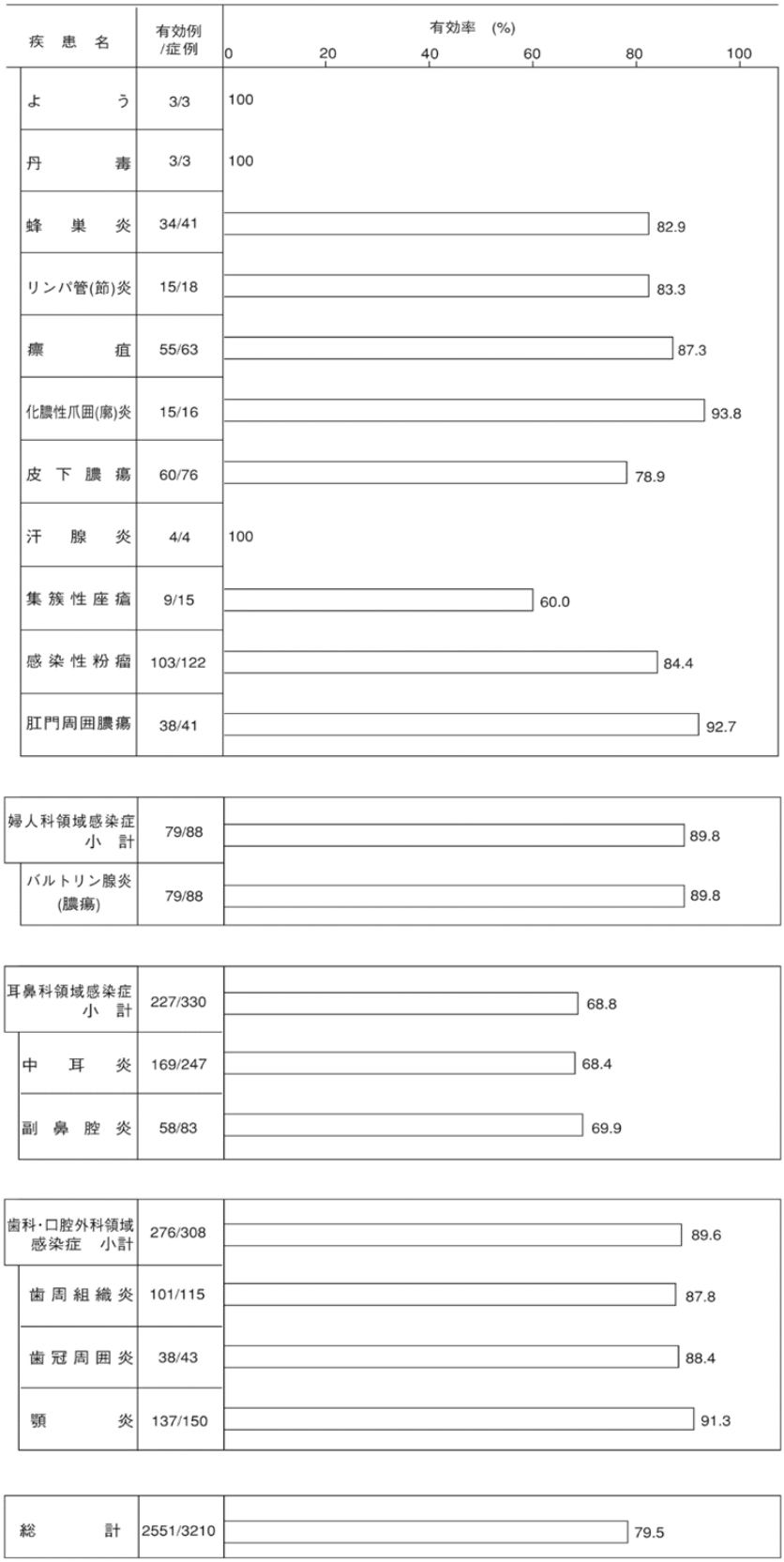
g）歯科・口腔外科領域感染症

歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎に対する有効率は 89.6%（276/308 例）であった。安全性解析対象症例のうち 2.2%（7/320 例）で副作用が発現し、主なものは下痢、嘔吐等の胃腸障害であった。

疾患別臨床効果

疾患名	有効例/症例	有効率(%)
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
癤	52/55	94.5
癤腫症	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。



3,210 例：一般臨床試験 2,549 例、二重盲検比較試験 661 例

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。

起炎菌別臨床効果

菌種	有効例/症例	有効率(%)
(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。

(歯科・口腔外科領域感染症適応追加時)

菌　　種	有効例/症例	有効率 (%)
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

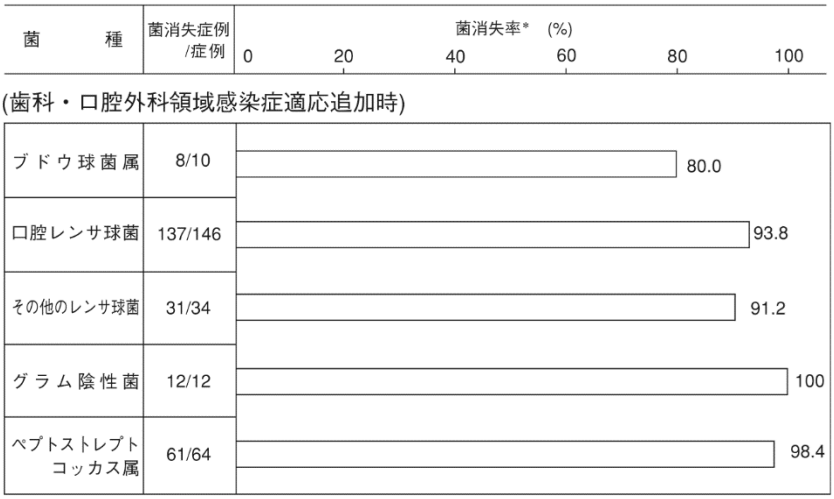
ここに示す成績は製造承認時の適応症・適応菌種に関するものであり、平成16年（2004年）の抗菌薬再評価結果を踏まえたものではありません。

起炎菌別細菌学効果

菌種	菌消失症例/症例	菌消失率* (%)
(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

＊菌消失率＝菌消失症例数／（菌消失＋菌交代＋菌存続）症例数

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。



＊菌消失率＝菌消失症例数／（菌消失＋菌交代＋菌存続）症例数

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）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。

(5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学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[1), 19), 20)]

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。

in vitro における *E. coli* NIHJ JC-2 の PBP に対する 50%阻害濃度（μg/mL）

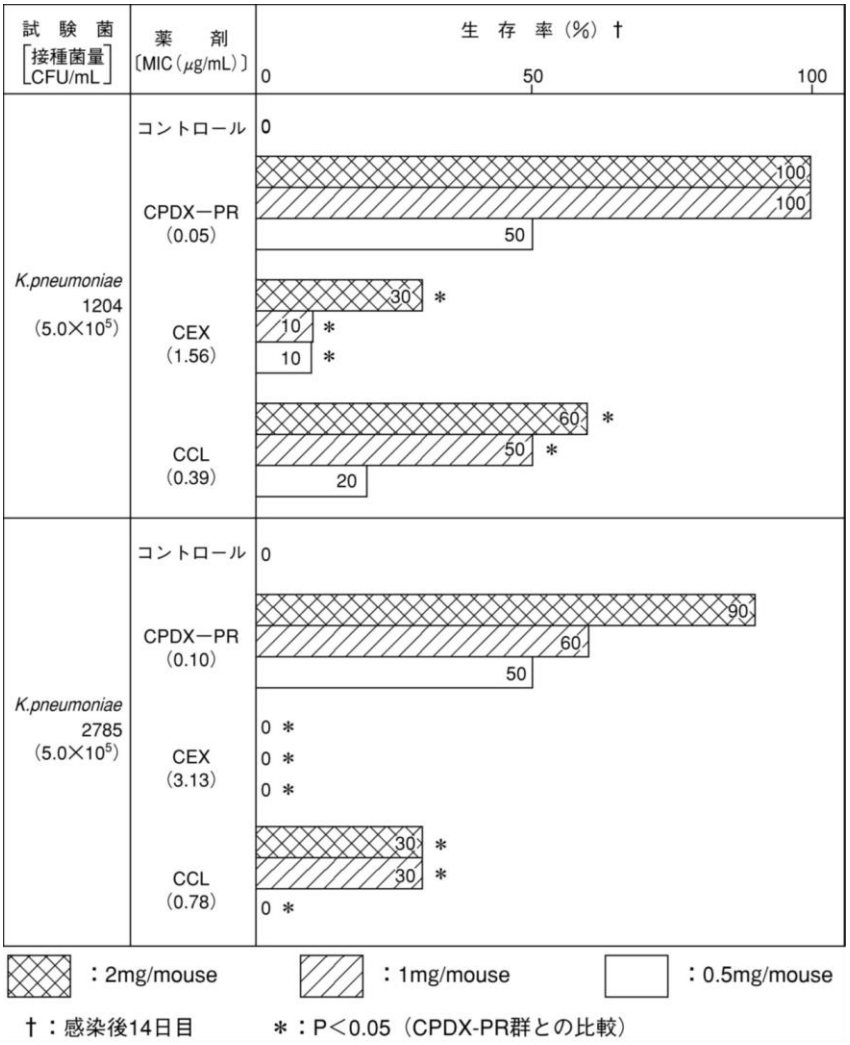
PBP	1A	1Bs	2	3	4	5	6
セフポドキシム	0.4	0.6	1.5	0.3	15.2	＞100	＞100

(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[21)]

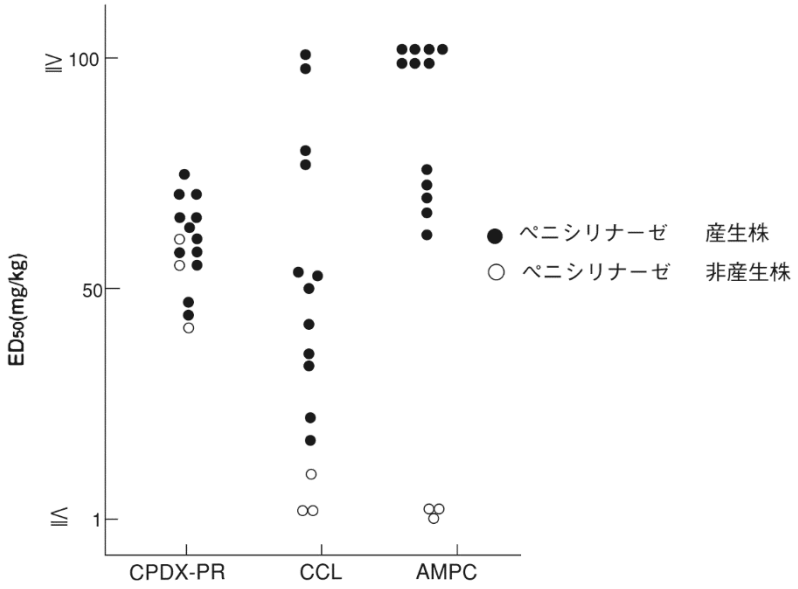
感染 5 時間目に 1 回目の投与を行い、翌日より 3 日間、2 回/日、計 7 回連続経口投与し、14 日目のマウス生存率を検討した。

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。

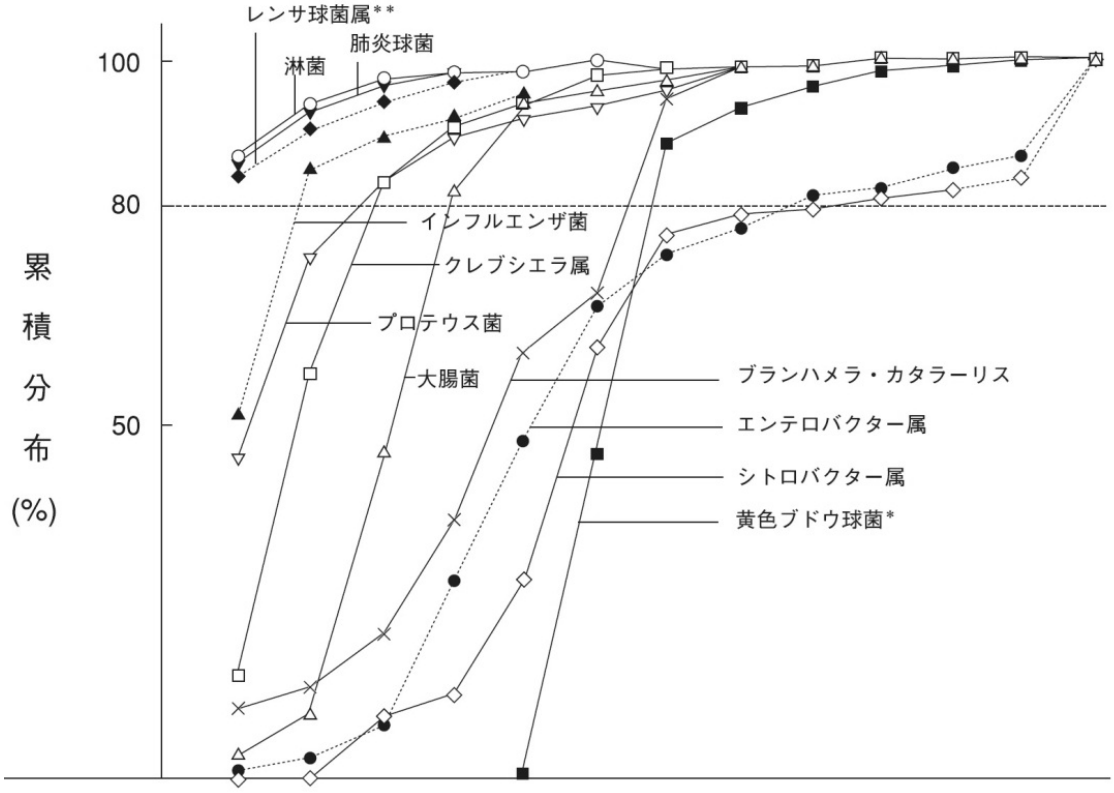

試験菌
接種菌量
CFU/mL
薬剤
〔MIC（μg/mL）〕
生存率（%）†
0
50
100
K.pneumoniae
1204
（5.0×10⁵）
コントロール
0
CPDX−PR
（0.05）
100
100
50
CEX
（1.56）
30 ＊
10 ＊
10 ＊
CCL
（0.39）
60 ＊
50 ＊
20
K.pneumoniae
2785
（5.0×10⁵）
コントロール
0
CPDX−PR
（0.10）
90
60
50
CEX
（3.13）
0 ＊
0 ＊
0 ＊
CCL
（0.78）
30 ＊
30 ＊
0 ＊
：2mg/mouse
：1mg/mouse
：0.5mg/mouse
†：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[22)]

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 ED_{50} 値は 10mg/kg 前後にあるが、CCL、AMPC は産生株では ED_{50} 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[2), 3), 19), 21)～25)]



菌名・株数 ＼ MIC（μg/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		

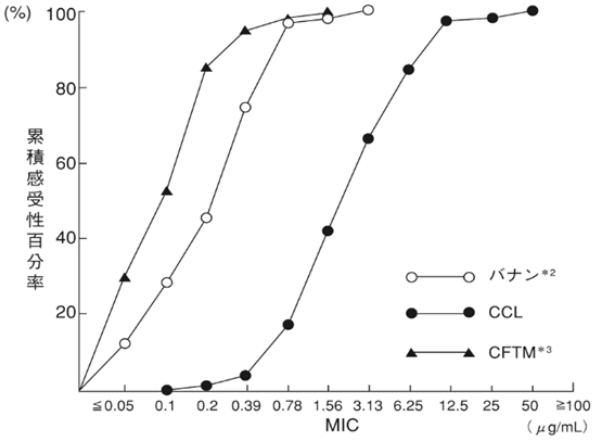
* メチシリン感性黄色ブドウ球菌　　（10^6CFU/mL）
** 肺炎球菌を除く

（第一三共社内集計）

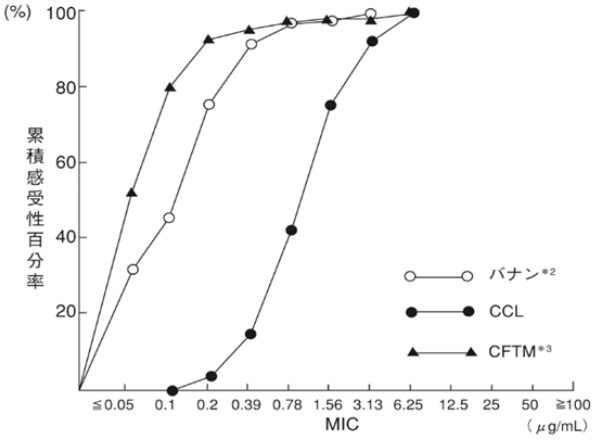
ここに示す成績は製造承認時の適応症・適応菌種に関するものであり、平成16年（2004年）の抗菌薬再評価結果を踏まえたものではありません。

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[17)，18)]

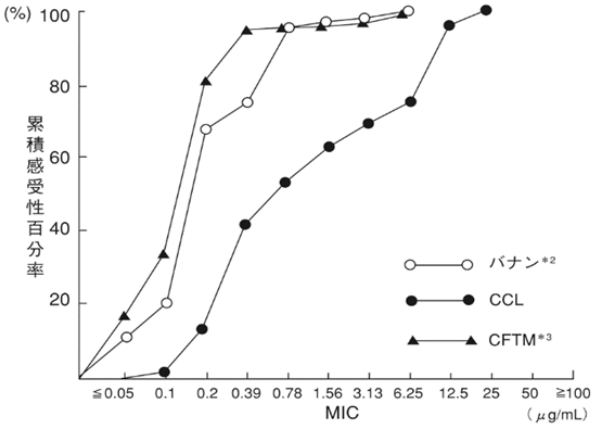
①口腔レンサ球菌＊1　　10^6CFU/mL164株



②その他の口腔レンサ球菌　　10^6CFU/mL　35株



③ペプトストレプトコッカス属　　10^6CFU/mL　52株



＊1　*S.anginous,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シムにて測定
＊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*）[1), 19)]

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

(1) 治療上有効な血中濃度

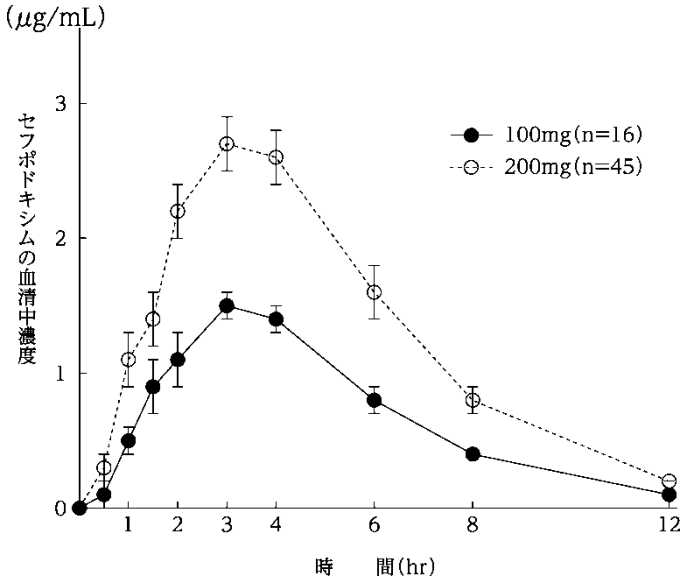
感染部位、起炎菌の感受性により異なる。

（「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目　2. 薬理作用　(2) 薬効を裏付ける試験成績」、「5. 分布　(5) その他の組織への移行性」の項参照）

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

1) 単回投与

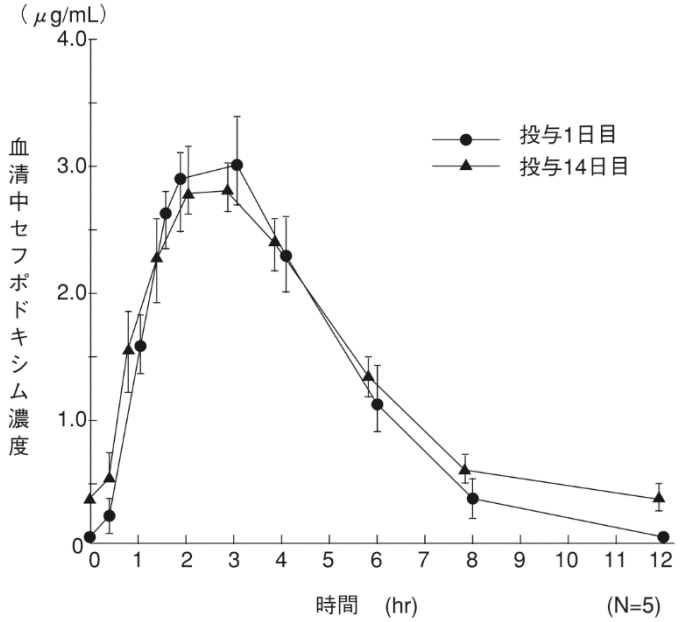
健康成人男性にセフポドキシム プロキセチル錠 100mg 又は 200mg を食後単回経口投与したときのセフポドキシムの最高血清中濃度は投与後 2～3 時間で得られ、それぞれ 1.5μg/mL、2.7μg/mL の濃度を示し、dose response が認められた。血清中濃度の半減期は投与量に依存せず一定で、約 2 時間であった[26)]。



食後経口投与時（単回投与）の血清中濃度

2）連続投与

健康成人男性 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）

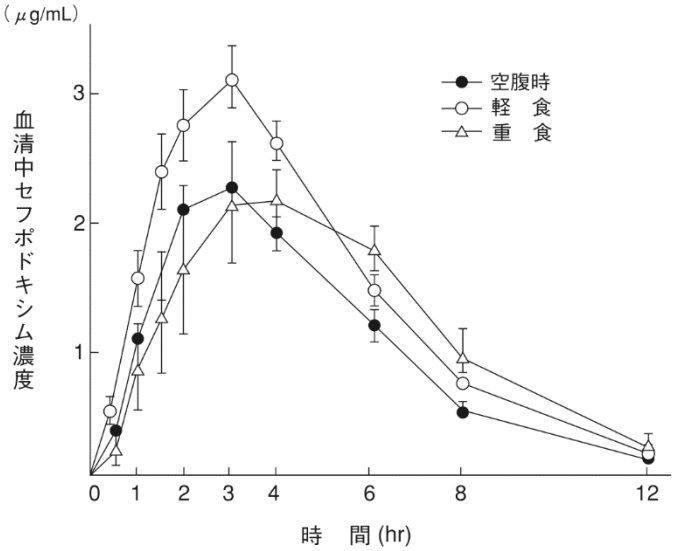
健康成人における 200mg 経口投与時（連続投与）の血清中濃度

（3）中毒域

該当資料なし

（4）食事・併用薬の影響

健康成人男性 6 名にセフポドキシム プロキセチル錠 200mg を空腹時又は軽食あるいは重食 30 分後に単回経口投与したときのセフポドキシムの最高血清中濃度は投与後 2.6～3.5 時間で得られ、それぞれ 2.1μg/mL、3.0μg/mL、2.7μg/mL の濃度を示した。また、$AUC_{0\text{-}12}$ はそれぞれ 12.5μg・hr/mL、16.9μg・hr/mL、14.8μg・hr/mL であり、空腹時より食後で吸収は良好であった。血清中濃度の半減期は空腹時、食後の影響はなく、約 2 時間であった [27]。



(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)	$AUC_{0\text{-}12}$ (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

Student's t-test　*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. 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 model [5]

（2）吸収速度定数

$Ka=0.75\pm0.09hr^{-1}$（mean±SE、n=6）

（健康成人男性 200mg、食後 1 回投与）[28]

（3）消失速度定数

$Ke=0.37\pm0.02hr^{-1}$（mean±SE、n=6）

（健康成人男性 200mg、食後 1 回投与）[28]

（4）クリアランス

＜外国人データ＞

全身クリアランス：9.88±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）[29)]

（5）分布容積

＜外国人データ＞

32.3±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）[29)]

（6）その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

（1）解析方法

該当資料なし

（2）パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

本剤は内服後、腸管より吸収される。

AUC：8.7±0.3μg・hr/mL（mean±SE、n=6）

（健康成人男性 100mg、食後 1 回投与）[5)]

15.2±1.8μg・hr/mL（mean±SE、n=6）

（健康成人男性 200mg、食後 1 回投与）[5)]

＜外国人データ＞

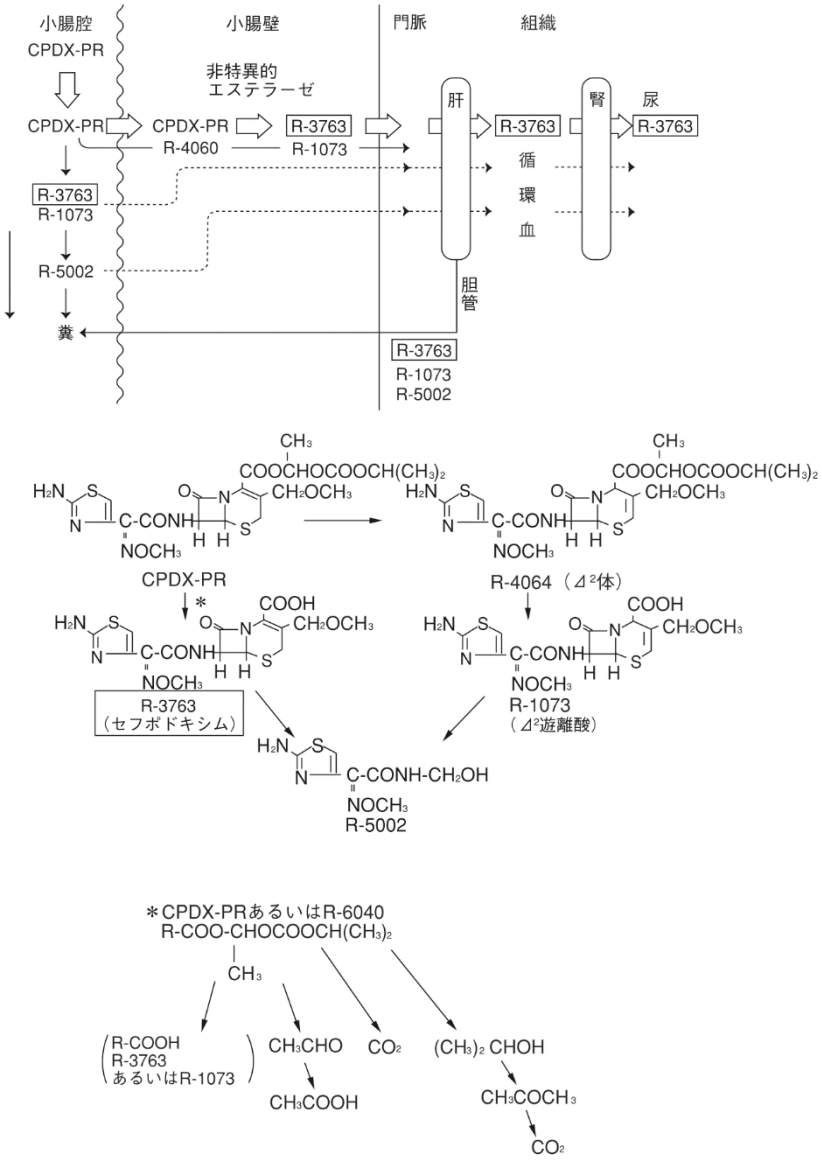
絶対的バイオアベイラビリティ：50%

（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）[29)]

＜動物データ＞

吸収及び代謝経路

セフポドキシム　プロキ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　プロキセチルは存在しない。未吸収のセフポドキシム　プロキ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（R-3763）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[30)]。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)]。


小腸腔
小腸壁
門脈
組織
CPDX-PR
非特異的
エステラーゼ
CPDX-PR
CPDX-PR
R-3763
R-4060
R-1073
肝
R-3763
腎
尿
R-3763
循
環
血
R-3763
R-1073
R-5002
胆
管
糞
R-3763
R-1073
R-5002
CPDX-PR
R-4064（Δ²体）
R-3763
（セフポドキシム）
R-1073
（Δ²遊離酸）
R-5002
＊CPDX-PRあるいはR-6040
R-COO-CHOCOOCH(CH₃)₂
R-COOH
R-3763
あるいはR-1073
CH₃CHO
CO₂
(CH₃)₂ CHOH
CH₃COOH
CH₃COCH₃
CO₂

推定代謝経過

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

＜動物データ（ラット）＞

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。大脳はじめ中枢組織への移行は低かった[30)]。

^{14}C-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

＜動物データ（ラット）＞

妊娠 18 日目ラットに ^{14}C-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[31]。

(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 0.05～0.13μg/mL 認められた[32]。

症例	血清中濃度（μg/mL）				乳汁中濃度（μg/mL）			
	1hr	2hr	4hr	6hr	1hr	2hr	4hr	6hr
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

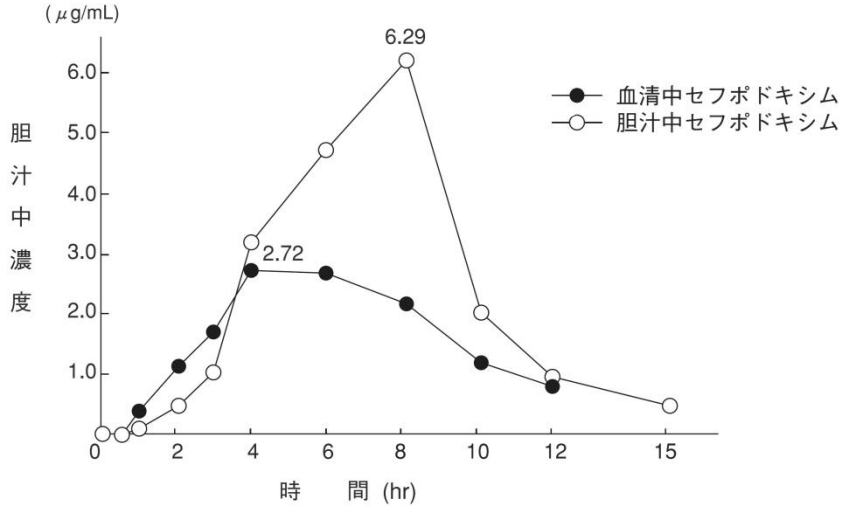
(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

1) 胆汁中濃度[33)～36)]

T-チューブ施行 18 例に本剤 200mg を食後 1 回経口投与したときの血清中セフポドキシム濃度は、投与 4 時間後に最高値 2.72μg/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 6.29μg/mL と良好な胆汁移行性を示した。



（第一三共社内集計）

2）喀痰中濃度[37), 38)]

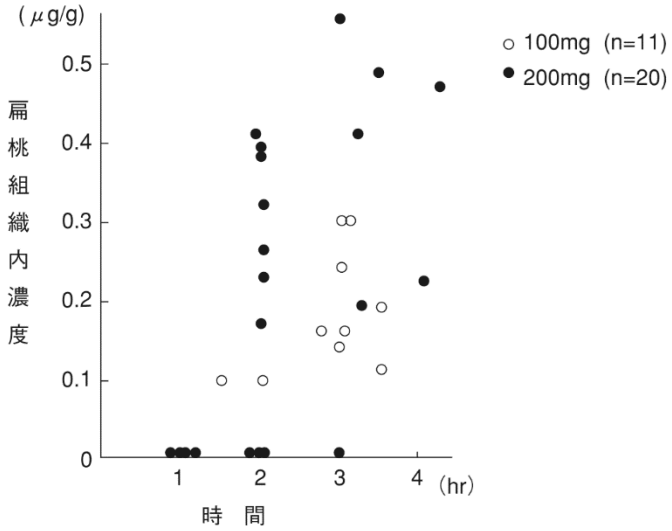
慢性呼吸器感染症 9 例に本剤 100mg 又は 200mg を食後に経口投与した。喀痰中濃度は 100mg 連投で 0.41μg/mL であり、最高血清中濃度に対する比率は 21.6%を示した。200mg 投与時の喀痰中濃度は測定限界以下を除き、単回投与で 0.10～0.16μg/mL、連投で 0.08～0.24μg/mL、最高血清中濃度に対する比率は、それぞれ 5.4～6.6%、2.35～3.8%であった。セフポドキシムの最高濃度到達時間は、血清中で投与後 2～6 時間、喀痰で投与後 2.5～6 時間であった。

投与量	投与方法		最高濃度（μg/mL）		喀痰中濃度/血清中濃度（%）
			血清中	喀　痰	
100mg	連続投与（3 回/日）	食後	1.9　(4.5hr)	0.41	21.6
200mg	1 回投与	食後	1.85（6hr） 2.42（4hr） 3.03（2hr）	0.10（6hr） 0.16（6hr） ＜0.04	5.4 6.6
	連続投与（2 回/日）	食後	3.7　(2.5hr) 3.4　(2hr) 3.4　(5hr) N.D.	＜0.05 0.08 0.13 0.24	2.35 3.8

N.D.：Not Done

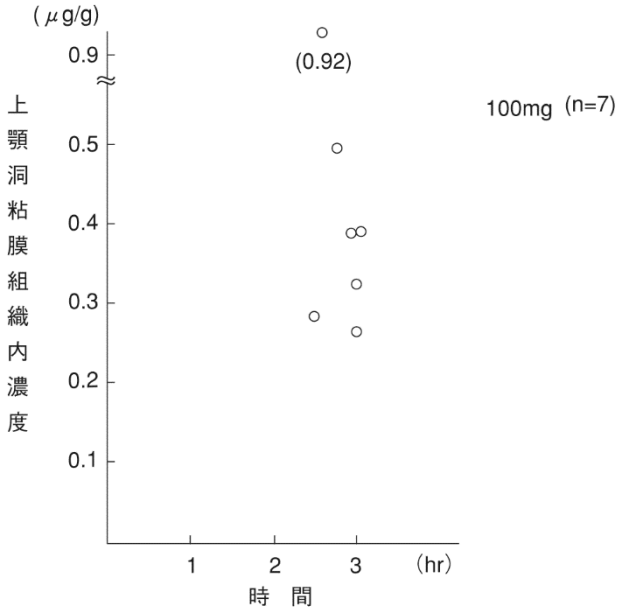
3）扁桃組織内濃度[39)～42)]

口蓋扁桃摘出術施行患者 31 例に本剤 100mg 又は 200mg を術前経口投与したときの扁桃組織内濃度を検討した。100mg 投与では投与後 90 分から 210 分の組織内セフポドキシム濃度は測定限界以下（＜0.078μg/g）から 0.3μg/g であり、200mg 投与では投与後 50 分から 255 分の組織内セフポドキシム濃度は測定限界以下から 0.56μg/g であった。扁桃組織内濃度/血清中濃度比はそれぞれ 30.9%以下、22.7%以下であった。



4）上顎洞粘膜組織内濃度[40)～42)]

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ときの上顎洞粘膜組織内濃度を検討した。150 分から 180 分の組織内セフポドキシム濃度は 0.26～0.92μg/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[40)，42)]

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 を経口投与したときの血清中及び組織内セフポド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）μg/mL であり、鼻茸中濃度は 0.34～3.28（平均 1.41）μg/g であった。また 200mg 投与後 120 分の血清中濃度は 0.14～2.08μg/mL、組織内濃度は 0.14～0.34μg/g であった。

用量	症例	投与後時間	血清中濃度（μm/mL）	組織内濃度（μg/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[43), 44)]

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とき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）μg/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）μg/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（μg/mL）	前立腺組織（μg/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±SE	0.87±0.20	0.60±0.17		68±14	
連続投与 200mg×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[43)]

慢性前立腺炎の患者に本剤 200mg×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 1.09～1.60μg/mL、2 週目は 1.17μg/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（μg/mL）	
		1 週目	2 週目
200mg×2/日	1	1.60	
	2[a)]	1.29	1.17
	3[a)]	1.09	1.17
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[45)]

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とき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）μg/g、そのときの血清中濃度は 0.05～2.85（平均 1.55）μg/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（μg/mL）	皮膚組織（μg/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

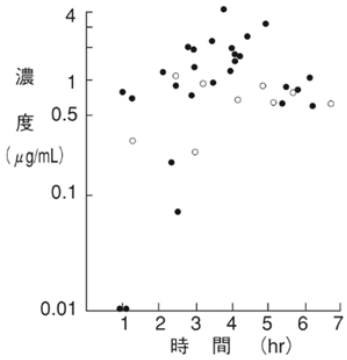
N.D.：Not detected

9）子宮・子宮付属器組織内移行[32)，46)，47)]

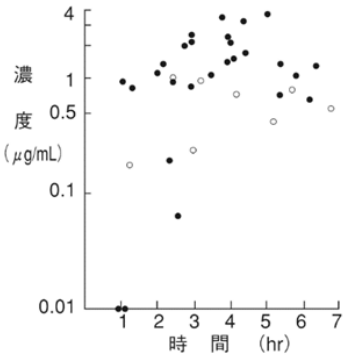
子宮筋腫で子宮全摘出術施行患者 28 例に術前本剤 100mg あるいは 200mg を単回投与したときの血清中ならびに子宮・子宮付属器組織内セフポドキシム濃度を検討した。子宮動脈血の血清中濃度は 100mg 投与で 0.17～0.94μg/mL、200mg 投与では投与初期の N.D.（測定限界以下）を除くと 0.06～3.07μg/mL、肘静脈血清中濃度は 100mg 投与で 0.24～1.09μg/mL、200mg 投与では投与初期の N.D.を除くと 0.07～3.99μg/mL と動・静脈血同程度の濃度を示した。組織内には 100mg 投与で 0.12～0.42μg/g、200mg 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

○：100mg　　●：200mg

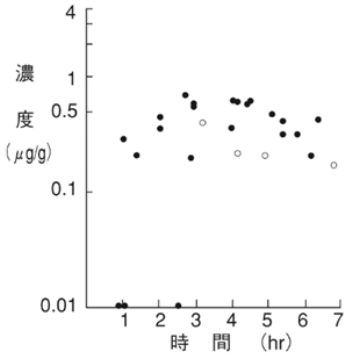
1）末梢血（100mg:9例，200mg:27例）



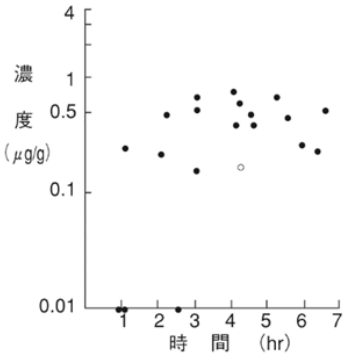
2）子宮動脈血（100mg:8例，200mg:27例）



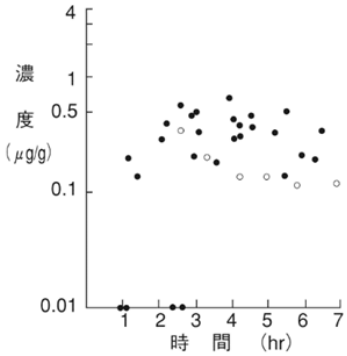
3）卵管（100mg:4例，200mg:22例）



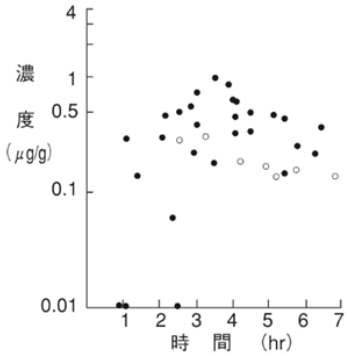
4）卵巣（100mg:1例，200mg:19例）



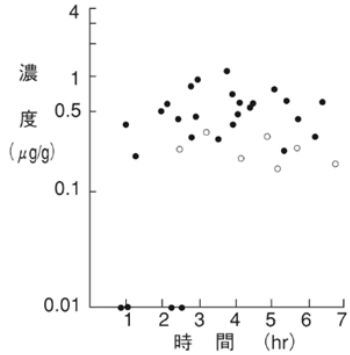
5）子宮内膜（100mg:6例，200mg:27例）



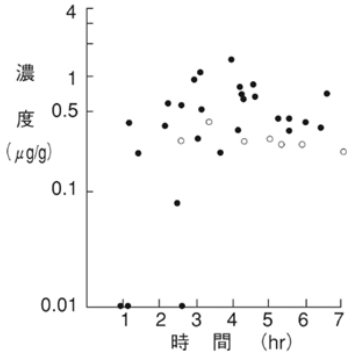
6）子宮筋層（100mg:7例，200mg:28例）



7）子宮頸部（100mg:7例，200mg:27例）



8）子宮膣部（100mg:7例，200mg:27例）



10）抜歯創・口腔組織への移行[48)]

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 0.78μg/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（μg/mL）	≧0.39μg/mL の頻度（%）	≧0.78μg/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 0.39μg/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 2.20μg/g、非検出例を除いた平均は 1.17±0.43μg/g であり、歯槽骨の 28 例では最高 1.07μg/g、平均は 0.57±0.24μg/g であり、歯小嚢の 15 例では最高 2.04μg/g、平均は 0.97±0.54μg/g 及び嚢胞壁の 13 例では最高 1.77μg/g、平均は 0.96±0.62μg/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（μg/g）		移行率（%）（平均±SD）
				最高値	平均±SD*	
歯肉	100	3（3）	180～210 分	0.97	0.79±0.26	－
	200	23（21）	120～360 分	2.20	1.17±0.43	47.3±11.6
歯小嚢	100	4（4）	180～225 分	0.91	0.74±0.19	－
	200	15（13）	85～235 分	2.04	0.97±0.54	37.5±11.4
嚢胞壁	100	3（2）	195～210 分	0.78	0.60±0.26	－
	200	13（11）	80～270 分	1.77	0.96±0.62	37.6±15.3**
歯槽骨	100	1（1）	180 分	1.07	0.26	－
	200	28（15）	70～220 分		0.57±0.24	17.7±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

（6）血漿蛋白結合率

健康成人男性 6 名にセフポドキシム プロキセチル錠 200mg を食後単回経口投与したとき、0.5～12 時間後のセフポドキシムの血清蛋白結合率は、限外濾過法で約 30%であった[5)]。

6. 代謝

（1）代謝部位及び代謝経路

「4. 吸収」の項参照

（2）代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

該当資料なし

（3）初回通過効果の有無及びその割合

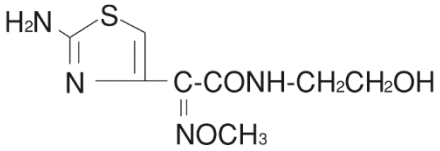
該当資料なし

（4）代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

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。

＜動物データ（ラット）＞

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[30]。



R-5002

7. 排泄

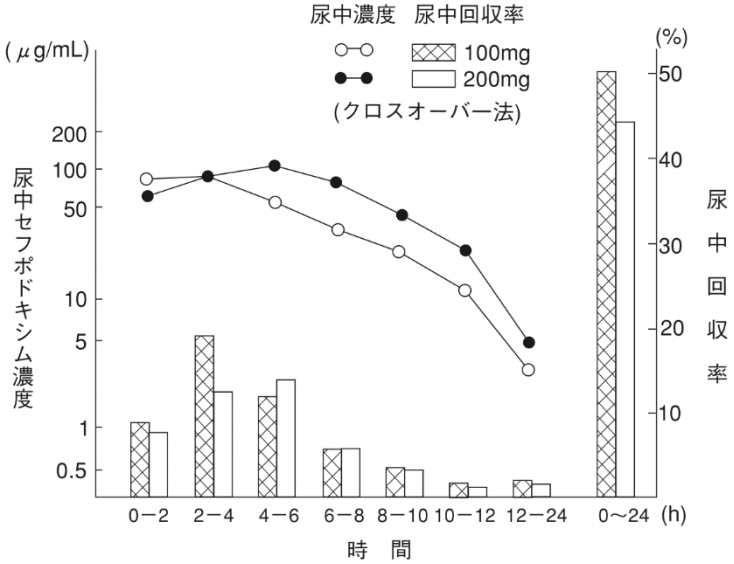
（1）排泄部位及び経路

腎を介して尿中に排泄される。

（2）排泄速度

1）健康成人

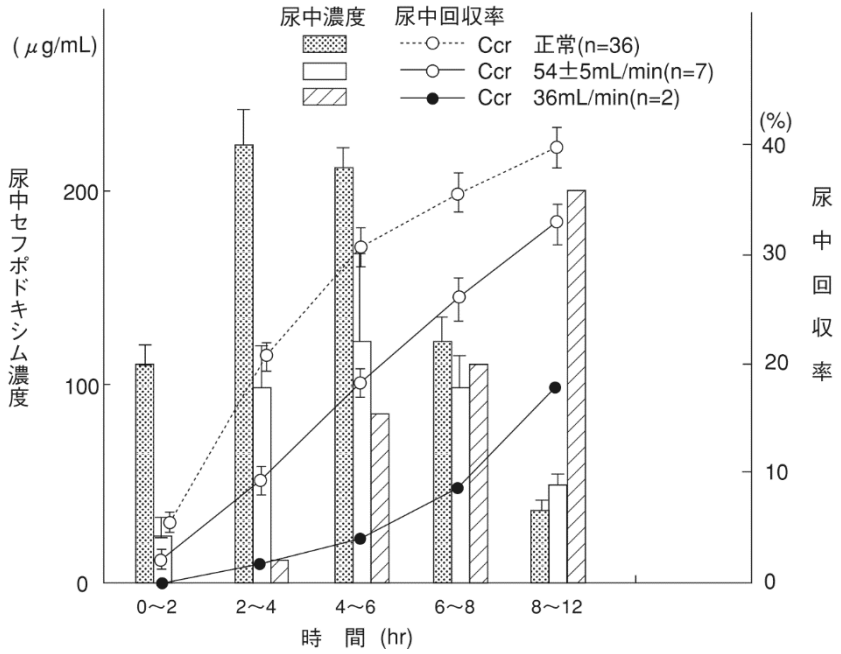
健康成人 6 例に 100mg 又は 200mg を食後 1 回経口投与したときの 24 時間までの尿中回収率はそれぞれ 50.8%、44.5%であった[5]。



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）腎機能障害患者

腎機能障害患者にセフポドキシム　プロキセチル錠 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[49]。



腎機能障害患者に 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

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

（1）腹膜透析

＜外国人データ＞

セフポドキシムとして 200mg を経口投与したとき、透析液中に 5.74±3.1%回収されると報告されている[50]。

（2）血液透析

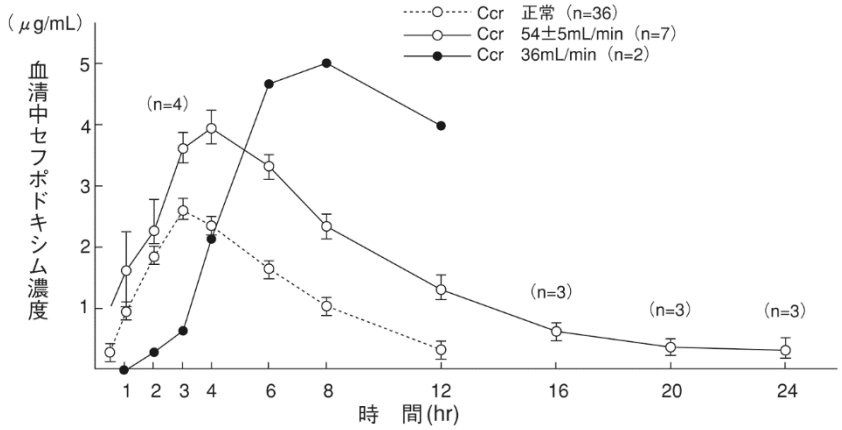
＜外国人データ＞

2.86±0.25 時間の透析により 22.4±2.9%除去される[51]。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[52]。

10. 特定の背景を有する患者

（1）腎機能障害患者

軽度腎機能障害患者（7 例）及び中等度腎機能障害患者（2 例）に、セフポドキシム プロキセチル錠 200mg を食後 30 分に経口投与したとき、腎機能の低下に伴い、C_{max} の増加、T_{max} の延長、$AUC_{0\text{-}12}$ の増加が認められた[49]。



投与対象	例数	Ccr 注) (mL/min)	C_{max} (μg/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)	$AUC_{0\text{-}12}$ (μg・hr/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±0.28**	3.7±0.3	3.6±0.4**	28.34±2.16**
中等度障害	2	36	4.81	7	3.4	34.03

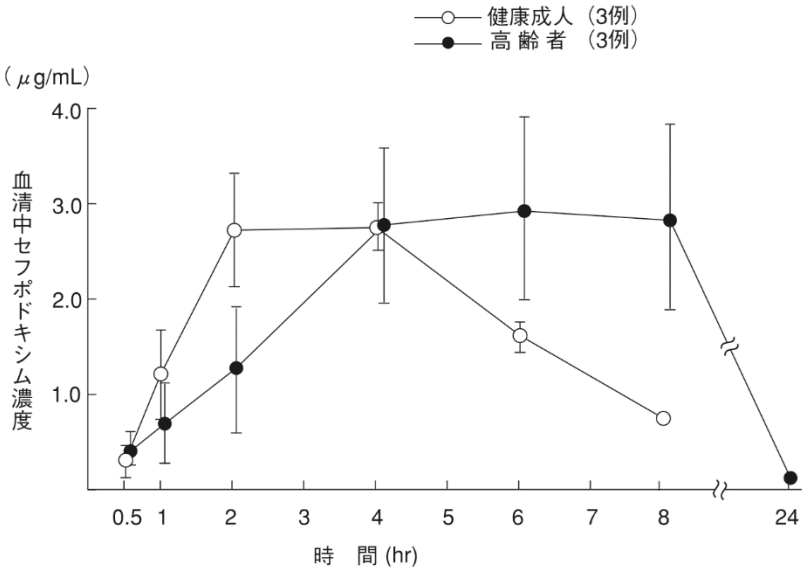
注）クレアチニンクリアランス　　Student's t-test　**P＜0.01（健康成人との比較）　　（mean±SE）

腎機能障害患者における 200mg 食後投与時の血清中濃度

（2）高齢者

平均年齢 32.7 歳の健康成人男性 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）にセフポドキシム プロキセチル錠 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±0.43μg/mL、6 時間後にピークとなり、2.93±0.98μg/mL、8 時間後に 2.89±0.99μg/mL、24 時間後は 1 例が測定限界以下となり、0.14±0.07μg/mL となった。

$t_{1/2}$ は平均 3.3 時間、AUC は平均 41.14μg・hr/mL であった [53]。



投与対象	例数	年齢	C_{max}（μg/mL）	$t_{1/2}$（hr）	AUC_{0-12}（μg・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

11. その他

該当資料なし

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 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

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「Ⅴ．治療に関する項目　2．効能又は効果に関連する注意」の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意
8.1 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。
8.2 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。［11.1.1 参照］
8.3 急性腎障害等の重篤な腎機能障害があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行うこと。［11.1.4 参照］

（解説）

8.1 細菌性感染症を効能又は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）

8.2 経口用セフェム系抗生物質に共通した注意事項

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 セフェム系又は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（ただし、本剤に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと）

9.1.2 本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー症状を起こしやすい体質を有する患者

9.1.3 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

観察を十分に行うこと。ビタミンK欠乏症状があらわれることがある。

（解説）

経口用セフェム系抗生物質の一般的注意事項

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 高度の腎機能障害のある患者

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。本剤は腎排泄型の抗生物質のため排泄遅延が起こる。［16.6.1 参照］

（解説）

経口用セフェム系抗生物質の一般的注意事項

本剤は腎排泄型の抗生物質のため排泄遅延が起こる。

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性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。

（解説）

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目　5. 分布　(2) 血液－胎盤関門通過性」の項参照（動物データ）

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。ヒト乳汁中へ移行する[32]。

（解説）

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目　5. 分布　(3) 乳汁への移行性」の項参照

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

（解説）

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。小児用ドライシロップ製剤が発売されている。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

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。

・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。

・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。

（解説）

経口用セフェム系抗生物質の一般的注意事項

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 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[54)，55)]。

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 **ショック**（頻度不明）、**アナフィラキシー**（頻度不明）

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、めまい、便意、耳鳴、発汗、発疹等）を起こすことがある。［8.2 参照］

11.1.2 **中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）**（頻度不明）、**皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）**（頻度不明）

11.1.3 **偽膜性大腸炎**（頻度不明）

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。

11.1.4 **急性腎障害**（頻度不明）

急性腎障害等の重篤な腎機能障害があらわれることがある。［8.3 参照］

11.1.5 **間質性肺炎**（頻度不明）、**PIE 症候群**（頻度不明）

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。

11.1.6 **肝機能障害**（頻度不明）、**黄疸**（頻度不明）

AST、ALT、γ-GTP 上昇等の肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

11.1.7 **汎血球減少症**（頻度不明）、**無顆粒球症**（頻度不明）、**溶血性貧血**（頻度不明）、**血小板減少**（頻度不明）

11.1.8 **痙攣**（頻度不明）

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～2%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	発疹	そう痒、発熱	蕁麻疹、紅斑、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 上昇、ALT 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、軟便、胃痛、食欲不振	嘔吐、腹痛、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

◆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〕				
AL－P 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第一三共社内集計〕

◆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
			症例数	件数	症例率（%）	（95%信頼区間）
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
			症例数	件数	症例率（%）	（95%信頼区間）
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

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12. 臨床検査結果に及ぼす影響
12.1 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。
12.2 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。

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意
14.1 薬剤交付時の注意
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ある。

（解説）
「PTP の誤飲対策について」（平成 8 年 3 月 27 日付日薬連発第 240 号）及び「新記載要領に基づく医療用医薬品添付文書等の作成にあたっての Q&A について」（平成 31 年 1 月 17 日付日薬連発第 54 号）に従い設定した。

12. その他の注意

（1）臨床使用に基づく情報

設定されていない

（2）非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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」の項参照

(2) 安全性薬理試験 [56)]

マウス、ラット、モルモット、ウサギ、ネコ及びイ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）	*in vitro*（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）	*in vitro* （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	モルモット （Hartley，雄，n=5）	*in vitro* （活性体）	10^{-3}g/mL	10^{-3}g/mL で有意作用なし	摘出回腸 （マグヌス法）
	抗ノルエピネフリン	ラット （SD，雄，n=5）		10^{-3}g/mL	10^{-3}g/mL で有意作用なし	摘出輸精管 （マグヌス法）
消化器系に及ぼす影響	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）	*in vitro* （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 （*ex vivo*）	25，100，500，2000	2000mg/kg まで有意作用なし	ADP 凝集 （*ex vivo*）
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）	*in vitro* （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）

（3）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[57)]

LD_{50}値（mg/kg）

動物種 / 投与経路	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[58)，59)]

（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 1000mg/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）遺伝毒性試験

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。

（4）がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

1) 妊娠前及び妊娠初期投与試験（SegmentⅠ）

（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（SegmentⅡ）

（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みられたが、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（SegmentⅢ）[60)]

（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（F_1）：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。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) 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。

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

3 年（安定性試験結果に基づく）

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向け医薬品ガイド：無し
くすりのしおり：有り

6. 同一成分・同効薬

先発医薬品、一物二名称の製品はない

7. 国際誕生年月日

1989 年 9 月 29 日（日本）

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

製造販売承認年月日：2008 年 9 月 10 日（販売名変更による）
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
薬価基準収載年月日：2008 年 12 月 19 日（販売名変更による）
販売開始年月日：1989 年 12 月

9. 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

10. 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

11. 再審査期間

6 年（1989 年 9 月 29 日～1995 年 9 月 28 日、終了）

12. 投薬期間制限に関する情報

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。

13. 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	個別医薬品コード（YJ コード）	レセプト電算処理システム用コード	GS1 コード（販売包装単位）
バナン錠 100mg	1109245020103	6132011F1080	6132011F1080	620008681	14987246730010

14. 保険給付上の注意

該当しない

ＸＩ．文献

1. 引用文献

1）宇津井幸男ほか：Chemotherapy*．1988；36（S-1）：146-158.
2）宇津井幸男ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：1-15.
3）五島瑳智子ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：43-61.
4）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
5）小林真一ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：200-214.
6）田島政三ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：215-228.
7）岡　慎一ほか：Chemotherapy．1988；36（S-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 Antibiot．1988；41（10）：1517-1537.（PMID：3060626）
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.（PMID：3146609）
14）柴　孝也ほか：感染症学雑誌．1988；62（12）：1166-1191.（PMID：3148015）
15）松田静治ほか：臨床医薬．1988；4（9）：1641-1685.
16）Chemotherapy．1988；36（S-1）：CEFPODOXIME PROXETIL論文特集号を中心に集計
17）佐々木次郎ほか：歯薬療法．1993；12（1）：17-32.
18）佐々木次郎ほか：歯薬療法．1996；15（2）：90-105.
19）横田　健ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：16-26.
20）西野武志ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：72-93.
21）安田　紘ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：159-172.
22）宇津井幸男ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：173-184.
23）小栗豊子ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：27-42.
24）永山在明ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：94-103.
25）田島政三ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：104-145.
26）社内資料：バナン錠申請資料概要　食後単回投与試験
27）斎藤　玲：Chemotherapy．1988；36（S-1）：252-260.
28）柴　孝也ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：434-441.
29）Tremblay D，et al.：J Antimicrob Chemother．1990；26（S-E）：21-28.（PMID：2292526）
30）駒井　亨ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：229-240.
31）江角凱夫ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：241-251.
32）山元貴雄ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：967-978.
33）岩井重富ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：612-619.
34）中津喬義ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：653-663.
35）由良二郎ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：664-676.
36）山本　博ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：685-689.
37）丹野恭夫ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：369-374.
38）高橋　淳ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：576-588.
39）畑山尚生ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：991-998.
40）新川　敦ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：1046-1055.
41）島田純一郎ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：1056-1063.
42）深水浩三ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：1067-1073.
43）西村一男ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：784-787.
44）岸　幹雄ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：802-812.
45）富澤尊儀ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：1079-1088.

46）小原達也ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：918-922.
47）張　南薫ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：923-940.
48）山本英雄ほか：歯薬療法．1993；12（1）：39-45.
49）植田省吾ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：859-867.
50）Johnson CA，et al.：Antimicrob Agents Chemother．1993；37（12）：2650-2655.（PMID：8109931）
51）Borin MT，et al.：J Clin Pharmacol．1992；32（11）：1038-1044.（PMID：1474165）
52）Hoffler D，et al.：Infection．1990；18（3）：157-162.（PMID：2365467）
53）鈴木幹三ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：492-501.
54）Saathoff N，et al.：Antimicrob Agents Chemother．1992；36（4）：796-800.（PMID：1354432）
55）Hughes GS，et al.：Clin Pharmacol Ther．1989；46（6）：674-685.（PMID：2557183）
56）小林晋作ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：329-349.
57）平野光一ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：274-279.
58）松沼尚史ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：280-299.
59）森　昌弘ほか：Chemotherapy．1988；36（S-1）：300-319.
60）棚瀬久雄ほか：Chemotherapy．1988；36（S-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

第十八改正日本薬局方解説書 2021，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 ヵ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, 2020 年 11 月）	**INDICATIONS AND USAGE** 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. **Recommended dosages, durations of therapy, and applicable patient populations vary among these infections. Please see DOSAGE AND ADMINISTRATION for specific recommendations.** **Acute otitis media** caused by *Streptococcus pneumoniae* (excluding penicillin-resistant strains), *Streptococcus pyogenes, Haemophilus influenzae* (including beta-lactamase-producing strains), or *Moraxella (Branhamella) catarrhalis* (including beta-lactamase-producing strains). **Pharyngitis and/or tonsillitis** caused by *Streptococcus pyogenes*. **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. **Community-acquired pneumonia** caused by *S. pneumoniae* or *H. influenzae* (including beta-lactamase-producing strains). **Acute bacterial exacerbation of chronic bronchitis** caused by *S. pneumoniae, H. influenzae* (non-beta-lactamase-producing strains only), or *M. catarrhalis*. 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 *H. influenzae*. **Acute, uncomplicated urethral and cervical gonorrhea** caused by *Neisseria gonorrhoeae* (including penicillinase-producing strains). **Acute, uncomplicated ano-rectal infections in women** due to *Neisseria gonorrhoeae* (including penicillinase-producing strains). **NOTE:** The efficacy of cefpodoxime in treating male patients with rectal 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*.

<table>
<tr><th>出典</th><th>記載内容</th></tr>
<tr><td>米国の添付文書
（CEFPODOXIME PROXETIL-
cefpodoxime proxetil tablet, film coated,
Sandoz Inc,
2020 年 11 月）（つづき）</td><td>

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 and other antibacterial drugs, Cefpodoxime proxetil tablets 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)

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

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.

</td></tr>
</table>

出典	記載内容
米国の添付文書（CEFPODOXIME PROXETIL-cefpodoxime proxetil tablet, film coated, Sandoz Inc, 2020 年 11 月）（つづき）	Males：(mL/min) $72 \times \frac{\text{Weight (kg)} \times (140 - \text{age})}{\text{serum creatinine (mg/100 mL)}}$ 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。

4. 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

5. 効能又は効果に関連する注意

＜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＞

「抗微生物薬適正使用の手引き」[4] 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。

6. 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。

2. 海外における臨床支援情報

（1）妊婦に関する海外情報

妊婦、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,2020 年 11 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 always predictive of human response, this drug should be used during pregnancy only if clearly needed. **Labor and Delivery** Cefpodoxime proxetil has not been studied for use during labor and delivery. Treatment should only be given if clearly needed. **Nursing Mothers** 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.

なお、本邦における本剤の使用上の注意「9.5 妊婦」、「9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりである。

9.5 妊婦
妊婦又は妊娠している可能性のある女性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。
9.6 授乳婦
治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。ヒト乳汁中へ移行する[32)]。

（2）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, 2020 年 11 月）	**PRECAUTIONS** **Pediatric Use** Safety and efficacy in infants less than 2 months of age have not been established.

なお、本邦における本剤の使用上の注意「9.7 小児等」の項の記載は以下のとおりである。

9.7 小児等
小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

ⅩⅢ. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

（1）粉砕

個別に照会すること（問い合わせ先は、弊社医薬情報担当者又は下記参照）

（2）崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

個別に照会すること（問い合わせ先は、弊社医薬情報担当者又は下記参照）

問い合わせ窓口：表紙の問い合わせ窓口を参照

2. その他の関連資料

専用アプリ「添文ナビ」でGS1バーコードを読み取ることで、最新の電子添文等を閲覧できます。

(01)14987246730010

（バナン錠100mg）

グラクソ・スミスクライン株式会社

〒107-0052　東京都港区赤坂１－８－１

BAXTIF01-D2211D

改訂年月2022年11月