

2022年9月改訂（第8版）

日本標準商品分類番号

876112

## 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

抗生物質製剤  
リンコマイシン塩酸塩水和物カプセル

**リンコシン<sup>®</sup>カプセル 250mg**

Lincocin<sup>®</sup> Capsules 250mg

剤形	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	1カプセル中、日局 リンコマイシン塩酸塩水和物250mg（力価）含有
一般名	和名：リンコマイシン塩酸塩水和物（JAN） 洋名：Lincomycin Hydrochloride Hydrate（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：2007年9月14日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2007年12月21日（販売名変更による） 販売開始年月日：1965年12月
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売：ファイザー株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ファイザー株式会社 製品情報センター 学術情報ダイヤル 0120-664-467 FAX 03-3379-3053 医療用製品情報 <a href="https://www.pfizermedicalinformation.jp">https://www.pfizermedicalinformation.jp</a>

本IFは2022年7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（<https://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

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>
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 .....	1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 .....	2
6. RMPの概要 .....	2
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>3</b>
1. 販売名 .....	3
2. 一般名 .....	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 .....	4
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	4
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>5</b>
1. 物理化学的性質 .....	5
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	5
3. 有効成分の確認試験法、定量法 .....	6
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>7</b>
1. 剤形 .....	7
2. 製剤の組成 .....	8
3. 添付溶解液の組成及び容量 .....	8
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
11. 別途提供される資材類 .....	9
12. その他 .....	9
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>10</b>
1. 効能又は効果 .....	10
2. 効能又は効果に関連する注意 .....	10
3. 用法及び用量 .....	11
4. 用法及び用量に関連する注意 .....	11
5. 臨床成績 .....	12
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>15</b>
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 .....	15
2. 薬理作用 .....	15
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>19</b>
1. 血中濃度の推移 .....	19
2. 薬物速度論的パラメータ .....	20
3. 母集団（ポピュレーション）解析 .....	20
4. 吸収 .....	20
5. 分布 .....	21

6. 代謝	22
7. 排泄	22
8. トランスポーターに関する情報	22
9. 透析等による除去率	23
10. 特定の背景を有する患者	23
11. その他	23
<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	<b>24</b>
1. 警告内容とその理由	24
2. 禁忌内容とその理由	24
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	24
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	24
5. 重要な基本的注意とその理由	24
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	25
7. 相互作用	26
8. 副作用	27
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	28
10. 過量投与	28
11. 適用上の注意	28
12. その他の注意	29
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>	<b>30</b>
1. 薬理試験	30
2. 毒性試験	31
<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	<b>34</b>
1. 規制区分	34
2. 有効期間	34
3. 包装状態での貯法	34
4. 取扱い上の注意	34
5. 患者向け資材	34
6. 同一成分・同効薬	34
7. 国際誕生年月日	34
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	35
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	35
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	35
11. 再審査期間	35
12. 投薬期間制限に関する情報	35
13. 各種コード	35
14. 保険給付上の注意	35
<b>XI. 文献</b>	<b>36</b>
1. 引用文献	36
2. その他の参考文献	36
<b>XII. 参考資料</b>	<b>37</b>
1. 主な外国での発売状況	37
2. 海外における臨床支援情報	37
<b>XIII. 備考</b>	<b>38</b>
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	38
2. その他の関連資料	38

---

## I. 概要に関する項目

---

### 1. 開発の経緯

リンコマイシンは米国ネブラスカ州、Lincoln の近くの土壌から分離された *Streptomyces* の一種、*Streptomyces lincolnensis* var. *lincoinesis* によって産生された抗生物質である。リンコマイシンは *in vitro* でブドウ球菌、レンサ球菌、肺炎球菌に対して抗菌力があること、本剤に対する耐性は徐々に出現すること、そして他の有用な抗生物質との間に交叉耐性がないことが研究により示された。

*in vivo* では、体液によって不活性化されず、動物の実験的感染症に対し有効であった。また、既知の抗生物質と比較し、独自の構造を持ち、感受性細菌の蛋白合成を阻害することによって作用を発現する。

2007年9月に、リンコシンカプセルからリンコシンカプセル 250mg に販売名を変更した。

### 2. 製品の治療学的特性

(1) 抗菌作用：ブドウ球菌、レンサ球菌、肺炎球菌等のグラム陽性菌に対して強い抗菌作用を示す (*in vitro*)。

(「VI-2. (1) 作用部位・作用機序」の項参照)

(2) リンコマイシンの誘導体であるクリンダマイシンは抗菌力の増大、腸管からの吸収率の増大、及び動物における毒性の低下を示した。

(「VII-4. 吸収」「IX. 非臨床試験に関する項目」の項参照)

(3) 重大な副作用として、ショック、偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎、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)、剥脱性皮膚炎、無顆粒球症、再生不良性貧血、汎血球減少症、血小板減少性紫斑病が報告されている。

(「VIII-8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照)

### 3. 製品の製剤学的特性

該当しない

### 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
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

リンコシンカプセル 250mg

(2) 洋名

Lincocin Capsules 250mg

(3) 名称の由来

産生土壌の Nebraska 州、Lincoln に由来した抗生物質である。

### 2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

リンコマイシン塩酸塩水和物 (JAN)

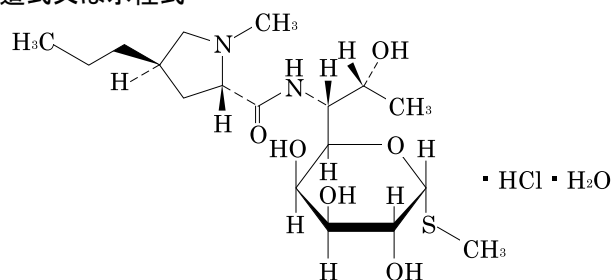
(2) 洋名 (命名法)

Lincomycin Hydrochloride Hydrate (JAN)

(3) ステム (stem)

-mycin : *Streptomyces* 属より産生される抗生物質

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式 : C<sub>18</sub>H<sub>34</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>S · HCl · H<sub>2</sub>O

分子量 : 461.01



## 5. 化学名（命名法）又は本質

### (1) IUPAC 式

Methyl 6,8-dideoxy-6-[(2*S*,4*R*)-1-methyl-4-propylpyrrolidine-2-carboxamido]-1-thio-D-*erythro*- $\alpha$ -D-galactooctopyranoside monohydrochloride monohydrate (IUPAC)

### (2) Merck 式

Methyl 6,8-dideoxy-6-(1-methyl-trans-4-propyl-2-pyrrolidinecarboxamido)-1-thio-D-*erythro*-D-galactooctopyranoside, hydrochloride

## 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：LCM

---

### III. 有効成分に関する項目

---

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

水又はメタノールに溶けやすく、エタノール (95) にやや溶けにくく、アセトニトリルに極めて溶けにくい。

##### (3) 吸湿性

参考：本品は 70°C で乾燥した結晶状態では最低 6 ヶ月は安定である。温度 70°C で 0.1N 塩酸中におけるリンコマイシン塩酸塩水和物の半減期は約 40 時間である。

##### (4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

145~147°C (分解)

##### (5) 酸塩基解離定数

pKa : 7.6 (free base)

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

比施光度  $[\alpha]_D^{25}$  : +137°

施光度  $[\alpha]_D^{20}$  : +135~+150° (0.5g、水、25mL、100mm)

pH : 本品 0.10g を水 1mL に溶かした液の pH は 3.0~5.5 である

水分 : 3.0~6.0% (0.5g、容量滴定法、直接滴定)

浸透圧比 : 約 5 (生理食塩液対比)

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

本品は著しく安定で、乾燥状態では 70°C に 6 ヶ月保存して力価の低下なく、300~1000  $\mu$ g/mL の水溶液は室温 2 年間又は 37°C に 1 週間保存し、力価の低下なく、血清の添加の影響も認めない。

### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

#### 確認試験法

日局「リンコマイシン塩酸塩水和物」の確認試験による。

- (1) 本品につき、赤外吸収スペクトル測定法のペースト法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトル又はリンコマイシン塩酸塩標準品のスペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。
- (2) 本品の水溶液（1→100）は塩化物の定性反応を呈する。

#### 定量法

日局「リンコマイシン塩酸塩水和物」の定量法による。

本品及びリンコマイシン塩酸塩標準品約 10mg（力価）に対する量を精密に量り、それぞれを移動相に溶かし、正確に 10mL とし、試料溶液及び標準溶液とする。試料溶液及び標準溶液 20  $\mu$ L ずつを正確にとり、次の条件で液体クロマトグラフィーにより試験を行い、それぞれの液のリンコマイシンのピーク面積  $A_T$  及び  $A_S$  を測定する。

$$\text{リンコマイシン (C}_{18}\text{H}_{34}\text{N}_2\text{O}_6\text{S) の量 } [\mu\text{g (力価)}] = W_S \times \frac{A_T}{A_S} \times 1000$$

$W_S$  : リンコマイシン塩酸塩水和物標準品の秤取量 [mg (力価)]

#### 試験条件

検出器：紫外吸光光度計（測定波長：210nm）

カラム：内径 4mm、長さ 25cm のステンレス管に 5  $\mu$ m の液体クロマトグラフィー用オクチルシリル化シリカゲルを充てんする。

カラム温度：46°C 付近の一定温度

移動相：リン酸 13.5mL に水 1000mL を加え、アンモニア試液を加えて pH を 6.0 に調節する。この液 780mL にアセトニトリル 150mL 及びメタノール 150mL を加える。

流量：リンコマイシンの保持時間が 9 分になるように調整する。

#### システム適合性

システムの性能：標準溶液 20  $\mu$ L につき、上記の条件で操作するとき、リンコマイシンのピークの理論段数及びシンメトリー係数は、それぞれ 4000 段以上、1.3 以下である。

システムの再現性：標準溶液 20  $\mu$ L につき、上記の条件で試験を 6 回繰り返すとき、リンコマイシンのピーク面積の相対標準偏差は 2.0% 以下である。

---

## IV. 製剤に関する項目

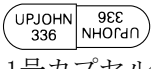
---

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

硬カプセル剤

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	含有	外形	識別コード	色調等	重量
リンコシン カプセル 250mg	250mg (力価)	 1号カプセル	UPJOHN 336	頭部：濃青色 不透明 胴部：淡青色 不透明	513～519mg

#### (3) 識別コード

リンコシンカプセル 250mg：カプセル頭部・胴部 UPJOHN336

#### (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	リンコシンカプセル 250mg
有効成分	1 カプセル中 日局 リンコマイシン塩酸塩水和物 250mg（力価）
添加剤	ステアリン酸マグネシウム タルク 乳糖水和物 （カプセル本体） 亜硫酸水素ナトリウム 酸化チタン ラウリル硫酸ナトリウム 青色 1 号 赤色 3 号

### (2) 電解質等の濃度

該当しない

### (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

力価は塩基の重量表示による。

## 5. 混入する可能性のある夾雑物

特になし

## 6. 製剤の各種条件下における安定性

温度：25℃で保存した場合、24 ヶ月後の力価残存率は約 90%を示す。

湿度：該当資料なし

光：該当資料なし

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（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性

該当資料なし

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

該当資料なし

(2) 包装

リンコシンカプセル 250mg : 100 カプセル [10 カプセル (PTP) ×10]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

該当資料なし

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. 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

#### 4. 効能又は効果

##### 〈適応菌種〉

リンコマイシンに感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、赤痢菌

##### 〈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、乳腺炎、骨髄炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、感染性腸炎、角膜炎（角膜潰瘍を含む）、中耳炎、副鼻腔炎、猩紅熱

### 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、急性気管支炎、感染性腸炎、中耳炎、副鼻腔炎〉

5.1 「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。

##### 〈効能共通〉

5.2 本剤の投与により偽膜性大腸炎があらわれることがあるため、次の場合には本剤を投与しないことが望ましい。 [8.2、11.1.2 参照]

- ・軽微な感染症
- ・他に有効な使用薬剤がある場合

##### 〈解説〉

国際的に脅威となる感染症対策の強化に関する基本計画（平成28年2月9日、国際的に脅威となる感染症対策関係閣僚会議）により策定された薬剤耐性（AMR）対策アクションプラン（2016-2020）に基づき、抗微生物薬の適正使用の推進を目的とした「抗微生物薬適正使用の手引き第一版」が厚生労働省健康局結核感染症課より平成29年6月1日に公表された。また、令和元年12月5日に「抗微生物薬適正使用の手引き第二版」<sup>1)</sup>が公表され、小児の中耳炎治療に関する内容が追加されたことから、使用上の注意改訂に関する厚生労働省医薬・生活衛生局医薬安全対策課長通知が発出された。これらを受け、両手引きに基づき、抗微生物薬の適正使用がなされるよう注意喚起するため、「効能又は効果に関連する注意」として設定した。

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

##### 6. 用法及び用量

リンコマイシン塩酸塩水和物として通常成人は、1日1.5～2g（力価）を3～4回に分割経口投与する。小児には1日体重1kgあたり20～30mg（力価）を3～4回に分割経口投与する。  
なお、年齢、症状により適宜増減する。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 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

忍容性試験

#### 1) 単回投与

該当資料なし

#### 2) 反復投与

該当資料なし

### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

### (4) 検証的試験

#### 1) 有効性検証試験

該当資料なし

#### 2) 安全性試験

該当資料なし

### (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

該当資料なし

#### 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

該当資料なし

(7) その他

本項に示す成績は承認時の適応症・適応菌種に関するものであり、平成16年度の抗菌剤再評価結果を踏まえたものではありません。

《臨床成績》

臨床治験 1412 例、効果判定可能 1408 例中、1265 例に有効と判定された。

●有効率

浅在性化膿性疾病群有効率	383/410	(93.4%)
深在性化膿性疾病群有効率	76/99	(76.8%)
呼吸器感染症有効率	222/267	(83.2%)
総計	1265/1408	(90.1%)

疾患名	有効率	菌検出
	(有効例/総症例)	有効率 (有効例/総症例)
急性・亜急性細菌性心内膜炎	(1/2)	(1/1)
敗血症	76.9% (10/13)	(1/2)
〃 + 骨髄炎	(1/1)	(1/1)
〃 + 肺炎	(1/1)	(1/1)
細菌性心内膜炎 + P. D. A.	(1/1)	(1/1)
(a) 浅在性化膿性疾患群		
膿痂疹	(6/6)	(3/3)
フルンケル	96.1% (74/77)	93.2% (41/44)
カルブンケル	(7/7)	(4/4)
膿瘍	66.7% (12/18)	66.7% (10/15)
フレグモーネ	96.3% (26/27)	94.1% (16/17)
咽喉頭炎	87.3% (48/55)	97.6% (41/42)
扁桃炎	97.2% (105/108)	89.5% (51/57)
麦粒腫	(8/8)	(8/8)
アンギーナ	(3/3)	
瘰癧	93.3% (28/30)	89.5% (17/19)
癰腫症	85.7% (18/21)	(6/9)
面疔	(3/4)	(3/3)
眼瞼膿瘍	(3/3)	(3/3)
耳癰	95% (19/21)	92.3% (12/13)
扁桃周囲膿瘍	(2/2)	(2/2)
腺窩性アンギーナ	100% (16/16)	(9/9)
化膿性湿疹	(2/2)	(2/2)
丹毒	(3/3)	
(b) 深在性化膿性疾病群		
乳腺炎	92.3% (24/26)	(2/3)
リンパ節(管)炎	84.6% (22/26)	(5/5)
髄膜炎	87.1% (27/31)	(4/4)
関節炎	(3/5)	

疾患名	有効率 (有効例/総症例)	菌検出
		有効率 (有効例/総症例)
急・慢性気管支炎	73.3% (66/90)	71.9% (23/32)
気管支肺炎及び肺炎	93.9% (108/115)	98.2% (53/54)
気管支拡張症	(9/10)	(9/10)
肺化膿症 (肺膿瘍)	81.1% (30/37)	79.4% (27/34)
アンギーナ気管支炎	(5/5)	
膿胸	(3/9)	(2/6)
// +気管支拡張症	(1/1)	(1/1)
胆嚢炎	(9/10)	(4/4)
胆道炎	(6/8)	(6/8)
虫垂炎	(1/1)	(1/1)
細菌性赤痢	91.3% (136/149)	91.3% (136/149)
腎盂腎炎	72.7% (8/11)	72.7% (8/11)
膀胱炎	93.8% (15/16)	93.3% (14/15)
子宮付属器炎	90.0% (18/20)	
産褥感染症	(5/5)	
髄膜炎	(1/1)	
猩紅熱	(10/10)	(10/10)
匍行性角膜潰瘍	(2/2)	
穿孔性角膜外傷	(4/4)	
中耳炎	88.4% (99/112)	84.1% (37/44)
副鼻腔炎	88.5% (23/26)	(3/4)
顎骨骨膜炎	(6/7)	(3/4)
智歯周囲炎	88.7% (55/62)	(1/1)
急性顎炎	98.1% (51/52)	
歯槽骨炎	97.7% (85/87)	
歯槽骨膜炎	95.5% (21/22)	
上顎洞炎	75.0% (15/20)	(4/4)

## 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

◇リンコマイシン系抗生物質

(クリンダマイシン塩酸塩、クリンダマイシンリン酸エステル)

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) 抗菌作用<sup>2)</sup>

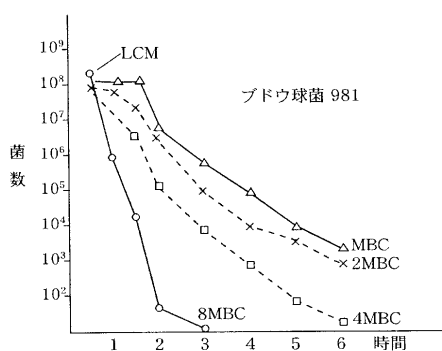
ブドウ球菌、レンサ球菌、肺炎球菌等のグラム陽性菌に対して強い抗菌作用を示す(*in vitro*)。

##### 2) 作用機序<sup>3)</sup>

細菌のリボゾーム 50S Subunit に作用し、ペプチド転移酵素反応を阻止し蛋白合成を阻害する。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

◆リンコマイシンに対して、MIC 0.78  $\mu$ g/mL の黄色ブドウ球菌を使用し MIC の 4 倍の濃度 3.12  $\mu$ g/mL で作用されると 99%以上黄色ブドウ球菌が死滅することを示している。<sup>2)、4)</sup>



リンコマイシンの濃度を MBC、2MBC、4MBC、8MBC と増加させるとその殺菌力は強力に増加する。

1) 嫌気性球菌<sup>5)</sup>

*Peptococcus*, *Peptostreptococcus*, *Veillonella* のほとんどの細菌に、LCMは0.19  $\mu$ g/mL以下のMICを示した。マクロライド系抗生物質と比較すると、2~8倍強い抗菌力を示した。

菌 株	MIC ( $\mu$ g/mL)					
	CLDM	LCM	LM	EM	JM	SPM
<i>Peptococcus prevotii</i> ATCC 9321	0.19	0.19	1.56	0.78	1.56	3.13
<i>Peptococcus aerogenes</i> ATCC 14963	0.19	0.19	0.78	0.78	0.78	6.25
<i>Peptococcus variabilis</i> 14955	0.39	0.78	3.13	6.25	6.25	6.25
<i>Peptococcus variabilis</i> PL-7	0.19	0.19	1.56	3.13	1.56	3.13
<i>Peptococcus anaerobius</i> B-40	100	0.19	100	100	6.25	100
<i>Peptococcus asaccharolyticus</i> Z-1003	0.19	0.19	3.13	3.13	0.78	6.25
<i>Peptostreptococcus anaerobius</i> B-38	0.19	0.19	1.56	0.78	1.56	0.78
<i>Peptostreptococcus putridus</i> PL-9-2	0.19	0.19	0.19	0.78	1.56	0.78
Group-1 NCTC 9803	0.19	0.19	1.56	1.56	1.56	0.19
Group-2 NCTC 9804	0.19	0.19	0.78	0.78	6.25	6.25
Group-7 NCTC 9808	0.19	0.19	3.13	0.78	1.56	6.25
Group-8 NCTC 9810	0.19	0.19	1.56	0.78	0.78	12.5
Group-9 NCTC 9811	0.19	0.19	0.39	0.39	0.19	0.19
<i>Veillonella parvula</i> ATCC 10790	0.19	0.19	12.5	3.13	12.5	100

LM : Leucomycin. EM : Erythromycin. JM : Josamycin. SPM : Spiramycin

2) 嫌気性グラム陰性桿菌<sup>5)</sup>

LCMは、マクロライド系抗生物質と同様に *Sphaerophorus* sp. H-17には抗菌作用を示さないが、これを除く菌種には12.5  $\mu$ g/mL以下のMICを示した。

菌 株	MIC ( $\mu$ g/mL)					
	CLDM	LCM	LM	EM	JM	SPM
<i>Bacteroides fragilis</i> H-7	6.25	0.19	1.56	0.78	0.19	25
<i>Bacteroides fragilis</i> H-6	0.19	3.13	0.78	1.56	1.56	25
<i>Bacteroides convexus</i> H-10	0.19	6.25	0.78	1.56	0.78	12.5
<i>Bacteroides convexus</i> H-8	0.19	6.25	0.78	3.13	3.13	50
<i>Bacteroides thetaiotaomicron</i> H-5	0.39	6.25	0.78	3.13	0.19	6.25
<i>Bacteroides thetaiotaomicron</i> W-3	0.78	3.13	0.78	1.56	0.39	6.25
<i>Bacteroides distasonis</i> W-7	3.13	12.5	1.56	3.13	0.78	12.5
<i>Bacteroides distasonis</i> W-8	3.13	12.5	100	100	0.39	100
<i>Bacteroides vulgatus</i> W-5	0.19	3.13	0.19	0.78	0.19	3.13
<i>Sphaerophorus necrophorus</i> H-12	0.19	0.78	25	25	50	25
<i>Sphaerophorus</i> sp. H-17	100	100	100	100	100	100
<i>Sphaerophorus</i> sp. H-18	50	12.5	100	100	100	100

LM : Leucomycin. EM : Erythromycin. JM : Josamycin. SPM : Spiramycin

## 好気性菌の試験管内感受性値

	通常の最小発育阻止濃度 ( $\mu$ g/mL)	
	LCM	CLDM
グラム陽性菌		
<i>Staphylococcus aureus</i>	0.2~3.1	0.04~0.4
<i>Staphylococcus epidermidis</i>	0.8~1.5	0.1~0.2
<i>Streptococcus pneumoniae</i>	0.01~0.5	0.01~0.06
<i>Streptococcus pyogenes</i>	0.04~0.5	0.02~0.2
<i>Streptococcus viridans</i>	0.02~0.5	0.01~0.06
<i>Streptococcus faecalis</i>	25~>100	12.5~>100
<i>Corynebacterium diphtheriae</i>	0.4	$\leq$ 0.2
<i>Nocardia</i>	3.1~>100	0.78~25
グラム陰性菌		
<i>Neisseria gonorrhoeae</i>	0.5~>100	0.01~6.3
<i>Neisseria meningitidis</i>	>50	5~25
<i>Haemophilus influenzae</i>	3~50	0.12~50
<i>Escherichia, Klebsiella,</i> <i>Enterobacter, Serratia,</i> <i>Proteus, Pseudomonas</i>	>100	25~>100
<i>Salmonella</i>	>100	12~25
<i>Shigella</i>	>100	25
グラム陰性非芽胞形成菌		
<i>Bacteroides fragilis</i>	$\leq$ 0.1~25	$\leq$ 0.1~3.1
<i>Bacteroides melaninogenicus</i>	$\leq$ 0.1~0.4	$\leq$ 0.1~0.2
<i>Fusobacterium</i>	$\leq$ 0.1~6.2	$\leq$ 0.1~1.6
グラム陽性非芽胞形成菌		
<i>Actinomyces</i>	0.03~1.0	0.03~0.25
<i>Bifidobacterium</i>	$\leq$ 0.1~1.6	$\leq$ 0.1
<i>Eubacterium</i>	$\leq$ 0.1~3.1	$\leq$ 0.1~0.8
<i>Propionibacterium</i>	$\leq$ 0.1~1.6	$\leq$ 0.1~0.2
芽胞形成菌		
<i>Clostridium perfringens</i>	$\leq$ 0.1~12.5	$\leq$ 0.1~3.1
<i>Clostridium species</i>	$\leq$ 0.1~12.5	$\leq$ 0.1~3.1
球菌		
<i>Peptococcus</i>	$\leq$ 0.1~1.6	$\leq$ 0.1~1.6
<i>Peptostreptococcus</i>	$\leq$ 0.1~1.6	$\leq$ 0.1~0.8
<i>Veillonella</i>	$\leq$ 0.1~6.2	$\leq$ 0.1

3) クロストリジウムに対する抗菌作用<sup>5)</sup>

LCM は *C. sticklandi* に 25  $\mu$ g/mL、*C. sporogenes* に 50  $\mu$ g/mL し、*C. perfringens*、*C. tetani*、*C. novyi*、*C. septicum* 等には 6.25  $\mu$ g/mL 以下の MIC を示した。

菌株	MIC ( $\mu$ g/mL)					
	CLDM	LCM	LM	EM	JM	SPM
<i>Clostridium perfringens</i>	0.19	0.19	1.56	3.13	3.13	6.25
<i>Clostridium tetani</i>	0.19	0.19	0.19	0.78	0.19	1.56
<i>Clostridium septicum</i>	50	6.25	100	100	100	100
<i>Clostridium novyi</i>	0.19	0.19	0.19	0.78	0.19	1.56
<i>Clostridium sporogenes</i>	6.25	50	0.78	0.78	0.78	6.25
<i>Clostridium histolyticum</i>	0.19	0.19	0.19	0.78	0.19	0.78
<i>Clostridium bifermentans</i>	0.19	0.19	0.39	100	0.78	100
<i>Clostridium tetanomorphum</i>	0.19	0.19	0.19	0.39	0.19	3.13
<i>Clostridium butyricum</i>	1.56	1.56	1.56	100	1.56	100
<i>Clostridium cohlearium</i>	0.19	0.19	0.19	0.19	0.19	0.19
<i>Clostridium sticklandi</i>	50	25	0.78	0.39	0.78	0.78

LM : Leucomycin. EM : Erythromycin. JM : Josamycin. SPM : Spiramycin

4) マイコプラズマに対する抗菌力<sup>5)</sup>

*Mycoplasma pneumoniae* の保存株 2 株と新鮮分離株 11 株の CLDM 及び LCM に対する *in vitro* における MIC を他の薬剤 (Tetracycline、Streptomycin、Kanamycin、Erythromycin) と比較検討した。その結果、CLDM の MIC は、0.8~3.12  $\mu$ g/mL であり、LCM の 1.56~6.25  $\mu$ g/mL に比較し、2~4 倍の抗マイコプラズマ作用を示した。また、殺マイコプラズマ作用濃度 (MCC) を検討した成績では CLDM は約 2.8  $\mu$ g/mL で、Tetracycline よりも低濃度であり Streptomycin と同程度であった。LCM の MCC は約 5.6  $\mu$ g/mL で、CLDM の 2 倍の濃度であった。

一方、CLDM、LCM とともに Erythromycin 耐性株に作用せず、あきらかな交叉耐性がみられた。次に MCC/MIC の比でみると CLDM では 2.2、LCM では 1.9 であり、抗マイコプラズマ作用の作用様式を考えると、この比の値の小さい Erythromycin (1.5)、Kanamycin (1.53) とともに殺マイコプラズマ的に作用すると考えられた。

(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

---

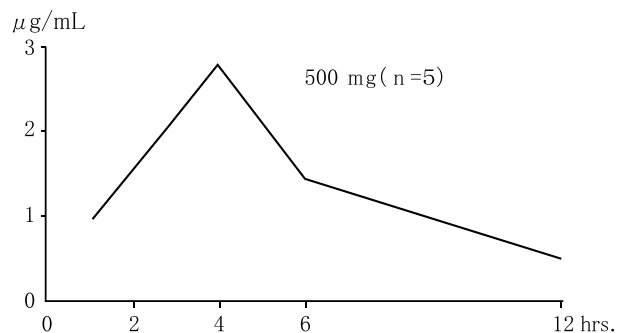
### 1. 血中濃度の推移

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>4)</sup>

健康成人 5 名に 500mg (力価) を 1 回経口投与した時の血中濃度は下図のとおりである。内服 4 時間後には平均  $2.82 \mu\text{g/mL}$  の最高血中濃度となり、6 時間後にもなお平均  $1.4 \mu\text{g/mL}$  の血中濃度を示す。



#### (3) 中毒域

該当資料なし

#### (4) 食事・併用薬の影響

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

### (3) 消失速度定数

該当資料なし

### (4) クリアランス

該当資料なし

### (5) 分布容積

0.41～0.57L/kg

### (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

本剤の消化管、筋肉内よりの吸収は良好である。経口投与時、20～35%が吸収される。

## 5. 分布

### (1) 血液－脳関門通過性

通過しない

### (2) 血液－胎盤関門通過性

通過しない

### (3) 乳汁への移行性<sup>6)</sup>

急性化膿性乳腺炎患者 2 例の Lincocin 500mg 内服 1、3、6 時間後の乳汁中移行量を測定した。第 1 例は 1～3 時間値 0.6～0.7  $\mu\text{g/mL}$ 、6 時間後に 1.2  $\mu\text{g/mL}$  でピークを示した。第 2 例では、1 時間値 3.2  $\mu\text{g/mL}$  でピークを示し、3～6 時間後に 1.4～0.7  $\mu\text{g/mL}$  と下降した。

### (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<sup>7)</sup>

<参考>マウスにおけるデータ

体重 20g 前後の健常マウスに 50mg/kg 筋注後、1 時間、3 時間、6 時間に断頭し、虚血したのち、尾動脈から生理食塩水を灌流して、血液を洗浄し、肺、肝、腎、脾、脳、心、筋の各臓器を摘出して、その重量の 2～4 倍量の生理食塩水を加えてホモジナイズし、その上清を被検液とした。その成績は、表のとおり肺が最も高く（1 時間値 2.16  $\mu\text{g/g}$ ）、ついで腎、脾で、肝には比較的 low 濃度（1 時間値 1.32  $\mu\text{g/g}$ ）、さらに心、筋の順であった。脳では 1 時間後にも証明できず、6 時間後ではすべての臓器で証明できなかった。

臓器内濃度（マウス 50mg/kg 筋注 3 匹平均）

	1 時間 ( $\mu\text{g/g}$ )	3 時間 ( $\mu\text{g/g}$ )	6 時間 ( $\mu\text{g/g}$ )
肺	2.16	1.29	0
腎	1.90	0.70	0
脾	1.76	0.68	0
肝	1.32	0.80	0
心	1.15	0	0
筋	1.06	0	0
脳	0	0	0

### 胆汁中濃度<sup>7)</sup>

肝機能障害の認められなかった胆石症疾患 2 例に胆嚢摘出後、総胆管排液法を行い、術後 7 日目前後に Lincocin 600mg 筋注し、排液管から胆汁を採取して測定した。その結果 30 分後にはすでに高濃度（16.0～11.3  $\mu\text{g/mL}$ ）の排泄がみられ、1 時間で最高値（19.0～11.7  $\mu\text{g/mL}$ ）に達し、その後 6 時間でもなお高い濃度（10.5～8.4  $\mu\text{g/mL}$ ）を示した。この成績は Lincocin は血中濃度より胆汁中濃度のほうが高い値を示した。

(6) 血漿蛋白結合率

93.6%

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(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

該当資料なし

7. 排泄

(1) 排泄部位<sup>8)</sup>

本剤の排泄は経口投与後、主に胆汁に排泄され、尿中には 24 時間以内に 3～5%が排泄されるにすぎない。しかし、静脈内投与後は、約 15～50%が尿中に排泄される。

(2) 排泄率<sup>8)</sup>

成人に 500mg（力価）を経口投与した時の 7 時間までの尿中回収率は平均 8.9%である。

(3) 排泄速度

該当資料なし

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

除去されない

### (2) 血液透析

除去されない

### (3) 直接血液灌流

該当資料なし

## 10. 特定の背景を有する患者

### ●腎不全患者における検討

Lincomycinは同系のclindamycinとは異なり、高度腎不全患者では $T_{1/2}$ がかなり延長するので、腎機能に応じて使用法を調整する必要がある。Ccr 10mL/min.以下では1回常用量を12～24時間間隔で投与することが一般的である。

腎不全における化学療法剤の薬動学的特徴<sup>9)</sup>

化学療法剤	血中半減期 (時間)			HD除去率 (%)	HD後の追加調整量 (mg)
	正常	末期腎不全	HD		
erythromycin	1.5	5.0		0	0.0
lincomycin	4.5	12.0		0	0.0
clindamycin	3.0	2.9		0	0.0

HD：血液透析

## 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）

2.1 本剤の成分又はクリンダマイシンに対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 エリスロマイシンを投与中の患者 [10.1 参照]

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V-2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

### 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 本剤の投与により、まれに発熱、腹痛、白血球増多、粘液・血液便を伴う激症下痢を主症状とする重篤な大腸炎で、内視鏡検査により偽膜斑等の形成をみる偽膜性大腸炎があらわれることがある。発症後直ちに投与を中止しなければ電解質失調、低蛋白血症等に陥り、特に高齢者及び衰弱患者では予後不良となることがある。

したがって、投与患者に対し、投与中又は投与後 2～3 週間までに腹痛、頻回な下痢があらわれた場合には服用を中止し、直ちに医師に通知するよう注意すること。 [5.2、9.1.1、9.8.2、11.1.2 参照]

8.3 無顆粒球症、再生不良性貧血、汎血球減少症、血小板減少性紫斑病、赤血球減少、白血球減少、顆粒球減少、好中球減少、血小板減少、好酸球増多があらわれることがあるので、血液検査等の観察を十分に行うこと。 [11.1.4、11.2 参照]

8.4 黄疸、AST、ALT の上昇があらわれることがあるので、定期的に肝機能検査を行うなど観察を十分に行うこと。 [11.2 参照]

8.5 窒素血症、乏尿、蛋白尿があらわれることがあるので、定期的に腎機能検査を行うなど観察を十分に行うこと。 [11.2 参照]

<解説>

- 8.1 厚生労働省薬務局安全課長通知薬案第5号（1993年1月19日付）により記載した。厚生労働省が実施した抗生物質感受性状況調査により MRSA 等の分離頻度が高いことが認められ、抗生物質全般について改めて適正使用を図ることになった。

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. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 衰弱患者、大腸炎等の既往歴のある患者

偽膜性大腸炎等の重篤な大腸炎があらわれるおそれがある。 [8.2、11.1.2 参照]

9.1.2 気管支喘息、著明なアレルギーの既往歴のある患者

重症の即時型アレルギー反応があらわれるおそれがある。

9.1.3 食道通過障害のある患者

食道に停留し、崩壊すると、食道潰瘍を起こすおそれがある。

9.1.4 重症筋無力症の患者

本剤は筋への直接作用により収縮を抑制するので、症状が悪化するおそれがある。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

腎排泄は本剤の主排泄経路ではないが、消失半減期が延長するおそれがある。

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 肝障害又は肝障害の既往歴のある患者

胆汁排泄のため、消失半減期が延長するおそれがある。また、肝障害があらわれるおそれがある。

(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投与しないことが望ましい。

(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。ヒト母乳中へ移行する。

(7) 小児等

9.7 小児等

〈低出生体重児、新生児〉

臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

9.8.1 一般に生理機能が低下している。

9.8.2 偽膜性大腸炎等の重篤な大腸炎があらわれるおそれがある。 [8.2、11.1.2 参照]

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

10.1 併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
エリスロマイシン (エリスロシン等) [2.2 参照]	併用しても本剤の効果があら われないと考えられる。	細菌のリボゾーム 50S Subunit への親和性が本剤より高い。

(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
末梢性筋弛緩剤 スキサメトニウム ツボクラリン等	筋弛緩作用が増強される。	本剤は神経筋遮断作用を有する。

8. 副作用

<p>11. 副作用</p> <p>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。</p>
--

(1) 重大な副作用と初期症状

<p>11.1 重大な副作用</p> <p>11.1.1 ショック（頻度不明）</p> <p>呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等のアナフィラキシーを伴うことがあるので、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、血圧の維持、体液の補充管理、気道の確保等の適切な処置を行うこと。</p> <p>11.1.2 偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎（頻度不明）</p> <p>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、輸液、バンコマイシンの経口投与等の適切な処置を行うこと。 [5.2、8.2、9.1.1、9.8.2 参照]</p> <p>11.1.3 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）、剥脱性皮膚炎（頻度不明）</p> <p>11.1.4 無顆粒球症（頻度不明）、再生不良性貧血（頻度不明）、汎血球減少症（頻度不明）、血小板減少性紫斑病（頻度不明）</p> <p>[8.3 参照]</p>
--



## (2) その他の副作用

11.2 その他の副作用	
	頻度不明
消化器	下痢、軟便、食欲不振、悪心・嘔吐、腹痛、心窩部痛、口唇乾燥感、舌炎、肛門そう痒症
過敏症	発疹、そう痒、浮腫、血管神経性浮腫、血清病
血液 <sup>a)</sup>	赤血球減少、白血球減少、顆粒球減少、好中球減少、血小板減少、好酸球増多
肝臓 <sup>b)</sup>	黄疸、AST、ALTの上昇
腎臓 <sup>c)</sup>	窒素血症、乏尿、蛋白尿
神経系	耳鳴、めまい
菌交代症	口内炎、カンジダ症
その他	膣炎、発熱、頭痛、倦怠感、小水疱性皮膚炎

a : [8.3 参照]  
b : [8.4 参照]  
c : [8.5 参照]

### ◆項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

## 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

14.1.1 水又は牛乳で服用し、特に就寝直前の服用等には注意するよう指導すること。食道に停留し、崩壊すると、まれに食道潰瘍を起こすことがある。

14.1.2 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。

## 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」参照)

#### (2) 安全性薬理試験<sup>3)</sup>

主として Gram 陽性菌に有効な新抗生物質 LCM の薬理作用について、摘出臓器（ガマ心臓、ウサギ腸管及び耳殻血管）並びにウサギ呼吸、血圧に対する作用を中心に実験を行い、下記のような成績を得た。

摘出心臓に対する作用では、 $10^{-4}$  ( $100 \mu\text{g/mL}$ )、摘出腸管に対する作用では  $10^{-5}$  ( $10 \mu\text{g/mL}$ )、血管に対する作用では  $10^{-4}$  ( $1.0\text{mg/mL}$ ) 及びそれ以下の濃度ではほとんど影響を与えない。このほとんど影響を与えない薬物濃度が、その抗菌作用：最小有効濃度にくらべ 10～100 倍の高濃度である点並びに Mason らの言うように経口投与時の  $\text{LD}_{50}$  が  $4,000\text{mg/kg}$  以上である点と意思合わせ、LCM は薬理作用からも毒性が少ない抗生物質の 1 つと思考する。

次に、LCM 高濃度又は大量適用の際は、心臓運動の抑制、腸管運動の軽度亢進、並びに血管の拡張の諸作用を認めたが、いずれの作用も RINGER 液や TYRODE で洗浄すると速やかに消失した。従ってその作用は一過性又は可逆性のものと考えられる。また、その作用態度は心拍動数や筋緊張に影響を与えなかった。

一方、ウサギ呼吸、血圧に対し  $0.1\sim 20.0\text{mg/kg}$  適用の際、呼吸にはほとんど変化はみられない。これに対して血圧は  $1.0\text{mg/kg}$  適用の際、全く変化はないが、 $5.0\text{mg/kg}$  及びそれ以上の適用例では、薬物量にほぼ比例してやや持続性の下降を示した。このような作用は、Atropine（副交感神経末端遮断薬）、Hexamethonium（自律神経節遮断薬）の前処置並びに迷走神経切断によって、Atropine でやや拮抗されるほかは、ほとんど影響を受けなかった。このような諸事実から、LCM の高濃度及び大量適用の際の諸作用は、Acetylcholine の作用と類似するところが多い。すなわち、軽度ながら Cholinergic な作用を示すものと思推される。

次に、血圧下降作用が、Hexamethonium や迷走神経の切断によって消失し難い事実から、血圧下降作用は末梢血管の拡張に由来するのが一般的であり、しかも、筋麻痺作用と断定するには、摘出臓器（心臓、腸管）に対する作用態度からみて困難である。従って、Acetylcholine 様の降圧作用のある組織 Hormone、更に言葉をすすめると、peptide の作用に関係があるものと推測する次第である。以上の諸成績から、LCM は生体内で抗菌作用を示す濃度の数 10～数 100 倍の濃度においてさえも、ほとんど認むべき薬理作用のない優れた抗生物質であり、同じような抗菌像を有する penicillin G や Erythromycin の場合と同一傾向の成績を得た。なお、大量投与時には軽度ながら cholinergic な作用をもつが、血管拡張作用があきらかであり、降圧性の作用 Peptide にも作用するものと推測する。

#### (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

#### 1) 急性毒性 LD<sub>50</sub> (mg/kg) <sup>10)</sup>

動物種	投与法	経口投与		皮下投与		筋注		静注	
	性別	雄	雌	雄	雌	雄	雌	雄	雌
ddN系マウス (mg/kg)		5000<		5000<		5000<		156.3	160.6
SD系ラット (mg/kg)		5000<		5000<		5000<		164.2	201.4

#### 2) 亜急性毒性 <sup>11)</sup>

動物	投与量	所見
ラット	胃内注入 期間：30日間 30mg/kg投与群 100mg/kg投与群 300mg/kg投与群	300mg/kg以下でも毒性なく、中毒症状は観察されなかった。 雌ラット300mg/kg投与群以外は体重、食餌摂取量とも増加した。 血液像異常なし。
犬	期間：30日間 30mg/kg投与群 100mg/kg投与群 300mg/kg投与群 期間：3週間 500mg/kg又は 750mg/kg	臨床観察、血液像、器官機能値、尿所見、組織検査で異常を認めず。
ラット	期間：30日間 投与法：皮下注 15mg/kg (1mL) 投与群 30mg/kg (1mL) 投与群 60mg/kg (1mL) 投与群	体重、血液像に異常なく、注射部位の変化も対照と差がなかった。
犬	期間：28日間 投与法：筋注 15mg/kg (1mL) 投与群 30mg/kg (1mL) 投与群 60mg/kg (1mL) 投与群	体重変動、血液、尿所見、肝・腎機能及び組織学的検査は対照と差がなかった。

3) 慢性毒性 (最大安全量) <sup>11)</sup>

動物	投与量	所見
ラット	胃内注入 期間：12ヵ月 30mg/kg投与群 100mg/kg投与群 300mg/kg投与群	下痢もなく、実験終了時の血液像、臓器重量、組織学的所見は対照ラットと差がなかった。
犬	1日3回分服 期間：6ヵ月 30mg/kg投与群 100mg/kg投与群 300mg/kg投与群	毎月の体重、ヘマトクリット、血色素、白血球数及び分布、血糖、血液尿素、BSP値、SGOT、SGPT値に異常を認めず。300mg/kgの大量投与2匹 (1群4匹) の甲状腺はリンパ球が組織実質を置換していたが、甲状腺機能の変化は見られなかった。

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験 <sup>11)</sup>

使用動物	投与量	投与方法	結 果	
マウス 生後3~4ヵ月 ICR系 初妊	①3,000mg/kg (大量投与群) ②300mg/kg (少量投与群)	妊娠8日から 14日まで 毎日1回 経口投与	(1) 母体の 一般状態  (2) 胎仔の状態	①~⑤とも薬物の著明な影響は認められない。  ①~⑤とも死胚仔率、生仔の奇形率、平均体重、及び性別に関して平均体重、及び性別に関して薬物の影響は認められなかった。
	③600mg/kg (大量投与群) ④450mg/kg (中量投与群) ⑤300mg/kg (少量投与群)	妊娠8日から 14日まで 毎日1回 腹腔内投与	(3) 生後6週間に至る発育を観察した結果	生後22日における哺育率、生後42日における生存率、体重増加の状態感覚、運動性成熟及び胸腹部内臓の異常に関して薬物の影響を示す所見は認められなかった。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

---

## X. 管理的事項に関する項目

---

### 1. 規制区分

製 剤：リンコシンカプセル 250mg 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：日局 リンコマイシン塩酸塩水和物

### 2. 有効期間

有効期間：4年（最終年月を外箱等に記載）

### 3. 包装状態での貯法

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

患者向医薬品ガイド：あり  
くすりのしおり：あり

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：リンコシン注射液 300mg、600mg、1g、1.5g  
同 効 薬：クリンダマイシン塩酸塩、クリンダマイシンリン酸エステル

### 7. 国際誕生年月日

1960年1月（コートジボアール）

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

履歴	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 リンコシンカプセル	1965年4月28日	(40AM輸)第202号	1965年12月	1965年12月
販売名変更 リンコシンカプセル 250mg	2007年9月14日	21900AMX01452	2007年12月21日	2008年2月29日

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

該当資料なし

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果通知日：1975年12月（第一次再評価）

再評価結果通知日：2004年9月30日

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、厚生労働省告示第107号（平成18年3月6日付）による「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。

13. 各種コード

販売名	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）	HOT（9桁）番号	レセプト電算処理システム用コード
リンコシンカプセル 250mg	6112003M1030	6112003M1030	110625103	620006165

14. 保険給付上の注意

該当しない



---

## XI. 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) 厚生労働省健康局結核感染症課編：抗微生物薬適正使用の手引き
- 2) 中沢 昭三ほか. : J Antibiot [B]. 1965;18 (2) :56-60 (PMID:14296219)
- 3) 荒谷 春恵ほか. : J Antibiot [B]. 1965;18 (2) :61-63 (PMID:14296220)
- 4) 奥山 宣夫ほか. : J Antibiot [B]. 1965;18 (2) :131-134 (PMID:14296208)
- 5) 二宮 敬宇ほか. : Jpn J Antibiot. 1973;26 (2) :157-162 (PMID:4354698)
- 6) 柴田 清人. : J Antibiot [B]. 1965;18 (2) :126-130 (PMID:14296207)
- 7) 石山 俊次ほか. : J Antibiot [B]. 1965;18 (2) :120-125 (PMID:14296206)
- 8) 清水 喜八郎ほか. : J Antibiot [B]. 1965;18 (2) :82-84 (PMID:14296225)
- 9) Keller, F. et al. : Nephron. 1982;30:220-227 (PMID:7099332)
- 10) 社内資料 [L20050325003]
- 11) Gray, J. E. et al. : Toxicol Appl Pharmacol. 1964;6 (4) :476-496 (PMID:14223498)

### 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

2020年12月現在、オーストラリア、インドネシア、トルコ、イタリア、スペイン、メキシコ、オマーン、ブラジル、チリ、モーリタニア、南アフリカ共和国、アラブ首長国連邦など、世界50の国と地域で承認されている。

### 2. 海外における臨床支援情報

#### (1) 妊婦に関する海外情報（FDA、オーストラリア分類）

本邦における特定の背景を有する患者に関する注意「9.4 生殖能を有する者、9.5 妊婦、9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリア分類とは異なる。

#### 【9. 特定の背景を有する患者に関する注意】

##### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないことが望ましい。

##### 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。ヒト母乳中へ移行する。

	分類
オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)	分類：A（2022年9月現在）

<参考：分類の概要>

オーストラリアの分類：(An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)

A: Drugs which have been taken by a large number of pregnant women and women of childbearing age without any proven increase in the frequency of malformations or other direct or indirect harmful effects on the fetus having been observed.

#### (2) 小児に関する海外情報

該当資料なし

---

## 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) 粉碎

該当資料なし

#### (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

### 2. その他の関連資料

該当資料なし

**文献請求先・製品情報お問い合わせ先**

---

ファイザー株式会社 製品情報センター  
〒151-8589 東京都渋谷区代々木 3-22-7  
学術情報ダイヤル 0120-664-467  
FAX 03-3379-3053

**製造販売**

---

ファイザー株式会社  
〒151-8589 東京都渋谷区代々木 3-22-7

