

# 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（1998年9月）に準拠して作成

抗生物質製剤

処方箋医薬品

**リンコシン<sup>®</sup>注射液 300mg**

**リンコシン<sup>®</sup>注射液 600mg**

**リンコシン<sup>®</sup>注射液 1g**

**リンコシン<sup>®</sup>注射液 1.5g**

Lincocin<sup>®</sup> Injection 300mg・600mg・1g・1.5g

日本薬局方 リンコマイシン塩酸塩注射液

剤形	注射剤
規格・含量	300mg：1mL中、日局 リンコマイシン塩酸塩水和物 300mg（力価）含有 600mg：2mL中、日局 リンコマイシン塩酸塩水和物 600mg（力価）含有 1g：3.33mL中、日局 リンコマイシン塩酸塩水和物 1g（力価）含有 1.5g：5mL中、日局 リンコマイシン塩酸塩水和物 1.5g（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・輸入承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造承認年月日：2007年8月31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） 発売年月日：300mg：2008年2月18日 600mg：2008年1月28日 1g：2008年2月29日 1.5g：2008年2月29日
開発・製造・輸入・発売・提携・販売会社名	製造販売：ファイザー株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	TEL： FAX：

本IFは2021年1月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

## IF 利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

### 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR と略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和 63 年日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成10年日病薬学術第 3 小委員会によって新たな位置付けとIF記載要領が策定された。

### 2. IF とは

IF は「医療用医薬品添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な医薬品の適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。

### 3. IF の様式・作成・発行

規格は A4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IF は日病薬が策定した「IF 記載要領」に従って記載するが、本 IF 記載要領は、平成 11 年 1 月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF 記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合には IF が改訂・発行される。

### 4. IF の利用にあたって

IF 策定の原点を踏まえ、MR へのインタビュー、自己調査のデータを加えて IF の内容を充実させ、IF の利用性を高めておく必要がある。

MR へのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段に IF 作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

# 目次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>
1. 開発の経緯.....	1
2. 製品の特徴及び有用性.....	1
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>
1. 販売名.....	2
2. 一般名.....	2
3. 構造式又は示性式.....	2
4. 分子式及び分子量.....	2
5. 化学名（命名法）.....	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	3
7. CAS 登録番号.....	3
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>
1. 有効成分の規制区分.....	4
2. 物理化学的性質.....	4
3. 有効成分の各種条件下における安定性.....	4
4. 有効成分の確認試験法.....	5
5. 有効成分の定量法.....	5
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>6</b>
1. 剤形.....	6
2. 製剤の組成.....	6
3. 注射剤の調製法.....	6
4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意.....	7
5. 製剤の各種条件下における安定性.....	7
6. 溶解後の安定性.....	7
7. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	7
8. 電解質の濃度.....	8
9. 混入する可能性のある夾雑物.....	8
10. 生物学的試験法.....	8
11. 製剤中の有効成分の確認試験法.....	8
12. 製剤中の有効成分の定量法.....	8
13. 力価.....	8
14. 容器の材質.....	8
15. その他.....	8
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>9</b>
1. 効能又は効果.....	9
2. 用法及び用量.....	9
3. 臨床成績.....	10
<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>12</b>
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群.....	12
2. 薬理作用.....	12
<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>14</b>
1. 血中濃度の推移・測定法.....	14
2. 薬物速度論的パラメータ.....	15
3. 吸収.....	16
4. 分布.....	16
5. 代謝.....	21
6. 排泄.....	21
7. 透析等による除去率.....	21

<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>22</b>
1. 警告内容とその理由 .....	22
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） .....	22
3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由.....	22
4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由.....	22
5. 慎重投与内容とその理由 .....	23
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 .....	23
7. 相互作用 .....	24
8. 副作用 .....	25
9. 高齢者への投与 .....	28
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 .....	28
11. 小児等への投与 .....	28
12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	29
13. 過量投与 .....	29
14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等） .....	29
15. その他の注意 .....	29
16. その他 .....	29
<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>30</b>
1. 一般薬理 .....	30
2. 毒性 .....	31
<b>X. 取扱い上の注意等に関する項目</b> .....	<b>32</b>
1. 有効期間又は使用期限 .....	32
2. 貯法・保存条件 .....	32
3. 薬剤取扱い上の注意点 .....	32
4. 承認条件 .....	32
5. 包装 .....	32
6. 同一成分・同効薬 .....	32
7. 国際誕生年月日 .....	32
8. 製造・輸入承認年月日及び承認番号 .....	32
9. 薬価基準収載年月日 .....	33
10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容.....	33
11. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	33
12. 再審査期間 .....	33
13. 長期投与の可否 .....	33
14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード .....	33
15. 保険給付上の注意 .....	33
<b>XI. 文献</b> .....	<b>34</b>
1. 引用文献 .....	34
2. その他の参考文献 .....	34
<b>XII. 参考資料</b> .....	<b>35</b>
主な外国での発売状況 .....	35
<b>XIII. 備考</b> .....	<b>36</b>
その他の関連資料 .....	36

---

## I. 概要に関する項目

---

### 1. 開発の経緯

Lincomycin は 1955 年米国 Upjohn 社の D. J. Mason、A. Dietz & C. De Boer 等により、Nebraska 州、Lincoln 近くの土壌から分離された放線菌の一種である *Streptomyces lincolnensis* var. *linconensis* の産生する抗生物質である。Lincomycin は現在使用されている各種抗生物質とはまったく構造式の相違した独自の抗生物質である。

(「IX. 非臨床試験に関する項目」の「1. 一般薬理」の項を参照)

### 2. 製品の特徴及び有用性

- (1) 本剤はブドウ球菌、レンサ球菌及び肺炎球菌等の好気性グラム陽性菌に抗菌作用を示す。  
(「IV. 薬効薬理に関する項目」の「2. (1) 作用部位・作用機序」の項を参照)
- (2) ペプトコッカス属、ペプトストレプトコッカス属、バクテロイデス属等の嫌気性菌に対し抗菌作用を有する。<sup>1)</sup>
- (3) 喀痰、胸水、胆汁、上顎洞粘膜、子宮等各種の体液、組織に対して良好な移行が認められる。<sup>2) ~5)</sup>

---

## II. 名称に関する項目

---

### 1. 販売名

#### (1) 和名

リンコシン<sup>®</sup>注射液 300mg  
リンコシン<sup>®</sup>注射液 600mg  
リンコシン<sup>®</sup>注射液 1g  
リンコシン<sup>®</sup>注射液 1.5g

#### (2) 洋名

Lincocin<sup>®</sup> Injection 300mg  
Lincocin<sup>®</sup> Injection 600mg  
Lincocin<sup>®</sup> Injection 1g  
Lincocin<sup>®</sup> Injection 1.5g

#### (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

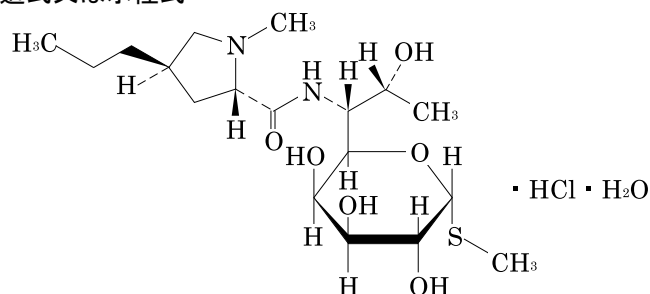
#### (1) 和名 (命名法)

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. 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)

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号 : LCM

治験番号 : U-10149A

7. CAS 登録番号

原体そのもの 154-21-2

HCl · H<sub>2</sub>O 塩 7179-49-9

HCl 塩 859-18-7

---

### III. 有効成分に関する項目

---

#### 1. 有効成分の規制区分

処方箋医薬品

注意－医師等の処方箋により使用すること

#### 2. 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℃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℃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℃（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

比旋光度  $[\alpha]_D^{25}$ ：+137°

旋光度  $[\alpha]_D^{20}$ ：+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）

#### 3. 有効成分の各種条件下における安定性

リンコマイシン塩酸塩水和物は、著しく安定で、乾燥状態では 70℃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℃に 1 週間保存した場合でも、力価の低下はなく、血清添加の影響も認めない。



#### 4. 有効成分の確認試験法

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。

#### 5. 有効成分の定量法

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、規格及び性状

##### 1) 溶液

##### 2) 1 バイアル中：

リンコシン注射液 300mg：	日局	リンコマイシン塩酸塩水和物	300mg	(力価)	/mL
リンコシン注射液 600mg：	日局	リンコマイシン塩酸塩水和物	600mg	(力価)	/2mL
リンコシン注射液 1g：	日局	リンコマイシン塩酸塩水和物	1 g	(力価)	/3.33mL
リンコシン注射液 1.5g：	日局	リンコマイシン塩酸塩水和物	1.5g	(力価)	/5mL

##### 3) 無色澄明の水溶性注射液である。

#### (2) 溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

pH : 3.5~5.5

浸透圧比：約 5 (生理食塩液対比)

#### (3) 酸価、ヨウ素価等

該当しない

#### (4) 注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

#### (2) 添加物

販売名	リンコシン注射液 300mg	リンコシン注射液 600mg	リンコシン注射液 1g	リンコシン注射液 1.5g
容量	1mL	2mL	3.33mL	5mL
有効成分	日局 リンコマイシン塩酸塩水和物			
	300mg (力価)	600mg (力価)	1g (力価)	1.5g (力価)
添加物	ベンジルアルコール 9.45mg	ベンジルアルコール 18.9mg	ベンジルアルコール 31.5mg	ベンジルアルコール 47.25mg

#### (3) 添付溶解液の組成及び容量

該当資料なし

### 3. 注射剤の調製法

該当資料なし

4. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当資料なし

5. 製剤の各種条件下における安定性

リンコシン注射液は室温で60ヵ月保存の結果、いずれの検体とも日抗基リンコマイシン塩酸塩水和物注射液の規格の範囲にあり、非常に安定な製剤であるといえる。

6. 溶解後の安定性

該当資料なし

7. 他剤との配合変化（物理化学的变化）<sup>6)、7)</sup>

pH変動スケール														規格 pH	
pH	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	3.5~5.5
					1.68		5.21		8.17						(600mg注)

0.1N塩酸又は0.1N水酸化ナトリウム試液を10mL加えたときの最終pHは、それぞれ1.68、8.17であった（外観変化なし）。

リンコシン注射液の配合変化表

配合薬品名	pH変化		力価 (mcg/mL) hr		
	直後	1 (hr)	0 (hr)	30 (分)	2 (hr)
フラビタン	5.0	5.0	10.2	10.0	10.2
ビタシミン	5.7	5.9	9.2	9.9	10.1
ピドキサール	5.5	5.5	10.2	9.7	9.9
タチオン	5.3	5.2	10.9	9.9	9.3
ソル・コーテフ	6.1	6.2	9.4	8.9	9.1
プレドニン	5.7	5.7	9.6	10.2	10.4
ソル・メドロール	6.2	6.2	9.0	9.1	10.1
ペルサンチン	2.6	2.7	10.7	10.1	10.1

残存力価：mcg/mL、濃度：0.001w/v%、温度：26℃~27℃

各種輸液中におけるリンコマイシンの安定性

輸液	pH変化			残存率 (%)		
	0 (hr)	1 (hr)	6 (hr)	3 (hr)	6 (hr)	24 (hr)
5%ブドウ糖500mL	4.7	4.9	5.0	100.0	101.0	96.2
ハルトマン液500mL	6.0	6.0	6.0	100.0	100.0	91.7
デキストロン液500mL	5.3	5.3	5.3	102.0	100.0	96.2
生理食塩液500mL	5.2	5.3	5.2	100.0	101.5	103.0

配合方法：輸液500mL+リンコマイシン3g/10mL

各種抗生物質とリンコマイシンの配合変化

配合薬品名	pH変化			24時間後の 残存率 (hr)
	0 (hr)	1 (hr)	6 (hr)	
セファメジンα	4.8	4.8	4.9	107.9
ビクシリン	7.0	7.0	7.0	112.2
ゲンタシン	4.6	4.7	4.7	108.0

リンコマイシンの残存率は TLC で分離した後測定。

8. 電解質の濃度

該当資料なし

9. 混入する可能性のある夾雑物

特別になし

10. 生物学的試験法

該当しない

11. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) 日局「赤外吸収スペクトル測定法（ペースト法）」による。
- (2) 日局「定性反応」による。

12. 製剤中の有効成分の定量法

日局「リンコマイシン塩酸塩水和物」の定量法による。

13. カ価

1 バイアル中：

リンコシン注射液 300mg	日局 リンコマイシン塩酸塩水和物	300mg (力価) / mL
リンコシン注射液 600mg	日局 リンコマイシン塩酸塩水和物	600mg (力価) / 2mL
リンコシン注射液 1g	日局 リンコマイシン塩酸塩水和物	1 g (力価) / 3.33mL
リンコシン注射液 1.5g	日局 リンコマイシン塩酸塩水和物	1.5g (力価) / 5mL

14. 容器の材質

該当資料なし

15. その他

本品はリンコマイシン塩酸塩水和物の液状の注射剤である。

---

## V. 治療に関する項目

---

### 1. 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、ペプトストレプトコッカス属、バクテロイデス属

#### <適応症>

敗血症、感染性心内膜炎、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、関節炎、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、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、子宮旁結合織炎、化膿性髄膜炎、角膜炎（角膜潰瘍を含む）、中耳炎、副鼻腔炎、猩紅熱

#### 【効能・効果に関連する使用上の注意】

咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、中耳炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」<sup>8)</sup>を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

#### <解説>

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」<sup>8)</sup>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」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・効果に関連する使用上の注意」として設定した。

### 2. 用法及び用量

#### 〔静脈内注射〕

リンコマイシン塩酸塩水和物として、通常成人は、1 回 600mg（力価）を 1 日 2～3 回点滴静注する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

#### 〔筋肉内注射〕

リンコマイシン塩酸塩水和物として、通常成人は、1 回 300mg（力価）を 1 日 2～3 回、又は 1 回 600mg（力価）を 1 日 2 回筋肉内注射する。

小児には、1 回体重 1kg あたり 10～15mg（力価）を 1 日 2～3 回筋肉内注射する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

**【用法・用量に関連する使用上の注意】**

本剤の使用にあたっては、耐性菌の発現等を防ぐため、原則として感受性を確認し、疾病の治療上必要な最小限の期間の投与にとどめること。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床効果

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。

リンコマイシンは主としてグラム陽性球菌感染症を中心として、国内、国外ともに、広く使用されている。経口投与では国内、国外あわせて約 3500 例で有効率 82%、菌検出例は約 1350 例で 92% の有効率を示した。筋注では約 460 例で有効率 89%、菌検出例は 250 例で 88% の有効率、静注では約 160 例で有効率 88%、菌検出例では 90% の有効率を示した。これを疾患別に検討すると次のようである。

疾患名	有効率 (有効例/総症例)	菌検出
		有効率 (有効例/総症例)
敗血症、感染性心内膜炎	82.1% ( 32 / 39)	87.1% ( 27 / 31)
浅在性化膿性疾患群 膿痂疹、よう、疔、蜂巣炎、 癩疽、皮膚感染症、扁桃炎、咽喉頭炎、 丹毒、麦粒腫、涙のう炎	89.0% (597/671)	86.3% (182/211)
外科・整形外科領域感染症 乳腺炎、リンパ管(節)炎、骨髓炎	86.6% (129/149)	89.0% ( 73 / 82)
呼吸器感染症 急性慢性気管支炎、気管支炎及び 肺炎、肺化膿症(肺膿瘍)	85.7% (360/410)	86.1% (198/230)

#### (2) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

#### (3) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 無作為化平行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(5) 治療的使用

1) 使用成績調査・特別調査・市販後臨床試験

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試験の概要

該当資料なし

## 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

リンコマイシン塩酸塩水和物カプセル、リンコマイシン塩酸塩水和物注射液、クリンダマイシン塩酸塩カプセル、注射用クリンダマイシンリン酸エステル

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### 1) 抗菌作用<sup>1)、2)、9)、10)</sup>

好気性グラム陽性菌のブドウ球菌属、レンサ球菌属（腸球菌を除く）、肺炎球菌、嫌気性グラム陽性菌のペプトコッカス属、ペプトストレプトコッカス属及び嫌気性グラム陰性菌のバクテロイデス属に強い抗菌作用を示す。

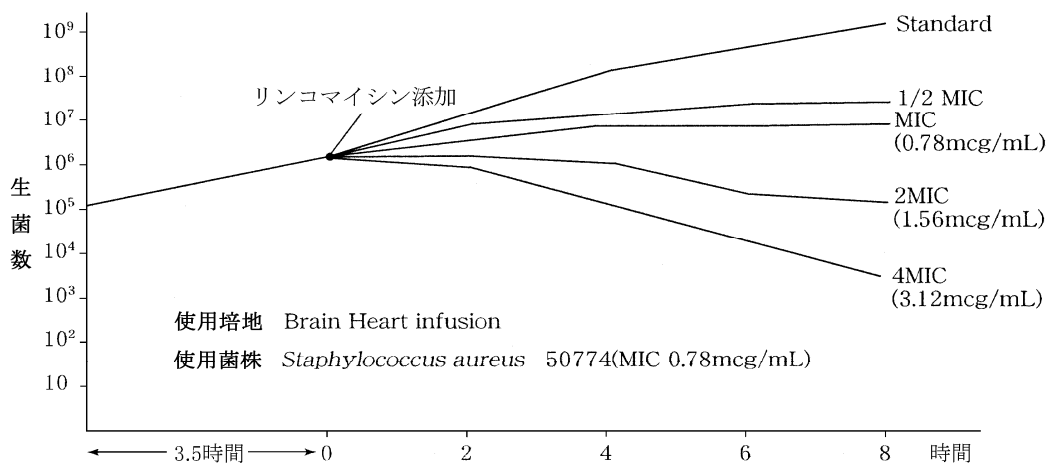
##### 2) 作用機序<sup>4)</sup>

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

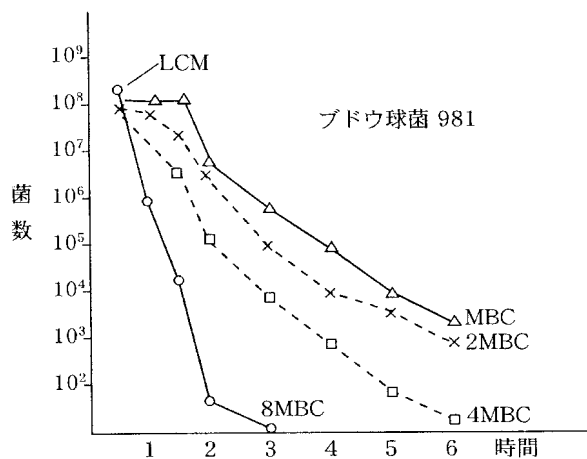
抗生物質の細菌に対する静菌、殺菌作用はその抗生物質の濃度に関係するといわれている。リンコマイシンも静菌作用を示す濃度、殺菌作用を示す濃度があり、殺菌作用の強い抗生物質である。<sup>9)、11)</sup>

◆リンコマイシンは濃度の増加にしたがって強力な殺菌作用を示す。





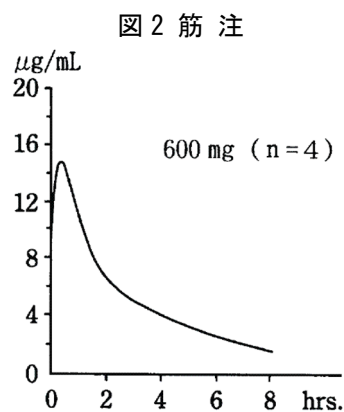
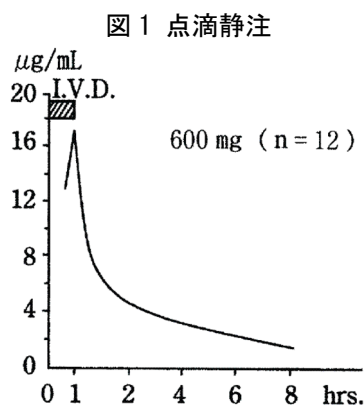
◆リンコマイシンに対して、MIC  $0.78 \mu\text{g/mL}$  の黄色ブドウ球菌を使用し MIC の 4 倍の濃度  $3.12 \mu\text{g/mL}$  で作用されると 99%以上黄色ブドウ球菌が死滅することを示している。  
 リンコシンの濃度を MBC、2MBC、4MBC、8MBC と増加させるとその殺菌力は強力に増加する。



## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・測定法<sup>2)</sup>

本剤 600mg1 時間点滴静注後の血中濃度は、点滴終了直後に最高 16.63  $\mu\text{g}/\text{mL}$  に達し、その後ゆるやかに減少した (図 1)。筋注後の血中濃度は、投与後 0.38 時間に最高 15.38  $\mu\text{g}/\text{mL}$  に達し、その後ゆるやかに減少した (図 2)。



(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

該当資料なし

### (3) 通常用量での血中濃度

Lincomycin 600mg を1時間点滴静注後の標準血中濃度は、点滴終了直後に最高 16.63  $\mu$ g/mL に達し、その後ゆるやかに減少した。

AUC : 61.6  $\mu$ g  $\cdot$  hr/mL

生物学的半減期 : 4.6~4.8 時間 (正常腎機能)

10~20 時間 (末期腎不全)

#### ●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、腎機能に応じて用法を調整する必要がある。Ccr 10mL/min. 以下では1回通常量を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>12)</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

### (4) 中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

## 2. 薬物速度論的パラメータ

### (1) 吸収速度定数

該当資料なし

### (2) バイオアベイラビリティ

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

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

28～86%

3. 吸収

注射部位

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性<sup>13)</sup>

通過しない

(2) 胎児への移行性

該当資料なし

(3) 乳汁中への移行性<sup>14)</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 $\mu$ g/mL、6時間後に1.2 $\mu$ g/mLでピークを示した。第2例では、1時間値3.2 $\mu$ g/mLでピークを示し、3～6時間後に1.4～0.7 $\mu$ 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

喀痰、胸水、胆汁、上顎洞粘膜、子宮等各種の体液、組織に良好な移行が認められる。<sup>2)～5)</sup>

胆汁中濃度

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 $\mu$ g/mL)の排泄がみられ、1時間で最高値(19.0～11.7 $\mu$ g/mL)に達し、その後6時間でもなお高い濃度(10.5～8.4 $\mu$ 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。<sup>4)</sup>

<参考>動物におけるデータ

臓器内移行量は数種の動物実験によると腎・肺に一番高く、ついで脾・肝等の順となる。各研究機関の実験によると次のごとくである。

●内服の場合

1) マウス ddD 系 (約 30g) に LCM 200mg/kg を胃内に注入 (1 群 3 匹使用)

	mg/g (血清 $\mu$ g/mL)			
	30分	1時間	2時間30分	4時間30分
肝 臓	0	2.1	0	0
脾 臓	0	2.7	0.4	0.4
腎 臓	2.4	8.4	1.8	0.4
肺	2.3	3.5	1.2	0.5
盲 腸	0	2,800	3,800	5,300
血 清	1.2	4.6	0.3	0

2) ラット Wistar 系 (100~150g) に LCM 40mg/kg を胃内に注入 (1 群 1 匹使用) <sup>13)</sup>

	30分
肝 臓	4.8 $\mu$ g/mL
脾 臓	<2.0
腎 臓	2.8
肺	<2.0
心 筋	2.4
筋 肉	2.8
脳	<2.0
血 清	0.7

●筋注の場合

3) 家兎 (約 2kg/kg) に LCM 20mg/kg を筋注 (1 群 3 羽使用) <sup>15)</sup>

	mg/g (血清 $\mu$ g/mL)		
	1時間	3時間	5時間
肝 臓	2.15	0.32	0.18
脾 臓	4.0	2.9	0.71
腎 臓	23.5	8.13	3.9
肺	7.55	0.89	0.4
筋 肉	1.6	0.43	0.19
血 清	7.7	0.94	0.39

4) ラット Wistar 系 100~150g に LCM 20mg/kg を筋注 (1 群 1 匹使用) <sup>13)</sup>

	mg/g (血清 $\mu$ g/mL)			
	30分	1時間	2時間30分	5時間
肝 臓	2.9	2.6	1.6	1.1
脾 臓	8.3	7.6	3.8	1.5
腎 臓	56.0	66.0	5.6	1.1
肺	5.7	6.6	1.9	<1.0
心 筋	6.0	4.0	1.2	<1.2
筋 肉	4.6	3.7	2.3	<1.3
脳	<1.0	<1.0	<1.0	<1.0
血 清	17.0	5.5	1.1	0.4
小 腸	3.9	6.0	2.0	<1.1

5) ラット (100g 前後) に LCM 30mg/kg 筋注 (1 群 2 匹使用) <sup>16)</sup>

	mg/g (血清 $\mu$ g/mL)			
	15分	30分	1時間	2時間
肝 臓	7.65	6.73	4.25	2.60
脾 臓	4.01	3.51	2.81	1.86
腎 臓	12.77	8.06	6.37	3.41
肺	3.51	2.81	2.53	1.56
血 清	2.58	2.12	1.32	1.07

6) マウス (20g 前後) に LCM 30mg/kg を筋注 (1 群 3 匹使用)

	mg/g (血清 $\mu$ g/mL)		
	1時間	3時間	5時間
肝 臓	1.32	0.80	0
脾 臓	1.76	0.68	0
腎 臓	1.90	0.70	0
肺	2.16	1.29	0
心 筋	1.15	0	0
筋 肉	1.06	0	0
脳	0	0	0

- 7) 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研磨し、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。<sup>4)</sup>

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

(眼組織移行量)

LCM は球結膜、眼筋、虹彩毛様体、鞏膜等によく移行する。

家兔に LCM 50mg/kg 筋注

組織	30 分後		90 分後		300 分後	
	mg/mL (g)		mg/mL (g)		mg/mL (g)	
	範囲	平均	範囲	平均	範囲	平均
前房水	0.58~ 0.60	0.59	0.37~ 0.49	0.43	0.24~ 0.43	0.33
角膜	0.66~ 1.2	0.93	1.65~ 1.80	1.73	0.50	0.50
虹彩毛様体	8.4 ~ 8.6	8.5	7.4 ~13.5	10.5	4.2 ~ 4.4	4.3
水晶体	0.2>		0.2>		0.2>	
硝子体	0.2>		0.2>		0.2>	
網脈絡膜	1.42~ 3.0	2.21	0.76~ 1.62	1.20	0.50~ 0.55	0.53
鞏膜	6.3 ~ 8.4	7.4	5.7 ~ 7.7	6.7	1.85~ 2.3	2.1
眼筋	13.4 ~15.5	14.5	7.6 ~10.4	9.0	2.35~ 3.45	2.90
球結膜	14.4 ~14.6	14.5	12.5 ~13.5	13.0	3.0 ~ 3.45	3.2
髄液	0.2>		0.2>		0.2>	
血漿	9.6 ~ 9.7	9.65	3.0 ~ 4.3	3.0	0.3 ~ 1.05	0.67

図1 白色家兎に LCM 100mg/kg 筋注、1時間値

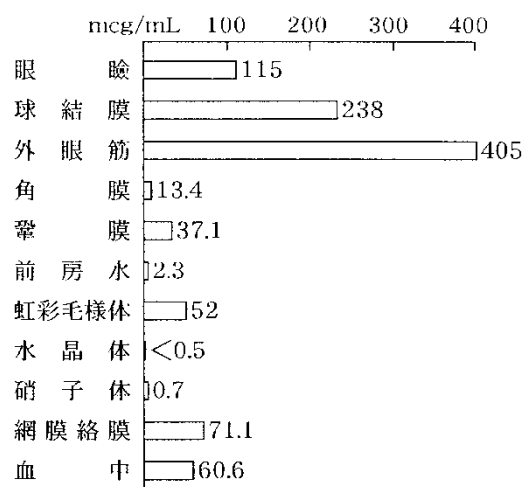
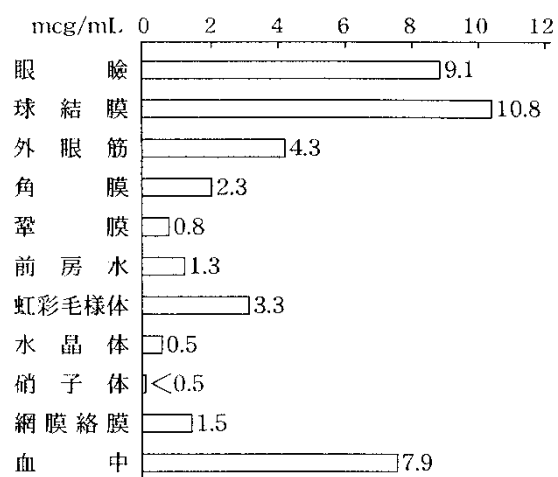


図2 白色家兎に LCM 100mg/kg 経口投与、2時間値





## 5. 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（CYP450 等）の分子種

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比率

関連物質の生物学的作用については次のようである。すなわち関連化合物 10 種類の生体外及び生体内作用を比較した。S-ethyl 及び N-ethyl analogues は、Lincomycin と同様にグラム陽性菌に対して Lincomycin の 5 倍強い生体外作用をもつ。N-Demethyl lincomycin の生体外作用は、Lincomycin の約 1/10 である。

### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

## 6. 排泄

### (1) 排泄部位

Lincomycin はほとんどそのまま尿中又は糞便中に排出される。

### (2) 排泄率<sup>17)</sup>

健康成人に 600mg（力価）を筋注した時の 8 時間までの尿中回収率は 11.0～13.5%である。

### (3) 排泄速度

該当資料なし

## 7. 透析等による除去率

### (1) 腹膜透析<sup>18)</sup>

除去されない

### (2) 血液透析<sup>18)</sup>

除去されない

### (3) 直接血液灌流

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由

**【禁忌（次の患者には投与しないこと）】**

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

### 3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

**【効能・効果に関連する使用上の注意】**

咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、中耳炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」<sup>8)</sup>を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

（解説）

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」<sup>8)</sup>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」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・効果に関連する使用上の注意」として設定した。

### 4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

**【用法・用量に関連する使用上の注意】**

本剤の使用にあたっては、耐性菌の発現等を防ぐため、原則として感受性を確認し、疾病の治療上必要な最小限の期間の投与にとどめること。

（解説）

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。

## 5. 慎重投与内容とその理由

### 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 高齢者及び衰弱患者、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（「重要な基本的注意」(1)の項参照）。〕
- (2) 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。〕
- (3) 腎障害のある患者〔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。〕
- (4) 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。〕
- (5) 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。〕

## 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (1) 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。したがって本剤の投与を考慮する場合には、次の注意が必要である。
  - 1) 次の場合には投与しないことが望ましい。
    - ①軽微な感染症
    - ②他に有効な使用薬剤がある場合
  - 2) 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、直ちに医師に通知するよう注意すること。また、症状が重篤な場合には輸液、バンコマイシンの経口投与等の適切な処置を行うこと。
- (2) 静脈内投与の場合、急速な静注により、心停止を来すおそれがあるので、急速静注は行わないこと。〔「適用上の注意」(1)の項参照〕
- (3) 本剤によるショック、アナフィラキシーの発生を確実に予知できる方法がないので、次の措置をとること。
  - 1) 事前に既往歴等について十分な問診を行うこと。なお、抗生物質等によるアレルギー歴は必ず確認すること。
  - 2) 投与に際しては、必ずショック等に対する救急処置のとれる準備をしておくこと。
  - 3) 投与開始から投与終了後まで、患者を安静の状態に保たせ、十分な観察を行うこと。特に、投与開始直後は注意深く観察すること。

## 7. 相互作用

### (1) 併用禁忌とその理由

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)	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

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 塩化スキサメトニウム 塩化ツボクラリン等	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

### (1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

#### 1) 重大な副作用と初期症状

##### (1) 重大な副作用

- 1) ショック（頻度不明）：ショックを起こすことがある。また、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。
- 2) 偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎（頻度不明）：偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎があらわれることがある。腹痛、頻回の下痢があらわれた場合には直ちに投与を中止し、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。[「重要な基本的注意」(1)の項参照]
- 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）：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）、剥脱性皮膚炎があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 4) 心停止（頻度不明）：急速な静注により心停止があらわれたとの報告がある。[「適用上の注意」(1)の項参照]
- 5) 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）：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あらわれたとの報告があるので、血液検査等の観察を十分に行い、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。

##### (2) 重大な副作用（類薬）

間質性肺炎、PIE 症候群：類薬（クリンダマイシンリン酸エステル）で発熱、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 症候群があらわれたとの報告があるので、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、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

## 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 <small>注1)</small>	発疹、そう痒、浮腫、血管神経性浮腫、血清病
血液 <small>注2)</small>	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 <small>注3)</small>	黄疸、AST (GOT)、ALT (GPT) の上昇
腎臓 <small>注4)</small>	窒素血症、乏尿、蛋白尿
神経系	耳鳴、めまい
菌交代症 <small>注5)</small>	口内炎、カンジダ症
注射部位	静脈内投与による血栓性静脈炎、筋肉内投与による疼痛・硬結・壊死・無菌膿瘍
その他	膣炎、発熱、頭痛、倦怠感、小水疱性皮膚炎

注1：このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

注2：血液検査等の観察を十分に行うこと。

注3：定期的に肝機能検査を行うなど観察を十分に行うこと。

注4：定期的に腎機能検査を行うなど観察を十分に行うこと。

注5：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。

(1990年10月1日)

調査症例数 10,272

調査施設数 669

## リンコシン注射液副作用集計

副作用の種類	発生件数(頻度%)	
消化器	偽膜性大腸炎	10 (0.10%)
	重篤下痢	4 (0.04%)
	下血	3 (0.03%)
	下痢	20 (0.19%)
	軟便	10 (0.10%)
	食欲不振	9 (0.09%)
	胃障害	2 (0.02%)
	悪心	4 (0.04%)
	嘔気	2 (0.02%)
	嘔吐	5 (0.05%)
	腹痛	3 (0.03%)
	心窩部痛	8 (0.08%)
	口内炎	3 (0.03%)
舌のしびれ感	2 (0.02%)	
舌炎	1 (0.01%)	
血液	白血球減少	9 (0.09%)
	顆粒球減少	2 (0.02%)
	好酸球減少	2 (0.02%)
	血小板減少	1 (0.01%)
	赤血球減少	1 (0.01%)
過敏症	皮疹	54 (0.53%)
	全身痒感	4 (0.04%)
	アナフィラキシー様反応	14 (0.14%)
肝臓	GOT・GPT上昇	22 (0.21%)
	肝障害	10 (0.10%)
	黄疸	1 (0.01%)
神経系	眩暈感	10 (0.10%)
その他	全身倦怠感	7 (0.07%)
	発熱	4 (0.04%)
	胸内苦悶	3 (0.03%)
	全身熱感	2 (0.02%)
	胸部不快感	2 (0.02%)
	不整脈	1 (0.01%)
	膀胱カンジダ症	1 (0.01%)
投与部位	注射部位疼痛	29 (0.28%)
	注射部位硬結	11 (0.11%)
	注射部位腫脹	2 (0.02%)
相互作用	筋弛緩を增強	1 (0.01%)
適用上の注意	血圧低下	5 (0.05%)
計		284 (2.76%)

(2) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(3) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法<sup>19)</sup>

Lincomycin の抗原性について検討した結果、非抗原性であることが認められた。

血球凝集反応 (Coombs test) : 通常は抗原抗体反応による赤血球の凝集反応をいう。これには抗赤血球抗体 (血液型抗体など) による凝集、抗原吸着赤血球の対応抗体による凝集、抗体感作赤血球の抗グロブリン抗体その他による凝集 (Coombs test, Wealer Rose Veeaction など)、抗体吸着赤血球の検体中の抗原との反応による凝集などが含まれる。

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないことが望ましい。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2) 授乳婦

授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること。[ヒト母乳中へ移行する。]

11. 小児等への投与

(1) 低出生体重児、新生児に対する安全性は確立していないので、特に必要とする場合は慎重に投与すること。

(2) 低出生体重児、新生児に使用する場合には十分注意すること。[外国において、ベンジルアルコールの静脈内大量投与 (99~234mg/kg) により、中毒症状 (あえぎ呼吸、アシドーシス、痙攣等) が低出生体重児に発現したとの報告がある。本剤は添加物としてベンジルアルコールを含有している。]



12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

本剤は用法・用量にしたがって、点滴静脈内投与又は筋肉内投与のみに使用すること。本剤の使用に際しては、以下の点に注意すること。

(1) 静脈内投与時

本剤を 100mL 以上の補液に希釈し、600mg あたり 1 時間以上かけて点滴静注すること。なお、それ以上の高濃度ないしは速度で投与しないこと。[「重要な基本的注意」(2) 及び「副作用」(1) 4) の項参照]

(2) 筋肉内投与時

- 1) 筋肉内投与はやむを得ない場合にのみ必要最小限に行うこと。同一部位への反復注射は行わないこと。特に低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児には十分観察を行い慎重に投与すること。
- 2) 神経走行部位を避けること。
- 3) 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり血液の逆流をみた場合は直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。

15. その他の注意

該当資料なし

16. その他

該当資料なし

---

## IX. 非臨床試験に関する項目

---

### 1. 一般薬理<sup>1)</sup>

本剤は種々のブドウ球菌性、連鎖球菌性（腸球菌以外のもの）、ペプトコッカス属、ペプトストレプトコッカス属、バクテロイデス属、マイコプラズマ等に有効で、独特の構造を有する抗生物質である。静菌的作用と殺菌作用に関してはその濃度に関係があるといわれている。本剤も静菌作用を示す濃度、殺菌作用を示す濃度があり、殺菌作用の強い抗生物質である。

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、雄性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  $\mu$ g/mL)、摘出腸管に対する作用では  $10^{-5}$  (100  $\mu$ g/mL)、血管に対する作用では  $10^{-4}$  (1.0  $\mu$ g/mL) 及びそれ以下の濃度でほとんど影響を与えない。この全く影響を与えない薬物濃度が、その抗菌作用：最少有効濃度に比べ 10～100 倍の高濃度である点並びに Mason らのいうように経口投与時の LD<sub>50</sub> が 4000mg/kg 以上である点と思いあわせ、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 で洗浄するとすみやかに消失した。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、0.1～20.0mg/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 1.0mg/kg 適用のさい、まったく変化はないが、5.0mg/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、ほとんど影響を受けなかった。

この様な諸事実から、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惟される。

つぎに、血圧降下作用が、Hexamethonium や迷走神経の切断によって消失し難い事実から、血圧降下作用は末梢血管の拡張に由来するのが一義的であり、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見て困難である。したがって、Acetylcholine 様の降圧作用のある組織 Hormone、さらに言葉をすすめると、peptide の作用に関係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。

## 2. 毒性

### (1) 単回投与毒性試験

急性毒性 (LD<sub>50</sub>, mg/kg)

投与経路	動物種	SD系ラット		ddN系マウス	
		雄	雌	雄	雌
経口		>5,000	>5,000	>5,000	>5,000
皮下		>5,000	>5,000	>5,000	>5,000
筋肉内		>5,000	>5,000	>5,000	>5,000
静脈外		164.2	201.4	156.3	160.6

### (2) 反復投与毒性試験

亜急性・慢性毒性

ラットに 15、30、60mg/kg を 30 日間皮下投与した結果、いずれの投与群においても特記すべき異常所見は認められなかった。

### (3) 生殖発生毒性試験

妊娠マウスに 300～3,000mg/kg を経口投与し、胎仔及び出生仔に対する影響を観察した結果、対照群との間に有意の差を示す所見は認められなかった。

### (4) その他の特殊毒性

◇G. J. White は、lincomycin (LCM) の抗原性について novobiocin (NB)、Penicillin (PC)、erythromycin (EM) と比較しながら検討した。

蛋白結合性を他の 3 剤と比較したところ、人に過敏症を起こさせたとの報告のある EM、PC、NB とは対照的に LCM は不活性であり、その低アレルギー性を示した。ウシ血清アルブミン、ゼラチン、家兎血清、ヒツジ赤血球に対して透析した結果、NB は蛋白と強固に結合し、EM はそれよりやや弱く、LCM、PC は結合が認められなかった。

◇これら 4 抗生剤について、それぞれの感作動物に 0.2～0.4mg を静注したが、致死アナフィラキシーを生じなかった。これに対し、ウシ血清アルブミンでは、CF-1 マウスに 50%致死アナフィラキシーを起こした。

◇抗生剤 4%の正常家兎血清を 37℃、24 時間培養した抗原について、寒天ゲル拡散試験を行った。すなわちこれらの抗原を透析後、抗-抗生剤マウスの血清に対して試験したところ、NB に沈降素を認めた。抗生剤前処理マウスの血清を希釈して、それぞれの抗生剤に感作させたヒツジの赤血球に対して試験する血球凝集素試験によると、LCM によって抗体が生じないが他の 3 抗生剤ではすべて陽性であった。

◇LCM は高分子に結合しているときでもその抗体が検出されなかった。ウシ血清アルブミン配合体を注射して得た CF-1 マウス又は家兎の抗血清は、LCM、LCM-家兎血清培養混合物、卵アルブミンとは融解反応を示した。また、LCM 特異性の抗体は誘導抗原処理ラット血清にも検出されなかった。

## X. 取扱い上の注意等に関する項目

### 1. 有効期間又は使用期限

4年（最終年月を外箱等に記載）

### 2. 貯法・保存条件

室温保存

### 3. 薬剤取扱い上の注意点

処方箋医薬品：注意－医師等の処方箋により使用すること

### 4. 承認条件

該当資料なし

### 5. 包装

リンコシン注射液 300mg：1mL×5 バイアル

リンコシン注射液 600mg：2mL×5 バイアル

リンコシン注射液 1g：3.33mL×5 バイアル

リンコシン注射液 1.5g：5mL×10 バイアル

### 6. 同一成分・同効薬

リンコシンカプセル 250mg

### 7. 国際誕生年月日

1960年1月

### 8. 製造・輸入承認年月日及び承認番号

品名	製造・輸入承認年月日	承認番号
リンコシン注射液 300mg	2007年8月31日	21900AMX01233
リンコシン注射液 600mg		21900AMX01234
リンコシン注射液 1g		21900AMX01232
リンコシン注射液 1.5g		21900AMX01231
(リンコシン注射液： 2008年8月31日 経過措置期間終了)	(1965年4月28日)	((40AM 輸) 第200号)

( ) 内は旧販売名

**9. 薬価基準収載年月日**

リンコシン注射液 300mg: 2007年12月21日

リンコシン注射液 600mg: 2007年12月21日

リンコシン注射液 1g: 2007年12月21日

リンコシン注射液 1.5g: 2007年12月21日

**10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容**

該当資料なし

**11. 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: 2004年9月30日

**12. 再審査期間**

該当しない

**13. 長期投与の可否**

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。

**14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード**

リンコシン注射液 300mg: 6112400A2030

リンコシン注射液 600mg: 6112400A4075

リンコシン注射液 1g: 6112400A7031

リンコシン注射液 1.5g: 6112400A6086

**15. 保険給付上の注意**

該当資料なし

---

## XI. 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) 二宮 敬宇ほか：Jpn J Antibiot 26 (2) : 157, 1973 [L20030528003]
- 2) 松田 静治ほか：産科と婦人科 50 (5) : 1158, 1983 [L20030602053]
- 3) 中富 昌夫ほか：Chemotherapy (Tokyo) 30 (1) : 61, 1982 [L20030602078]
- 4) 石山 俊次ほか：J Antibiot [B] 18 (2) : 120, 1965 [L20030602088]
- 5) 小川 雅規ほか：日本耳鼻咽喉科感染症研究会会誌 2 (1) : 23, 1984 [L20030616265]
- 6) 福嶋 裕行ほか：リンコマイシン系抗生物質製剤 塩酸リンコマイシン注射剤の配合変化  
第2版 札幌 富士書院：2134, 2002 [L20101013015]
- 7) 宮本 剛典ほか編：”抗生物質製剤 リンコマイシン系”混注時の留意点 表解注射薬の配合変化  
菅原 満監修 改訂9版 じほう：469, 2005 [L20051212018]
- 8) 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
- 9) 中沢 昭三ほか：J Antibiot [B] 18 (2) : 56, 1965 [L20030602051]
- 10) Vacek, V. et al. : Cas Lek Cesk 107 (50) : 1505, 1968 [L20030616333]
- 11) 荒谷 春恵ほか：J Antibiot [B] 18 (2) : 61, 1965 [L20030616361]
- 12) Keller, F. et al. : Nephron 30 : 220, 1982 [L49990007431]
- 13) 加藤 康道ほか：J Antibiot [B] 18 (2) : 29, 1965 [L20030616391]
- 14) 柴田 清人：J Antibiot [B] 18 (2) : 126, 1965 [L49990041932]
- 15) 清水 喜八郎ほか：J Antibiot [B] 18 (2) : 82, 1965 [L20030616410]
- 16) 上田 泰ほか：J Antibiot [B] 18 (2) : 40, 1965 [L20030616426]
- 17) 後藤 幸夫ほか：J Antibiot (Tokyo) 18 (2) : 95, 1965 [L20030616274]
- 18) 斎藤 篤：Medical Practice 8 (4) : 531, 1991 [L19970609038]
- 19) White, G. J. : Antimicrob Agents Chemother 1965 : 398, 1966 [L20030616269]

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

---

## XII. 参考資料

---

### 主な外国での発売状況

2020年12月現在、アメリカ、メキシコ、インドネシア、トルコ、イタリア、スペイン、ブラジル、ペルー、エジプト、南アフリカ共和国、アラブ首長国連邦など、世界35の国と地域で承認されている。

---

## XIII. 備考

---

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

