

抗生物質製剤

処方せん医薬品^{注)}

※※日本薬局方 リンコマイシン塩酸塩注射液

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 1.5gLincocin[®] Injection 300mg・600mg・1g・1.5g

貯法：室温保存

使用期限：4年（最終年月をラベル・外箱等に記載）

注)注意－医師等の処方せんにより使用すること

	300 mg	600 mg	1 g	1.5 g
承認番号	21900AMX01233	21900AMX01234	21900AMX01232	21900AMX01231
薬価収載	2007年12月			
販売開始	2008年2月	2008年1月	2008年2月	
国際誕生	1960年1月			

【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

【組成・性状】

1. 組成

1バイアル中：

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

2. 性状

本剤は無色澄明の水性注射液で、その溶液のpH及び浸透圧比は次のとおりである。

pH	3.0～5.5
浸透圧比	約5（生理食塩液対比）

【効能・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

【用法・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600 mg（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300 mg（力価）を1日2～3回、又は1回600 mg（力価）を1日2回筋肉内注射する。

小児には、1回体重1 kgあたり10～15 mg（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。

【使用上の注意】

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- 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）。〕
- 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。〕
- 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。〕
- 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。〕
- 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. 重要な基本的注意

- 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。

- 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〕
- 本剤によるショック、アナフィラキシー様症状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。

3. 相互作用

(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)	併用しても本剤の効果があらわれないと考えられる。	細菌のリボソーム 50S Subunit への親和性が本剤より高い。

(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 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。

4. 副作用

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

- 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様症状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) 皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson症候群) (頻度不明)、中毒性表皮壊死症 (Lyell症候群) (頻度不明)、剥脱性皮膚炎 (頻度不明) : 皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson症候群)、中毒性表皮壊死症 (Lyell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。

(3) 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 ^{注1)}	発疹、そう痒、浮腫、血管神経性浮腫、血清病
血液 ^{注2)}	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 ^{注3)}	黄疸、AST (GOT)、ALT (GPT) の上昇
腎臓 ^{注4)}	窒素血症、乏尿、蛋白尿
神経系	耳鳴、めまい
菌交代症 ^{注5)}	口内炎、カンジダ症

	頻度不明
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	腔炎、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。

5. 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ため、慎重に投与すること。

6. 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。〕

7. 小児等への投与

- 1) 未熟児、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) 未熟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 (99~234 mg/kg) により、Gaspung 症候群が未熟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。〕

8. 適用上の注意

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100 mL以上の補液に希釈し、600 mg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

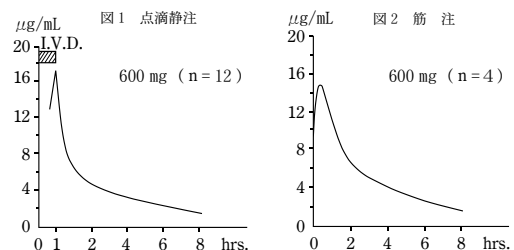
(2) 筋肉内投与時

- 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。特に未熟児、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。

【薬物動態】

1. 血中濃度¹⁾

成人に600 mg (力価) を点滴静注あるいは筋注して得られた血中濃度は図1、2のとおりである。



2. 分布^{1~4)}

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。

3. 排泄⁵⁾

健康成人に600 mg (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。

【薬効薬理】

1. 抗菌作用^{6,7)}

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

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。

【有効成分に関する理化学的知見】

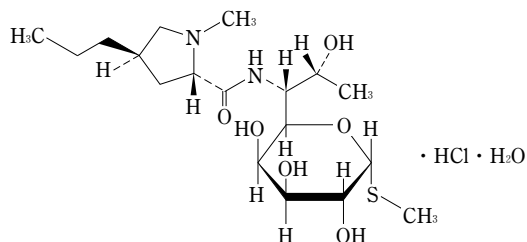
一般名：リンコマイシン塩酸塩水和物 (Lincomycin Hydrochloride Hydrate)

化学名：Methyl 6, 8-dideoxy-6-[(2*S*, 4*R*)-1-methyl-4-propylpyrrolidine-2-carboxamido]-1-thio-D-*erythro*- α -D-*galacto*-octopyranoside monohydrochloride monohydrate

分子式：C₁₈H₃₄N₂O₆S · HCl · H₂O

分子量：461.01

構造式：



性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

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。

【包装】

リンコシン注射液 300 mg：1 mL×5 パイアル

リンコシン注射液 600 mg：2 mL×5 パイアル

リンコシン注射液 1 g：3.33 mL×5 パイアル

リンコシン注射液 1.5 g：5 mL×10 パイアル

【主要文献】

- 1) 松田 静治ほか：産科と婦人科 50(5)：1158, 1983 [L20030602053]
- 2) 中富 昌夫ほか：Chemotherapy (Tokyo) 30(1)：61, 1982 [L20030602078]
- 3) 石山 俊次ほか：J Antibiot [B]. 18(2)：76, 1965 [L20030602088]
- 4) 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]
- 5) 後藤 幸夫ほか：J Antibiot (Tokyo) 18(2)：95, 1965 [L20030616274]
- 6) 中沢 昭三ほか：J Antibiot [B]. 18(2)：10, 1965 [L20030602051]
- 7) 二宮 敬宇ほか：Jpn J Antibiot 26(2)：157, 1973 [L20030528003]

【文献請求先】

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
東京都渋谷区代々木3-22-7