2015年 6月改訂　　日本標準商品分類番号：876131

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2008に準拠して作成

合成ペニシリン製剤

処方箋医薬品

日本薬局方
アモキシシリンカプセル

パセトシン®カプセル125・250

パセトシン®細粒10%
パセトシン®錠250

PASETOCIN® Capsules, Fine Granules, Tablets

剤　　形	硬カプセル剤、細粒剤、錠剤（フィルムコーティング錠）
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	カプセル125：1カプセル中 日局アモキシシリン水和物125mg(力価) カプセル250：1カプセル中 日局アモキシシリン水和物250mg(力価) 細 粒　10 %：1g中 日局アモキシシリン水和物100mg(力価) 錠　　250：1錠中 日局アモキシシリン水和物250mg(力価)
一　般　名	和名：アモキシシリン水和物 洋名：Amoxicillin Hydrate
製造販売承認年月日・ 薬価基準収載・発売年月日	

	カプセル125・250 細粒10%	錠250
製造販売承認年月日	2007年11月21日*	1979年6月7日
薬価基準収載年月日	2008年6月20日*	1981年8月31日
発　売　年　月　日	1975年1月10日	1981年9月1日

＊：販売名変更に伴う

開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元（輸入元）：協和発酵キリン株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	協和発酵キリン株式会社　くすり相談窓口 フリーダイヤル　0120-850-150 電話　03（3282）0069　FAX　03（3282）0102 受付時間　9:00～17:30（土・日・祝日および弊社休日を除く） 医療関係者向けホームページ　http://www.kksmile.com

本IFは2015年1月改訂（第20版：カプセル、第19版：錠、第16版：細粒）の添付文書の記載に基づき改訂した。
最新の添付文書情報は、PMDAホームページ「医薬品に関する情報」
http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要　―日本病院薬剤師会―

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下，添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には，添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では，当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下，日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下，IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後，医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて，平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在，医薬品情報の創り手である製薬企業，使い手である医療現場の薬剤師，双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて，平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな IF 記載要領が策定された。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し，薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な，医薬品の品質管理のための情報，処方設計のための情報，調剤のための情報，医薬品の適正使用のための情報，薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として，日病薬が記載要領を策定し，薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし，薬事法・製薬企業機密等に関わるもの，製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると，製薬企業から提供された IF は，薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに，必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

［IF の様式］

①規格は A4 版，横書きとし，原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し，一色刷りとする。ただし，添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には，電子媒体ではこれに従うものとする。

②IF 記載要領に基づき作成し，各項目名はゴシック体で記載する。

③表紙の記載は統一し，表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし，2 項にまとめる。

［IF の作成］

①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤，注射剤，外用剤）に作成される。

②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。

③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。

④製薬企業の機密等に関するもの，製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。

⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」（以下，「IF 記載要領 2008」と略す）により作成された IF は，電子媒体での提供を基本とし，必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

［IF の発行］

①「IF 記載要領 2008」は，平成 21 年 4 月以降に承認された新医薬品から適用となる。

②上記以外の医薬品については，「IF 記載要領 2008」による作成・提供は強制されるものではない。

③使用上の注意の改訂，再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ，記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2008」においては，従来の主に MR による紙媒体での提供に替え，PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は，電子媒体から印刷して利用することが原則で，医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体の IF については，医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが，IF の原点を踏まえ，医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ，IF の利用性を高める必要がある。また，随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては，IF が改訂されるまでの間は，当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等，あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに，IF の使用にあたっては，最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお，適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることがあり，その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし，薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により，製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて，当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから，記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は，IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり，今後インターネットでの公開等も踏まえ，薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

（2008 年 9 月）

目　次

Ⅰ．概要に関する項目
1.開発の経緯……1
2.製品の治療学的・製剤学的特性……1

Ⅱ．名称に関する項目
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）……4
6.慣用名，別名，略号，記号番号……4
7.CAS 登録番号……4

Ⅲ．有効成分に関する項目
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……6
3.有効成分の確認試験法……6
4.有効成分の定量法……6

Ⅳ．製剤に関する項目
1.剤形……7
2.製剤の組成……8
3.懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意……8
4.製剤の各種条件下における安定性……9
5.調製法及び溶解後の安定性……13
6.他剤との配合変化（物理化学的変化）……13
7.溶出性……14
8.生物学的試験法……14
9.製剤中の有効成分の確認試験法……14
10.製剤中の有効成分の定量法……15
11.力価……15
12.混入する可能性のある夾雑物……15
13.治療上注意が必要な容器に関する情報……15
14.その他……15

Ⅴ．治療に関する項目
1.効能・効果……16
2.用法・用量……17
3.臨床成績……19

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……31
2.薬理作用……31

Ⅶ．薬物動態に関する項目
1.血中濃度の推移・測定法……34
2.薬物速度論的パラメータ……35
3.吸収……36
4.分布……36
5.代謝……38
6.排泄……38
7.透析等による除去率……39

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……40
2.禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）……40
3.効能・効果に関連する使用上の注意とその理由……40
4.用法・用量に関連する使用上の注意とその理由……40
5.慎重投与内容とその理由……40
6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法……41
7.相互作用……41
8.副作用……42
9.高齢者への投与……63
10.妊婦，産婦，授乳婦等への投与……63
11.小児等への投与……63
12.臨床検査結果に及ぼす影響……63
13.過量投与……64
14.適用上の注意……64
15.その他の注意……64

16.その他……65

Ⅸ．非臨床試験に関する項目
1.薬理試験……66
2.毒性試験……67

Ⅹ．管理的事項に関する項目
1.規制区分……68
2.有効期間又は使用期限……68
3.貯法・保存条件……68
4.薬剤取扱い上の注意点……68
5.承認条件等……68
6.包装……68
7.容器の材質……69
8.同一成分・同効薬……69
9.国際誕生年月日……69
10.製造販売承認年月日及び承認番号…69
11.薬価基準収載年月日……69
12.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……70
13.再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容……71
14.再審査期間……72
15.投薬期間制限医薬品に関する情報…73
16.各種コード……73
17.保険給付上の注意……73

ⅩⅠ．文献
1.引用文献……74
2.その他の参考文献……75

ⅩⅡ．参考資料
1.主な外国での発売状況……80
2.海外における臨床支援情報……80

ⅩⅢ．備考
その他の関連資料……82

Ⅰ．概要に関する項目

1.開発の経緯

パセトシン（アモキシシリン水和物）は、イギリスビーチャム社（現：グラクソ・スミスクライン社）で開発された合成ペニシリンで、 アンピシリン水和物のベンゼン環のパラ位に水酸基を導入したものである。

本剤は経口投与で速やかに吸収され高い血中及び尿中濃度が得られることから、感染症治療薬 としての効果が期待され、本邦においては 1971 年 6 月より開発に着手し、1974 年 9 月に承認を得てカプセル剤及び細粒剤が販売された。1979 年 4 月にパセトシン錠 50*、6 月にはパセトシン錠 250 が承認され販売された。

また 1979 年 9 月にはパセトシンカプセル 125・250 に「梅毒」の効能・効果が追加承認された。

2000 年 9 月には、パセトシンカプセル、パセトシン錠 250 に「胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染（アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン、ランソプラゾール３剤併用による除菌療法)」が効能・効果として追加承認され、次いでプロトンポンプインヒビターとしてランソプラゾールのかわりにオメプラゾール（2002 年 4 月）、ラベプラゾールナトリウム（2007 年 1 月）、エソメプラゾール（2011 年 11 月）を用いた除菌療法への適用が、さらに 2007 年 8 月には「アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びプロトンポンプインヒビター併用によるヘリコバクター・ピロリの除菌治療が不成功の場合」の用法・用量が承認された。

2010 年 6 月には、ヘリコバクター・ピロリの 3 剤併用療法（一次除菌療法、二次除菌療法を含む）が、胃 MALT リンパ腫、特発性血小板減少性紫斑病、早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃に対して有効であるという公知の文献等を科学的根拠として、これら 3 疾患が効能効果の適応症に追加承認された。

また、2010 年 6 月にはパセトシンカプセル 125・250 製剤が日本薬局方に収載された。さらに 2012 年 2 月には、ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症に対する小児の最大投与量の変更が承認された。2013 年 2 月には公知の文献等を科学的根拠として、「ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎」に対する効能・効果が追加承認され、現在に至っている。

＊：現在パセトシン錠 50 は販売していない。

2.製品の治療学的・製剤学的特性

1. グラム陽性菌、陰性菌に抗菌力を示す。
2. 経口投与で速やかに吸収され、高い血中濃度が得られる。
3. ほとんど代謝されることなく活性型のまま、高濃度に尿中・胆汁中に排泄される。
4. 胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染に対してアモキシシリン水和物、クラリスロマイシン、プロトンポンプインヒビター（ランソプラゾール、オメプラゾール、ラベプラゾール、エソメプラゾール） ３剤併用により高い除菌効果を示す。
5. 副作用

[ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症]

カプセル、細粒による承認時及び 1977 年 12 月までの副作用頻度調査において、19,052 例中、 副作用及び臨床検査値異常の発現例は 997 例(発現率 5.2%)で、1,245 件であった。

主な副作用 は胃腸障害 898 件(4.7%)、発疹等の皮膚症状 281 件(1.5%)、口内炎・舌炎等 15 件(0.08%)等であった。

[（胃潰瘍・十二指腸潰瘍における）ヘリコバクター・ピロリ感染症]

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びランソプラゾール併用の場合

承認時までに行われた試験では 430 例中 217 例(50.5%)に、市販後の使用成績調査では 3,491 例中 318 例(9.1%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。また、外国で行われた試験では 548 例中 179 例(32.7%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。（再審査終了時）

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びオメプラゾール併用の場合

《カプセル・錠のみ》

承認時及び市販後臨床試験では 513 例中 273 例(53.2%)に、市販後の高齢者に対する特定使用成績調査では 473 例中 40 例(8.5%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。（再審査終了時）

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びラベプラゾールナトリウム併用の場合

承認時までに国内で行われた試験では 508 例中 205 例（40.4%）に、市販後の使用成績調査では 3,789 例中 166 例（4.4%）に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。（再審査終了時）

●アモキシシリン水和物、メトロニダゾール及びプロトンポンプインヒビター併用の場合

《カプセル・錠のみ》

承認時までに国内において臨床試験等の副作用発現頻度が明確となる試験を実施していない。

[胃 MALT リンパ腫・特発性血小板減少性紫斑病・早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎]

《カプセル・錠のみ》

承認時までに国内において臨床試験等の副作用発現頻度が明確となる試験を実施していない。

また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)、**多形紅斑、急性汎発性発疹性膿疱症、紅皮症（剥脱性皮膚炎）、重篤な顆粒球減少、黄疸又は**AST(GOT)，ALT(GPT)**の上昇等、急性腎不全等の重篤な腎障害、偽膜性大腸炎、出血性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎、間質性肺炎、好酸球性肺炎、項部硬直、発熱、頭痛、悪心・嘔吐あるいは意識混濁等を伴う無菌性髄膜炎**が報告されている。

Ⅱ．名称に関する項目

1.販売名

（1）和名：

パセトシンカプセル 125・250
パセトシン細粒 10%
パセトシン錠 250

（2）洋名：

PASETOCIN Capsules 125・250
PASETOCIN Fine Granules 10%
PASETOCIN Tablets 250

（3）名称の由来：

特になし

2.一般名

（1）和名（命名法）：

和名：アモキシシリン水和物（JAN）

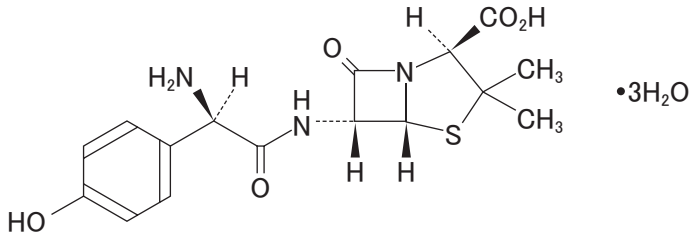
（2）洋名（命名法）：

洋名：Amoxicillin Hydrate（JAN，INN）

（3）ステム：

6-アミノペニシラン酸系抗生物質：-cillin

3.構造式又は示性式



4.分子式及び分子量

分子式：$C_{16}H_{19}N_3O_5S$ ・$3H_2O$

分子量：419.45

5.化学名（命名法）

（2*S*, 5*R*, 6*R*）-6-［（2*R*）-2-Amino-2-（4-hydroxyphenyl）acetylamino］-3, 3-dimethyl-7-oxo-4-thia-1-azabicyclo［3.2.0］heptane-2-carboxylic acid trihydrate（IUPAC）

6.慣用名，別名，略号，記号番号

略名　　：AMPC

開発時治験番号：BRL2333

7.CAS 登録番号

61336－70－7

Ⅲ．有効成分に関する項目

1.物理化学的性質

(1) 外観・性状：

白色～淡黄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にくく、エタノール（95）に極めて溶けにくい。

各種溶媒に対する溶解性

溶　　媒	本品 1g を溶かすに要する溶媒量（mL）
水	292
メタノール	169
エタノール	1,117
エーテル	>10,000

(3) 吸湿性：

相対湿度 75% 25℃、14 日で吸湿量は 0.4%であった。

(4) 融点（分解点），沸点，凝固点：

融点：195℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数：

pka'_1 = 約 2.6（－COOH）

pka'_2 = 約 7.3（$-NH_2$）

pka'_3 = 約 9.7（－OH）

(6) 分配係数：

該当資料なし

(7) その他の主な示性値：

旋光度：〔α〕$^{20}_{D}$＋ 290～＋ 315°（脱水物に換算したもの 0.1g，水，100mL，100mm）

水溶液（1→1,000）の pH：約 4.7

2.有効成分の各種条件下における安定性

<table>
<tr><th colspan="2">試験</th><th>保存条件</th><th>保存期間</th><th>保存容器</th><th>試験結果</th></tr>
<tr><td colspan="2" rowspan="2">長期保存試験</td><td>15℃</td><td>6,12,18,24 ヵ月</td><td rowspan="2">無色透明のガラス瓶
遮光、気密容器</td><td>変化なし</td></tr>
<tr><td>室温</td><td>6,12,18,24 ヵ月</td><td>変化なし</td></tr>
<tr><td rowspan="7">苛酷試験</td><td rowspan="2">加 温</td><td>40℃</td><td>1,2,3,4,6 ヵ月</td><td rowspan="2">無色透明のガラス瓶
遮光、気密容器</td><td>ほとんど変化なし</td></tr>
<tr><td>60℃</td><td>15,30 日</td><td>経時的に着色した。また力価もやや低下した。</td></tr>
<tr><td rowspan="3">加 温 ・
加湿</td><td>25℃ 50%RH</td><td>1,2,3 ヵ月</td><td rowspan="3">無色透明のガラス瓶
遮光、開放</td><td>ほとんど変化なし</td></tr>
<tr><td>40℃ 50%RH</td><td>1,2,3 ヵ月</td><td>ほとんど変化なし</td></tr>
<tr><td>30℃ 82%RH</td><td>1,3 ヵ月</td><td>ほとんど変化なし</td></tr>
<tr><td rowspan="2">曝 光</td><td>太陽光</td><td>1,2,3 日</td><td rowspan="2">無色透明のガラス瓶
遮光、気密容器</td><td>変化なし</td></tr>
<tr><td>室内散光
約 1,000Lx</td><td>1,2,3 ヵ月</td><td>変化なし</td></tr>
</table>

3.有効成分の確認試験法

日局「アモキシシリン水和物」の確認試験による。

4.有効成分の定量法

日局「アモキシシリン水和物」の定量法による。

Ⅳ．製剤に関する項目

1.剤形

（1）剤形の区別，規格及び性状：

■パセトシンカプセル 125・250

品名	色･号数
パセトシンカプセル 125	キャップ淡青色、ボディ白色の 3 号硬カプセル
パセトシンカプセル 250	キャップ淡青色、ボディ白色の 2 号硬カプセル

■パセトシン細粒 10%

外　観	におい	味
だいだい色･細粒	パイナップル臭	甘味

■パセトシン錠 250

直径 (mm)	厚さ (mm)	重量	表面	裏面	側面	色調剤皮
10.1	5.2	0.35	KH 816			淡橙色　フィルムコーティング錠

（2）製剤の物性：

■パセトシン細粒 10%

安息角：35～45°

逃避率：35%以下

粒　度：（850　m 以上）　0%

（850～500　m）　5%以下

（75　m 以下）　10%以下

（3）識別コード：

パセトシンカプセル 125：KH806（カプセル、PTP シートに表示）

パセトシンカプセル 250：KH807（カプセル、PTP シートに表示）

パセトシン錠 250　　：KH816（錠剤本体、PTP シートに表示）

（4）pH，浸透圧比，粘度，比重，無菌の旨及び安定な pH 域等：

該当しない

2.製剤の組成

（1）有効成分（活性成分）の含量：

パセトシンカプセル 125：1 カプセル中に日局アモキシシリン水和物 125mg(力価)を含有する。

パセトシンカプセル 250：1 カプセル中に日局アモキシシリン水和物 250mg(力価)を含有する。

パセトシン細粒 10%　：1g 中に日局アモキシシリン水和物 100mg(力価)を含有する。

パセトシン錠 250　：1 錠中に日局アモキシシリン水和物 250mg(力価)を含有する。

（2）添加物：

■パセトシンカプセル 125・250

日局ステアリン酸マグネシウム

カプセル本体に青色 1 号、日局ラウリル硫酸ナトリウム、日局酸化チタン、日局ゼラチン含有

■パセトシン細粒 10%

日局安息香酸ナトリウム、黄色 5 号、シリコーン樹脂、日局白糖、日局ヒドロキシプロピルセルロース、香料

（本剤 1g 中に日局白糖約 850mg を含有する。）

■パセトシン錠 250

黄色 5 号アルミニウムレーキ、エチルセルロース、日局カルナウバロウ、日局カルメロースカルシウム、グリセリン脂肪酸エステル、日局軽質無水ケイ酸、日局結晶セルロース、日局酸化チタン、日局ステアリン酸マグネシウム、日局トウモロコシデンプン、日局ヒプロメロース（置換度タイプ：2910）

（3）その他：

該当しない

3.懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4.製剤の各種条件下における安定性

■パセトシンカプセル 125・250

保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
室温	33,36 ヵ月	PTP 包装	変化なし
40℃ 50%RH	1,2,3,4,6 ヵ月	PTP 包装	3 ヵ月頃から外観にわずかに黄色味が増加した。
40℃ 90%RH	1,2,3 ヵ月	PTP 包装	2 ヵ月頃から外観に黄色味が増加した。また薄 層クロマトグラフィーにおいて分解物である ペニシロ酸のスポットがわずかに認められた。
室内散光 1,000Lx	1,2,3 ヵ月	PTP 包装	変化なし

■パセトシン細粒 10%

保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
室温	1,3,6,9,12,15,18, 21,24 ヵ月	アルミ分包	変化なし
40℃ 90%RH	1,2,3 ヵ月	無色透明のガラス瓶	変化なし
		アルミ分包	
50℃ 50%RH	1,2,3 ヵ月	無色透明のガラス瓶	変化なし
室内散光 1,000Lx	1,2,3 ヵ月	無色透明のガラス瓶	変化なし

■パセトシン錠 250

保存条件	保存期間	保存形態	試験結果
室温	30,33,36 ヵ月	PTP 包装	変化なし
40℃ 50%RH	1,2,3,6 ヵ月	PTP 包装	6 ヵ月でわずかな力価低下が認められた。
40℃ 80%RH	1,2,3 ヵ月	PTP 包装	含湿度の増加がわずかに認められ、3 ヵ月でわずかな力価低下が認められた。
室内散光 1,000Lx	1,2,3 ヵ月	PTP 包装	変化なし

＜参考＞未包装状態での安定性

■パセトシンカプセル 125

保存条件	試験項目	保存期間				
		試験開始時	30 日	50 日	60 日	90 日
40℃	性状	白色の粉末	変化なし	—	変化なし	変化なし
	含量（%）	100.0	97.7	—	97.9	99.0
25℃ 75%RH	性状	白色の粉末	変化なし	—	変化なし	変化なし
	含量（%）	100.0	98.5	—	98.6	97.8
25℃ 60%RH 1,000Lx	性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	—	変化なし
	含量（%）	100.0	99.2	99.7	—	100.3

■パセトシンカプセル 250

保存条件	試験項目	保存期間				
		試験開始時	30 日	50 日	60 日	90 日
40℃	性状	白色の粉末	変化なし	—	変化なし	変化なし
	含量（%）	100.0	98.3	—	98.7	97.0
25℃ 75%RH	性状	白色の粉末	変化なし	—	変化なし	変化なし
	含量（%）	100.0	100.3	—	97.7	97.8
25℃ 60%RH 1,000Lx	性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	—	変化なし
	含量（%）	100.0	99.4	100.2	—	97.1

■パセトシン錠 250

保存条件	試験項目	保存期間				
		試験開始時	30 日	50 日	60 日	90 日
40℃	性状	淡橙色の錠剤	変化なし	—	変化なし	変化なし
	含量（%）	100.0	95.7	—	95.9	96.8
	硬度（kg）	14.3～16.6	16.4～18.8	—	16.3～18.6	13.0～15.0
25℃ 75%RH	性状	淡橙色の錠剤	変化なし	—	変化なし	変化なし
	含量（%）	100.0	95.9	—	94.8	99.0
	硬度（kg）	14.3～16.6	12.4～13.1	—	12.3～12.8	11.1～13.6
25℃ 60%RH 1,000Lx	性状	淡橙色の錠剤	変化なし	変化なし	—	変化なし
	含量（%）	100.0	96.3	96.4	—	97.6
	硬度（kg）	14.3～16.6	12.2～13.8	12.5～14.3	—	10.8～13.4

＜参考＞脱カプセル後の安定性

■パセトシンカプセル 250

保存条件		試験項目	保存期間			
			試験開始時	7 日	15 日	30 日
グラシン紙分包	40℃	外観	白色結晶性粉末	変化なし	微黄白色結晶性粉末	黄白色結晶性粉末
		重量変化率（%）	0.0	−1.6	−2.1	−2.4
		含量（%）	100.0	101.3	100.6	100.6
	25℃ 75%RH	外観	白色結晶性粉末	変化なし	変化なし	微黄白色結晶性粉末
		重量変化率（%）	0.0	1.2	1.4	1.3
		含量（%）	100.0	98.9	99.4	99.8
	1,000 Lx	外観	白色結晶性粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		重量変化率（%）	0.0	0.6	0.6	0.4
		含量（%）	100.0	100.3	100.2	99.9
シャーレ開放	40℃	外観	白色結晶性粉末	変化なし	微黄白色結晶性粉末	黄白色結晶性粉末
		重量変化率（%）	0.0	−0.4	−0.6	−1.0
		含量（%）	100.0	100.2	100.3	100.1
	25℃ 75%RH	外観	白色結晶性粉末	変化なし	変化なし	微黄白色結晶性粉末
		重量変化率（%）	0.0	0.3	0.3	0.1
		含量（%）	100.0	99.6	99.6	100.1
	1,000 Lx	外観	白色結晶性粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		重量変化率（%）	0.0	0.1	0.1	−0.1
		含量（%）	100.0	99.4	100.1	100.1

＜参考＞粉砕後の安定性

■パセトシン錠 250

保存条件		試験項目	保存期間			
			試験開始時	7 日	15 日	30 日
グラシン紙分包	40℃	外観	淡黄色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	淡黄色のフィルムコーティング片を含む微黄白色の粉末	淡黄色のフィルムコーティング片を含む黄白色の粉末
		重量変化率（%）	0.0	−1.8	−2.1	−2.2
		含量（%）	100.0	98.8	98.5	98.0
	25℃ 75%RH	外観	淡黄色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	淡黄色のフィルムコーティング片を含む微黄白色の粉末
		重量変化率（%）	0.0	2.4	2.4	2.1
		含量（%）	100.0	97.1	97.0	95.8
	1,000 Lx	外観	淡黄色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		重量変化率（%）	0.0	1.0	0.8	0.8
		含量（%）	100.0	98.7	97.7	97.6
シャーレ開放	40℃	外観	淡黄色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	淡黄色のフィルムコーティング片を含む微黄白色の粉末	淡黄色のフィルムコーティング片を含む黄白色の粉末
		重量変化率（%）	0.0	−0.9	−1.0	−1.1
		含量（%）	100.0	98.6	99.2	97.6
	25℃ 75%RH	外観	淡黄色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	淡黄色のフィルムコーティング片を含む微黄白色の粉末
		重量変化率（%）	0.0	1.3	1.5	1.4
		含量（%）	100.0	97.8	97.6	96.5
	1,000 Lx	外観	淡黄色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		重量変化率（%）	0.0	0.6	0.6	0.6
		含量（%）	100.0	97.2	98.1	97.8

5.調製法及び溶解後の安定性

■パセトシン細粒 10%〔水で溶解（懸濁）する場合〕

・調製法

用時水で懸濁する。

・安定性

パセトシン細粒 10%に水を加えて懸濁して 25mg(力価)/mL の濃度に調製した試料を5℃及び室温保存して安定性を検討した結果、5℃ 14 日保存、室温 7 日保存のいずれの条件でも外観変化並びにアモキシシリン水和物の力価低下は認められなかった。

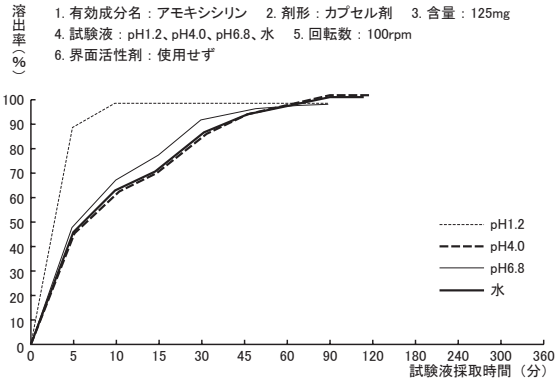
保存条件		保存期間	保存形態	結果
25mg(力価)/mL	5℃	3,7,14 日	透明のガラス瓶	変化なし
	室温	3,7 日		

6.他剤との配合変化（物理化学的変化）

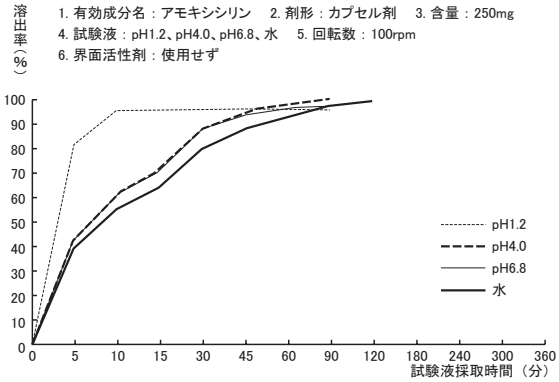
詳細は「XⅢ. 備考　配合変化試験成績」を参照のこと。

7.溶出性

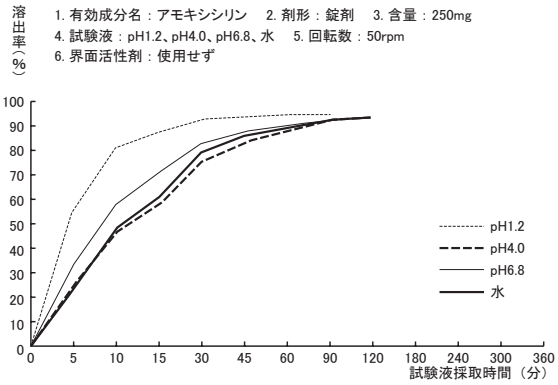
●アモキシシリンカプセル 125mg



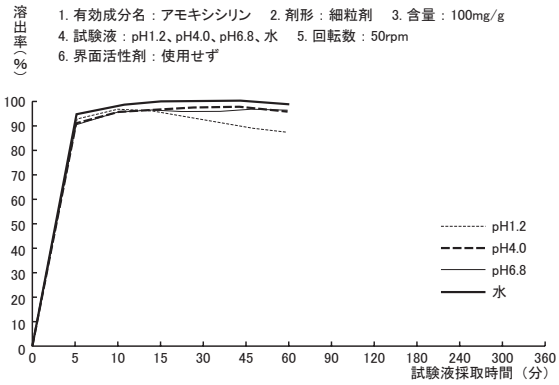
●アモキシシリンカプセル 250mg



●アモキシシリン錠 250mg



●アモキシシリン細粒 10%



8.生物学的試験法

日本薬局方外医薬品規格第四部による。

9.製剤中の有効成分の確認試験法

■パセトシンカプセル

日局「アモキシシリンカプセル」の確認試験による。

■パセトシン錠 250・細粒 10%

(1)カルボニル基の確認 （塩酸ヒドロキシアンモニウム試液、酸性硫酸アンモニウム鉄（Ⅲ）との反応）

(2)紫外可視吸光度測定法　等

10.製剤中の有効成分の定量法

■パセトシンカプセル

日局「アモキシシリンカプセル」の定量法による。

■パセトシン錠 250・細粒 10%

日本薬局方外医薬品規格第四部による。

11.力価

アモキシシリン水和物の力価はアモキシシリン($C_{16}H_{19}N_3O_5S$)としての量を質量(力価)で示す。

■パセトシンカプセル 125・250

125mg カプセルは 1 カプセル中に日局アモキシシリン水和物 125mg(力価)を含有する。

250mg カプセルは 1 カプセル中に日局アモキシシリン水和物 250mg(力価)を含有する。

■パセトシン細粒 10%

1g 中に日局アモキシシリン水和物 100mg(力価)を含有する。

■パセトシン錠 250

1 錠中に日局アモキシシリン水和物 250mg(力価)を含有する。

12.混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13.治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

(容器の材質に関しては「X．7．容器の材質」の項を参照)

14.その他

該当しない

Ⅴ．治療に関する項目

1.効能・効果

■パセトシンカプセル 125・250、パセトシン錠 250

〈適応菌種〉

本剤に感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、淋菌、大腸菌、プロテウス・ミラビリス、インフルエンザ菌、ヘリコバクター・ピロリ、梅毒トレポネーマ

〈適応症〉

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、びらん・潰瘍の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、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、前立腺炎（急性症、慢性症）、精巣上体炎（副睾丸炎）、淋菌感染症、梅毒、子宮内感染、子宮付属器炎、 子宮旁結合織炎、涙嚢炎、麦粒腫、中耳炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、猩紅熱、胃 潰瘍・十二指腸潰瘍・胃 MALT リンパ腫・特発性血小板減少性紫斑病・早期胃癌に対する 内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎

〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

1)進行期胃 MALT リンパ腫に対するヘリコバクター・ピロリ除菌治療の有効性は確立していない。

2)特発性血小板減少性紫斑病に対しては、ガイドライン等を参照し、ヘリコバクター・ ピロリ除菌治療が適切と判断される症例にのみ除菌治療を行うこと。

3)早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃以外には、ヘリコバクター・ピロリ除菌治療による胃癌の発症抑制に対する有効性は確立していない。

4)ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎に用いる際には、ヘリコバクター・ピロリが陽性であること及び内視鏡検査によりヘリコバクター・ピロリ感染胃炎であることを確認すること。

[解説]

1)ヘリコバクター・ピロリ除菌治療の適応となる胃 MALT リンパ腫は、限局期(Lugano 国際会議分類の stage Ⅰ もしくはⅡ$_1$）の症例であり、進行期症例におけるヘリコバクター・ピロリ除菌治療の有効性は確立されていないことから、その旨注意喚起するため設定した。

2)特発性血小板減少性紫斑病に対しては、ガイドライン等を参照し、ヘリコバクター· ピロリ除菌治療が適切と判断される症例にのみ除菌治療を行う旨注意喚起するため設定した。

3)胃癌の抑制効果が検証されているのは、早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃のみであることから、その旨注意喚起するため設定した。

4)ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎の治療にあたっては、ヘリコバクター・ピロリ感染と内視鏡によるヘリコバクター・ピロリ感染胃炎の確認が必要であることから設定した。

■パセトシン細粒 10%

〈適応菌種〉

本剤に感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、淋菌、大腸菌、プロテウス・ミラビリス、インフルエンザ菌、ヘリコバクター・ピロリ、梅毒トレポネーマ

〈適応症〉

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、びらん・潰瘍の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、咽頭・喉頭炎、扁桃 炎、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、前立腺炎（急 性症、慢性症）、精巣上体炎（副睾丸炎）、淋菌感染症、梅毒、子宮内感染、子宮付属器炎、 子宮旁結合織炎、涙嚢炎、麦粒腫、中耳炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、猩紅熱、胃 潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症

2.用法・用量

■パセトシンカプセル 125・250、パセトシン錠 250

[ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症]

成人：アモキシシリン水和物として、通常 1 回 250mg(力価)を 1 日 3～4 回経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

小児：アモキシシリン水和物として、通常 1 日 20～40mg(力価)/kg 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が、1 日量として最大 90mg(力価)/kg を超えないこと。

[ヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎]

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びプロトンポンプインヒビター併用の場合

通常、成人にはアモキシシリン水和物として 1 回 750mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 200mg(力価)及びプロトンポンプインヒビターの 3 剤を同時に 1 日 2 回、7 日間経口投与する。

なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1 回 400mg(力価)1 日 2 回を上限とする。

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びプロトンポンプインヒビター併用によるヘリコバクター・ピロリの除菌治療が不成功の場合

通常、成人にはアモキシシリン水和物として 1 回 750mg(力価)、メトロニダゾールとして 1 回 250mg 及びプロトンポンプインヒビターの 3 剤を同時に 1 日 2 回、7 日間経口投与する。

■パセトシン細粒 10%

[ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症]

成人：アモキシシリン水和物として、通常 1 回 250mg(力価)を 1 日 3～4 回経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

小児：アモキシシリン水和物として、通常 1 日 20～40mg(力価)/kg 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が、1 日量として最大 90mg(力価)/kg を超えないこと。

[胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症]

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びランソプラゾール併用の場合

通常、成人にはアモキシシリン水和物として1回750mg(力価)、クラリスロマイシンとして1回200mg(力価)及びランソプラゾールとして1回30mgの3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。

なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1回400mg(力価)1日2回を上限とする。

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びラベプラゾールナトリウム併用の場合

通常、成人にはアモキシシリン水和物として1回750mg(力価)、クラリスロマイシンとして1回200mg(力価)及びラベプラゾールナトリウムとして1回10mgの3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。

なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1回400mg(力価)1日2回を上限とする。

■パセトシンカプセル125・250、パセトシン錠250

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

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

2)高度の腎障害のある患者には、投与量を減らすか、投与間隔をあけて投与するなど慎重に投与すること。[「慎重投与」の項参照]

3)本剤をヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎に用いる場合、プロトンポンプインヒビターはランソプラゾールとして1回30mg、オメプラゾールとして1回20mg、ラベプラゾールナトリウムとして1回10mg、エソメプラゾールとして1回20mg又はボノプラザンとして1回20mgのいずれか1剤を選択する。

■パセトシン細粒10%

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

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

2)高度の腎障害のある患者には、投与量を減らすか、投与間隔をあけて投与するなど慎重に投与すること。[「慎重投与」の項参照]

[解説]

1)細菌性感染症を効能・効果とする抗菌性物質製剤一般の注意事項である。

2)腎機能障害のみられる患者では、障害の程度に応じて血漿中濃度半減期が延長し、血漿中濃度が長期間持続する可能性があることから設定した。

3)パセトシンカプセル125・250、錠剤250をヘリコバクター・ピロリ感染症に用いる場合のプロトンポンプインヒビターの一般名とその用量を記載した。

3.臨床成績

(1) 臨床データパッケージ（2009 年 4 月以降承認品目）:

該当しない

＜参考＞

・胃 MALT リンパ腫・特発性血小板減少性紫斑病・早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症に対する小児の最大投与量、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎

承認時までに国内において臨床試験を実施しておらず、公知の文献等※を科学的根拠として申請を行った。

※：「ＸＩ. 2. その他の参考文献」の項参照

(2) 臨床効果：

[ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症]

1,335 例の一般臨床試験（カプセル、細粒）における成績概要は次のとおりである。また、3 種の二重盲検比較試験においても本剤の有用性が認められている。[1)]

疾　患　名	有効率	
	有効以上（%）	やや有効以上（%）
表在性皮膚感染症〔毛のう炎、膿痂疹〕	23/35（65.7）	34/35（97.1）
深在性皮膚感染症〔癤、よう、蜂窩織炎、瘭疽、耳癤、鼻癤〕	52/68（76.5）	59/68（86.8）
リンパ管・リンパ節炎〔リンパ節炎〕	8 / 9（88.9）	8 / 9（88.9）
慢性膿皮症〔膿皮症、痤瘡、膿瘍、感染粉瘤〕	19/29（65.5）	25/29（86.2）
外傷・熱傷及び手術創等の二次感染〔創傷および手術後の二次感染〕	11/20（55.0）	15/20（75.0）
びらん・潰瘍の二次感染〔褥瘡〕	3 / 7（42.9）	5 / 7（71.4）
乳腺炎	7 /10（70.0）	8 /10（80.0）
骨髄炎	6 / 9（66.7）	6 / 9（66.7）
咽頭・喉頭炎〔咽頭炎〕	9 /10（90.0）	9 /10（90.0）
扁桃炎	80/95（84.2）	82/95（86.3）
急性気管支炎、慢性呼吸器病変の二次感染〔気管支炎〕	34/44（77.3）	38/44（86.4）
肺炎	58/68（85.3）	61/68（89.7）
膀胱炎	215/270（79.6）	217/270（80.4）
腎盂腎炎〔腎盂腎炎、腎盂炎〕	41/63（65.1）	43/63（68.3）
前立腺炎（急性症、慢性症）	16/19（84.2）	16/19（84.2）
精巣上体炎（副睾丸炎）	2 / 2（－）	2 / 2（－）
淋菌感染症〔淋疾〕	59/68（86.8）	59/68（86.8）
子宮内感染	27/35（77.1）	27/35（77.1）
子宮付属器炎	31/38（81.6）	32/38（84.2）
子宮旁結合織炎	2 / 4（－）	2 / 4（－）
涙嚢炎	2 / 4（－）	4 / 4（－）
麦粒腫	20/32（62.5）	26/32（81.3）
中耳炎	44/54（81.5）	45/54（83.3）
歯周組織炎〔歯齦膿瘍、歯槽骨炎〕	11/14（78.6）	11/14（78.6）
歯冠周囲炎〔智歯周囲炎〕	9 /14（64.3）	12/14（85.7）
顎炎〔急性顎炎、顎骨周囲炎〕	12/18（66.7）	16/18（88.9）
猩紅熱	42/43（97.7）	43/43（100）

1) Chemotherapy, 21（8）：1973 を中心に集計

[（胃潰瘍・十二指腸潰瘍における）ヘリコバクター・ピロリ感染症]

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びランソプラゾール併用の場合

ヘリコバクター・ピロリ陽性の胃潰瘍・十二指腸潰瘍の患者を対象とした除菌の臨床試験における除菌*率は下表のとおりである。

＊培養法及び組織診断法の結果がいずれも陰性

胃潰瘍・十二指腸潰瘍における除菌率（7 日間経口投与）

各薬剤の 1 回投与量		投与回数	除菌率	
			胃潰瘍	十二指腸潰瘍
アモキシシリン水和物 クラリスロマイシン ランソプラゾール	750mg(力価) 200mg(力価) 30mg	2 回/日	87.5% (84/96)	91.1% (82/90)
アモキシシリン水和物 クラリスロマイシン ランソプラゾール	750mg(力価) 400mg(力価) 30mg	2 回/日	89.2% (83/93)	83.7% (82/98)

除菌率は基本解析対象集団を対象とした。（　）内は例数。

なお、米国及び英国で行われたヘリコバクター・ピロリ陽性の十二指腸潰瘍等に対する除菌の臨床試験[注1)] においても、同程度の成績が認められている。

注 1) 各薬剤の投与量、投与期間は下記のとおりであり、国内の承認用法・用量と異なる（「Ⅴ．2．用法・用量」の項参照）。

米国：アモキシシリン水和物として 1 回 1000mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 500mg(力価)及びランソプラゾールとして 1 回 30mg の 3 剤を 1 日 2 回、10 日間又は 14 日間経口投与

英国：アモキシシリン水和物として 1 回 1000mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 250mg(力価)及びランソプラゾールとして 1 回 30mg の 3 剤を 1 日 2 回、7 日間経口投与

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びオメプラゾール併用の場合

《カプセル 125・250，錠 250》

ヘリコバクター・ピロリ陽性の胃潰瘍・十二指腸潰瘍の患者を対象とした国内の臨床試験における除菌率は下表のとおりである。

胃潰瘍・十二指腸潰瘍における除菌率（7 日間経口投与）

各薬剤の 1 回投与量		投与回数	除菌率	
			胃潰瘍	十二指腸潰瘍
アモキシシリン水和物 クラリスロマイシン オメプラゾール	750mg(力価) 400mg(力価) 20mg	2 回/日	75.9% (44/58)	81.8% (45/55)

（　）内は例数。

なお、海外において、活動期又は瘢痕期の十二指腸潰瘍患者、活動期の胃潰瘍患者を対象とした試験[注2)] においても、同程度の成績が得られている。

注 2) 各薬剤の投与量、投与期間は下記のとおりであり、国内の承認用法・用量と異なる（「Ⅴ．2．用法・用量」の項参照）。

アモキシシリン水和物として1回1000mg(力価)、クラリスロマイシンとして1回500mg(力価)及びオメプラゾールとして1回20mgの3剤を1日2回、7日間経口投与。

ヘリコバクター・ピロリ陽性の胃潰瘍・十二指腸潰瘍の患者を対象とした国内の市販後臨床試験における除菌率は下表のとおりである。

胃潰瘍・十二指腸潰瘍における除菌率（7日間経口投与）

各薬剤の1回投与量	投与回数	除菌率	
		胃潰瘍	十二指腸潰瘍
アモキシシリン水和物 750mg(力価) クラリスロマイシン 200mg(力価) オメプラゾール 20mg	2回/日	86.3% (63/73)	75.7% (53/70)
アモキシシリン水和物 750mg(力価) クラリスロマイシン 400mg(力価) オメプラゾール 20mg	2回/日	77.1% (54/70)	82.7% (62/75)

（　）内は例数。

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びラベプラゾールナトリウム併用の場合

ヘリコバクター・ピロリ陽性の胃潰瘍・十二指腸潰瘍の患者を対象とした国内の臨床試験における除菌率は下表のとおりである。

胃潰瘍・十二指腸潰瘍における除菌率（7日間経口投与）

各薬剤の1回投与量	投与回数	除菌率	
		胃潰瘍	十二指腸潰瘍
アモキシシリン水和物 750mg(力価) クラリスロマイシン 200mg(力価) ラベプラゾールナトリウム 10mg	2回/日	87.7% (57/65)	83.3% (45/54)
アモキシシリン水和物 750mg(力価) クラリスロマイシン 400mg(力価) ラベプラゾールナトリウム 10mg	2回/日	89.7% (61/68)	87.8% (36/41)

（　）内は例数。

なお、海外で行われたヘリコバクター・ピロリ陽性の胃・十二指腸潰瘍等に対する除菌の臨床試験[注3)]においても、同程度の成績が得られている。

注3)各薬剤の投与量、投与期間は下記のとおりであり、国内の承認用法・用量とは異なる（「V．2．用法・用量」の項参照）。
アモキシシリン水和物として1回1000mg(力価)、クラリスロマイシンとして1回500mg(力価)及びラベプラゾールナトリウムとして1回20mgの3剤を1日2回、7日間経口投与

＜参考＞

・胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症（二次除菌）

《カプセル 125・250，錠 250》

承認時までに国内において臨床試験を実施しておらず、公知の文献等※を科学的根拠として申請を行った。

アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン、プロトンポンプインヒビター 3 剤併用による一次除菌不成功例に対し、アモキシシリン水和物、メトロニダゾール、プロトンポンプインヒビター 3 剤併用による二次除菌を施行した国内 10 文献※の結果、いずれの報告においても 80%を超える除菌効果が得られた。 また、そのうちの副作用の発現頻度が算出可能な 3 文献における副作用の発現頻度は、8.3%（5/60）、11.3%（7/62）、0%（0/18）であり、下痢・軟便、舌の荒れ、悪心、しびれ感が認められた。

※：「ＸＩ. 2. その他の参考文献」の項参照

・胃 MALT リンパ腫・特発性血小板減少性紫斑病・早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリ感染症

《カプセル 125・250，錠 250》

承認時までに国内において臨床試験を実施しておらず、公知の文献等※を科学的根拠として申請を行った。

参考として、国内のエビデンス（承認用法・用量内）の一部を記す。

※：「ＸＩ. 2. その他の参考文献」の項参照

①胃 MALT リンパ腫[2)]

ヘリコバクター・ピロリ陽性の胃 MALT リンパ腫患者を対象とした除菌の臨床試験における有効性は下表のとおりである。

胃 MALT リンパ腫における除菌率及び有効性（7 日間経口投与）

各薬剤の 1 回投与量	投与回数	除菌率	有効性(腫瘍縮小効果) 寛解率
アモキシシリン水和物 750mg(力価) クラリスロマイシン 200mg(力価) ランソプラゾール 30mg	2 回/日	施行後 6 ヶ月以内 78.6%*(11/14) 施行後 12 ヶ月以内 92.9%*(13/14)	**Hp 陽性例** [除菌成功例] -評価①： 除菌治療後 6 ヶ月以内 63.6%*(7/11) 除菌治療後 12 ヶ月以内 69.2%*(9/13) -評価②： 除菌治療後 12 ヶ月以内 84.6%*(11/13) [除菌不成功例] -評価①： 除菌治療後 6 ヶ月以内 66.7%*(2/3) 除菌治療後 12 ヶ月以内 100%*(1/1) -評価②： 除菌治療後 12 ヶ月以内 100%*(1/1) [除菌施行例] -評価①： 除菌治療後 6 ヶ月以内 64%(9/14) 除菌治療後 12 ヶ月以内 71%(10/14) -評価②： 除菌治療後 12 ヶ月以内 86%(12/14)

(　)内は例数

＊：例数より算出

腫瘍縮小効果の評価の定義

評価①：内視鏡的所見に基づく complete remission（CR）

評価②：Wotherspoon の grade に基づく histological remission=grade/score 0、1、2 又は 3

2) Shiozawa, E. et al. : J. Gastroenterol. Hepatol., 24（2）: 307, 2009

②特発性血小板減少性紫斑病[3)]

ヘリコバクター・ピロリ陽性の特発性血小板減少性紫斑病の患者を対象とした除菌の臨床試験における有効性は下表のとおりである。

特発性血小板減少性紫斑病における除菌率及び有効性（7 日間経口投与）

各薬剤の 1 回投与量	投与回数	除菌率	有効性(腫瘍縮小効果) 寛解率
アモキシシリン水和物 750mg(力価) クラリスロマイシン　200mg(力価) ランソプラゾール　30mg	2 回/日	84%(27/32)	[Hp 陽性例] 除菌成功例 56%(15/27) -GR 率* 37%(10/27) -PR 率* 19%(5/27) 除菌不成功例 0%(0/5) 除菌非施行例 0%(0/7) [Hp 陰性例(全例除菌非施行例] 除菌非施行例 0%(0/14)

(　)内は例数

＊：GR(good response)　：血小板増加>100×10³/μL 又は血小板数が正常範囲(>150×10³/μL)

：PR(partial response)：血小板増加 50-100×10³/μL

3) Sato, R. et al. : Arch. Intern. Med., 164（17）: 1904, 2004

③早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃[4)]

ヘリコバクター・ピロリ陽性の早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃の患者を対象とした除菌の臨床試験における有効性は下表のとおりである。

早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃における除菌率及び有効性（7 日間経口投与）

各薬剤の 1 回投与量	投与回数	除菌率	有効性
アモキシシリン水和物 750mg(力価) クラリスロマイシン 200mg(力価) ランソプラゾール 30mg	2 回/日	75% (203/272)	[異時性胃癌発生例数] 除菌施行群：9 例 （ITT[a)] 272 例、訂正 ITT[b)] 255 例）[c)] 除菌非施行群：24 例 （ITT[a)] 272 例、訂正 ITT[b)] 250 例）[d)] [異時性胃癌発生のオッズ比] 0.353（p=0.009） （ITT[a)]）［95%C.I.：0.161-0.775］ [異時性胃癌の 1000 例・年あたりの発生] 除菌施行群：14.1 例 除菌非施行群：40.5 例 ハザード比　0.339（p=0.003） （訂正 ITT[b)]）［ 95%C.I.：0.157-0.729］

a)：無作為化されたすべての患者集団

b）：無作為化された患者のうち、無作為化後少なくとも１回、経過観察された患者集団
c）：観察期間の中央値 1076 日（34-1277 日）
d）：観察期間の中央値 1041 日（48-1270 日）

4) Fukase, K. et al. : Lancet, 372（9636）: 392, 2008

・ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎

《カプセル 125・250，錠 250》

承認時までに国内において臨床試験を実施しておらず、公知の文献等※を科学的根拠として申請を行った。
参考として、国内のエビデンス（承認用法・用量内）の一部を記す。

※：「ＸＩ. 2. その他の参考文献」の項参照

①消化性潰瘍の治癒が確認されたヘリコバクター・ピロリ陽性患者における有効性[5)]
消化性潰瘍の治癒が確認されたヘリコバクター・ピロリ陽性患者（日本人）を対象とした除菌の臨床試験における有効性は下表のとおりである。

消化性潰瘍の治癒が確認されたヘリコバクター・ピロリ陽性患者における除菌率および有効性

各薬剤の１日投与量	投与期間	除菌率	有効性（組織学的評価）※
低用量もしくは高用量 【低用量】 オメプラゾール：40mg アモキシシリン：1500mg クラリスロマイシン：800mg 【高用量】 オメプラゾール：40mg アモキシシリン：2000mg クラリスロマイシン：1000mg	１週間	施行終了６週間後 【低用量群】 78.8% （95%C.I.: 70.1-85.9%） 【高用量群】 83.0% （95%C.I.: 74.8-89.5%）	**炎症** [除菌成功例] -幽門洞中央 施行開始前: 80% 施行終了６週間後: 3% -胃体上部 施行開始前: 46% 施行終了６週間後: 0% [除菌不成功例] -幽門洞中央 施行開始前: 65% 施行終了６週間後: 27% -胃体上部 施行開始前: 52% 施行終了６週間後: 12%
			好中球活性 [除菌成功例] -幽門洞中央 施行開始前: 36% 施行終了６週間後: 0% -胃体上部 施行開始前: 35% 施行終了６週間後: 0% [除菌不成功例] -幽門洞中央 施行開始前: 27% 施行終了６週間後: 12% -胃体上部 施行開始前: 46% 施行終了６週間後: 3%

各薬剤の１日投与量	投与期間	除菌率	有効性（組織学的評価）※
低用量もしくは高用量 【低用量】 オメプラゾール：40mg アモキシシリン：1500mg クラリスロマイシン：800mg 【高用量】 オメプラゾール：40mg アモキシシリン：2000mg クラリスロマイシン：1000mg	１週間	施行終了６週間後 【低用量群】 78.8% （95%C.I.: 70.1-85.9%） 【高用量群】 83.0% （95%C.I.: 74.8-89.5%）	萎縮 [除菌成功例] -幽門洞中央 施行開始前: 23% 施行終了６週間後: 14% 施行終了30週間後: 13% -胃体上部 施行開始前: 4% 施行終了６週間後: 3% 施行終了30週間後: 0% [除菌不成功例] -幽門洞中央 施行開始前: 43% 施行終了６週間後: 24% 施行終了30週間後: 48% -胃体上部 施行開始前: 10% 施行終了６週間後: 7% 施行終了30週間後: 3%

※：重症度の評価は、The Updated Sydney System に従って評価した。数値は、"moderate"あるいは"marked"の割合を示している。

5) Watanabe, H. et al. : J. Int. Med. Res., 31（5）: 362, 2003

②ヘリコバクター・ピロリ陽性患者における有効性[6)]

ヘリコバクター・ピロリ陽性患者（日本人）を対象とした除菌の臨床試験における有効性は下表のとおりである。

ヘリコバクター・ピロリ陽性患者における除菌率および有効性

各薬剤の１日投与量	投与期間	除菌率	有効性（組織学的評価）※※
オメプラゾール：40mg ランソプラゾール：60mg ラベプラゾール：20mg アモキシシリン：1500mg クラリスロマイシン：400mg	７日間	91.0%(294/323)※	[除菌成功例（30例）] （観察期間10年間） -萎縮スコア 除菌６ヵ月～６年後で有意に減少した。 -腸上皮化生スコア 観察期間を通してスコアは非常に変動していたが、胃体部小弯側のスコアは除菌６年後で有意に減少した。 -炎症スコア 除菌６ヵ月で有意に減少した。 -活動性スコア 除菌６ヵ月で有意に減少した。

各薬剤の1日投与量	投与期間	除菌率	有効性（組織学的評価）※※
オメプラゾール：40mg ランソプラゾール：60mg ラベプラゾール：20mg アモキシシリン：1500mg クラリスロマイシン：400mg	7日間	91.0%(294/323)※	[除菌不成功例（21例)] (除菌後中央値7.2年時点) -萎縮スコア 除菌前と比較し、有意な変化は認められなかった。 -腸上皮化生スコア 除菌前と比較し、有意な変化は認められなかった。

※：例数より算出

※※：胃の5箇所から生検標本を採取し、The Updated Sydney Systemに従って胃炎の程度を評価した。

6) Kodama, M. et al. : J. Gastroenterol., 47（4）: 394, 2012

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験：

・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びランソプラゾール併用の場合（胃潰瘍・十二指腸潰瘍）

単回経口投与試験として、健康成人男子(6例)を対象にクラリスロマイシン400mg単剤、ランソプラゾール30mg/アモキシシリン水和物1,000mg(力価)の2剤及びランソプラゾール30mg/アモキシシリン水和物1,000mg(力価)/クラリスロマイシン400mg(力価)の3剤を2日間ずつ休薬して投与した。また、反復経口投与試験として、健康成人男子(実薬群6例、プラセボ群3例)を対象にランソプラゾール30mg/アモキシシリン水和物1,000mg(力価)/クラリスロマイシン400mg(力価)の3剤を1日2回7日間投与した。その結果、ランソプラゾール30mg/アモキシシリン水和物1,000mg(力価)/クラリスロマイシン400mg(力価)の忍容性は良好であると判断された。

注)本邦で承認されている用法・用量（ヘリコバクター・ピロリ感染症）：
通常、成人にはアモキシシリン水和物として1回750mg(力価)、クラリスロマイシンとして1回200mg(力価)及びプロトンポンプインヒビターの3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1回400mg(力価)1日2回を上限とする。

・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びオメプラゾール併用の場合（胃潰瘍・十二指腸潰瘍）

オメプラゾール20mg/アモキシシリン水和物1,000mg(力価)/クラリスロマイシン400mg(力価)の3剤を健康成人男子12例に単回又は1日2回、7日間経口反復投与した。また、オメプラゾール20mg/アモキシシリン水和物750mg(力価)/クラリスロマイシン400mg(力価)の3剤又はオメプラゾール20mg/アモキシシリン水和物1,000mg(力価)/クラリスロマイシン500mg(力価)の3剤を健康成人12例に1日2回、7日間経口反復投与した。その結果、オメプラゾール20mg/アモキシシリン水和物1,000mg(力価)/クラリスロマイシン400mg(力価)反復投与時及びオメプラゾール20mg/アモキシシリン水和物1,000mg(力価)/クラリスロマイシン500mg(力価)投与時に、各々1例ずつ肝機能検査値異常のため投与を中止した。また、下痢等の消化器症

状、臨床検査値異常変動がみられたが、いずれも一過性であり、ほとんどの症例で処置なく消失しており、特に忍容性に問題はないと判断された。

注)本邦で承認されている用法・用量（ヘリコバクター・ピロリ感染症）：
通常、成人にはアモキシシリン水和物として1回750mg(力価)、クラリスロマイシンとして1回200mg(力価)及びプロトンポンプインヒビターの3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1回400mg(力価)1日2回を上限とする。

・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びラベプラゾールナトリウム併用の場合

健康成人男性(20例)を対象にラベプラゾールナトリウム20mg、アモキシシリン水和物750mg(力価)及びクラリスロマイシン400mg(力価)を1日2回7日間反復投与した。その結果、味覚異常、軟便、水様便、腹痛、消化不良などが発現したがいずれも軽度であった。また、重篤な有害事象は認められなかった。3剤併用投与に起因した臨床的に問題となる重篤な副作用は認められなかったことから、3剤併用投与の忍容性に問題はないと判断した。

注)本邦で承認されている用法・用量（ヘリコバクター・ピロリ感染症）：
通常、成人にはアモキシシリン水和物として1回750mg(力価)、クラリスロマイシンとして1回200mg(力価)及びプロトンポンプインヒビター*の3剤を同時に1日2回、7日間経口投与する。なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1回400mg(力価)1日2回を上限とする。
＊：ラベプラゾールナトリウムは1回10mg

(4) 探索的試験：用量反応探索試験：

該当資料なし

(5) 検証的試験：

1) 無作為化並行用量反応試験：

該当資料なし

2) 比較試験：

・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びオメプラゾール併用の場合（胃潰瘍・十二指腸潰瘍）

*H.pylori*陽性の胃潰瘍又は十二指腸潰瘍患者225例を対象として、オメプラゾール20mg/アモキシシリン水和物750mg(力価)/クラリスロマイシン400mg(力価)を1日2回7日間投与(低用量群)の除菌効果及び安全性を確認するため、オメプラゾール20mg/アモキシシリン水和物1,000mg(力価)/クラリスロマイシン500mg(力価)1日2回7日間投与(高用量群)を対照に第Ⅲ相二重盲検比較試験を実施した。その結果、低用量群の除菌率は78.8%(89/113例)、高用量群の除菌率は83.0%(93/112)であった。

両群間に有害事象の発現頻度や内容に差はみられず、重篤な有害事象が認められなかったことより、両群ともに忍容性に特に問題はないと考えられた。

胃潰瘍・十二指腸潰瘍における除菌率（7 日間経口投与）

各薬剤の 1 回投与量	投与回数	除菌率		
		胃潰瘍	十二指腸潰瘍	計
●低用量群 アモキシシリン水和物　750mg(力価) クラリスロマイシン　400mg(力価) オメプラゾール　20mg	2 回/日	75.9% （44/58）	81.8% （45/55）	78.8% （89/113）
●高用量群 アモキシシリン水和物 1,000mg(力価) クラリスロマイシン　500mg(力価) オメプラゾール　20mg	2 回/日	75.4% （43/57）	90.9% （50/55）	83.0% （93/112）

（　）内は例数

注）本邦で承認されている用法・用量（ヘリコバクター・ピロリ感染症）：
通常、成人にはアモキシシリン水和物として 1 回 750mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 200mg(力価)及びプロトンポンプインヒビターの 3 剤を同時に 1 日 2 回、7 日間経口投与する。なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1 回 400mg(力価)1 日 2 回を上限とする。

3) 安全性試験：

該当資料なし

4) 患者・病態別試験：

＜参考＞

・小児への効果

小児におけるヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症に対する最大投与量に関しては、承認時までに国内において臨床試験を実施しておらず、公知の文献等を科学的根拠として申請を行った（「ＸＩ. 2. その他の参考文献」の項参照）。

(6) 治療的使用：

1) 使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）：

・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びオメプラゾール併用の場合（胃潰瘍・十二指腸潰瘍）〔特定使用成績調査〕

高齢者(65 歳以上)におけるアモキシシリン水和物、クラリスロマイシン、オメプラゾールによる 3 剤併用療法の安全性及び有効性を確認することを目的とした特定使用成績調査を実施した。

安全性評価対象症例 473 例のうち、再審査対象効能外症例及び検査未実施症例の計 79 例を除外した有効性評価対象症例 394 例のうち、*H.pylori* が消失したと判定した症例は 330 例、除菌率は 83.8%であった。

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要：

該当しない

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

1.薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

合成ペニシリン系抗生物質

2.薬理作用

（1）作用部位・作用機序：

●作用部位

細菌の細胞壁

●作用機序

1. ペニシリンは細菌細胞壁ムレイン合成の最終段階である架橋反応に関与する酵素(peptidoglycan transpeptidase と D-alanin carboxypeptidase)の活性中心に結合し阻害(不活化)することにより、細菌細胞に特有な細胞壁の合成が阻害される。
2. β－ラクタマーゼに対する安定性[7)]

   アモキシシリン水和物は Penicillinase によってアンピシリンと同程度加水分解され不安定であるが、Cephalosporinase に対してはアンピシリンと同様安定であった。
3. 効果は殺菌的[8)]

   殺菌作用はアンピシリン水和物より強い。
4. 感受性菌の種類及び MIC[8~11)]

グラム陽性菌及びグラム陰性菌に広い抗菌作用を示し、特にブドウ球菌属、レンサ球菌属、大腸菌、インフルエンザ菌等に強い抗菌力を示す。また、抗トレポネーマ作用も認められている。

菌　名			MIC(g/mL)
グラム陽性菌	黄色ブドウ球菌属	*Staph. aureus* 209PJC Smith 寺島 Neuman No.80(PC－R)	0.1 0.1 0.39 0.39 >100
	表皮ブドウ球菌属	*Staph. epidermidis*	0.2
	レンサ球菌属	*Strept. pyogenes* S_{23} Cook	0.013 0.025
	腸球菌属	*Strept. faecalis*	1.56
	緑色レンサ球菌属	*Strept. viridans*※	1.56
	肺炎球菌	*Strept. pneumoniae* type Ⅰ type Ⅱ,Ⅲ	0.025 0.05
	八連球菌属	*Sarcina lutea*※ PCI 1001	＜ 0.013

菌　名				MIC(g/mL)
グラム陽性菌	枯草菌	*Bacillus subtilis*※	PCI 219	0.78
	炭疽菌	*Bacillus anthracis*※		0.05
	ジフテリア菌	*Coryneb. diphtheriae*※		0.39
	破傷風菌	*Clostridium tetani*※		0.39
	ウェルシュ菌	*Clostridium perfringens*※		0.39
グラム陰性菌	淋菌	*Neisseria gonorrhoeae*		0.05
	髄膜炎菌	*Neisseria meningitidis*※		0.1
	大腸菌	*Escherichia coli*	NIHJC NIH	6.25 1.56
	エロゲネス菌	*Enterobacter aerogenes*※		50
	腸チフス菌	*Salmonella typhi*※		0.39
	パラチフス菌	*Salmonella paratyphi*※	A B	0.2 0.39
	腸炎菌	*Salmonella enteritidis*※		3.12
	赤痢菌　A群 B群 C群 D群	*Sh. dysenteriae*※ *Sh. flexneri*※ *Sh. boydii*※ *Sh. sonnei*※	EW-7 2a EW-28 EW-33	6.25 3.12 12.5 1.56
	肺炎桿菌	*Klebsiella pneumoniae*※		0.78
	プロテウス・ミラビリス	*Proteus mirabilis*	1287	3.12
	プロテウス・ブルガリス	*Proteus vulgaris*※		50
	モルガン菌	*Proteus morganii*※	Kono	＞100
	緑膿菌	*Ps. aeruginosa*※	No.12	＞100
	インフルエンザ菌	*Haemophilus influenzae*		0.25

※パセトシンの適応外菌種

5. 交叉耐性[12)]

S. aureus、*E. coli*、*K. pneumoniae* においてアモキシシリン水和物、アンピシリン間で交叉耐性が認められている。

6. ヘリコバクター・ピロリに対する作用[13)]

1) 殺菌的な抗菌作用を示す。

2) アモキシシリン水和物とクラリスロマイシンとの併用における抗菌力には、相乗又は相加作用が認められ、いずれの菌株においても拮抗作用は認められていない。

3) 臨床分離ヘリコバクター・ピロリ

MIC_{50}　0.025　g/mL　　MIC_{80}　0.1　g/mL

(2) 薬効を裏付ける試験成績：

1.「Ⅵ. 2. (1) 作用部位・作用機序」の項を参照。

2. ヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎に対するアモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びプロトンポンプインヒビターの 3 剤療法

1) アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンともにランソプラゾールとの併用により、経口投与後の胃組織中濃度の上昇が認められる（ラット）。

2) プロトンポンプインヒビターの強力な胃酸分泌抑制作用により胃内 pH を上昇させることにより、アモキシシリン水和物及びクラリスロマイシンの抗菌活性が高まると考えられる。

(3) 作用発現時間・持続時間：

該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

1.血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度：

疾患、起炎菌により異なるため特定できない。

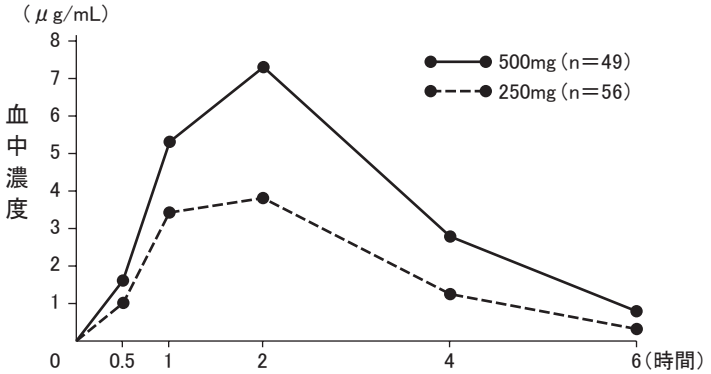
(2) 最高血中濃度到達時間：

「Ⅶ. 1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度：

●アモキシシリン水和物単剤投与時 [14)]

健常人にアモキシシリン 250mg(力価)及び 500mg(力価)[注)] を経口投与した場合の血中濃度の推移は下図のとおりである。



測定時間（時間）		0.5	1	2	4	6
血中濃度（ g/mL）	250mg	1.03	3.43	3.82	1.25	0.33
	500mg	1.60	5.29	7.28	2.83	0.80

注)アモキシシリン水和物としてのヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症の承認用量(成人)は1回 250mg(力価)である。(「Ⅴ. 2. 用法・用量」の項参照)

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びランソプラゾール併用の場合

健常人 6 名にアモキシシリン水和物として 1 回 1000mg(力価)[注)]、クラリスロマイシンとして 1 回 400mg(力価)及びランソプラゾールとして 1 回 30mg の 3 剤を同時に経口投与(絶食下)した場合、アモキシシリン水和物の薬物動態パラメータは下表のとおりである。

C_{max}（ g/mL）	T_{max}（hr）	$T_{1/2}$（hr）	AUC（ g・hr/mL）
10.05 ± 1.62	1.67 ± 0.52	1.0 ± 0.2	29.04 ± 7.15

mean ± S.D.

なお、3 剤併用時の 3 剤各々の血中濃度は単独投与時の血中濃度とほぼ同様の推移を示す。また、健常人 7 名に 3 剤を同様の用量で同時に 1 日 2 回 7 日間反復経口投与したとき、薬物動態に変化は認められていない。

注)アモキシシリン水和物としての承認用量は 1 回 750mg(力価)であり、承認用量と異なる（「V. 2. 用法・用量」の項参照)。

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びオメプラゾール併用の場合

《カプセル 125・250，錠 250》

健常人にアモキシシリン水和物として 1 回 750mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 400mg(力価)及びオメプラゾールとして 1 回 20mg の 3 剤を同時に 1 日 2 回 7 日間反復経口投与した場合、最終投与後のアモキシシリン水和物の薬物動態パラメータは下表のとおりである。

C_{max}（ g/mL)	T_{max}（hr)	$T_{1/2}$（hr)	$AUC_{0\sim\infty}$（ g・hr/mL)
5.6878 ± 1.7574	4.2 ± 1.1	1.15 ± 0.14*	27.069 ± 10.002*

n=11、mean ± S.D.、＊：n=3

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びラベプラゾールナトリウム併用の場合

健常人にアモキシシリン水和物として 1 回 750mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 400mg(力価)及びラベプラゾールナトリウムとして 1 回 20mg を 1 日 2 回 7 日間反復経口投与した場合、アモキシシリン水和物の薬物動態パラメータは下表のとおりである。ただし、投与第 1 日目及び第 7 日目は 1 日 1 回朝経口投与(絶食下)とした(計 12 回)。

C_{max}（ g/mL)	T_{max}（hr)	$T_{1/2}$（hr)	$AUC_{0\sim12}$（ g・hr/mL)
9.86 ± 2.79	1.63 ± 0.37	1.09 ± 0.19*	25.82 ± 5.41*

n=19、mean ± S.D.、＊：n=16

(4) 中毒域：

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響：

該当資料なし

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因：

該当資料なし

2.薬物速度論的パラメータ

(1) コンパートメントモデル：

該当資料なし

(2) **吸収速度定数**：

該当資料なし

(3) **バイオアベイラビリティ**：

＜参考：外国人のデータ＞[15, 16]

75～90%

(4) **消失速度定数**：

該当資料なし

(5) **クリアランス**：

該当資料なし

(6) **分布容積**：

＜参考：外国人のデータ＞[16]

0.36 L/kg

(7) **血漿蛋白結合率**[17]：

ヒト血清蛋白との結合率は寒天平板拡散法で 25.0%、平衡透析法で 16.6%、ゲル濾過法で 22.4%であった。

3.吸収

吸収部位：小腸上部

吸 収 率：＜参考：外国人のデータ＞[15, 16] 75～90%

腸間循環：該当資料なし

4.分布

(1) **血液－脳関門通過性**：

＜参考：マウスでのデータ＞[18]

アモキシシリン水和物 300mg/kg(力価)をマウスに経口投与した場合、2 時間後の脳内濃度は 5 g/mL であった。

(2) **血液－胎盤関門通過性**[19]：

アモキシシリン水和物 250mg(力価)及び 500mg(力価)[注] を妊婦 17 名に経口投与した場合の臍帯血濃度ピークはそれぞれ 0.7 g/mL(2 時間)，1.8 g/mL(2.5 時間)で、このとき母体血中濃度はそれぞれ 3.1，7.1 g/mL であった。

注)アモキシシリン水和物としてのヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症の承認用量(成人)は 1 回 250mg(力価)である。(「Ⅴ．2．用法・用量」の項参照)

(3) **乳汁への移行性**[19, 20]：

授乳婦 6 名にアモキシシリン水和物 500mg(力価)[注] 単回投与後の母乳中移行は投与 2～6 時間後で trace～0.6 g/mL であった。

注)アモキシシリン水和物としてのヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症の承認用量(成人)は 1 回 250mg(力価)である。(「V．2．用法・用量」の項参照)

(4) **髄液への移行性**：

＜参考：外国人のデータ＞[21]

結核性髄膜炎の患者 9 名にアモキシシリン水和物 1000mg(力価)[注] 経口投与 2 時間後の髄液中濃度は 0.1～1.5 g/mL であった。

注)アモキシシリン水和物としてのヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症の承認用量(成人)は 1 回 250mg(力価)である。(「V．2．用法・用量」の項参照)

(5) **その他の組織への移行性**：

1) **喀痰内濃度**[22]

患者にアモキシシリン水和物 500mg(力価)[注] 経口投与後の経時的な喀痰内濃度は、膿性痰、粘液漿液性痰で 0.05～0.6 g/mL とかなり高値を示すものが多いのに対して膿粘液性痰、粘液性痰では 0.05～0.2 g/mL と低値を示した。4～8 時間経過後も喀痰内濃度は高値を示した。

2) **骨髄内濃度**[23]

健常人 12 名にアモキシシリン水和物 500mg(力価)[注] を空腹時に経口投与した場合、骨髄内濃度は投与後 2 時間値にピークがあり、8.1 g/mL であった。このときの対血中濃度比は 0.84 であった。

3) **扁桃組織濃度**[24]

患者にアモキシシリン水和物 125mg(力価)[注] 及び 250mg(力価)を経口投与し、2 時間後摘出した扁桃の組織内濃度は、125mg 投与時 0.02～0.27 g/g(3 名)、250mg 投与時 0.04～0.57 g/g(5 名)であった。

4) **上顎洞粘膜組織濃度**[24]

患者にアモキシシリン水和物 250mg(力価)及び 500mg(力価)[注] を経口投与し、2 時間後摘出した上顎洞粘膜の組織濃度は、250mg 投与時 1.20,1.56 g/g(2 名)、500mg 投与時 0.33,1.35 g/g (2 名)であった。

5) **体組織への分布**

＜参考：ラットでのデータ＞[25]

アモキシシリン水和物 100mg/kg(力価)をラットに経口投与した場合、1 時間後の体組織への分布は肝臓＞腎臓＞血清＞脾臓＞肺＞心臓の順であった。

注)アモキシシリン水和物としてのヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症の承認用量(成人)は 1 回 250mg(力価)である。(「V．2．用法・用量」の項参照)

5.代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路[25]：

ほとんどが未変化体のまま尿中に排泄される。

(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[25]：

健常人 5 名にアモキシシリン水和物 500mg(力価)[注] を経口投与した場合の 24 時間尿中排泄率は、尿中に未変化体が 72.2%、代謝物として β-lactam 環の開裂したペニシロ酸(penicilloic acid)が 20.7%であった。

また、500mg(力価)[注] 経口投与時の血清、尿、胆汁中の代謝活性物質を検索した結果いずれにおいても抗菌活性代謝物質は認められなかった。

注)アモキシシリン水和物としてのヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症の承認用量(成人)は 1 回 250mg(力価)である。(「Ⅴ．2．用法・用量」の項参照)

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ：

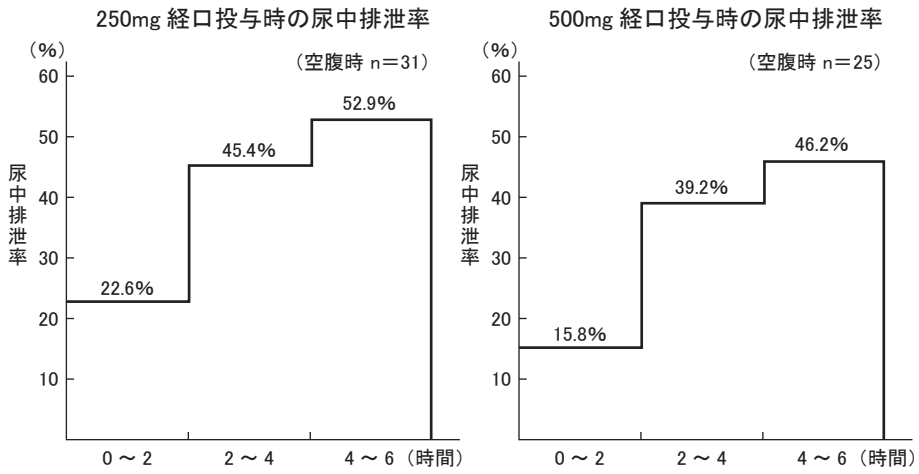
該当資料なし

6.排泄

(1) 排泄部位、排泄率、排泄速度：

1) 尿中排泄[14]

健常人にアモキシシリン水和物 250mg(力価)及び 500mg(力価)[注] を経口投与した場合、6 時間までに未変化体が、250mg 投与で 52.9%(31 名の平均値)、500mg(力価)投与で 46.2%(25 名の平均値)尿中に排泄された。



2）胆汁中排泄 [26]

患者８名にアモキシシリン水和物 1,000mg(力価)[注] を経口投与した場合、胆汁中濃度は４時間後にピークとなり、ピーク値は 1.1～44.0 g/mL(平均値 10.1±14.2 g/mL)とばらつきが大きかった。このうち３名では血清中濃度と胆汁中濃度を同時に測定し、胆汁中濃度のピーク値は平均 22.1 g/mL、血清中濃度のピーク値は平均 7.6 g/mL で胆汁中濃度の方が明らかに高かった。

注）アモキシシリン水和物としてのヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症の承認用量(成人)は１回 250mg(力価)である。（「Ⅴ．2．用法・用量」の項参照）

7.透析等による除去率

（1）腹膜透析 [27]

間歇的腹膜透析患者２名及び持続的腹膜透析患者３名にアモキシシリン水和物 1,000mg(力価)[注] を経口投与した場合、透析液中濃度の最高値は 3.92～4.02 及び 4.92～12.10 g/mL で、透析液中への回収率はそれぞれ 5.3～12.4%及び 2.93～7.24%であったとの報告がある。

注）アモキシシリン水和物としてのヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症の承認用量(成人)は１回 250mg(力価)である。（「Ⅴ．2．用法・用量」の項参照）

（2）血液透析

＜参考：外国人のデータ（静脈内投与）＞ [28]

患者にアモキシシリンナトリウムを 1,000mg(力価)静脈内投与した場合、４時間血液透析で投与量の約 30%が透析液に回収されたとの報告がある。

（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（原則禁忌を含む）

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】
1）本剤の成分によるショックの既往歴のある患者
2）伝染性単核症のある患者［発疹の発現頻度を高めるおそれがある。］

[解説]
1)本剤の成分によるショックの既往歴のある患者は、本剤の投与によりショックを含む過敏症状を発現する可能性が高いため設定した。
2)伝染性単核症のある患者にアンピシリン水和物を投与した場合、発疹が高率に発現することが知られているが、アモキシシリン水和物においても伝染性単核症のある患者に投与して発疹を発現した症例が報告されている[29)]。

【原則禁忌（次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること）】
本剤の成分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

[解説]
本剤の成分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は、本剤の投与により過敏症状を発現する可能性が高いため設定した。

3.効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

「Ⅴ．1．効能・効果」の項参照

4.用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

「Ⅴ．2．用法・用量」の項参照

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)セフェム系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者
2)本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー症状を起こしやすい体質を有する患者
3)高度の腎障害のある患者［高い血中濃度が持続することがある。］
4)高齢者［「高齢者への投与」の項参照］
5)経口摂取の不良な患者又は非経口栄養の患者、全身状態の悪い患者［ビタミンＫ欠乏症状があらわれることがある。］

[解説]

1)ペニシリン系抗生物質とセフェム系抗生物質は化学構造が類似しているため、セフェム系抗生物質過敏患者はペニシリン系抗生物質にも過敏反応を起こす可能性があるため設定した。

2)アレルギー素因を有する患者では過敏症を発現する可能性が高いので、家族歴にも注意する必要がある。

3)「V．2．用法・用量」の項参照。

5)抗生物質の投与により腸内細菌叢が変動しビタミンKの合成が阻害されるため、経口的なビタミンKの摂取が不良な患者では出血傾向等への注意が必要である。

6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法

■パセトシンカプセル 125・250、パセトシン錠 250

重要な基本的注意

1)**ショック**があらわれることがあるので、十分な問診を行うこと。

2)本剤をヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎に用いる際には、除菌治療に用いられる他の薬剤の添付文書に記載されている禁忌、慎重投与、重大な副作用等の使用上の注意事項を必ず確認すること。

■パセトシン細粒 10%

重要な基本的注意

1)**ショック**があらわれることがあるので、十分な問診を行うこと。

2)本剤を胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症に用いる際には、クラリスロマイシン及びプロトンポンプインヒビター（ランソプラゾール又はラベプラゾールナトリウム）の添付文書に記載されている禁忌、慎重投与、重大な副作用等の使用上の注意事項を必ず確認すること。

[解説]

1)ペニシリンショックはペニシリン系抗生物質の注射後5分以内に発現する重篤な副作用として周知のものであるが、内服剤についても十分な注意が必要とされていることから設定した。

2)ヘリコバクター・ピロリ感染症に用いる際は本剤を含めた3剤併用療法であり、他の薬剤の使用上の注意を必ず確認する必要があることから設定した。

7.相互作用

(1) 併用禁忌とその理由：

該当しない

(2) 併用注意とその理由：

併用注意（併用に注意すること）

薬　剤　名	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ワルファリンカリウム	ワルファリンカリウムの作用が増強されるおそれがある。	腸内細菌によるビタミンKの産生を抑制することがある。
経口避妊薬	経口避妊薬の効果が減弱するおそれがある。	腸内細菌叢を変化させ、経口避妊薬の腸肝循環による再吸収を抑制すると考えられる。
プロベネシド	本剤の血中濃度を増加させる。	本剤の尿細管分泌を阻害し、尿中排泄を低下させると考えられている。

8.副作用

(1) 副作用の概要：

[ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症]
カプセル、細粒による承認時及び1977年12月までの副作用頻度調査において、19,052例中、副作用及び臨床検査値異常の発現例は997例(発現率5.2%)で、1,245件であった。
主な副作用は胃腸障害898件(4.7%)、発疹等の皮膚症状281件(1.5%)、口内炎・舌炎等15件(0.08%)等であった。

■パセトシンカプセル 125・250、パセトシン錠 250

［ヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎］

○胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びランソプラゾール併用の場合

承認時までに行われた試験では 430 例中 217 例(50.5%)に、市販後の使用成績調査では 3,491 例中 318 例(9.1%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。また、外国で行われた試験では 548 例中 179 例(32.7%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。（再審査終了時）

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びオメプラゾール併用の場合

承認時及び市販後臨床試験では 513 例中 273 例(53.2%)に、市販後の高齢者に対する特定使用成績調査では 473 例中 40 例(8.5%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。（再審査終了時）

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びラベプラゾールナトリウム併用の場合

承認時までに国内で行われた試験では 508 例中 205 例（40.4%）に、市販後の使用成績調査では 3,789 例中 166 例（4.4%）に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。（再審査終了時）

●アモキシシリン水和物、メトロニダゾール及びプロトンポンプインヒビター併用の場合

承認時までに国内において臨床試験等の副作用発現頻度が明確となる試験を実施していない。

○胃 MALT リンパ腫・特発性血小板減少性紫斑病・早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎

承認時までに国内において臨床試験等の副作用発現頻度が明確となる試験を実施していない。

■パセトシン細粒 10%

［胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症］

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びランソプラゾール併用の場合

承認時までに行われた試験では 430 例中 217 例(50.5%)に、市販後の使用成績調査では 3,491 例中 318 例(9.1%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。また、外国で行われた試験では 548 例中 179 例(32.7%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。（再審査終了時）

●アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びラベプラゾールナトリウム併用の場合

承認時までに国内で行われた試験では 508 例中 205 例（40.4%）に、市販後の使用成績調査では 3,789 例中 166 例（4.4%）に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。（再審査終了時）

(2) 重大な副作用と初期症状：

重大な副作用

(1) **ショック、アナフィラキシー**(呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等)を起こすことがあるので、観察を十分に行い、不快感、口内異常感、喘鳴、めまい、便意、耳鳴、発汗等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) **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)、多形紅斑、急性汎発性発疹性膿疱症、紅皮症（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、発熱、頭痛、関節痛、皮膚や粘膜の紅斑・水疱、膿疱、皮膚の緊張感・灼熱感・疼痛等の異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(3) **重篤な顆粒球減少**があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(4) **黄疸又は** AST(GOT)**、**ALT(GPT)**の上昇等**があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(5) **急性腎不全等の重篤な腎障害**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。

(6) **偽膜性大腸炎、出血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、適切な処置を行うこと。

(7) **間質性肺炎、好酸球性肺炎**があらわれることがあるので、咳嗽、呼吸困難、発熱等が認められた場合には、速やかに胸部 X 線、胸部 CT 等の検査を実施すること。間質性肺炎、好酸球性肺炎が疑われた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

(8) **項部硬直、発熱、頭痛、悪心・嘔吐あるいは意識混濁等を伴う無菌性髄膜炎**があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用：

［ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症］
下記のような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減量・休薬等の適切な処置を行うこと。
なお、太字で記載の副作用については投与を中止すること。

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	**発疹**	**瘙痒、発熱**	
血　液		好酸球増多	
消化器	食欲不振、下痢、悪心・嘔吐、腹痛、消化不良		黒毛舌
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欠乏症状(舌炎、口内炎、食欲不振、神経炎等)
その他		頭痛、めまい、耳鳴	梅毒患者の場合：ヤーリッシュ・ヘルクスハイマー反応(発熱、全身倦怠感、頭痛等の発現、病変部の悪化)

■パセトシンカプセル 125・250、パセトシン錠 250

［ヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎］
下記のような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適切な処置を行うこと。
なお、太字で記載の副作用については投与を中止すること。

	5%以上注1)	1～5%未満注1)	1%未満注1)	頻度不明注2)
過敏症		**発疹**	**瘙痒**	
精神神経系			頭痛、しびれ感、めまい、眠気、不眠、うつ状態	
消化器	下痢(15.5%)、軟便(13.5%)、味覚異常	腹痛、腹部膨満感、口内炎、便秘、食道炎	口渇、悪心、舌炎、胃食道逆流、胸やけ、十二指腸炎、嘔吐、痔核、食欲不振	黒毛舌
血　液*		好中球減少、好酸球増多	貧血、白血球増多、血小板減少	
肝　臓*		AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、LDH 上昇、γ-GTP 上昇	Al-P 上昇、ビリルビン上昇	
その他		尿蛋白陽性、トリグリセリド上昇、総コレステロール上昇・低下	尿糖陽性、尿酸上昇、倦怠感、熱感、動悸、発熱、QT 延長、カンジダ症、浮腫、血圧上昇、霧視	

注 1)発現頻度は、胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるアモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びプロトンポンプインヒビター（ランソプラゾール、オメプラゾール又はラベプラゾールナトリウム）併用除菌治療の承認時までの成績に基づいている。
注 2)国内外自発報告に基づく副作用。
＊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。

■パセトシン細粒 10%

［胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症］
下記のような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適切な処置を行うこと。
なお、太字で記載の副作用については投与を中止すること。

	5%以上注1)	1～5%未満注1)	1%未満注1)	頻度不明注2)
過敏症		**発疹**	**瘙痒**	
精神神経系			頭痛、しびれ感、眠気、めまい、不眠、うつ状態	
消化器	下痢(14.0%)、軟便(11.8%)	味覚異常、腹部膨満感、腹痛、便秘	悪心、口内炎、口渇、舌炎、胸やけ、胃食道逆流、嘔吐、食欲不振	黒毛舌
血　液*		好中球減少、好酸球増多、貧血	白血球増多、血小板減少	
肝　臓*		AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、LDH 上昇、γ-GTP 上昇、Al-P 上昇	ビリルビン上昇	
その他		トリグリセリド上昇、尿蛋白陽性、総コレステロール上昇・低下、尿糖陽性、膣モニリア症注3)	尿酸上昇、倦怠感、熱感、浮腫、動悸、血圧上昇	

注 1)発現頻度は、アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びプロトンポンプインヒビター（ランソプラゾール又はラベプラゾールナトリウム）併用除菌治療の承認時までの成績に基づいている。
注 2)国内外自発報告に基づく副作用。
注 3)外国で行われた試験で認められている副作用。
＊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。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧：

1. ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症

●パセトシンカプセル 125・250、細粒 10%

	承認時までの調査	承認時以降の調査 (1977 年 12 月末日まで)
調査施設数 調査症例数 副作用発現症例数 副作用発現件数	59 1,335 111 130	986 17,717 886 1,115
副作用発現症例数／調査症例数(%)	8.3	5.0

副作用の種類		副作用発現件数(%)	
		承認時までの調査	承認時以降の調査 (1977 年 12 月末日まで)
皮膚付属器官障害	発　疹	38（2.8）	238（1.3）
	瘙　痒	1（0.07）	4（0.02）
胃腸系障害	下痢・軟便	28（2.1）	199（1.1）
	悪心・嘔吐・嘔気	14（1.0）	201（1.1）
	食欲不振	9（0.7）	246（1.4）
	腹　痛	10（0.7）	83（0.5）
	消化不良	3（0.2）	76（0.4）
	鼓腸放屁	1（0.07）	0
	便　秘	0	1（0.006）
	胃腸障害	11（0.8）	14（0.08）
	口内炎	1（0.07）	6（0.03）
	口角炎	1（0.07）	0
	舌　炎	1（0.07）	4（0.02）
	黒舌症	0	2（0.01）
	食道炎	0	1（0.006）
	血　便	0	1（0.006）
その他の障害	舌のしびれ感	1（0.07）	1（0.006）
	口唇のしびれ感	1（0.07）	1（0.006）
	めまい	1（0.07）	2（0.01）
	頭　痛	0	5（0.03）
	発　熱	0	3（0.02）
	顔面浮腫	0	2（0.01）
	硬口蓋発赤	0	2（0.01）
	トランスアミナーゼ上昇	5（0.4）	5（0.03）
	好酸球増多	1（0.07）	9（0.05）

副作用の種類		副作用発現件数(%)	
		承認時までの調査	承認時以降の調査 (1977 年 12 月末日まで)
その他の障害	好中球減少	0	2（0.01）
	A1-P 上昇	0	1（0.006）
	口中苦味感	2（0.1）	1（0.006）
	口囲の腫脹	1（0.07）	1（0.006）
	耳　鳴	0	2（0.01）
	カンジダ症	0	1（0.006）
	脱力感	0	1（0.006）

2. 胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染

1）ランソプラゾール／アモキシシリン水和物／クラリスロマイシン併用例

（1）国内で行われた試験における副作用（臨床検査値異常を含む）発現頻度

	承認時迄	使用成績調査	合　計
調査施設数	62	706	739
調査症例数	430	3,491	3,921
副作用等の発現症例数	217	318	535
副作用等の発現件数	419	425	844
副作用等の発現症例率（%）	50.47	9.11	13.64

副作用の種類	副作用等の種類別発現症例（件数）率（%）		
	承認時迄	使用成績調査	合　計
感染症および寄生虫症	1 (0.23)	1 (0.03)	2 (0.05)
*　白癬	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
*　咽頭炎	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
血液およびリンパ系障害	0 (0.00)	2 (0.06)	2 (0.05)
好酸球増加症	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
好中球減少症	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
代謝および栄養障害	1 (0.23)	3 (0.09)	4 (0.10)
食欲不振	1 (0.23)	2 (0.06)	3 (0.08)
食欲減退	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
精神障害	2 (0.47)	0 (0.00)	2 (0.05)
うつ病	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
不眠症	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
神経系障害	20 (4.65)	55 (1.58)	75 (1.91)
頭痛	2 (0.47)	0 (0.00)	2 (0.05)

副作用の種類	副作用等の種類別発現症例（件数）率（%）		
	承認時迄	使用成績調査	合　計
浮動性めまい	1 (0.23)	1 (0.03)	2 (0.05)
味覚異常	15 (3.49)	53 (1.52)	68 (1.73)
味覚減退	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
傾眠	2 (0.47)	2 (0.06)	4 (0.10)
眼障害	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
*　アレルギー性結膜炎	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
心臓障害	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
動悸	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
血管障害	0 (0.00)	2 (0.06)	2 (0.05)
潮紅	0 (0.00)	2 (0.06)	2 (0.05)
呼吸器、胸郭および縦隔障害	1 (0.23)	2 (0.06)	3 (0.08)
*　咽喉頭疼痛	1 (0.23)	2 (0.06)	3 (0.08)
胃腸障害	112 (26.05)	232 (6.65)	344 (8.77)
腸炎	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
出血性腸炎	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
食道炎	1 (0.23)	1 (0.03)	2 (0.05)
逆流性食道炎	2 (0.47)	5 (0.14)	7 (0.18)
便秘	4 (0.93)	2 (0.06)	6 (0.15)
下痢	38 (8.84)	123 (3.52)	161 (4.11)
腹部不快感	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
腹部膨満	2 (0.47)	2 (0.06)	4 (0.10)
腹痛	1 (0.23)	6 (0.17)	7 (0.18)
下腹部痛	1 (0.23)	2 (0.06)	3 (0.08)
上腹部痛	0 (0.00)	3 (0.09)	3 (0.08)
季肋部痛	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
腸雑音異常	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
消化不良	2 (0.47)	6 (0.17)	8 (0.20)
おくび	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
鼓腸	2 (0.47)	0 (0.00)	2 (0.05)
軟便	59 (13.72)	74 (2.12)	133 (3.39)
悪心	1 (0.23)	4 (0.11)	5 (0.13)
レッチング	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
胃不快感	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
水様便	1 (0.23)	2 (0.06)	3 (0.08)
嘔吐	2 (0.47)	2 (0.06)	4 (0.10)

副作用の種類	副作用等の種類別発現症例（件数）率（%）		
	承認時迄	使用成績調査	合　計
*　びらん性胃炎	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
びらん性十二指腸炎	2 (0.47)	0 (0.00)	2 (0.05)
アフタ性口内炎	1 (0.23)	1 (0.03)	2 (0.05)
口唇炎	2 (0.47)	0 (0.00)	2 (0.05)
口腔内不快感	0 (0.00)	4 (0.11)	4 (0.10)
口内炎	1 (0.23)	11 (0.32)	12 (0.31)
口の感覚鈍麻	1 (0.23)	1 (0.03)	2 (0.05)
舌炎	0 (0.00)	3 (0.09)	3 (0.08)
舌痛	1 (0.23)	1 (0.03)	2 (0.05)
舌障害	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
肝胆道系障害	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
肝機能異常	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
皮膚および皮下組織障害	18 (4.19)	35 (1.00)	53 (1.35)
顔面浮腫	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
蕁麻疹	2 (0.47)	4 (0.11)	6 (0.15)
全身性蕁麻疹	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
薬剤性皮膚炎	1 (0.23)	7 (0.20)	8 (0.20)
湿疹	1 (0.23)	2 (0.06)	3 (0.08)
発赤	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
そう痒症	3 (0.70)	5 (0.14)	8 (0.20)
発疹	9 (2.09)	15 (0.43)	24 (0.61)
全身性皮疹	0 (0.00)	2 (0.06)	2 (0.05)
全身紅斑	0 (0.00)	2 (0.06)	2 (0.05)
全身性そう痒症	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
筋骨格系および結合組織障害	2 (0.47)	0 (0.00)	2 (0.05)
*　四肢不快感	2 (0.47)	0 (0.00)	2 (0.05)
腎および尿路障害	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
蛋白尿	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
生殖系および乳房障害	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
*　乳房痛	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
全身障害および投与局所様態	5 (1.16)	4 (0.11)	9 (0.23)
熱感	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)
*　悪寒	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
倦怠感	1 (0.23)	2 (0.06)	3 (0.08)
末梢性浮腫	0 (0.00)	1 (0.03)	1 (0.03)

副作用の種類	副作用等の種類別発現症例（件数）率（%）		
	承認時迄	使用成績調査	合　計
口渇	3 (0.70)	0 (0.00)	3 (0.08)
臨床検査	112 (26.05)	30 (0.86)	142 (3.62)
血中ＬＤＨ増加	13 (3.02)	4 (0.11)	17 (0.43)
血中ＡＬＰ増加	8 (1.86)	3 (0.09)	11 (0.28)
好塩基球数増加	3 (0.70)	0 (0.00)	3 (0.08)
好酸球数増加	18 (4.19)	0 (0.00)	18 (0.46)
ヘマトクリット減少	2 (0.47)	0 (0.00)	2 (0.05)
ヘモグロビン減少	4 (0.93)	1 (0.03)	5 (0.13)
* リンパ球数減少	6 (1.40)	0 (0.00)	6 (0.15)
リンパ球数増加	5 (1.16)	0 (0.00)	5 (0.13)
単球数増加	3 (0.70)	0 (0.00)	3 (0.08)
好中球数減少	5 (1.16)	0 (0.00)	5 (0.13)
好中球数増加	4 (0.93)	1 (0.03)	5 (0.13)
血小板数減少	2 (0.47)	1 (0.03)	3 (0.08)
赤血球数減少	3 (0.70)	0 (0.00)	3 (0.08)
白血球数減少	13 (3.02)	4 (0.11)	17 (0.43)
白血球数増加	8 (1.86)	2 (0.06)	10 (0.26)
* 血小板数増加	3 (0.70)	0 (0.00)	3 (0.08)
ＡＬＴ（ＧＰＴ）増加	21 (4.88)	17 (0.49)	38 (0.97)
ＡＳＴ（ＧＯＴ）増加	21 (4.88)	11 (0.32)	32 (0.82)
血中ビリルビン増加	8 (1.86)	1 (0.03)	9 (0.23)
γ－ＧＴＰ増加	12 (2.79)	10 (0.29)	22 (0.56)
血中コレステロール減少	5 (1.16)	0 (0.00)	5 (0.13)
血中コレステロール増加	9 (2.09)	0 (0.00)	9 (0.23)
血中トリグリセリド増加	16 (3.72)	0 (0.00)	16 (0.41)
血中尿酸増加	6 (1.40)	0 (0.00)	6 (0.15)
* アルブミン・グロブリン比異常	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
* 血中アルブミン減少	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
* 総蛋白減少	3 (0.70)	0 (0.00)	3 (0.08)
血中クレアチニン減少	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
ＢＵＮ増加	3 (0.70)	1 (0.03)	4 (0.10)
尿中ブドウ糖陽性	8 (1.86)	0 (0.00)	8 (0.20)
* 尿中血陽性	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
尿中蛋白陽性	15 (3.49)	0 (0.00)	15 (0.38)

副作用の種類	副作用等の種類別発現症例（件数）率（%）		
	承認時迄	使用成績調査	合　計
*　血中カリウム減少	2 (0.47)	0 (0.00)	2 (0.05)
*　血中カリウム増加	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
*　血中ナトリウム減少	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)
*　体重減少	1 (0.23)	0 (0.00)	1 (0.03)

＊：現行の使用上の注意から予測できない副作用

（2）外国で行われた試験注）における副作用（臨床検査値異常変動含）発現頻度（ランソプラゾール／アモキシシリン水和物／クラリスロマイシン併用例）

	アメリカ	イギリス
調査症例数	422	126
副作用発現症例数	131	48
発現率（%）	31.0	38.1

副作用の種類		発現件数（%）	
		アメリカ	イギリス
皮膚・皮膚付属器障害	皮膚乾燥	1（0.2）	0
	斑状丘疹性皮疹	1（0.2）	0
	小水疱水疱性皮疹	1（0.2）	0
	瘙痒（症）	2（0.5）	0
	発　疹	3（0.7）	1（0.8）
	顔面皮疹	0	1（0.8）
	蕁麻疹	1（0.2）	0
	皮膚疾患	1（0.2）	0
筋・骨格系障害	非炎症性関節腫脹	0	1（0.8）
	筋(肉)痛	1（0.2）	0
中枢・末梢神経系障害	口内しびれ(感)	0	1（0.8）
	めまい	7（1.7）	2（1.6）
視覚障害	弱　視	1（0.2）	0
その他の特殊感覚障害	味覚倒錯	51（12.1）	0
	味覚喪失	1（0.2）	0
	金属味	0	2（1.6）
精神障害	不　安	1（0.2）	0
	錯　乱	2（0.5）	0
	不眠(症)	2（0.5）	0
	神経過敏(症)	1（0.2）	0
	傾　眠	2（0.5）	0

副作用の種類		発現件数（%）	
		アメリカ	イギリス
消化管障害	変色便	2（0.5）	0
	食欲不振	4（0.9）	1（0.8）
	下　痢	51（12.1）	24（19.0）
	排便回数増加	0	4（3.2）
	便　秘	0	3（2.4）
	直腸障害	3（0.7）	0
	下　血	1（0.2）	0
	嘔　気	9（2.1）	3（2.4）
	嘔　吐	3（0.7）	1（0.8）
	腹　痛	5（1.2）	0
	胃　痛	0	4（3.2）
	胃不快感	0	1（0.8）
	腹部痙直	0	1（0.8）
	下腹部異和感	0	1（0.8）
	鼓腸放屁	1（0.2）	0
	おくび	1（0.2）	0
	肛門疼痛	0	1（0.8）
	口内乾燥	3（0.7）	0
	咽喉乾燥	0	1（0.8）
	口内炎	6（1.4）	0
	口唇炎	1（0.2）	0
	舌　炎	4（0.9）	1（0.8）
	舌　痛	0	1（0.8）
	舌変色	3（0.7）	0
	舌疾患	1（0.2）	0
肝臓・胆管系障害	AST(GOT)上昇	0	1（0.8）
	ALT(GPT)上昇	0	1（0.8）
	γ-GTP 上昇	0	1（0.8）
代謝・栄養障害	血清総蛋白上昇	0	1（0.8）
心・血管障害（一般）	低血圧	1（0.2）	0
	触　診	0	1（0.8）
呼吸器系障害	咽頭炎	2（0.5）	0
	咽頭痛	0	2（1.6）
白血球・網内系障害	好酸球増多(症)	0	1（0.8）
女性生殖（器）障害	膣　炎	5（1.2）	0

副作用の種類		発現件数（%）	
		アメリカ	イギリス
男性生殖（器）障害	インポテンス	1（0.2）	0
一般的全身障害	脱力(感)	1（0.2）	0
	頭　痛	11（2.6）	4（3.2）
	倦怠(感)	1（0.2）	0
	疲　労	0	1（0.8）
抵抗機構障害	かぜ症候群	0	2（1.6）
	口腔内モニリア症	2（0.5）	0
	膣モニリア症	5（1.2）	1（0.8）

注)外国で行われた試験は日本で承認された用法・用量と異なる。また、日本で承認されていない効能・効果への投与例も含む。

2）オメプラゾール／アモキシシリン水和物／クラリスロマイシン併用例

(1)国内で行われた試験における副作用（臨床検査値異常変動含）発現頻度（除菌療法～観察期）

時期	除菌療法期（0～1週）	観察期（1～7週）	除菌療法期～観察期（0～7週）
投与群	n=225	n=223	n=225
発現例数（%）	133（59.1）	14（6.3）	138（61.3）
皮膚・皮膚付属器障害	3（1.3）	0	3（1.3）
発疹	3（1.3）	0	3（1.3）
中枢・末梢神経系障害	4（1.8）	0	4（1.8）
頭痛	2（0.9）	0	2（0.9）
舌しびれ	1（0.4）	0	1（0.4）
めまい	1（0.4）	0	1（0.4）
その他の特殊感覚障害	47（20.9）	0	47（20.9）
苦味	35（15.6）	0	35（15.6）
味覚異常	11（4.9）	0	11（4.9）
酸味	1（0.4）	0	1（0.4）
精神障害	1（0.4）	0	1（0.4）
睡眠障害	1（0.4）	0	1（0.4）
消化管障害	100（44.4）	11（4.9）	107（47.6）
悪心	3（1.3）	0	3（1.3）
口角炎	0	2（0.9）	2（0.9）
下痢	48（21.3）	0	48（21.3）
水様便	3（1.3）	0	3（1.3）
軟便	37（16.4）	0	37（16.4）

時期	除菌療法期 （0～1 週）	観察期 （1～7 週）	除菌療法期～観察期 （0～7 週）
口内炎	1（0.4）	0	1（0.4）
口内異常感	1（0.4）	1（0.4）	2（0.9）
口内刺激	0	1（0.4）	1（0.4）
口内乾燥	4（1.8）	0	4（1.8）
痔核	1（0.4）	0	1（0.4）
食道炎	0	5（2.2）	5（2.2）
舌炎	0	1（0.4）	1（0.4）
舌荒れ	1（0.4）	0	1（0.4）
胃痛	3（1.3）	0	3（1.3）
腹部膨満	1（0.4）	0	1（0.4）
便秘	2（0.9）	1（0.4）	2（0.9）
腹部膨満感	1（0.4）	0	1（0.4）
腹鳴	1（0.4）	0	1（0.4）
痔出血	1（0.4）	0	1（0.4）
舌刺激感	1（0.4）	0	1（0.4）
十二指腸炎	0	1（0.4）	1（0.4）
口腔苔癬様変化	1（0.4）	0	1（0.4）
肝臓・胆管系障害	15（6.7）	0	15（6.7）
肝機能障害	4（1.8）	0	4（1.8）
AST(GOT)上昇	6（2.7）	0	6（2.7）
ALT(GPT)上昇	3（1.3）	0	3（1.3）
脂肪便	1（0.4）	0	1（0.4）
血清ビリルビン上昇	2（0.9）	0	2（0.9）
代謝・栄養障害	6（2.7）	0	6（2.7）
Al-P 上昇	2（0.9）	0	2（0.9）
高コレステロール血症	1（0.4）	0	1（0.4）
血清コレステロール上昇	1（0.4）	0	1（0.4）
血中尿酸上昇	2（0.9）	0	2（0.9）
心拍数・心リズム障害	1（0.4）	0	1（0.4）
QT 延長	1（0.4）	0	1（0.4）
赤血球障害	1（0.4）	0	1（0.4）
貧血	1（0.4）	0	1（0.4）
白血球・網内系障害	6（2.7）	0	6（2.7）
好酸球増多(症)	2（0.9）	0	2（0.9）
白血球増多(症)	1（0.4）	0	1（0.4）
白血球分画異常	3（1.3）	0	3（1.3）

時期	除菌療法期（0～1 週）	観察期（1～7 週）	除菌療法期～観察期（0～7 週）
血小板・出血凝血障害	2（0.9）	0	2（0.9）
血小板減少(症)	2（0.9）	0	2（0.9）
泌尿器系障害	4（1.8）	0	4（1.8）
尿蛋白	4（1.8）	0	4（1.8）
一般的全身障害	4（1.8）	2（0.9）	6（2.7）
頭重(感)	0	1（0.4）	1（0.4）
発熱	1（0.4）	0	1（0.4）
倦怠(感)	1（0.4）	0	1（0.4）
気分不良	1（0.4）	0	1（0.4）
腹痛	1（0.4）	1（0.4）	2（0.9）
熱感	1（0.4）	0	1（0.4）
抵抗機構障害	0	1（0.4）	1（0.4）
膣カンジダ症	0	1（0.4）	1（0.4）

(2)外国で行われた試験[注)] における有害事象発現頻度
（オメプラゾール／アモキシシリン水和物／クラリスロマイシン併用例）

（　）内は有害事象発現例数／評価例数

	1 日投与量			投与期間	対　象	有害事象発現率*
	オメプラゾール	アモキシシリン水和物	クラリスロマイシン			
MACH1[30]	40mg	2,000mg	500mg	1 週間	活動期又は瘢痕期の十二指腸潰瘍	43.8%（56/128 例）
	40mg	2,000mg	1,000mg	1 週間	活動期又は瘢痕期の十二指腸潰瘍	61.1%（80/131 例）
MACH2[31]	40mg	2,000mg	1,000mg	1 週間	瘢痕期の十二指腸潰瘍	52.3%（69/132 例）
DU-MACH[32]	40mg	2,000mg	1,000mg	1 週間	活動期の十二指腸潰瘍	70.0%（35/50 例）
GU-MACH[33]	40mg	2,000mg	1,000mg	1 週間	活動期の胃潰瘍	9.6%（5/52 例）

注)外国で行われた試験は日本で承認された用法・用量と異なる。
＊：文献より一部改変

(3)高齢者に対する特定使用成績調査における副作用発現頻度
（オメプラゾール／アモキシシリン水和物／クラリスロマイシン併用例）

①調査施設数	96
②調査症例数	473
③副作用等の発現症例数	40
④副作用等の発現件数	56
⑤副作用等の発現症例率　（③／②×１００）	8.5%

副作用等の種類	発現例数〔件数〕(%)	
感染症および寄生虫症	1	(0.21)
鼻咽頭炎	1	(0.21)
精神障害	1	(0.21)
不眠症	1	(0.21)
神経系障害	11	(2.33)
浮動性めまい	1	(0.21)
味覚異常	10	(2.11)
眼障害	1	(0.21)
霧視	1	(0.21)
血管障害	1	(0.21)
ほてり	1	(0.21)
胃腸障害	29	(6.13)
腹痛	1	(0.21)
口唇炎	1	(0.21)
便秘	1	(0.21)
下痢	21	(4.44)
胃食道逆流性疾患	1	(0.21)
悪心	2	(0.42)
逆流性食道炎	1	(0.21)
口内炎	1	(0.21)
舌苔	1	(0.21)
嘔吐	1	(0.21)
肝胆道系障害	2	(0.42)
肝機能異常	2	(0.42)
皮膚および皮下組織障害	2	(0.42)
冷汗	1	(0.21)
発疹	1	(0.21)
筋骨格系および結合組織障害	1	(0.21)
関節痛	1	(0.21)

副作用等の種類	発現例数〔件数〕(%)	
全身障害および投与局所様態	5	(1.06)
末梢性浮腫	1	(0.21)
発熱	1	(0.21)
口渇	3	(0.63)

(MedDRA/J Ver.8.1)

3) ラベプラゾールナトリウム／アモキシシリン水和物／クラリスロマイシン併用例

(1)承認時及び使用成績調査における副作用発現状況一覧

	承認時	使用成績調査	合計
調査施設数	36	651	678
調査症例数	508	3,789	4,297
副作用の発現症例数	205	166	371
副作用の発現件数	302	195	497
副作用の発現症例率（%）	40.35	4.38	8.63

副作用の種類	副作用の種類別発現症例（件数）率（%）		
感染症および寄生虫症	−	1（0.03）	1（0.02）
膀胱炎	−	1（0.03）	1（0.02）
血液およびリンパ系障害	2（0.39）	2（0.05）	4（0.09）
貧血	−	2（0.05）	2（0.05）
白血球減少症	1（0.20）	−	1（0.02）
血小板減少症	1（0.20）	−	1（0.02）
代謝および栄養障害	2（0.39）	1（0.03）	3（0.07）
高カリウム血症	−	1（0.03）	1（0.02）
高尿酸血症	1（0.20）	−	1（0.02）
食欲減退	1（0.20）	−	1（0.02）
神経系障害	29（5.71）	24（0.63）	53（1.23）
浮動性めまい	1（0.20）	2（0.05）	3（0.07）
味覚異常	25（4.92）	20（0.53）	45（1.05）
頭痛	3（0.59）	3（0.08）	6（0.14）
感覚鈍麻	2（0.39）	−	2（0.05）
眼障害	−	1（0.03）	1（0.02）
眼瞼浮腫	−	1（0.03）	1（0.02）
心臓障害	1（0.20）	1（0.03）	2（0.05）
動悸	1（0.20）	1（0.03）	2（0.05）

副作用の種類	副作用の種類別発現症例（件数）率（%）		
血管障害	1（0.20）	2（0.05）	3（0.07）
低血圧	−	2（0.05）	2（0.05）
ほてり	1（0.20）	−	1（0.02）
呼吸器，胸郭および縦隔障害	−	1（0.03）	1（0.02）
口腔咽頭痛	−	1（0.03）	1（0.02）
胃腸障害	165（32.48）	105（2.77）	270（6.28）
腹部不快感	1（0.20）	4（0.11）	5（0.12）
腹部膨満	9（1.77）	2（0.05）	11（0.26）
腹痛	11（2.17）	2（0.05）	13（0.30）
下腹部痛	1（0.20）	−	1（0.02）
上腹部痛	−	2（0.05）	2（0.05）
口唇炎	1（0.20）	−	1（0.02）
便秘	6（1.18）	2（0.05）	8（0.19）
下痢	145（28.54）	80（2.11）	225（5.24）
口内乾燥	1（0.20）	−	1（0.02）
消化不良	2（0.39）	−	2（0.05）
腸炎	1（0.20）	−	1（0.02）
鼓腸	5（0.98）	−	5（0.12）
胃食道逆流性疾患	−	1（0.03）	1（0.02）
舌炎	1（0.20）	3（0.08）	4（0.09）
舌痛	1（0.20）	−	1（0.02）
痔核	1（0.20）	−	1（0.02）
口唇腫脹	−	2（0.05）	2（0.05）
悪心	5（0.98）	4（0.11）	9（0.21）
口腔内不快感	−	1（0.03）	1（0.02）
逆流性食道炎	1（0.20）	−	1（0.02）
口内炎	3（0.59）	1（0.03）	4（0.09）
舌障害	1（0.20）	−	1（0.02）
嘔吐	−	3（0.08）	3（0.07）
口唇のひび割れ	1（0.20）	−	1（0.02）
直腸しぶり	1（0.20）	−	1（0.02）
口の感覚鈍麻	2（0.39）	−	2（0.05）
口の錯感覚	1（0.20）	2（0.05）	3（0.07）
胃腸音異常	−	1（0.03）	1（0.02）
肝胆道系障害	2（0.39）	6（0.16）	8（0.19）
肝機能異常	2（0.39）	6（0.16）	8（0.19）

副作用の種類	副作用の種類別発現症例（件数）率（%）		
皮膚および皮下組織障害	14（2.76）	30（0.79）	44（1.02）
アレルギー性皮膚炎	−	1（0.03）	1（0.02）
薬疹	1（0.20）	3（0.08）	4（0.09）
湿疹	2（0.39）	−	2（0.05）
皮脂欠乏性湿疹	1（0.20）	−	1（0.02）
紅斑	−	1（0.03）	1（0.02）
そう痒症	2（0.39）	1（0.03）	3（0.07）
発疹	3（0.59）	16（0.42）	19（0.44）
全身性皮疹	−	1（0.03）	1（0.02）
蕁麻疹	1（0.20）	7（0.18）	8（0.19）
全身性そう痒症	1（0.20）	−	1（0.02）
中毒性皮疹	3（0.59）	−	3（0.07）
腎および尿路障害	2（0.39）	−	2（0.05）
蛋白尿	1（0.20）	−	1（0.02）
尿異常	1（0.20）	−	1（0.02）
生殖系および乳房障害	1（0.20）	−	1（0.02）
勃起増強	1（0.20）	−	1（0.02）
一般・全身障害および投与部位の状態	7（1.38）	5（0.13）	12（0.28）
悪寒	−	1（0.03）	1（0.02）
顔面浮腫	1（0.20）	1（0.03）	2（0.05）
熱感	2（0.39）	−	2（0.05）
倦怠感	3（0.59）	1（0.03）	4（0.09）
浮腫	−	1（0.03）	1（0.02）
疼痛	−	1（0.03）	1（0.02）
発熱	−	1（0.03）	1（0.02）
口渇	3（0.59）	−	3（0.07）
臨床検査	29（5.71）	8（0.21）	37（0.86）
アラニン・アミノトランスフェラーゼ増加	3（0.59）	−	3（0.07）
アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ増加	3（0.59）	−	3（0.07）
血中乳酸脱水素酵素増加	2（0.39）	−	2（0.05）
血圧低下	−	1（0.03）	1（0.02）
血圧上昇	1（0.20）	−	1（0.02）
血中トリグリセリド増加	5（0.98）	−	5（0.12）
好酸球数増加	3（0.59）	−	3（0.07）
γ−グルタミルトランスフェラーゼ増加	−	2（0.05）	2（0.05）
尿中ブドウ糖陽性	1（0.20）	−	1（0.02）

副作用の種類	副作用の種類別発現症例（件数）率（%）		
INR 増加	−	1（0.03）	1（0.02）
眼圧上昇	1（0.20）	−	1（0.02）
リンパ球数減少	2（0.39）	−	2（0.05）
リンパ球数増加	2（0.39）	−	2（0.05）
単球数増加	−	1（0.03）	1（0.02）
好中球数減少	3（0.59）	−	3（0.07）
赤血球数減少	−	1（0.03）	1（0.02）
白血球数減少	4（0.79）	2（0.05）	6（0.14）
白血球数増加	1（0.20）	−	1（0.02）
尿中蛋白陽性	1（0.20）	−	1（0.02）
血中アルカリホスファターゼ増加	3（0.59）	1（0.03）	4（0.09）
肝酵素上昇	1（0.20）	−	1（0.02）

（MedDRA/J version 13.1）

(5) 基礎疾患，合併症，重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度：

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法：

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】
1) 本剤の成分によるショックの既往歴のある患者

【原則禁忌（次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること）】
本剤の成分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

1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
1) セフェム系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者
2) 本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー症状を起こしやすい体質を有する患者

2. 重要な基本的注意
1) **ショック**があらわれることがあるので、十分な問診を行うこと。

4. 副作用
1） 重大な副作用
(1) **ショック、アナフィラキシー**（呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等）を起こすことがあるので、観察を十分に行い、不快感、口内異常感、喘鳴、めまい、便意、耳鳴、発汗等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

4. 副作用
2）その他の副作用
過敏症：
[ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症]
発疹（0.1～5%未満）、**瘙痒、発熱**（0.1%未満）が発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

■パセトシンカプセル 125・250、パセトシン錠 250
[ヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎]
発疹（1～5%未満）、**瘙痒**（1%未満）が発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

■パセトシン細粒 10%
[胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症]
発疹（1～5%未満）、**瘙痒**（1%未満）が発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

9.高齢者への投与

高齢者には、次の点に注意し、用量並びに投与間隔に留意するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。
1)高齢者では生理機能が低下していることが多く副作用が発現しやすい。
2)高齢者ではビタミン K 欠乏による出血傾向があらわれることがある。

10.妊婦，産婦，授乳婦等への投与

1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、臍帯血、羊水へ移行することが報告されている。なお、動物試験(ラット)において、アモキシシリン水和物(500mg/kg/日)、クラリスロマイシン(160mg/kg/日)及びランソプラゾール(50mg/kg/日)を併用投与すると、母動物での毒性の増強とともに胎児の発育抑制の増強が認められている。また、ラットにアモキシシリン水和物(400mg/kg/日以上)、クラリスロマイシン(50mg/kg/日以上)及びラベプラゾールナトリウム(25mg/kg/日)を 4 週間併用投与した試験で、雌で栄養状態の悪化が認められている。]
2)授乳中の婦人に投与する場合には授乳を避けさせることが望ましい。[母乳中へ移行することが報告されている。(「薬物動態」の項参照)]

11.小児等への投与

低出生体重児、新生児に対する安全性は確立していない（使用経験がない)。

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.適用上の注意

●パセトシンカプセル 125・250、錠 250

薬剤交付時
PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。［PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。］

[解説]

日薬連発第 240 号「PTP の誤飲対策について」（平成 8 年 3 月 27 日付）の申し合わせ事項により記載した。

15.その他の注意

■パセトシンカプセル 125・250、錠 250

1) ラットにアモキシシリン水和物(2000mg/kg/日)、ランソプラゾール(15mg/kg/日以上)を 4 週間併用経口投与した試験、及びイヌにアモキシシリン水和物(500mg/ kg/日)、ランソプラゾール(100mg/kg/日)、クラリスロマイシン(25mg/kg/日)を 4 週間併用経口投与した試験で、アモキシシリン水和物を単独あるいは併用投与した動物に結晶尿が認められているが、結晶はアモキシシリン水和物が排尿後に析出したものであり、体内で析出したものではないことが確認されている。

2) **ヘリコバクター・ピロリの除菌判定上の注意**
ランソプラゾール等のプロトンポンプインヒビターやアモキシシリン水和物、クラリスロマイシン等の抗生物質及びメトロニダゾールの服用中や投与終了直後では、^{13}C-尿素呼気試験の判定結果が偽陰性になる可能性があるため、^{13}C-尿素呼気試験による除菌判定を行う場合には、これらの薬剤の投与終了後 4 週間以降の時点で実施することが望ましい。

■パセトシン細粒　10%

1) ラットにアモキシシリン水和物(2000mg/kg/日)、ランソプラゾール(15mg/kg/日以上)を4週間併用経口投与した試験、及びイヌにアモキシシリン水和物(500mg/ kg/日)、ランソプラゾール(100mg/kg/日)、クラリスロマイシン(25mg/kg/日)を4週間併用経口投与した試験で、アモキシシリン水和物を単独あるいは併用投与した動物に結晶尿が認められているが、結晶はアモキシシリン水和物が排尿後に析出したものであり、体内で析出したものではないことが確認されている。

2) **ヘリコバクター・ピロリの除菌判定上の注意**
ランソプラゾール等のプロトンポンプインヒビターやアモキシシリン水和物、クラリスロマイシン等の抗生物質の服用中や投与終了直後では、^{13}C-尿素呼気試験の判定結果が偽陰性になる可能性があるため、^{13}C-尿素呼気試験による除菌判定を行う場合には、これらの薬剤の投与終了後4週間以降の時点で実施することが望ましい。

16.その他

該当資料なし

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1.薬理試験

(1) 薬効薬理試験：

「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」参照

(2) 副次的薬理試験：

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験 [34)]：

アモキシシリン水和物の一般薬理作用を検討した。最大投与量は投与液量の関係でマウス、ラットの経口投与では 4,000mg/kg、イヌの経口投与では 1,000mg/kg とした。なお、これらの投与量は、臨床での 1 回内服常用量（250mg/人すなわち約 5mg/kg）のそれぞれ約 800 倍及び 200 倍量である。

1) アモキシシリン水和物 4,000mg/kg の経口投与で、マウスのバルビツレイト麻酔、電気ショック痙攣、ラットの体温、血圧及び心拍数に影響を与えず、マウスで鎮痛効果を示さなかった。また、ラットの尿量及び電解質排泄に事実上影響を与えなかった。
2) 無麻酔犬にアモキシシリン水和物 1,000mg/kg を経口投与しても、血圧、心拍数及び空腸の自働運動に変化はみられなかった。
3) アモキシシリン水和物は 5.0×10^{-4}g/mL の濃度でモルモット摘出心房の収縮張力及び拍動数、ラットの横隔膜神経－筋標本での神経－筋伝達、家兎の摘出回腸及びラットの摘出子宮の自働運動、アセチルコリン、ヒスタミン及びバリウムによるモルモット回腸の攣縮並びにセロトニンによるラット胃切片の攣縮に影響を与えなかった。
4) アモキシシリン水和物は 4%懸濁液の点眼では、家兎の角膜で局所麻酔作用を示さず、結膜、瞬膜等に対する刺激作用もほとんどみられなかった。

(4) その他の薬理試験：

該当資料なし

2.毒性試験

(1) 単回投与毒性試験 [35]：

急性毒性

LD_{50}(g/kg)

動物種 ＼ 投与経路		経口（p.o.）	腹腔内（i.p.）	皮下（s.c.）
マウス	雄	＞25	6.41	＞20
	雌	＞25	3.59	＞20
ラット	雄	＞15	3.75	＞8
	雌	＞15	2.87	＞8
ウサギ	雄	＞12.5	－	－
	雌	＞12.5	－	－

(2) 反復投与毒性試験 [36]：

Wistar 系ラットに 6 ヵ月間アモキシシリン水和物を 0.4，0.9，1.9，4.0g/kg 経口投与して、尿、血液及び病理学、組織学検査等を行ったところ、盲腸の肥大を認めるほか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 [37]：

ICR 系マウス及び Wistar 今道系ラットに器官形成期を通じて 7 日間(妊娠 7 日間～13 日間)アモキシシリン水和物を 0.4，1.3，4.0g/kg 経口投与した試験では、胎児、新生児とも薬物投与によると思われる影響は認められず、催奇形性作用は認められなかった。

(4) その他の特殊毒性 [38]：

抗原性

ウサギ、モルモットを用いて 30 日間連続経口投与して抗体の産生を検討したところ、抗体の産生は認められなかったが、非経口的に投与すると、他のペニシリン系抗生剤と同様アモキシシリン水和物特異の抗体産生が認められた。

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.有効期間又は使用期限

パセトシンカプセル 125・250：3 年（包装に表示の期限内に使用すること）
パセトシン細粒 10%　　：2 年（包装に表示の期限内に使用すること）
パセトシン錠 250　　：3 年（包装に表示の期限内に使用すること）

3.貯法・保存条件

室温保存（湿気を避けること。）

4.薬剤取扱い上の注意点

（1）薬局での取り扱いについて：
該当しない

（2）薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）：
「Ⅷ　14.適用上の注意」の項参照

5.承認条件等

該当しない

6.包装

パセトシンカプセル 125：［PTP］100 カプセル（10 カプセル×10）
パセトシンカプセル 250：［PTP］100 カプセル（10 カプセル×10）
パセトシン細粒 10%　：［バラ］100g
パセトシン錠 250　　：［PTP］100 錠（10 錠×10）

7.容器の材質

■パセトシンカプセル 125・250、パセトシン錠 250

［PTP］表面：ポリ塩化ビニール、裏面：アルミ箔、ピロー袋：ポリエチレン／アルミ箔

■パセトシン細粒 10%

［バラ］容器：ポリエチレン、蓋：ポリプロピレン、内蓋：ポリエチレン

8.同一成分・同効薬

同一成分薬：サワシリン、アモリン

同　効　薬：アンピシリン水和物

9.国際誕生年月日

1972 年 3 月 7 日

10.製造販売承認年月日及び承認番号

製造承認年月日

■パセトシンカプセル 125・250

2007 年 11 月 21 日(パセトシンカプセルとして 1974 年 9 月 6 日)

■パセトシン細粒 10%

2007 年 11 月 21 日(パセトシン細粒として 1974 年 9 月 6 日)

■パセトシン錠 250

1979 年 6 月 7 日(自社製造承認)、2000 年 5 月 26 日(輸入承認)

承認番号

パセトシンカプセル 125：21900AMX01777000

パセトシンカプセル 250：21900AMX01778000

パセトシン細粒 10%　：21900AMX01779000

パセトシン錠 250　　：15400EMZ00952000

11.薬価基準収載年月日

■パセトシンカプセル 125・250

2008 年 6 月 20 日(パセトシンカプセルとして 1974 年 12 月 17 日)

■パセトシン細粒 10%

2008 年 6 月 20 日(パセトシン細粒として 1974 年 12 月 17 日)

■パセトシン錠 250

1981 年 8 月 31 日

12.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

項　目	追加変更等の年月日	変更追加の内容
効能・効果	1979 年 9 月 3 日 （カプセル） 1982 年 10 月 12 日 （錠 250） 1983 年 3 月 30 日 （細粒）	梅毒トレポネーマによる梅毒
効能・効果	2000 年 9 月 22 日 （カプセル、 錠 250） 2004 年 9 月 30 日 （細粒）*	胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染
用法・用量（胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染）の追加	2000 年 9 月 22 日 （カプセル、 錠 250） 2004 年 9 月 30 日 （細粒）*	・通常、成人にはアモキシシリンとして 1 回 750mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 200mg(力価)及びランソプラゾールとして 1 回 30mg の 3 剤を同時に 1 日 2 回、7 日間経口投与する。 なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1 回 400mg(力価)1 日 2 回を上限とする。
用法・用量（胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染）の追加	2002 年 4 月 11 日 （カプセル、錠 250）	**・アモキシシリン、クラリスロマイシン及びオメプラゾール併用の場合** 通常、成人にはアモキシシリンとして 1 回 750mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 400mg(力価)及びオメプラゾールとして 1 回 20mg の 3 剤を同時に 1 日 2 回、7 日間経口投与する。
用法・用量（胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症）の追加	2007 年 1 月 26 日 （カプセル、細粒、錠 250）	**・アモキシシリン、クラリスロマイシン及びラベプラゾールナトリウム併用の場合** 通常、成人にはアモキシシリンとして 1 回 750mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 200mg(力価)及びラベプラゾールナトリウムとして 1 回 10mg の 3 剤を同時に 1 日 2 回、7 日間経口投与する。 なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1 回 400mg(力価)1 日 2 回を上限とする。
用法・用量（胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症）の変更 （下線部）	2007 年 1 月 31 日 （カプセル、錠 250）	**・アモキシシリン、クラリスロマイシン及びオメプラゾール併用の場合** 通常、成人にはアモキシシリンとして 1 回 750mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 <u>200mg(力価)</u>及びオメプラゾールとして 1 回 20mg の 3 剤を同時に 1 日 2 回、7 日間経口投与する。 <u>なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1 回 400mg(力価)1 日 2 回を上限とする。</u>
用法・用量（胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症）の追加	2007 年 8 月 23 日 （カプセル、錠 250）	**・アモキシシリン、クラリスロマイシン及びプロトンポンプインヒビター併用によるヘリコバクター・ピロリの除菌治療が不成功の場合** 通常、成人にはアモキシシリン水和物として 1 回 750mg(力価)、メトロニダゾールとして 1 回 250mg 及びプロトンポンプインヒビターの 3 剤を同時に 1 日 2 回、7 日間経口投与する。

項　目	追加変更等の年月日	変更追加の内容
効能・効果	2010 年 6 月 18 日 （カプセル、錠 250）	胃 MALT リンパ腫・特発性血小板減少性紫斑病・早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリ感染症
用法・用量（ヘリコバクター・ピロリ感染症）の記載方法変更 （下線部）	2010 年 6 月 18 日 （カプセル、錠 250）	**[ヘリコバクター・ピロリ感染症]** **・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びプロトンポンプインヒビター併用の場合** 通常、成人にはアモキシシリン水和物として 1 回 750mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 200mg（力価）及びプロトンポンプインヒビターの 3 剤を同時に 1 日 2 回、7 日間経口投与する。 なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1 回 400mg(力価)1 日 2 回を上限とする。
用法・用量（ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症）の小児に対する最大投与量、記載方法の変更 （下線部）	2012 年 2 月 22 日 （カプセル、細粒、錠 250）	**[ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症]** 成人：アモキシシリン水和物として、通常 1 回 250mg(力価)を 1 日 3～4 回経口投与する。 なお、年齢、症状により適宜増減する。 小児：アモキシシリン水和物として、通常 1 日 20～40mg(力価)/kg 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が、1 日量として最大 90mg(力価)/kg を超えないこと。
効能・効果	2013 年 2 月 21 日 （カプセル、錠 250）	ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎
用法・用量（ヘリコバクター・ピロリ感染症）の記載方法変更 （下線部）	2013 年 2 月 21 日 （カプセル、錠 250）	**[ヘリコバクター・ピロリ感染症、ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎]** **・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びプロトンポンプインヒビター併用の場合** 通常、成人にはアモキシシリン水和物として 1 回 750mg(力価)、クラリスロマイシンとして 1 回 200mg(力価)及びプロトンポンプインヒビターの 3 剤を同時に 1 日 2 回、7 日間経口投与する。 なお、クラリスロマイシンは、必要に応じて適宜増量することができる。ただし、1 回 400mg(力価)1 日 2 回を上限とする。

＊：再評価結果に合わせて、「効能・効果」等を一部変更。

13.再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果通知年月日：2004 年 9 月 30 日

結果：「効能・効果」を一部改めることにより、薬事法第 14 条第 2 項各号のいずれにも該当しないと通知されたため、下記のとおり「効能・効果」を変更した

［旧効能・効果］

アモキシシリン感性の大腸菌、変形菌（特にプロテウス・ミラビリス）、インフルエンザ菌、淋菌、溶血連鎖球菌、腸球菌、肺炎球菌、ブドウ球菌及び梅毒トレポネーマによる下記感染症

○敗血症、細菌性心内膜炎
○気管支炎、肺炎、咽頭炎、扁桃炎、猩紅熱、中耳炎、耳せつ、鼻せつ
○乳腺炎、リンパ節炎、骨髄炎、骨膜炎
○胆管炎、胆のう炎、急性膵炎
○腎盂腎炎、膀胱炎、尿道炎、前立腺炎、副睾丸炎、淋疾、梅毒
○子宮付属器炎、子宮内感染、子宮旁結合織炎、骨盤腹膜炎
○眼瞼炎、涙のう炎、麦粒腫
○毛のう炎、膿皮症、膿痂疹、せつ、よう、ざ瘡、膿瘍、蜂窩織炎、感染粉瘤、ひょう疽、褥瘡
○創傷及び手術後の二次感染
○歯齦膿瘍、急性顎炎、顎骨周囲炎、智歯周囲炎、歯槽骨炎
胃潰瘍又は十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染

［新効能・効果］

<適応菌種>
本剤に感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、淋菌、大腸菌、プロテウス・ミラビリス、インフルエンザ菌、ヘリコバクター・ピロリ、梅毒トレポネーマ
<適応症>
表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、びらん・潰瘍の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、咽頭･喉頭炎、扁桃炎、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、前立腺炎（急性症、慢性症）、精巣上体炎（副睾丸炎）、淋菌感染症、梅毒、子宮内感染、子宮付属器炎、子宮旁結合織炎、涙嚢炎、麦粒腫、中耳炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、猩紅熱、胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症

胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症

・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びランソプラゾール併用の場合(カプセル、錠のみ)
　再審査結果通知年月日：2008 年 3 月 24 日
　結果：薬事法第 14 条第 2 項第 3 号イからハまでのいずれにも該当しない
・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びオメプラゾール併用の場合(カプセル、錠のみ)
　再審査結果通知年月日：2009 年 3 月 30 日
　結果：薬事法第 14 条第 2 項第 3 号イからハまでのいずれにも該当しない
・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びラベプラゾールナトリウム併用の場合
　再審査結果通知年月日：2013 年 4 月 4 日
　結果：薬事法第 14 条第 2 項第 3 号イからハまでのいずれにも該当しない

14.再審査期間

＜ヘリコバクター・ピロリ感染を除く感染症＞

該当しない

＜ヘリコバクター・ピロリ感染症＞

○胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症

・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びランソプラゾール併用の場合(カプセル、錠のみ)

2000 年 9 月 22 日～2004 年 9 月 21 日(4 年)

・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びオメプラゾール併用の場合(カプセル、錠のみ)

2002 年 4 月 11 日～2006 年 4 月 10 日(4 年)

・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びラベプラゾールナトリウム併用の場合

2007 年 1 月 26 日～2011 年 1 月 25 日(4 年)

・アモキシシリン水和物、クラリスロマイシン及びプロトンポンプインヒビター併用による ヘリコバクター・ピロリの除菌療法が不成功の場合

該当しない

○胃 MALT リンパ腫・特発性血小板減少性紫斑病・早期胃癌に対する内視鏡的治療後胃におけるヘリコバクター・ピロリ感染症

該当しない

15.投薬期間制限医薬品に関する情報

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。

ただし、使用上の注意には以下の記載がある。

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

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

16.各種コード

販売名	HOT(9 桁)番号	厚生労働省薬価基準収載コード	レセプト電算処理コード
パセトシンカプセル 125	110736401	6131001M1070	620007024
パセトシンカプセル 250	110742501	6131001M2319	620007025
パセトシン細粒 10%	110726501	6131001C1228	620007026
パセトシン錠 250	110733301	6131001F2042	616130295

17.保険給付上の注意

該当しない

ＸＩ．文献

1.引用文献

文献請求 No

1) Chemotherapy, 21（8）：1973 を中心に集計
2) Shiozawa, E. et al. : J. Gastroenterol. Hepatol., 24（2）：307, 2009 [019-586]
3) Sato, R. et al. : Arch. Intern. Med., 164（17）：1904，2004 [019-614]
4) Fukase, K. et al. : Lancet, 372（9636）：392, 2008 [019-635]
5) Watanabe, H. et al. : J. Int. Med. Res., 31（5）：362, 2003 [023-092]
6) Kodama, M. et al. : J. Gastroenterol., 47（4）：394, 2012 [023-093]
7) 三橋　進, 他：Chemotherapy, 21（8）：1355，1973 [000-210]
8) 中沢昭三, 他：Chemotherapy, 21（8）：1375，1973 [000-225]
9) 小野田洋一, 他：Jpn. J. Antibiotics, 30（9）：744，1977 [000-151]
10) 渡辺邦友, 他：Chemotherapy, 21（8）：1369，1973 [000-208]
11) Sutherland, R., et al. : Antimicrob. Ag. Chemother., 10：411，1970 [014-269]
12) 上田　泰, 他：Chemotherapy, 21（8）：1446，1973 [000-229]
13) 新薬承認情報集 NO. 41, 147－159，2000：日本薬剤師研修センター
14) Miki, F. : an International Symposium on Amoxycillin（London 1973） [001-996]
15) Zarowny, D., et al. : Clin. Pharmacol Ther., 16（6）：1045，1974 [014-270]
16) USPDI20TH EDITON, MICROMEDEX 2411－2412，2000
17) 佐藤　清, 他：Chemotherapy, 21（8）：1383，1973 [000-224]
18) 真下啓明, 他：Chemotherapy, 21（8）：1441，1973 [000-230]
19) 青河寛次, 他：Chemotherapy, 21（8）：1780，1973 [013-106]
20) 古谷　博, 他：Chemotherapy, 21（8）：1752，1973 [013-075]
21) Strausbaugh, LJ., et al. : Antimicrob. Ag. Chemother. 14,（6）：899, 1978 [014-271]
22) 羽田　回：Jap. J. Antibiotics, 30（6）：450，1977 [000-103]
23) 近藤　茂：Chemotherapy, 21（8）：1638，1973 [000-190]
24) 高須照男, 他：Chemotherapy, 21（8）：1838，1973 [000-174]
25) 村川武雄, 他：Chemotherapy, 21（8）：1399，1973 [000-222]
26) 古沢悌二, 他：Chemotherapy, 21（8）：1624，1973 [000-189]
27) 加地正伸, 他：腎と透析, 19（2）：211，1985 [014-272]
28) Francke, EL., et al. : Clin. Pharmacol Ther., 26：31，1979 [014-273]
29) 山田政春, 他：皮膚, 23（1）：121，1981 [000-129]
30) Lind, T., et al. : Helicobacter, 1（3）：138，1996 [015-587]
31) Lind, T., et al. : Gastroenterology, 116（2）：248，1999 [015-588]
32) Veldhuyzen, van Zanten, SJO., et al. : Aliment. Pharmacol. Ther., 13（3）：289，1999 [015-589]
33) Malfertheiner, P., et al. : Aliment. Pharmacol. Ther., 13（6）：703，1999 [015-590]
34) 内田精一, 他：Chemotherapy, 21（8）：1392，1973 [000-223]
35) 宮崎英治, 他：基礎と臨床, 7（13）：3040，1973 [000-093]
36) 宮崎英治, 他：基礎と臨床, 7（13）：3074，1973 [000-095]

37) 宮崎英治, 他：基礎と臨床, 7（13）：3113，1973 [000-096]
38) 峯　靖弘, 他：Chemotherapy, 21（8）：1409，1973 [000-221]

2.その他の参考文献

文献請求 No

公知申請に関連する資料

（1）胃潰瘍・十二指腸潰瘍におけるヘリコバクター・ピロリ感染症（二次除菌）
国内 10 文献

1) Shimoyama T. et al.：J. Gastroenterol., 39（10）：927，2004 [023-217]
2) 沖本 忠義 他：第 9 回日本ヘリコバクター学会抄録集，：46，2003 [023-226]
3) Isomoto H. et al.：Aliment. Pharmacol. Ther., 18（1）：101，2003 [023-218]
4) 桜井 宏一 他：日本消化器病学会雑誌, 101（Suppl）：A692，2004 [023-219]
5) 横地　眞 ：Frontiers in Gastroenterology, 9（3）：264，2004 [023-220]
6) Shirai N. et al.：Gastroenterology., 128（4 Supp 2）：A430，2005 [023-221]
7) 白土 綾佳 他：日本消化器病学会雑誌, 102（Suppl）：A717，2005 [023-222]
8) 今瀬 教人 他：新薬と臨床，51（8）：743，2002 [023-223]
9) 丸岡 直隆 他：日本消化器病学会雑誌, 100（Suppl）：A235，2003 [023-224]
10) Kawai T. et al.：Gastroenterology., 128（4 Supp 2）：A428，2005 [023-225]

（2）胃 MALT リンパ腫
国内 18 文献（用法・用量内 3 文献、用法・用量外 15 文献）、海外 10 文献

1) Ono, S. et al.：Gastrointest. Endosc., 68（4）：624，2008 [019-585]
2) Shiozawa, E. et al.：J. Gastroenterol. Hepatol., 24（2）：307，2009 [019-586]
3) 大楽 尚弘 他：胃と腸，39（3）：277，2004 [019-587]
4) Urakami, Y. et al.：J. Gastroenterol. Hepatol., 15（10）：1113，2000 [019-588]
5) Nakamura, T. et al.：J. Gastroenterol., 38（10）：921，2003 [019-589]
6) 加藤 俊幸 他：胃と腸，42（8）：1217，2007 [019-590]
7) 小野 裕之 他：胃と腸，37（4）：521，2002 [019-591]
8) 目良 清美 ：癌の臨床，50（7）：565，2004 [019-592]
9) 西崎 朗 他：癌の臨床，50（7）：539，2004 [019-593]
10) Hiyama, T. et al.：Oncol. Rep., 8（2）：289，2001 [019-594]
11) Takenaka, R. et al.：Helicobacter, 9（3）：194，2004 [019-595]
12) Nakamura, S. et al.：Cancer, 104（3）：532，2005 [019-596]
13) Ohashi, S. et al.：Scand. J. Gastroenterol., 37（3）：279，2002 [019-597]
14) 加藤 俊幸 他：胃と腸，34（11）：1345，1999 [019-598]
15) Terai, S. et al.：Tohoku J. Exp. Med., 214（1）：79，2008 [019-599]
16) 北台 靖彦 他：消化器科，38（1）：46，2004 [019-600]
17) 炭田 知宜 他：消化器科，48（1）：33，2009 [019-601]
18) 郷田 憲一 他：Gastroenterol. Endosc.，45（9）：1881，2003 [019-602]

19) Yeh, H. Z. et al. : J. Gastroenterol. Hepatol., 18（2）: 162，2003 [019-603]
20) Nobre-Leitão, C. et al. : Am. J. Gastroenterol., 93（5）: 732，1998 [019-604]
21) Kim. Y. S. et al. : J. Gastroenterol., 37（1）: 17，2002 [019-605]
22) Lévy, M. et al. : J. Clin. Oncol., 23（22）: 5061，2005 [019-606]
23) Yi, Z. H. et al. : Chin. J. Dig. Dis., 7（1）: 12，2006 [019-607]
24) Lee, S. K. et al. : World J. Gastroenterol., 10（2）: 223，2004 [019-608]
25) Diz-Lois Palomares, M. T. et al. : Rev. Esp. Enferm. Dig., 94（11）: 674，2002 [019-609]
26) Montalban, C. et al. : Haematologica, 86（6）: 609，2001 [019-610]
27) Chen, L. T. et al. : J. Natl. Cancer Inst., 97（18）: 1345，2005 [019-611]
28) Levy, M. et al. : Am. J. Gastroenterol., 97（2）: 292，2002 [019-612]

（3）特発性血小板減少性紫斑病

国内 19 文献（用法・用量内 13 文献、用法・用量外 6 文献）、海外 4 文献

1) Suzuki, T. et al. : Am. J. Gastroenterol., 100（6）: 1265，2005 [019-613]
2) Sato, R. et al. : Arch. Intern. Med., 164（17）: 1904，2004 [019-614]
3) Inaba, T. et al. : Eur. J. Clin. Invest., 35（3）: 214，2005 [019-615]
4) Asahi, A. et al. : Haematologica, 91（10）: 1436，2006 [019-616]
5) Kodama, M. et al. : Helicobacter, 12（1）: 36，2007 [019-617]
6) Ando, K. et al. : Int. J. Hematol., 77（3）: 239，2003 [019-618]
7) Fujimura, K. et al. : Int. J. Hematol., 81（2）: 162，2005 [019-267]
8) Hashino, S. et al. : Int. J. Hematol., 77（2）: 188，2003 [019-619]
9) Ishiyama, M. et al. : Int. J. Hematol., 83（2）: 147，2006 [019-620]
10) Satake, M. et al. : J. Gastroenterol. Hepatol., 22（12）: 2233，2007 [019-621]
11) 野村 昌作 他：MHC, 14（2）: 201，2007 [019-622]
12) 稲垣 直子 他：臨床血液，48（9）: 1145，2007 [019-623]
13) 末盛 晋一郎 他：川崎医会誌， 31（4）: 243，2005 [019-624]
14) Hino, M. et al. : Ann. Hematol., 82（1）: 30，2003 [019-625]
15) Kohda, K. et al. : Br. J. Haematol., 118（2）: 584，2002 [019-626]
16) 加藤 功大 他：日本消化器病学会雑誌， 101（11）: 1209，2004 [019-627]
17) Ando, T. et al. : Helicobacter, 9（5）: 443，2004 [019-628]
18) Nomura, S. et al. : Eur. J. Haematol., 72（4）: 304，2004 [019-629]
19) 福山 隆之 他：消化器科，40（1）: 47，2005 [019-630]
20) Rostami, N. et al. : Am. J. Hematol., 83（5）: 376，2008 [019-631]
21) Stasi, R. et al. : Am. J. Med., 118（4）: 414，2005 [019-632]
22) Jarque, I. et al. : Br. J. Haematol., 115（4）: 1002，2001 [019-633]
23) Scandellari, R. et al. : Blood Coagul. Fibrinolysis. 20（2）: 108，2009 [019-634]

（4）早期胃癌の内視鏡治療後胃

国内 7 文献（用法・用量内 5 文献、用法・用量外 2 文献）

1) Fukase, K. et al. : Lancet, 372（9636）: 392, 2008 [019-635]
2) Nakagawa, S. et al. : Aliment. Pharmacol. Ther., 24（Suppl 4）: S214, 2006 [019-636]
3) Tashiro, J. et al. : Dig. Endosc., 19（4）: 167, 2007 [019-637]
4) Shiotani, A. et al. : Digestion, 78（2-3）: 113, 2008 [019-638]
5) Kamada, T. et al. : Aliment. Pharmacol. Ther., 21（9）: 1121, 2005 [019-639]
6) 早川 誠 他 : 日本消化器内視鏡学会雑誌, 43（Suppl 2）: S1731, 2001 [019-640]
7) Uemura, N. et al. : Cancer Epidemiol. Biomarkers Prev., 6（8）: 639, 1997 [019-641]

（5）小児への効果

1) Amoxil®添付文書（米国）、GlaxoSmithKline 社（2009 年 9 月）
2) Amoxil® 500mg 注射液添付文書（英国）、GlaxoSmithKline 社（2010 年 3 月）
3) Amoxil® 1g 注射液添付文書（英国）、GlaxoSmithKline 社（2010 年 3 月）
4) Amoxil® 250mg カプセル添付文書（英国）、GlaxoSmithKline 社（2010 年 11 月）
5) Amoxil® 500mg カプセル添付文書（英国）、GlaxoSmithKline 社（2010 年 11 月）
6) Amoxil® 3g 分包添付文書（英国）、GlaxoSmithKline 社（2010 年 11 月）
7) Amoxil® 小児用懸濁液添付文書（英国）、GlaxoSmithKline 社（2010 年 11 月）
8) Amoxicillin STADA® 添付文書（独国）、STADApharm 社（2004 年 3 月）
9) Clamoxil® 添付文書（仏国）、GlaxoSmithKline 社（2009 年 1 月）
10) Arguedas, A. et al. : Pediatr. Infect. Dis. J., 24（2）: 153, 2005 [019-824]
11) Garrison, GD. et al. : Ann. Pharmacother., 38（1）: 15, 2004 [019-825]
12) Hazir, T. et al. : Arch. Dis. Child., 92（4）: 291, 2007 [019-826]
13) Piglansky, L. et al.: Pediatr. Infect. Dis. J., 22（5）: 405, 2003 [019-827]
14) Bottenfield, GW. et al.: Pediatr. Infect. Dis. J., 17（10）: 963, 1998 [019-828]
15) Dagan, R. et al. : Pediatr. Infect. Dis. J., 20（9）: 829, 2001 [019-829]
16) Adam, D. et al. : Antimicrob. Agents. Chemother., 22（3）: 353, 1982 [019-830]
17) Kang, JH. et al.: Jpn. J. Antibiotics., 63（1）: 11, 2010 [019-831]
18) Bingen, E. et al.: Antimicrob. Agents. Chemother., 47（7）: 2345, 2003 [019-832]
19) Rafeey, M. et al.: J. Infect. Chemother., 13（5）: 291, 2007 [019-833]
20) Schito, GC. et al.: J. Antimicrob. Chemother., 50（T-1）: 7, 2002 [019-834]
21) Jacobs, MR. et al.: Antimicrob. Agents. Chemother., 43（8）: 1901, 1999 [019-835]
22) García-Cobos, S. et al.: Antimicrob. Agents. Chemother., 52（8）: 2760, 2008 [019-836]
23) Hoban, DJ. et al.: Clinical. Infect. Diseases., 32（Suppl 2）: S81, 2001 [019-837]
24) 冨山 道夫 : 日本耳鼻咽喉科感染症研究会会誌, 21（1）: 48, 2003 [019-838]
25) 冨山 道夫 : 日本耳鼻咽喉科感染症研究会会誌, 22（1）: 42, 2004 [019-839]

26) 冨山 道夫：日本耳鼻咽喉科感染症研究会会誌, 24（1）：28, 2006 [019-840]
27) 冨山 道夫：日本耳鼻咽喉科感染症研究会会誌, 25（1）：111, 2007 [019-841]
28) 林 達哉 他：Otol. Jpn., 17（2）：118, 2007 [019-842]
29) 宇野 芳史：Otol. Jpn., 18（5）：639, 2008 [019-843]
30) 深澤 満：外来小児科, 12（3）：302, 2009 [019-844]
31) 菅原 一真 他：日本耳鼻咽喉科感染症研究会会誌, 28（1）：31, 2010 [019-845]
32) 小森 学 他：Otol. Jpn., 20（3）：156, 2010 [019-846]
33) 杉田 麟也 他：新薬と臨牀, 54（9）：1056, 2005 [019-847]
34) 田島 剛 他：日本化学療法学会総会プログラム・講演抄録, 56（Suppl A）：155, 2008 [019-848]
35) 坂田 宏：日本化学療法学会雑誌, 58（3）：239, 2010 [019-849]
36) 平潟 洋一 他：Jpn. J. Antibiotics., 62（2）：90, 2009 [019-850]
37) 小林 寅喆 他：化学療法の領域, 23（11）：75, 2007 [019-851]
38) 山口 惠三 他：日本化学療法学会雑誌, 53（10）：627, 2005 [019-852]
39) Furuya, R. et al.：J. Infect. Chemother., 12（4）：172, 2006 [019-853]
40) 村上 和成 他：日本ヘリコバクター学会誌, 9（2）：93, 2008 [019-854]
41) Ramakrishnan, K. et al.: Am. Fam. Physician., 76（11）：1650, 2007 [019-855]
42) Barenkamp, SJ. et al.: Adv. Pediatr., 53：241, 2006 [019-856]
43) Fauci, AS. et al.: Harrison's Principles of Internal Medicine, 17th edition, The McGraw-Hill Companies, 208, 2008
44) Kliegman, RM. et al.: Nelson Textbook of Pediatrics, 18th edition, Sauders, 2632, 2007
45) Pickering, LK. et al.: Red Book 2009, American Academy of Pediatrics, 524, 2009
46) Mandell, GL. et al.: Mandell, Douglas, and Bennett's Principle's and Practice of Infectious Diseases, Churchill Livingstone, 831, 2000
47) Glibert, DN. et al.: The Sanford Guide to Antimicrobial Therapy, Antimicrobial Therapy, 10, 2010
48) 日本耳科学, 日本小児耳鼻咽喉科学会, 日本耳鼻咽喉科感染症研究会 編：小児急性中耳炎診療ガイドライン 2009 年版. 金原出版, 2009
49) Diagnosis and Management of Acute Otitis Media: Pediatrics, 113（5）：1451, 2004 [019-857]
50) Dowell, SF. et al.: Pediatr. Infect. Dis. J., 18（1）：1, 1999 [019-858]
51) クラバモックス小児用配合ドライシロップ添付文書（グラクソ・スミスクライン株式会社）（2010 年 9 月改訂（第 7 版））
52) Craig, WA. et al.: Pediatr. Infect. Dis. J., 15（3）：255, 1996 [019-859]
53) Dagan, R. et al.: J. Antimicrob. Chemother., 47（2）：129, 2001 [019-860]
54) アモキシシリン水和物製剤 添付文書（日本）サワシリンカプセル 125/カプセル 250/細粒 10%/錠 250（2011 年 3 月改訂（第 18 版））

(6) ヘリコバクター・ピロリ感染胃炎

国内 2 文献、海外 7 文献

1) Watanabe, H. et al. : J. Int. Med. Res., 31（5）: 362, 2003 [023-092]
2) Kodama, M. et al. : J. Gastroenterol., 47（4）: 394, 2012 [023-093]
3) Sung, JJ. et al. : Gastroenterology., 119（1）: 7, 2000 [023-094]
4) Mazzoleni, LE. et al. : Dig Dis Sci., 51（1）: 89, 2006 [023-095]
5) Vakil, N. et al. : Aliment Pharmacol Ther., 24（1）: 55, 2006 [023-096]
6) Koskenpato, J. et al. : Scand J Gastroenterol., 37（7）: 778, 2002 [023-097]
7) Ercin, CN. et al. : Anatol J Clin Investig., 2（3）: 118, 2008 [023-098]
8) Milutinovic, AS. et al. : Eur J Gastroenterol Hepatol., 15（7）: 755, 2003 [023-099]
9) van der Schaar, PJ. et al. : Dig Dis Sci., 46（9）: 1833. 2001 [023-100]

ⅩⅡ．参考資料

1.主な外国での発売状況

アモキシシリン水和物製剤は、海外約 40 ヵ国で販売されている（2010 年 3 月現在）。

2.海外における臨床支援情報

（1）妊婦に対する海外情報（FDA、オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下の通りであり、米国 FDA、オーストラリア分類とは異なる。

【使用上の注意】「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」

1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。［妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。また、臍帯血、羊水へ移行することが報告されている。なお、動物試験(ラット)において、アモキシシリン水和物(500mg/kg/日)、クラリスロマイシン(160mg/kg/日)及びランソプラゾール(50mg/kg/日)を併用投与すると、母動物での毒性の増強とともに胎児の発育抑制の増強が認められている。また、ラットにアモキシシリン水和物(400mg/kg/日以上)、クラリスロマイシン(50mg/kg/日以上)及びラベプラゾールナトリウム(25mg/kg/日)を 4 週間併用投与した試験で、雌で栄養状態の悪化が認められている。］

2)授乳中の婦人に投与する場合には授乳を避けさせることが望ましい。［母乳中へ移行することが報告されている。(「薬物動態」の項参照)］

	分類
FDA：Pregnancy Category	B （2014 年 7 月米国添付文書）
オーストラリアの分類：（An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy）	A※ (2015 年 5 月 database)

※：amoxycilllin の情報

参考：分類の概要

FDA：Pregnancy Category Definitions

B：Animal reproduction studies have failed to demonstrate a risk to the fetus and there are no adequate and well-controlled studies in pregnant women. Animal reproduction studies have shown an adverse effect (other than decrease in fertility), but adequate and well-controlled studies in pregnant women have failed to demonstrate a risk to the fetus during the first trimester of pregnancy (and there is no evidence of a risk in later trimesters).

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）小児等に関する記載

本邦における使用上の注意「小児等への投与」の項の記載は以下のとおりであるが、参考として米国の添付文書を記載する。

【使用上の注意】「小児等への投与」

低出生体重児、新生児に対する安全性は確立していない（使用経験がない）。

AMOXICILLIN　米国添付文書（2014 年 7 月）

8.4 Pediatric Use

Because of incompletely developed renal function in neonates and young infants, the elimination of amoxicillin may be delayed. Dosing of amoxicillin should be modified in pediatric patients 12 weeks or younger (≦ 3 months) [*see Dosage and Administration (2.2)*].

ⅩⅢ．備考

その他の関連資料

「配合変化試験成績」を次頁以降に掲載

※2015 年 6 月における改訂（パセトシン細粒 10%）
・包装規格「[分包]1g×300 包」の削除　等
・識別コード、容器の材質（分包）の削除　等

[配合変化試験成績]

■ここに記載している配合変化試験成績は参考情報であり、配合を推奨するものではありません。
■保存状態ほか、試験（配合）条件により結果が異なる場合があります。
※配合薬剤名、一般名は試験当時のものを記載しています。

1. ドライシロップ・細粒・顆粒・散剤・末との配合変化

●試料

パセトシン細粒10％1gと各薬剤の小児1日量（最大量）を混合し、混合薬剤のほぼ1gをラミネート加工グラシン紙（透湿度：40～50g/m², 24hr）で33mm×40mmの寸法（内寸）に分包した。配合薬の種類と配合量は試験結果の別表に一覧表示した。

●保存条件

恒温恒湿器を用い25℃, 70%RHとした。

●試験項目

外　観：肉眼的観察による。
懸濁性：調剤1日量に水20mLを加えて試験管中で振盪し目視観察
色　調：色測色差計による。
重　量：重量変化
含　量：アモキシシリン水和物表示量に対する%－HPLC法による。（混合直後、5日）

●観察期間

混合直後、1日，3日，5日

●試験結果

市販の医薬品との配合変化試験結果は表1 に示すとおりである。
パセトシン細粒10％は、他の散剤と配合すると吸湿してくる傾向があるので、これらの薬剤と配合する場合は、防湿するか又は用時調製とする方がよい。
また、アスピリン、デパケン細粒、PL顆粒、リンコデ100倍散、ワッサーV顆粒との配合では水に懸濁した場合に沈降してしまうので、配合を避けた方が望ましい。
なお、観察期間中、主薬（アモキシシリン水和物）の力価低下（90% 以下）を来したものは、アスコルビン酸とラックビーであった。

表1. パセトシン細粒10%-ドライシロップ・細粒・顆粒・散剤・末との配合変化試験結果
※配合薬剤名、一般名は試験当時のものを記載しています。

－：変化なし　／：未測定

配合薬剤（一般名）	含量	配合量	試験項目	時間 混合直後	1日	3日	5日
アスコルビン酸（日局アスコルビン酸）	1g/g	1.0g	外観	橙色	わずかに湿潤	湿潤・固結	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	89.6(実測値)	／	／	87.9(実測値)
アストミン散（リン酸ジメモルファン）	100mg/g	0.3g	外観	淡橙色	－	わずかに湿潤	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	95.6
アスピリン（日局アスピリン）	1g/g	2.5g	外観	淡橙色	－	わずかに湿潤	湿潤・固結
			懸濁性	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)
			残存率(%)	100	／	／	101.9
アスベリン散（ヒベンズ酸チペピジン）（クエン酸チペピジン相当量）	1107mg/g 100mg/g	0.4g	外観	橙色	わずかに湿潤	湿潤・固結	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	94.6
アスベリンドライシロップ（ヒベンズ酸チペピジン）（クエン酸チペピジン相当量）	22.5mg/g 20mg/g	2.0g	外観	橙色	わずかに湿潤	湿潤・固結	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	101.3
アタラックスーPドライシロップ（パモ酸ヒドロキシジンを塩酸ヒドロキシジンとして）	25mg/g	2.0g	外観	橙黄色	－	－	わずかに湿潤
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	99.7
イノリン散（塩酸トリメトキノール）	10mg/g	0.4g	外観	橙色	－	わずかに湿潤	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	100.6
S・M散	配合剤	2.0g	外観	灰褐色	－	－	－
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	97.7

ー：変化なし　／：未測定

配合薬剤（一般名）	含量	配合量	試験項目	時間 混合直後	1日	3日	5日
エンテロノンーR（コンクエンテロポリアール末）	100mg/g 10^7個以上の生菌	1.5g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	わずかに湿潤	わずかに湿潤
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	100.6
スルピリン（日局スルピリン）	1g/g	0.5g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	湿潤・固結	湿潤・固結・淡黄橙色
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	96.4
タベジール散（フマル酸クレマスチン）（クレマスチン）	1.34mg/g 1mg/g	1.0g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	わずかに湿潤	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	98.2
デパケン細粒400（バルプロ酸ナトリウム）	400mg/g	1.5g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	わずかに湿潤	わずかに湿潤
			懸濁性	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)
			残存率(%)	100	／	／	98.8
トランサミンG（トラネキサム酸）	500mg/g	1.0g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	わずかに湿潤	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	97.1
ナウゼリンドライシロップ（ドンペリドン）	10mg/kg	4.0g	外観	淡橙色	ー	ー	ー
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	100.4
ノイチーム顆粒（塩化リゾチーム）	100mg（力価）	3.0g	外観	橙色/白色	ー	わずかに湿潤	わずかに湿潤
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	94.9
パントシン5倍散（パンテチン）	200mg/g	0.4g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	湿潤・固結	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	97.0
調剤用パンビタン末「タケダ」	配合剤	1.0g	外観	橙黄色	ー	わずかに湿潤	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	101.0
PL顆粒	配合剤	1.2g	外観	橙色/白色	わずかに湿潤	わずかに湿潤	湿潤・固結
			懸濁性	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)
			残存率(%)	100	／	／	97.6
幼児用PL顆粒	配合剤	8.0g	外観	淡橙色	ー	ー	ー
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	100.2
ビオスミン散	配合剤	3.0g	外観	淡橙色	ー	わずかに湿潤	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	100.9
ビオフェルミン	配合剤	3.0g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	わずかに湿潤	わずかに湿潤
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	103.7
ビソルボン細粒（塩酸ブロムヘキシン）	20mg/g	0.3g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	湿潤・固結	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	96.7
ビタメジン散	配合剤	0.5g	外観	淡赤橙色	わずかに湿潤	湿潤・固結	著しい湿潤・赤橙色
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	100.0
ヒベルナ散（ヒベンズ酸プロメタジン）	塩酸プロメタジンとして0.1g/gに相当するヒベンズ酸プロメタジンを含有	0.4g	外観	淡橙色	ー	ー	ー
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	99.3
ピレチア細粒（メチレンジサリチル酸プロメタジン）	塩酸プロメタジンとして100mg/g（メチレンジサリチル酸プロメタジン135mg/g）	0.4g	外観	淡橙色	ー	ー	ー
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	99.7
プレドニゾロン散「タケダ」（プレドニゾロン）	10mg/g	3.0g	外観	微橙色	わずかに湿潤	湿潤・固結	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	98.4
ベラチンドライシロップ（塩酸ツロブテロール）	1mg/g	0.8g	外観	橙色/白色	ー	ー	ー
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	103.9
ペリアクチン100倍散（塩酸シプロヘプタジン）	10mg/g	0.5g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	湿潤・固結	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	95.5
ポララミン散（*d*-マレイン酸クロルフェニラミン）	10mg/g	0.4g	外観	淡橙色	ー	ー	わずかに湿潤
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	98.8
ポンタール散（日局メフェナム酸）	500mg/g	1.0g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	湿潤・固結	湿潤・固結
			懸濁性	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)
			残存率(%)	100	／	／	101.7
ミヤBM細粒（宮入り菌末）	40mg/g	1.0g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	わずかに湿潤	わずかに湿潤
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	100.3

ー：変化なし　／：未測定

配合薬剤（一般名）	含量	配合量	試験項目	時間 混合直後	1日	3日	5日
メジコン散（臭化水素酸デキストロメトルファン）	100mg/g	0.6g	外観	淡橙色	ー	わずかに湿潤	わずかに湿潤
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	99.9
メチエフ10倍散（*dl*-塩酸メチルエフェドリン）	100mg/g	0.75g	外観	淡橙色	わずかに湿潤	湿潤・固結	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	97.1
モノフィリン（プロキシフィリン）		0.15g	外観	橙色/白色	ー	ー	わずかに湿潤
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	99.6
ラックビー（ラクトバチルス・ビフィズス生菌）	1mg/g	3.0g	外観	白色/橙色	湿潤・固結	湿潤・固結	湿潤・固結
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	84.0
リザベン細粒（トラニラスト）	100mg/g	10.0g	外観	橙色/黄緑色	ー	ー	ー
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	96.5
リンコデ100倍散（リン酸コデイン）	10mg/g	3.0g	外観	淡橙色	ー	ー	ー
			懸濁性	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)
			残存率(%)	100	／	／	101.5
リンデロン散（ベタメタゾン）	1mg/g	4.0g	外観	微橙色	ー	わずかに湿潤	わずかに湿潤
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	100.2
レベニン（ラクトバチルス・ビフィズス菌）	300mg/g	1.5g	外観	淡橙色	ー	わずかに湿潤	わずかに湿潤
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	95.6
ロートエキス散（日局ロートエキス）	100mg/g	0.5g	外観	帯灰橙色	わずかに湿潤	わずかに湿潤	わずかに湿潤
			懸濁性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	／	／	98.5
ワッサーV顆粒	配合剤	0.5g	外観	橙色/黄色	わずかに湿潤	湿潤・固結	湿潤・固結
			懸濁性	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)	不良(沈降)
			残存率(%)	100	／	／	96.0

2. シロップ・内用液剤との配合変化

●試料

パセトシン細粒10%1gを5mLの蒸留水であらかじめ懸濁し、各薬剤の小児用量と混合した。容器としてフラスコを用いた。配合薬の種類と配合量は結果の別表に一覧表示した。

●保存条件

室温散光下とし、配合薬に制約がある場合にはその条件に従った。

●試験項目

外　　観：肉眼的観察による。
再分散性：肉眼的観察による。
pH 測定　：pHメーターによる。
含　　量：アモキシシリン水和物表示量に対する%－HPLC法による。

●試験結果

市販の医薬品との配合変化試験結果は表2に示すとおりである。
パセトシン細粒10%と他の液剤を混合したとき、経時的に力価が低下（90%以下）するものが半数以上あり、これらの液剤と配合調剤する場合には、用時調製することが望ましい。
また、浮遊物が生じ内壁に付着し再分散性が低下するものがあったが、一定量の服用が保障できないことから、これらの薬剤との配合調剤は避けるべきと思われる。

表2.パセトシン細粒10%-シロップ・内容液剤との配合変化試験結果
※配合薬剤名、一般名は試験当時のものを記載しています。

配合薬剤（一般名）	含量	配合量	試験項目	時間 混合直後	1日	3日	5日
アストミンシロップ（リン酸ジメモルファン）	2.5mg/mL	12mL	外観	橙色懸濁液 淡橙色浮遊物	橙色懸濁液 淡橙色沈降物＋＋（一部内壁に付着）	橙色懸濁液 淡橙色沈降物＋＋（一部内壁に付着）	橙色懸濁液 淡橙色沈降物＋＋（一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	98.3	87.2	81.7
アスベリンシロップ（ヒベンズ酸チペピジン）（クエン酸チペピジン相当量）	5.54mg/mL 5mg	12mL	外観	淡橙色懸濁液	淡橙色懸濁液	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	97.5	91.8	89.0
アタラックスーPシロップ（日局パモ酸ヒドロキシジン）（塩酸ヒドロキシジン相当量）	8.5mg/mL 5mg	10mL	外観	橙黄色懸濁液 黄色浮遊物	橙黄色懸濁液 淡黄色沈降物＋＋（一部内壁に付着）	橙黄色懸濁液 淡黄色沈降物＋＋（一部内壁に付着）	橙黄色懸濁液 淡黄色沈降物＋＋（一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	95.0	92.1	91.5
アリメジンシロップ（日局酒石酸アリメマジン）	0.5mg/mL	3mL	外観	白色浮遊物	淡桃色沈降物＋＋（一部内壁に付着）	淡桃色沈降物＋＋（一部内壁に付着）	淡桃色沈降物＋＋（一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	80.3	68.7	74.9
イノリンシロップ（塩酸トリメトキノール）	1mg/mL	6mL	外観	淡橙色懸濁液	淡橙色懸濁液 白色の沈降物＋＋	淡橙黄色懸濁液 白色の沈降物＋＋	黄色懸濁液 白色沈降物＋＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	97.3	92.8	88.4
キョウニン水「ケンエー」（日局キョウニン水）	1mL/mL	1.5mL	外観	淡橙色懸濁液	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	104.5	94.5	99.8
クロダミンシロップ（*dl*-マレイン酸クロルフェニラミン）	0.5mg/mL	6mL	外観	淡橙色懸濁液	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	101.5	98.8	94.2
ザジテンシロップ（フマル酸ケトチフェン）（ケトチフェン）	0,276mg/mL 0.2mg/mL	6mL	外観	橙色懸濁液 白色浮遊物	橙色懸濁液 白色沈降物＋＋（一部内壁に付着）	橙色懸濁液 白色沈降物＋＋（一部内壁に付着）	橙色懸濁液 白色沈降物＋＋（一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	98.8	95.6	分離定量不能（配合薬とｱﾓｷｼｼﾘﾝのHPLCが重なる為）

配合薬剤（一般名）	含量	配合量	試験項目	時間			
				混合直後	1日	3日	5日
セネガシロップ（日局セネガ）	日局セネガ40mg中の10vエタノール浸出成分を含有	10mL	外観	淡茶褐色懸濁液	淡茶褐色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡茶褐色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡茶褐色懸濁液 白色沈降物＋＋＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	97.1	95.4	91.6
セルシンシロップ（ジアゼパム）	1mg/mL	10mL	外観	橙色懸濁液	橙色懸濁液 白色沈降物＋＋	橙色懸濁液 白色沈降物＋＋	橙色懸濁液 白色沈降物＋＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	97.9	96.9	96.3
セレスタミンシロップ（ベタメタゾン）（d-マレイン酸クロルフェニラミン）	0.05mg/mL 0.4mg/mL	5mL	外観	橙色懸濁液 白色浮遊物	橙色懸濁液 淡橙色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	橙色懸濁液 淡橙色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	橙色懸濁液 淡橙色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	97.7	94.6	86.8
タベジールシロップ（フマル酸クレマスチン）（クレマスチン）	0.134mg/mL 0.1mg/mL	10mL	外観	淡橙色懸濁液	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋ 白色浮遊物	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	93.9	87.6	80.1
デカドロンエリキシル（日局デキサメタゾン）	0.1mg/mL	40mL	外観	赤色懸濁液	赤色懸濁液 白色沈降物＋	赤色懸濁液 白色沈降物±	赤色澄明
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	98.3	94.9	85.5
デパケンシロップ（バルプロ酸ナトリウム）	50mg/mL	8mL	外観	赤桃色懸濁液	赤桃色懸濁液 白色沈降物＋＋＋ 白色浮遊物	赤桃色懸濁液 白色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	赤橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	84.9	68.5	13.5
トランサミンシロップ（トラネキサム酸）	50mg/mL	10mL	外観	赤桃色懸濁液 桃色浮遊物	赤桃色懸濁液 桃色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	赤桃色懸濁液 桃色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	赤桃色懸濁液 桃色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	94.7	86.8	73.5
ビソルボンシロップ（塩酸ブロムヘキシン）	0.8mg/mL	7.5mL	外観	淡橙色懸濁液 白色浮遊物	淡橙色懸濁液 淡橙色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	淡橙色懸濁液 淡橙色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	淡橙色懸濁液 淡橙色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	101.4	98.7	94.1
フェノバールエリキシル（日局フェノバルビタール）	4mg/mL	25mL	外観	赤色懸濁液	赤色懸濁液 淡赤色沈降物＋	赤色澄明	赤色澄明
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	79.3	63.3	56.0
フラビタンシロップ（フラビンアデニンジヌクレオチドナトリウムをFADとして）	3mg/mL	15mL	外観	黄橙色懸濁液 黄色浮遊物	黄橙色懸濁液 黄色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	黄橙色懸濁液 黄色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	黄橙色懸濁液 黄色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	99.5	96.7	96.0
プリンペランシロップ（塩酸メトクロプラミド）	1mg/mL	14mL	外観	淡褐色懸濁液	淡褐色懸濁液 淡褐色沈降物＋＋＋	淡褐色懸濁液 淡褐色沈降物＋＋＋	淡褐色懸濁液 淡褐色沈降物＋＋＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	89.9	76.9	67.0
ブロチン液（桜皮エキス）	33mg/mL	6mL	外観	茶色懸濁液	茶色懸濁液 淡茶色沈降物＋＋＋ 白色浮遊物	茶色懸濁液 淡茶色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	茶色懸濁液 淡茶色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	98.5	91.1	88.6
ベネトリンシロップ（硫酸サルブタモール）（サルブタモール）	0.48mg/mL 0.4mg/mL	15mL	外観	淡橙褐色懸濁液 白色浮遊物	淡橙褐色懸濁液 白色沈降物＋＋ （一部内壁に付着）	淡橙褐色懸濁液 白色沈降物＋＋ （一部内壁に付着）	淡橙褐色懸濁液 白色沈降物＋＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	84.2	73.1	64.3
ペリアクチンシロップ（日局塩酸シプロヘプタジン）	0.4mg/mL	5mL	外観	淡橙色懸濁液	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	101.3	97.5	96.4
ベロテックシロップ（臭化水素酸フェノテロール）	0.5mg/mL	15mL	外観	淡橙色懸濁液	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	98.4	93.5	93.7

配合薬剤 （一般名）	含量	配合量	試験項目	時間			
				混合直後	1日	3日	5日
ポララミンシロップ （*d*-マレイン酸クロルフェニラミン）	0.4mg/mL	2.5mL	外観	淡橙色懸濁液	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	89.9(実測値)	87.7(実測値)	88.6(実測値)	89.2(実測値)
ポンタールシロップ （メフェナム酸）	32.5mg/mL	30mL	外観	淡橙色懸濁液	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	96.5	96.4	90.8
ムコダインシロップ5％ （カルボシステイン）	20mg/mL	10mL	外観	赤色懸濁液 白色浮遊物	赤色懸濁液 白色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	赤色懸濁液 白色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	赤色懸濁液 白色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	97.2	89.9	53.4
メジコンシロップ （臭化水素酸デキストロメトルファン） （クレゾールスルホン酸カリウム）	2.5mg/mL 15mg/mL	5mL	外観	淡茶褐色懸濁液 白色浮遊物	淡茶褐色懸濁液 微褐色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	淡茶褐色懸濁液 微褐色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）	淡茶褐色懸濁液 微褐色沈降物＋＋＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	100.5	94.0	74.6
メプチンシロップ （塩酸プロカテロール）	5μg/mL	40mL	外観	淡橙色懸濁液	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋＋
			再分散性	良	良	良	良
			残存率(%)	100	98.5	99.7	95.9
リンデロンシロップ （ベタメタゾン）	0.1mg/mL	20mL	外観	橙色懸濁液 白色浮遊物	橙色懸濁液 白色の沈降物＋ （一部内壁に付着）	橙色懸濁液 白色の沈降物＋ （一部内壁に付着）	橙色懸濁液 白色の沈降物＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	97.2	85.7	64.4
レフトーゼシロップ （塩化リゾチーム）	5mg(力価)/mL	12mL	外観	淡橙色懸濁液 白色浮遊物	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋ （一部内壁に付着）	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋ （一部内壁に付着）	淡橙色懸濁液 白色沈降物＋＋ （一部内壁に付着）
			再分散性	不良	不良	不良	不良
			残存率(%)	100	95.9	86.9	71.2

Memo

協和発酵キリン株式会社

PAST0001EGA15F