



※※2014年11月改訂(薬事法改正に伴う改訂、他)(第10版)

※2013年 4月改訂

貯 法: 密閉容器、室温保存

使用期限: 包装に表示の期限内に使用すること

EF

日本標準商品分類番号
876142

抗生物質製剤

※※ 処方箋医薬品*

アセチルスピラマイシン錠 100

アセチルスピラマイシン錠 200

ACETYLSPIRAMYCIN Tablets
スピラマイシン酢酸エステル錠

※※ *注意-医師等の処方箋により使用すること

	100mg錠	200mg錠
承認番号	21800AMX10202	21800AMX10201
薬価収載	2006年 6月	2006年 6月
販売開始	1967年 9月	1968年 6月
薬効再評価(第7次)	1975年12月	
再評価結果	1993年 9月	
再評価結果	2004年 9月	

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】





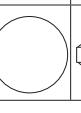
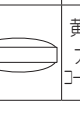
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

1. 組成

品名	アセチルスピラマイシン錠100	アセチルスピラマイシン錠200
有効成分	1錠中日局スピラマイシン酢酸エステル100mg(力価)	1錠中日局スピラマイシン酢酸エステル200mg(力価)
添加物	黄色5号アルミニウムレーキ、日局カルナウパロウ、日局カルメロースカルシウム、日局軽質無水ケイ酸、ショ糖脂肪酸エステル、日局ステアリン酸マグネシウム、日局タルク、トリアセチン、日局乳糖水和物、日局ヒプロメロース(置換度タイプ:2910)、ポリビニルアルコール(部分けん化物)	

※ 2. 製剤の性状

品名	直径(mm)	厚さ(mm)	重量(g)	表面	裏面	側面	色調 剤皮	識別記号
アセチルスピラマイシン錠100	8.1	3.6	0.15				黄橙色 フィルム コーティング錠	KH803 (錠剤本体、 PTPシート に表示)
アセチルスピラマイシン錠200	10.1	4.5	0.26				黄橙色 フィルム コーティング錠	KH804 (錠剤本体、 PTPシート に表示)

【効能・効果】

〈適応菌種〉

スピラマイシンに感性的なブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、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、乳腺炎、骨髄炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、慢性呼吸器病変の二次感染、梅毒、子宮付属器炎、涙囊炎、麦粒腫、中耳炎、猩紅熱

【用法・用量】

通常、成人にはスピラマイシン酢酸エステルとして1回200mg(力価)を1日4~6回経口投与する。
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)

肝機能障害又は腎機能障害のある患者[体内貯留が延長するおそれがある。]

2. 副作用

承認時及び1970年2月までの副作用頻度調査において、5,903例中、副作用の発現例は180例(発現率3.0%)であった。主な副作用は食欲不振60件(1.0%)、悪心・嘔吐37件(0.6%)、皮膚発疹・発赤27件(0.5%)、下痢14件(0.2%)、胃部不快感10件(0.2%)等であった。

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・発赤		
消化器	食欲不振、 悪心・嘔吐、 下痢、胃部不快感	軟便、口内炎	胃部圧迫感

3. 高齢者への投与

高齢者では肝機能、腎機能が低下していることが多く、体内貯留の延長のおそれがあるため減量するなど注意すること。

4. 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。]

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。]

5. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児に対する安全性は確立していない。

6. 臨床検査結果に及ぼす影響

フェニルヒドラジン反応(Porter-Silver反応)が陽性になることがある。

7. 適用上の注意

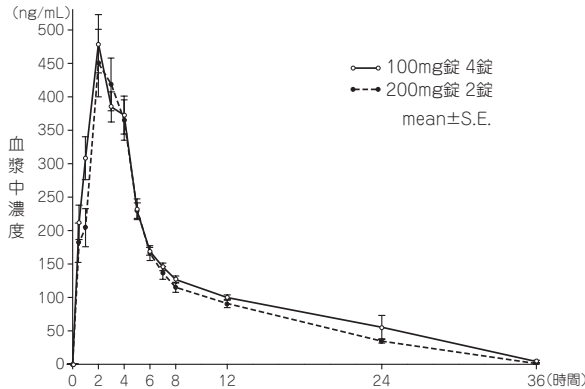
薬剤交付時

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。]

【薬物動態】

1. 吸収¹⁾

健康成人20名にスピラマイシン酢酸エステル400mg(100mg錠4錠及び200mg錠2錠)を経口投与した場合の血漿中濃度の推移は下図のとおりである。



2. 分布

● 体組織への分布 (参考: ラットでのデータ²⁾)

ラットにスピラマイシン酢酸エステル500mg/kgを経口投与したところ、3時間後の体組織への分布は、肝臓>脾臓>肺>腎臓の順であった。

● 通過性・移行性

血液-胎盤門通過性 ³⁾	臍帯血中には母体血中濃度の約1/2、胎盤組織中には母体血中濃度の約1/2~1/3が認められた。
その他の組織への移行性 ^{4)~6)}	胆汁中、膿汁中、肝、肺、胸水、母乳中へ移行し、血中濃度より高値を示した。なお、髄液中への移行は認められなかった。

3. 代謝⁷⁾⁸⁾

尿中代謝物として脱アセチル化体であるスピラマイシンとそれが更に代謝されてミカロースが外れたネオスピラマイシンが確認されている。

4. 排泄⁷⁾

健康成人3名にスピラマイシン酢酸エステル500mgを経口投与した場合、7時間までに投与量の約4%が尿中に排泄された。

【臨床成績】^{3)~10)}

国内43施設で実施された臨床試験で有効率84.2% (855/1,016)を示した。その概要は次のとおりである。(有効率: やや有効以上)

- 表在性皮膚感染症〔膿痂疹〕77.8% (14/18)、深在性皮膚感染症86.9% (113/130)〔癬〕91.6% (76/83)、瘰癧81.0% (17/21)、蜂巣炎76.9% (20/26)、慢性膿皮症〔感染性粉瘤〕100% (12/12)、咽頭・喉頭炎92.6% (25/27)、扁桃炎86.8% (46/53)、麦粒腫93.3% (14/15)の有効率であった。
- リンパ管・リンパ節炎77.3% (17/22)、乳腺炎93.0% (40/43)、骨髄炎88.9% (8/9)の有効率であった。
- 急性気管支炎、慢性呼吸器病変の二次感染〔気管支炎〕75.7% (28/37)、肺炎83.3% (10/12)、肺膿瘍80.0% (16/20)の有効率であった。
- 中耳炎83.9% (26/31)、猩紅熱76.3% (29/38)の有効率であった。
- 梅毒66.7% (4/6)の有効率であった。

【薬効薬理】

1. 抗菌作用^{11)~14)}

- 1) ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌等のグラム陽性菌に抗菌作用を示し、その作用は静菌的である。
- 2) 抗トレポネーマ、抗マイコプラズマ、抗トキソプラズマ作用を示す。(マイコプラズマ、トキソプラズマは適応外である。)

2. 作用機序

細菌の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: スピラマイシン酢酸エステル Spiramycin Acetate

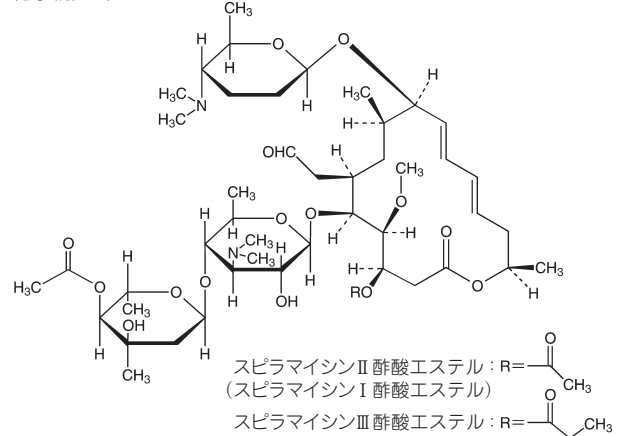
化学名: (スピラマイシン II 酢酸エステル(スピラマイシン I 酢酸エステル))

(3R, 4S, 5S, 6R, 8R, 9R, 10E, 12E, 15R)-3-Acetoxy-5-[4-O-acetyl-2, 6-dideoxy-3-C-methyl- α -L-ribo-hexopyranosyl-(1 \rightarrow 4)-3, 6-dideoxy-3-dimethylamino- β -D-glucopyranosyloxy]-9-(2, 3, 4, 6-tetraoxy-4-dimethylamino- β -D-erythro-hexopyranosyloxy)-6-formylmethyl-4-methoxy-8-methylhexadeca-10, 12-dien-15-olide

(スピラマイシン III 酢酸エステル)

(3R, 4S, 5S, 6R, 8R, 9R, 10E, 12E, 15R)-5-[4-O-Acetyl-2, 6-dideoxy-3-C-methyl- α -L-ribo-hexopyranosyl-(1 \rightarrow 4)-3, 6-dideoxy-3-dimethylamino- β -D-glucopyranosyloxy]-9-(2, 3, 4, 6-tetraoxy-4-dimethylamino- β -D-erythro-hexopyranosyloxy)-6-formylmethyl-4-methoxy-8-methyl-3-propanoyloxyhexadeca-10, 12-dien-15-olide

化学構造式:



性状: 白色～淡黄白色の粉末である。

溶解性: アセトニトリル又はメタノールに極めて溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けやすく、水にほとんど溶けない。

融点: 117~119°C

分配係数: $\log P_{\text{OCT}} = 2.17$

測定法: フラスコシェイキング法
n-オクタノール/pH7.4緩衝溶液

【包装】

アセチルスピラマイシン錠100: [PTP]100錠(10錠×10)
アセチルスピラマイシン錠200: [PTP]100錠(10錠×10)

【主要文献及び文献請求先】

(主要文献)	(文献請求No.)
1) 社内資料: 山地幸雄, 他: アセチルスピラマイシン錠の生物学的同源性について	
2) 高平汎志, 他: J. Antibiotics, Ser. B., 19 , (2), 95, (1966)	001-083
3) 張 南薫, 他: J. Antibiotics, Ser. B., 19 , (3), 211, (1966)	001-072
4) 柴田清人, 他: J. Antibiotics, Ser. B., 19 , (3), 200, (1966)	001-098
5) 石井哲也, 他: J. Antibiotics, Ser. B., 19 , (6), 432, (1966)	001-065
6) 中川圭一, 他: J. Antibiotics, Ser. B., 19 , (2), 105, (1966)	001-092
7) 清水喜八郎, 他: J. Antibiotics, Ser. B., 19 , (6), 423, (1966)	005-008
8) 松下光延, 他: J. Antibiotics, Ser. B., 19 , (4), 305, (1966)	001-070
9) 上田 泰, 他: Chemotherapy, 16 , (5), 755, (1968)	005-009
10) 塩田憲三, 他: J. Antibiotics, Ser. B., 19 , (4), 292, (1966)	001-089
11) 中沢昭三, 他: J. Antibiotics, Ser. B., 19 , (2), 90, (1966)	001-085
12) 善養寺浩, 他: Chemotherapy, 17 , (8), 1578, (1969)	005-010
13) 中村昭司: 日本医事新報, No.2851, 23 , (1978)	004-422
14) 青木豊治, 他: 寄生虫学雑誌, 18 , (2), 190, (1969)	005-012

※※【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

協和発酵キリン株式会社 <すり相談窓口>

〒100-8185 東京都千代田区大手町1-6-1

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)

製造販売元

協和発酵キリン株式会社

東京都千代田区大手町1-6-1

EF