

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2013に準拠して作成

持続性経口ペニシリン製剤

バイシリン[®] G顆粒40万単位

BICILLIN[®] G Granules 400,000 units

ベンジルペニシリンベンザチン水和物顆粒

剤形	顆粒剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品：注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	1g中に日本薬局方ベンジルペニシリンベンザチン水和物40万単位を含有
一般名	和名：ベンジルペニシリンベンザチン水和物 洋名：Benzylpenicillin Benzathine Hydrate
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造販売承認年月日：2007年3月22日（販売名変更による） 薬価基準収載年月日：2007年6月15日（販売名変更による） 発売年月日：1981年9月1日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元： MSD株式会社
医薬情報担当者の連絡先	TEL. : FAX. :
問い合わせ窓口	MSD カスタマーサポートセンター 医療関係者の方：フリーダイヤル 0120-024-961 <受付時間> 9:00～17:30（土日祝日・当社休日を除く） 医療関係者向けホームページ http://www.msconnect.jp/

本IFは2019年3月改訂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、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp> にてご確認ください。

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、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 IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構ホームページ（<http://www.pmda.go.jp>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切に審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

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、添付文書で赤字・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 頁にまとめる。

〔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 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」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 2013」は、平成 25 年 10 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 2013」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 2013」においては、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ある。

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もあり、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。（2013 年 4 月改訂）

目 次

I. 概要に関する項目	1
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	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名(命名法)	2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2
7. CAS 登録番号	2
III. 有効成分に関する項目	3
1. 物理化学的性質	3
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3
3. 有効成分の確認試験法	4
4. 有効成分の定量法	4
IV. 製剤に関する項目	5
1. 剤形	5
2. 製剤の組成	5
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5
4. 製剤の各種条件下における安定性	6
5. 調製法及び溶解後の安定性	6
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6
7. 溶出性	6
8. 生物学的試験法	6
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	6
10. 製剤中の有効成分の定量法	6
11. 力価	6
12. 混入する可能性のある夾雑物	6
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6
14. その他	6
V. 治療に関する項目	7
1. 効能又は効果	7
2. 用法及び用量	7
3. 臨床成績	7
VI. 薬効薬理に関する項目	9
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	9
2. 薬理作用	9

VII. 薬物動態に関する項目	11
1. 血中濃度の推移・測定法	11
2. 薬物速度論的パラメータ	11
3. 吸収	12
4. 分布	12
5. 代謝	12
6. 排泄	13
7. トランスポーターに関する情報	13
8. 透析等による除去率	13
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	14
1. 警告内容とその理由	14
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	14
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	14
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	14
5. 慎重投与内容とその理由	15
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15
7. 相互作用	15
8. 副作用	15
9. 高齢者への投与	16
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	16
11. 小児等への投与	16
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	16
13. 過量投与	16
14. 適用上の注意	16
15. その他の注意	16
16. その他	16
IX. 非臨床試験に関する項目	17
1. 薬理試験	17
2. 毒性試験	17
X. 管理的事項に関する項目	18
1. 規制区分	18
2. 有効期間又は使用期限	18
3. 貯法・保存条件	18
4. 薬剤取扱い上の注意点	18
5. 承認条件等	18
6. 包装	18
7. 容器の材質	18
8. 同一成分・同効薬	18
9. 国際誕生年月日	18
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	18
11. 薬価基準収載年月日	19
12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	19

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	19
14. 再審査期間	19
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	19
16. 各種コード	19
17. 保険給付上の注意	19
X I. 文 献	20
1. 引用文献	20
2. その他の参考文献	20
X II. 参考資料	21
1. 主な外国での発売状況	21
2. 海外における臨床支援情報	21
X III. 備 考	22
その他の関連資料	22

I . 概要に関する項目

1. 開発の経緯

バイシリン®G 顆粒 40 万単位は、ベンジルペニシリンベンザチンの製剤である。

ベンジルペニシリン（ペニシリン G）は、主としてグラム陽性菌に対し強力な抗菌作用をあらわし、連鎖球菌、肺炎球菌などによる感染症に優れた効果を示す。

しかしながら、経口投与では十分な臨床効果が得られないことや、有効血中濃度の持続時間の短いことが欠点とされている。

ベンジルペニシリンベンザチンは、これらの欠点を補う目的で 1951 年米国において William F. Brauce らにより開発されたベンジルペニシリンの誘導体である。

本剤は酸に安定で、経口投与において有効血中濃度が得られ、かつ長時間持続する遷延性ペニシリン製剤として広く使用されている。

当社において、バイシリン®G 顆粒は 1978 年 8 月 1 日に承認され、1981 年 9 月 1 日発売に至った。

1993 年 6 月 4 日には医療用医薬品再評価の結果として、【効能又は効果】の〈適応菌種〉のうち「ベンジルペニシリンに感性のブドウ球菌、淋菌」が削除され、〈適応症〉のうち「膿皮症、膿痂疹、せつ、せつ腫症、よう、蜂か織炎、乳腺症、淋疾」が削除されることが通知された。【用法及び用量】については記載表現が変更されたが、内容についての変更はなかった。また、2004 年 9 月 30 日には医療用医薬品再評価の結果として、【効能又は効果】の〈適応症〉のうち「細菌性心内膜炎」が削除され、【用法及び用量】についても「細菌性心内膜炎」に関する内容が削除された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 主としてグラム陽性菌に対し強力な抗菌作用をあらわす。
- (2) 酸に安定である。
- (3) 経口投与において有効血中濃度が得られ、かつ長時間持続する。
- (4) 経口ペニシリン剤特有の苦味がない。
- (5) 内服後、連鎖球菌、梅毒スピロヘータのように感受性の高い病原体に有効な濃度を長く持続する。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名：バイシリン®G 顆粒 40 万単位

(2) 洋名：BICILLIN® G Granules 400,000 units

(3) 名称の由来：1 分子あたりペニシリン (penicillin) が 2 つ (bi) 存在することから、Bicillin と命名した。

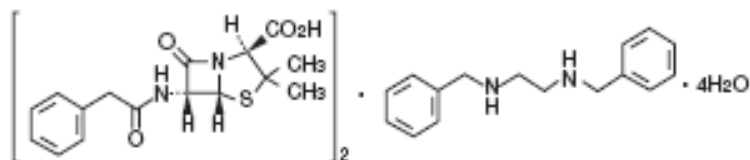
2. 一般名

(1) 和名 (命名法)：ベンジルペニシリンベンザチン水和物 (JAN)

(2) 洋名 (命名法)：Benzylpenicillin Benzathine Hydrate (JAN)

(3) ステム：不明

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式： $(C_{16}H_{18}N_2O_4S)_2 \cdot C_{16}H_{20}N_2 \cdot 4H_2O$

分子量：981.18

5. 化学名 (命名法)

(2*S*, 5*R*, 6*R*)-3, 3-Dimethyl-7-oxo-6-[(phenylacetyl) amino]-4-thia-1-azabicyclo[3. 2. 0]heptane-2-carboxylic acid hemi (*N*, *N'*-dibenzylethane-1, 2-diamine) dihydrate

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：PCG (ベンジルペニシリン)

7. CAS 登録番号

41372-02-5

1538-09-6 (anhydrous)

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

本品は白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

メタノール又はエタノール(99.5)に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

臨界相対湿度：37℃－88%（参考値）

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

融点：123～124℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

○ $[\alpha]_D^{25}$: +206° (c 0.105, ホルムアミド)

○ 溶液の液性(pH)及び安定な pH 域：4.0～7.5（飽和水溶液）

2. 有効成分の各種条件下における安定性

本品は、乾燥状態で 55℃に 1 年間放置した時、力価の低下を認めない。

また、1mL 当たり 30 万単位を含有する水性または油性（2%アルミニウムモノステアレート加大豆油）懸濁液は

37℃に 1 年間放置しても力価の低下を認めない。

しかし、他の P C G 誘導体と同様にペニシリナーゼ（β-ラクタマーゼ）に対しては不安定で、短時間に不活化される。

各種条件下におけるベンジルペニシリンベンザチンの安定性

	保存条件	保存期間	保存形態	結 果
長期安定性試験	室温	5 年間	気密容器	外観、力価、含湿度に変化なし pH はわずかに低下
苛酷試験	40℃	2 カ月	気密容器	外観は微黄色に変色 力価は約 4 % 低下 pH は変化なし
	60℃	2 カ月	気密容器	外観は黄色に変色 力価は約 15% 低下 pH はわずかに低下
	光照射 (蛍光灯下)	(1)	シャーレ (開放)	外観、力価、pH に 変化なし
	光照射 (殺菌灯下)	(2)	シャーレ (開放)	外観は淡黄色に変色 力価は約 3 % 低下 pH はわずかに低下

(1) 照射条件：直径 85mm のシャーレに試料 3g を広げ、試料上の明るさが 2500 ルクスになるような位置に白色蛍光灯を置き、120 万 Lux・hr になるまで照射した。

(2) 照射条件：直径 85mm のシャーレに試料 3g を広げ、殺菌灯（三菱殺菌ランプ；G L-10）を試料の上方 50 cm の位置に置き、24 時間紫外線を照射した。

3. 有効成分の確認試験法

日局「ベンジルペニシリンベンザチン水和物」による。

4. 有効成分の定量法

日局「ベンジルペニシリンベンザチン水和物」による。

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

1) 区別：顆粒剤

2) 規格：1g 中に日本薬局方ベンジルペニシリンベンザチン水和物を 40 万単位含有

3) 性状：

販 売 名	性 状		
	色 調	形 状	におい
バイシリン®G 顆粒 40 万単位	うすい赤色	顆 粒	芳 香

(2) 製剤の物性

物 性		
安息角	34.7	
崩潰角	32.3	
疎充填かさ密度（静かかさ密度）	0.63	g/mL
密充填かさ密度 （タッピング法かさ密度）	0.70	g/mL
圧縮度	9.7	%
分散度	34.3	%
飛散性	逃飛率	9.7 %
	集合率	-

(3) 識別コード

なし

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な p 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：

1g 中に日本薬局方ベンジルペニシリンベンザチン水和物 40 万単位を含有するうすい赤色の顆粒剤である。

(2) 添加物

添加物としてクエン酸ナトリウム水和物、安息香酸ナトリウム、サッカリンナトリウム水和物、トウモロコシデンプン、赤色 102 号、精製白糖、香料、レシチン、トウイーンを含有する。

(3) その他

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

<顆粒剤>

保存条件	保存期間	保存形態	結 果
40℃	6 ヶ月	ガラス製気密容器 セロポリ分包 メタル分包	外観、含湿度、崩壊性及び力価にほとんど変化はなく、T L Cにも異常は認められない。
室温 60～70% R. H.	14 日	無包装	吸湿性、力価、TLC に変化なし。
	1 ヶ月	セロポリ分包	吸湿性、力価、TLC に変化なし。
35℃ 81% R. H.	5 日	無包装	吸湿が認められた*
	1 ヶ月	セロポリ分包	吸湿性、力価、TLC に変化なし。
35℃ 92% R. H.	3 日	無包装	アメ状となった*
	14 日	セロポリ分包	吸湿性、力価、TLC に変化なし。
紫外線照射 (2537Å)	24 時間		外観、力価、含湿度、崩壊性、TLC に変化なし。
室温	36 ヶ月	ガラス製気密容器 セロポリ分包 メタル分包	外観、力価、含湿度、崩壊性、TLC に変化なし。

*吸湿した場合、外観は塊状（またはアメ状）になるが、力価低下は認められなかった。

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

7. 溶出性

該当資料なし

8. 生物学的試験法

抗生物質の微生物学的力価試験法による。試験菌 *Staphylococcus aureus* ATCC 6538 P を用いる。

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

該当資料なし

10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「ベンジルペニシリンベンザチン水和物」による。

11. 力価

本剤の力価はペニシリンの力価としての単位を表す。

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

〈適応菌種〉

ベンジルペニシリンに感性のレンサ球菌属、肺炎球菌、梅毒トレポネーマ

〈適応症〉

リンパ管・リンパ節炎、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、梅毒、中耳炎、副鼻腔炎、猩紅熱、リウマチ熱の発症予防

〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」¹⁾を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

2. 用法及び用量

通常、成人にはベンジルペニシリンベンザチン水和物として1回40万単位を1日2～4回経口投与する。梅毒に対しては、通常、成人1回40万単位を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。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

(1) 腎障害患者

高度の腎障害のある患者には、投与量・投与間隔の適切な調節をするなど慎重に投与すること。（「慎重投与」の項参照）

(2) 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少限の期限の投与にとどめること。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験

該当資料なし

(4) 探索的試験

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

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 患者・病態別試験

該当資料なし

(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）

該当しない

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. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

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：バイシリンは、血中で活性体であるペニシリンGとなって作用する。薬理作用は、主としてペプチド転移酵素反応の阻害による。

ペニシリン系抗生物質がペプチド転移酵素反応を阻害する理由としては、その構造がペプチドグリカンのD-Ala-D-Ala末端と類似しているために、基質の代わりに、これらの抗生物質が酵素の活性中心と結合するためと考えられている。 β -ラクタム環のC0-N結合は反応性に富むが、これがD-Ala-D-AlaのC0-N結合に相当しており、 β -ラクタム環のC0-N結合が開裂し、ペプチド転移酵素と結合し、ペニシロイル酵素をつくることが推定されている。

(a) 効果は殺菌的か静菌的か

殺菌的

(b) 感受性菌の種類²⁾³⁾⁴⁾及びMIC⁵⁾、MBC、交差耐性等

連鎖球菌、肺炎球菌等に対し抗菌力を有する。また、梅毒トレポネーマに対しても作用する。

(次頁の表参照のこと)

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

原因菌、重症度等により異なる。

表. 抗菌スペクトル (*: 適応外菌種)

*菌種名は承認申請資料に基づき記載している。

標準菌株			MIC ($\mu\text{g/mL}$)	
			PCG	ABPC
グラム陽性菌	<i>Staph. pyogenes</i> (Oxford) 1227 (*)		0.02	0.05
	<i>Staph. pyogenes</i> (Smith) (*) 1474		0.02	0.05
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*) 1232		0.01	0.05
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*) 1233		0.02	0.05
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*) NCIB 8588		0.02	0.06
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*) 1399		0.02	0.05
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*) 1402		0.02	0.05
	<i>Staph. pyo. var. aureus</i> (*) 1083		125.0	125.0
	<i>Strep. pyogenes</i> β type 1489		0.005	0.01
	<i>Strep. pyogenes</i> β type 1490		0.01	0.02
	<i>Strep. pyogenes</i> β type 1488		0.06	0.01
	<i>Strep. pyogenes</i> α type 1479		0.005	0.02
	<i>Strep. pyogenes</i> α type 1482		0.005	0.01
	<i>Diplococcus pneumoniae</i> 1222		0.05	0.02
	<i>Diplococcus pneumoniae</i> 1224		0.02	0.05
	<i>Diplococcus pneumoniae</i> 1251		0.1	0.02
<i>Streptococcus faecalis</i> (*) 1591		2.5	1.25	
<i>Streptococcus faecalis</i> (*) NCIB 8191		12.5	5.0	
<i>Streptococcus faecalis</i> (*) NCIB 8192		12.5	5.0	
<i>Streptococcus faecalis</i> (*) 1274		1.25	1.25	
標準菌株			MIC ($\mu\text{g/mL}$)	
			PCG	ABPC
グラム陰性菌	<i>Neisseria catarrhalis</i> (*) NCTC 3622		0.005	0.12
	<i>Haemophilus influenzae</i> (*) 1584		0.5	0.5
	<i>Haemophilus influenzae</i> (*) 1585		0.5	0.25
	<i>Haemophilus influenzae</i> (*) 1583		0.5	0.25
	<i>Haemophilus parainfluenzae</i> (*) 1586		0.25	0.12
	<i>Alcaligenes faecalis</i> (*) NCIB 8156		5.0	5.0
	<i>Escherichia coli</i> (*) 1014		50.0	5.0
	<i>Escherichia coli</i> (*) 1015		25.0	2.5
	<i>Escherichia coli</i> (*) 1590		50.0	5.0
	<i>Escherichia coli</i> (*) 1589		25.0	2.5
	<i>Escherichia coli</i> (*) 1013		25.0	5.0
	<i>Aerobacter aerogenes</i> (*) NCIB 418		250.0	250.0
	<i>Klebsiella pneumoniae</i> (*) 1052		6.25	1.25
	<i>Shigella shigaei</i> (*) NCTC 4837		5.0	0.5
	<i>Shigella shimitzi</i> (*) 1079		5.0	0.6
	<i>Shigella flexneri</i> (*) 1078		12.5	1.25
	<i>Shigella sonnei</i> (*) NCTC 8220		50.0	5.0
	<i>Salmonella paratyphi</i> A (*) 1070		6.25	0.6
	<i>Salmonella paratyphi</i> B (*) 1385		5.0	1.25
	<i>Salmonella typhi</i> (*) NCTC 8393		2.5	0.25
	<i>Salmonella typhimurium</i> (*) 1416		6.25	1.25
	<i>Proteus vulgaris</i> (*) 1055		5.0	5.0
	<i>Proteus vulgaris</i> (*) NCTC 401		25.0	5.0
	<i>Proteus mirabilis</i> (*) 1431		5.0	1.25
	<i>Proteus morgani</i> (*) NCTC 2815		500.0	62.5
	<i>Pseudomonas pyocyanea</i> (*) 1058		500.0	250.0

(培地: "Oxoid" No.2, 37° C, 24hrs)

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

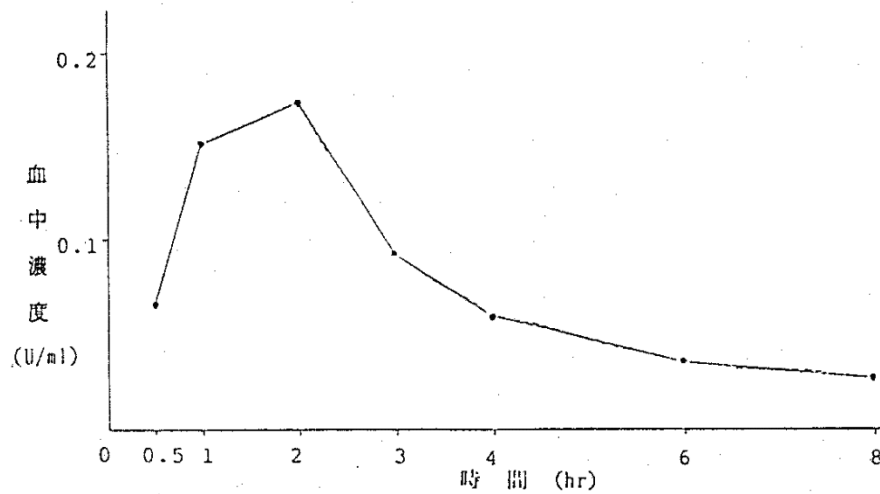
原因菌、症例により異なる。

(2) 最高血中濃度到達時間

1～3 時間

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

健康成人 (n=12) に、ベンジルペニシリンベンザチン水和物顆粒 40 万単位を経口投与した場合、血中濃度のピークは 2 時間後にあり、その平均値は 0.17 単位/mL を示し、8 時間後には 0.02 単位/mL を認めた。



(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

空腹時投与でバイシリンの血中濃度は急速に高くなるが、食事と共に投与すると、よりよく有効濃度が維持され、その差異は僅少である⁶⁾。

(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) 解析方法

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

小児にバイシリン 50 万単位を経口投与した時の AUC は、3 時間後で $8.85 \pm 3.58 \text{min} \cdot \mu\text{g/mL}$ 、6 時間後には $14.52 \pm 5.02 \text{min} \cdot \mu\text{g/mL}$ であった⁷⁾。

(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

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

消化管（小腸上部）から吸収される。

4. 分布

(1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

(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) 排泄部位及び経路

主として腎臓

(2) 排泄率

健康成人 (n=12) に、ベンジルペニシリンベンザチン水和物顆粒 40 万単位を経口投与した場合、8 時間までの平均尿中排泄率は、14.5%であった。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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）】

本剤の成分に対し過敏症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）】

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）

ペニシリン系抗生物質による過敏症の副作用が知られており、全てのβ-ラクタム系抗生物質に必要な注意である。処置方法は、過敏症に対する一般的治療を行う。

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

＜効能・効果に関連する使用上の注意＞

咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」¹⁾を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

（解説）

平成30年3月27日付通知（薬生安発0327第1号）に基づき、「咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、副鼻腔炎」の効能・効果に関連する使用上の注意を追記した。

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞

(1) 腎障害患者

高度の腎障害のある患者には、投与量・投与間隔の適切な調節をするなど慎重に投与すること。
（「慎重投与」の項参照）

(2) 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少限の期間の投与にとどめること。

（解説）

(1) 高度の腎障害のある患者は、本剤の排泄時間が延長し、血中濃度が上昇するため、副作用の発現率が高くなるおそれがあるので、投与量・投与間隔の適切な調節をするなど慎重に投与するよう注意を喚起している。

(2) 抗菌性物質製剤の適切な使用を図り、耐性菌の蔓延防止のため、細菌性感染症を効能・効果とする全ての抗菌性物質製剤に記載されている。

（薬安第5号 平成5年1月19日）

5. 慎重投与内容とその理由

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
- (3)高度の腎障害のある患者〔血中濃度が持続するので、投与量を減ずるか、投与間隔をあけて使用すること。〕

(解説)

- (1)過敏症の既往歴のある患者は本剤投与によりショックまたは過敏症を起こす可能性が高いと考えられるため設定した。
- (2)アレルギー体質を有する患者は、アレルギー反応を示す傾向が高いと考えられるため設定した。
- (3)腎障害患者では薬物の排泄が遅延し、血中濃度が上昇するため、副作用の発現率が高くなると考えられるため設定した。

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

2. 重要な基本的注意

ショックを起こすことがあるので、十分な問診を行うこと。

(解説)

ペニシリン系抗生物質によるショックの副作用が知られており、全てのβ-ラクタム系抗生物質に必要な注意である。

処置方法は、ショックに対する一般的治療を行う。

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

該当しない

8. 副作用

(1)副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。(再審査対象外)

(2)重大な副作用と初期症状

(1)重大な副作用

次のような副作用があらわれることがあるので、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。

- 1) **ショック**(頻度不明)：初期症状として、不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴、発汗等があらわれることがあるので観察を十分に行うこと。
- 2) **溶血性貧血**(頻度不明)：重篤な血液障害があらわれることがあるので、定期的に検査を実施するなど観察を十分に行うこと。
- 3) **間質性腎炎、急性腎障害**(いずれも頻度不明)：重篤な腎障害があらわれることがあるので、定期的に検査を実施するなど観察を十分に行うこと。
- 4) **偽膜性大腸炎**(頻度不明)：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中止するなど適切な処置を行うこと。

(3) その他の副作用

(2) その他の副作用

次のような症状又は異常があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

種類/頻度	頻度不明
過敏症	発熱、発疹、蕁麻疹
血液	好酸球増多症
肝臓	肝機能障害（AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇）
消化器	下痢、悪心、食欲不振
その他	梅毒患者におけるヤーリッシュ・ヘルクスハイマー反応（発熱、全身倦怠感、頭痛等の発現、病変部の増悪）

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(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

該当資料なし

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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。〕

11. 小児等への投与

該当資料なし

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

該当資料なし

15. その他の注意

該当資料なし

16. その他

該当資料なし

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 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

該当資料なし

(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

マウスに経口投与したときのLD₅₀値は、2,000mg/kgで、腹腔内投与では、459.9mg/kgであった⁸⁾。

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製剤：バイシリン®G 顆粒 40 万単位 処方箋医薬品^注

注) 注意-医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間又は使用期限

使用期間：2 年

使用期限：外箱に表示

3. 貯法・保存条件

気密容器、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当しない

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

該当資料なし

くすりのしおり：有り

(3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

1g 中 40 万単位：瓶 100g

7. 容器の材質

瓶	キャップ
ポリエチレン	ポリプロピレン

8. 同一成分・同効薬

(1) 同一成分薬：なし

(2) 同効薬：経口ペニシリン系抗生物質

9. 国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

(1) 製造販売承認年月日：2007 年 3 月 22 日

(2) 承認番号：21900AMX00686000

11. 薬価基準収載年月日

2007年6月15日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

2007年、旧名バイシリン®G 顆粒において「医薬品関連医療事故防止対策の強化・徹底について」の4項「医療用医薬品の販売名の取扱いについて」〔平成16年6月2日付け厚生労働省医薬食品局長通知（薬食発第0602009号）〕の通知に基づき製品名をバイシリン®G 顆粒40万単位へ変更した。これに伴い、製造承認年月日、薬価基準収載年月日、発売年月日及び承認番号が変更になった。

旧名バイシリン®G 顆粒の承認番号、承認日、薬価基準収載日及び発売日：

承認番号	15300EMZ00792000
承認日	1978年8月1日
薬価基準収載日	1981年9月1日
発売日	1981年9月1日

次項参照（医療用医薬品再評価結果に伴う変更）

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

医療用医薬品再評価結果

1993年6月4日

【効能・効果】

〈適応菌種〉「ベンジルペニシリンに感性のブドウ球菌、淋菌」が削除され、〈適応症〉「膿皮症、膿痂疹、せつ、せつ腫症、よう、蜂か織炎、乳腺症、淋疾」が削除された。

【用法・用量】

記載表現が変更されたが、内容についての変更はなかった。

2004年9月30日

【効能・効果】

〈適応症〉「細菌性心内膜炎」が削除された。

【用法・用量】

「細菌性心内膜炎」に関する内容が削除された。

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

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 医薬品コード	レセプト電算コード
バイシリン®G 顆粒40万単位	110613801	6111002D1039	620005060

17. 保険給付上の注意

該当しない

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1)厚生労働省健康局結核感染症課編：抗微生物薬適正使用の手引き
- 2)Sabath, L. D. et al. : Antimicrob. Agents&Chemother. , 1970 : 53-56, 1971
- 3)Maxwell, E. et al. : Antimicrob. Agents&Chemother. , 9(1) : 11-19, 1976
- 4)大久保暢夫、他：感染症学雑誌, 47(12) : 506-509, 1973
- 5)Rolinson, G. N., et al. : Br. Med. J. I(5246) : 191-196, 1961
- 6)高野正彦：月刊薬事, 18(5) : 813-821, 1976
- 7)藤田晃三、他：日本小児科学会雑誌, 85(10) : 1478-1479, 1981
- 8)Seifter, J. et al. : Antibiotics&Chemotherapy, 1(8) : 504-508, 1951

2. その他の参考文献

X II . 参考資料

1. 主な外国での発売状況
2. 海外における臨床支援情報

XⅢ. 備 考

その他の関連資料

