

※※日本薬局方 注射用スペクチノマイシン塩酸塩

**トロビシン<sup>®</sup> 筋注用2g**

Trobicin<sup>®</sup> for Intramuscular Use 2g

※※貯 法：室温保存、密封容器  
使用期限：最終年月を外箱等に記載

注)注意－医師等の処方箋により使用すること

承認番号	22100AMX00001
薬価収載	2009年3月
販売開始	2009年6月
国際誕生	1970年1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**

成分	販売名	
	トロビシン筋注用2g	
粉末バイアル	有効成分	日局 スペクチノマイシン塩酸塩水和物 2g（力価）
添付懸濁用液	（容量） 添加物	（3.2 mL） ベンジルアルコール 28.8 mg

なお、本品を懸濁するとき、その1 mL中にはスペクチノマイシン塩酸塩水和物400 mg（力価）を含有する。

**2. 性状**

本剤は白色～淡黄白色の結晶性粉末（バイアル）と懸濁用液（アンプル）よりなり、用時懸濁して用いる注射剤で、添付懸濁用液で調製したときのpH及び浸透圧比は次のとおりである。

pH	4.0～7.0
浸透圧比	約5（生理食塩液対比）

**【効能・効果】**

<適応菌種>

スペクチノマイシンに感性的淋菌

<適応症>

淋菌感染症

**【用法・用量】**

[筋注]

スペクチノマイシンとして、通常成人は2g（力価）を1回臀部筋肉内に注射する。また、2g（力価）1回投与にて効果の不十分なときは、4g（力価）を1回追加投与する。4g（力価）投与は左右の臀筋の2箇所に分けてもよい。

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. 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. 本剤は1回投与後3～5日間は経過を観察し、効果判定をすること。なお、追加投与の必要のある場合は、用法・用量に準ずること。

**【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）**

- (1)アトピー性体質の患者〔重症の即時型アレルギー反応があらわれおそれがある。〕
- (2)小児等〔「小児等への投与」の項参照〕

**2. 重要な基本的注意**

- (1)本剤によるショック、アナフィラキシーの発生を確実に予知できる方法がないので、次の措置をとること。
  - 1)事前に既往歴等について十分な問診を行うこと。なお、抗生物質等によるアレルギー歴は必ず確認すること。
  - 2)投与に際しては、必ずショック等に対する救急処置のとれる準備をしておくこと。
  - 3)投与開始から投与終了後まで、患者を安静の状態に保たせ、十分な観察を行うこと。特に、投与開始直後は注意深く観察すること。
- (2)潜伏状態の梅毒の兆候を遮蔽したり遅延させる可能性があるため、淋疾の治療の際には梅毒の血清学的検査を行うこと。
- (3)本剤投与後、ときに淋疾後尿道炎（postgonococcal urethritis）があらわれることがあるので、適切な治療を行うこと。

**3. 副作用**

調査症例数2,577例中、副作用発現症例は124例（4.81%）であり、副作用発現件数は延べ127件であった。その主なものは、注射部位疼痛112件（4.35%）、皮疹3件（0.12%）、頭重感2件（0.08%）等であった。なお、調査症例2,577例中、1例にショック症状が報告されている。また、臨床検査値の異常は認められなかった。（承認時までの調査及び市販後の使用成績調査の集計）

**(1)重大な副作用**

ショック（0.04%）：ショックを起こすことがある。また、不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴等のアナフィラキシーを伴うことがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には血圧の維持、体液の補充管理、気道の確保等の適切な処置を行うこと。

**(2)その他の副作用**

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明 <sup>注)</sup>
注射部位	疼痛の持続	発赤、硬結	
過敏症	皮疹		蕁麻疹
神経系		頭重感、しびれ感	めまい、不眠
消化器		悪心・嘔吐、胃痛、 下腹部痛、下腹部 膨満感	
腎臓			乏尿、BUNの上昇、 クレアチニン・ク リアランスの低下
その他		倦怠感	悪寒、発熱、ALT (GPT)、Al-P上昇、 ヘマトクリット値、 ヘモグロビン減少

注：自発報告のため頻度不明

**4. 高齢者への投与**

高齢者では、生理機能が低下していることが多く、副作用があらわれやすいので、注意すること。

**5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与**

**(1)妊婦**

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

**(2)授乳婦**

本剤投与中は授乳を避けさせることが望ましい。〔動物実験（ウシ、ヒツジ）で乳汁中に移行することが認められている。〕

## 6. 小児等への投与

(1)小児等に対する安全性は確立していないので、特に必要とする場合には慎重に投与すること。

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

## 7. 適用上の注意

### (1)投与経路

本剤は用法・用量にしたがって、臀部筋肉内注射のみに使用すること。

### (2)投与时

- 20ゲージの針を使用することが望ましい。
- 懸濁直後及び注射筒に吸引時、強く振盪すること。
- 同一部位への反復投与は行わないこと。
- 神経走行部位を避けること。
- 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり血液の逆流をみた場合は直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。
- 注射部位に壊死をみることがある。

### (3)アンプルカット時

添付の懸濁用アンプルのカット部分をエタノール綿等で清拭してからカットすることが望ましい。

### (4)調製後の使用

調製した懸濁液は24時間以内に使用すること。

## 【薬物動態】<sup>1)</sup>

### 1. 血中濃度

健康成人にスペクチノマイシン 2g（力価）筋注後の血中濃度は、投与後30分で平均77.8 μg/mLを示し、1時間でピークとなり91.4 μg/mL、2時間で71.8 μg/mL、4時間で45.9 μg/mL、6時間でもなお20.1 μg/mLの高い濃度を示す（5名平均）。

### 2. 代謝

人尿で生体内代謝産物を薄層クロマトグラフィーにより検討した結果、生体内で代謝されることなく排泄される。

### 3. 排泄

健康成人に本剤 2g（力価）筋注後の尿中濃度は、投与後30分で1,455.6 μg/mLを示し、1時間でピークとなり7,086 μg/mL、2時間で5,434 μg/mL、4時間で2,748 μg/mL、6時間でもなお1,222 μg/mLと非常に高い尿中濃度を示す。6時間までの尿中回収率は平均45.5%である（5名平均）。

## 【臨床成績】<sup>2)</sup>

国内10施設、調査症例200例についての臨床試験の結果、淋菌による淋疾に対する有効率は93.0%（186/200例）であった。

## 【薬効薬理】

### 1. 抗菌作用<sup>3)</sup>

(1)臨床分離淋菌に対する感受性は、ベンジルペニシリンでは0.011～6.25 μg/mLの幅広い範囲に分布を示し、耐性菌も認められたが、スペクチノマイシンでは3.13～12.5 μg/mLで、約60%は6.25 μg/mLの感受性を有し、一峰性の感受性分布を示す。

(2)本剤とベンジルペニシリンとの間には感受性相関は認められず、ベンジルペニシリン感受性株、耐性株のいずれに対しても良好な感受性を示す。

(3)淋菌の増殖曲線に及ぼす影響について、12.5、25、50 μg/mLにおいて濁度法及び生菌数測定との両面より、静菌作用と殺菌作用の検討を行った。濁度法においては静菌的な変化を示したが、生菌数測定においては著明な殺菌作用を示した。6.25 μg/mLでも添加後4時間目より殺菌作用があらわれ、24時間以内に生菌数は約 $2 \times 10^7$  cells/mLから $10^1$  cells/mL以下となった。

### 2. 作用機序<sup>4)</sup>

細菌細胞内のリボゾーム30S Subunitに作用し蛋白合成を阻害する。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：スペクチノマイシン塩酸塩水和物

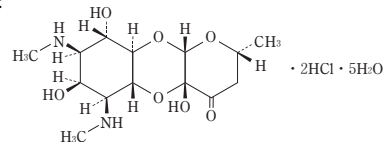
(Spectinomycin Hydrochloride Hydrate)

化学名：(2R, 4aR, 5aR, 6S, 7S, 8R, 9S, 9aR, 10aS)-4a, 7, 9-Trihydroxy-2-methyl-6, 8-bis(methylamino)-2, 3, 4a, 5a, 6, 7, 8, 9, 9a, 10a-decahydro-4H-pyrano[2, 3-b][1, 4]benzodioxin-4-one dihydrochloride pentahydrate

分子式：C<sub>14</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>7</sub> · 2HCl · 5H<sub>2</sub>O

分子量：495.35

構造式：



性状：本品は白色～淡黄白色の結晶性の粉末である。

水に溶けやすく、エタノール（95）にほとんど溶けない。

## 【包装】

トロピシン筋注用 2g：2g（力価）× 5 バイアル（懸濁用液添付）

## 【主要文献】

- 1) 中山 一誠ほか：Jpn J Antibiot 29 (9) : 783, 1976 [L20030526020]
- 2) 社内資料：淋菌感染症に対する臨床試験成績 [L20041108076]
- 3) 大槻 雅子：Jpn J Antibiot 29 (9) : 789, 1976 [L20030526026]
- 4) Anderson, P. et al. : J Mol Biol 29 (1) : 203, 1967 [L20030526029]

## 【文献請求先】

「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ください。

ファイザー株式会社 製品情報センター

〒151-8589 東京都渋谷区代々木3-22-7

学術情報ダイヤル 0120-664-467

FAX 03-3379-3053



【製造販売】  
ファイザー株式会社  
東京都渋谷区代々木3-22-7