

# 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の I F 記載要領 2013 に準拠して作成

抗生物質製剤

## 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

剤 形	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	アセチルスピラマイシン錠 100：1 錠中日局スピラマイシン酢酸エステル 100mg（力価）含有 アセチルスピラマイシン錠 200：1 錠中日局スピラマイシン酢酸エステル 200mg（力価）含有
一般名	和名：スピラマイシン酢酸エステル 洋名：Spiramycin Acetate
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造承認年月日：2006年2月3日 （アセチルスピラマイシン錠協和として1967年6月24日） 薬価基準収載年月日：2006年6月9日 （アセチルスピラマイシン錠協和として1968年2月27日） 発売年月日：1967年9月1日 （アセチルスピラマイシン錠協和〔100mg（力価）／錠〕として） 1968年6月10日 （アセチルスピラマイシン錠協和〔200mg（力価）／錠〕として）
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販 売：サンド株式会社 製造販売：サンドファーマ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	サンド株式会社 カスタマーケアグループ 〒105-6333 東京都港区虎ノ門 1-23-1 TEL 0120-982-001 FAX 03-6257-3633 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.sandoz.jp/medical">https://www.sandoz.jp/medical</a>

本 IF は 2021 年 9 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「医薬品に関する情報」

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> にてご確認下さい。

# 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、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「医薬品に関する情報」(<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) 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か審査・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 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・一部改変)

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>9</b>
1. 開発の経緯 .....	1	1. 効能又は効果 .....	9
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1	2. 用法及び用量 .....	9
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	3. 臨床成績 .....	9
1. 販売名 .....	2	(1) 臨床データパッケージ .....	9
(1) 和名 .....	2	(2) 臨床効果 .....	9
(2) 洋名 .....	2	(3) 臨床薬理試験 .....	9
(3) 名称の由来 .....	2	(4) 探索的試験 .....	9
2. 一般名 .....	2	(5) 検証的試験 .....	9
(1) 和名 (命名法) .....	2	(6) 治療的使用 .....	10
(2) 洋名 (命名法) .....	2	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>11</b>
(3) ステム .....	2	1. 薬理的に関連ある化合物	
3. 構造式又は示性式 .....	2	又は化合物群 .....	11
4. 分子式及び分子量 .....	2	2. 薬理作用 .....	11
5. 化学名 (命名法) .....	3	(1) 作用部位・作用機序 .....	11
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績 .....	11
7. CAS 登録番号 .....	3	(3) 作用発現時間・持続時間 .....	11
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>4</b>	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>12</b>
1. 物理化学的性質 .....	4	1. 血中濃度の推移・測定法 .....	12
(1) 外観・性状 .....	4	(1) 治療上有効な血中濃度 .....	12
(2) 溶解性 .....	4	(2) 最高血中濃度到達時間 .....	12
(3) 吸湿性 .....	4	(3) 臨床試験で確認された血中濃度 .....	12
(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点 .....	4	(4) 中毒域 .....	12
(5) 酸塩基解離定数 .....	4	(5) 食事・併用薬の影響 .....	12
(6) 分配係数 .....	4	(6) 母集団 (ポピュレーション) 解析	
(7) その他の主な示性値 .....	4	により判明した薬物体内動態変動	
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	4	要因 .....	12
3. 有効成分の確認試験法 .....	4	2. 薬物速度論的パラメータ .....	12
4. 有効成分の定量法 .....	4	(1) 解析方法 .....	12
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>5</b>	(2) 吸収速度定数 .....	12
1. 剤形 .....	5	(3) バイオアベイラビリティ .....	12
(1) 剤形の区別、規格及び性状 .....	5	(4) 消失速度定数 .....	12
(2) 製剤の物性 .....	5	(5) クリアランス .....	13
(3) 識別コード .....	5	(6) 分布容積 .....	13
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨		(7) 血漿蛋白結合率 .....	13
及び安定な pH 域等 .....	5	3. 吸収 .....	13
2. 製剤の組成 .....	5	4. 分布 .....	13
(1) 有効成分 (活性成分) の含量 .....	5	(1) 血液-脳関門通過性 .....	13
(2) 添加物 .....	5	(2) 血液-胎盤関門通過性 .....	13
(3) その他 .....	5	(3) 乳汁への移行性 .....	13
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 .....	5	(4) 髄液への移行性 .....	13
4. 製剤の各種条件下における安定性 .....	6	(5) その他の組織への移行性 .....	13
5. 調製法及び溶解後の安定性 .....	8	5. 代謝 .....	14
6. 他剤との配合変化 (物理化学的変化) .....	8	(1) 代謝部位及び代謝経路 .....	14
7. 溶出性 .....	8	(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等)	
8. 生物学的試験法 .....	8	の分子種 .....	14
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	8	(3) 初回通過効果の有無及びその割合 .....	14
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	8	(4) 代謝物の活性の有無及び比率 .....	14
11. 力価 .....	8	(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ .....	14
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	8	6. 排泄 .....	14
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 .....	8	(1) 排泄部位及び経路 .....	14
14. その他 .....	8	(2) 排泄率 .....	14
		(3) 排泄速度 .....	14

# 目 次

7. トランスポーターに関する情報	14	<b>X. 管理的事項に関する項目</b>	<b>19</b>
8. 透析等による除去率	14	1. 規制区分	19
<b>VII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	<b>15</b>	2. 有効期間又は使用期限	19
1. 警告内容とその理由	15	3. 貯法・保存条件	19
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	15	4. 薬剤取扱い上の注意点	19
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	15	(1) 薬局での取扱い上の留意点について	19
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	15	(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）	19
5. 慎重投与内容とその理由	15	(3) 調剤時の留意点について	19
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15	5. 承認条件等	19
7. 相互作用	15	6. 包装	19
(1) 併用禁忌とその理由	15	7. 容器の材質	19
(2) 併用注意とその理由	15	8. 同一成分・同効薬	19
8. 副作用	16	9. 国際誕生年月日	20
(1) 副作用の概要	16	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	20
(2) 重大な副作用と初期症状	16	11. 薬価基準収載年月日	20
(3) その他の副作用	16	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	20
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	16	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	20
(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	16	14. 再審査期間	20
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	16	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	20
9. 高齢者への投与	17	16. 各種コード	20
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	17	17. 保険給付上の注意	20
11. 小児等への投与	17	<b>X I. 文献</b>	<b>21</b>
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	17	1. 引用文献	21
13. 過量投与	17	2. その他の参考文献	21
14. 適用上の注意	17	<b>X II. 参考資料</b>	<b>22</b>
15. その他の注意	17	1. 主な外国での発売状況	22
16. その他	17	2. 海外における臨床支援情報	22
<b>VIII. 非臨床試験に関する項目</b>	<b>18</b>	<b>X III. 備考</b>	<b>23</b>
1. 薬理試験	18	その他の関連資料	23
(1) 薬効薬理試験	18		
(2) 副次的薬理試験	18		
(3) 安全性薬理試験	18		
(4) その他の薬理試験	18		
2. 毒性試験	18		
(1) 単回投与毒性試験	18		
(2) 反復投与毒性試験	18		
(3) 生殖発生毒性試験	18		
(4) その他の特殊毒性	18		

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

スピラマイシン酢酸エステルはスピラマイシンの Acetate 誘導体であって弊社が合成・開発したマクロライド系抗生物質である。本剤はブドウ球菌、レンサ球菌、肺炎球菌等のグラム陽性菌及び梅毒トレポネーマに抗菌作用を示し、経口投与により速やかに吸収される。

臨床的には呼吸器感染症、皮膚軟部組織感染症、外科感染症、耳鼻科感染症、産婦人科感染症等に有用性が認められている。

2017年9月に製造販売承認がアスペンジャパン株式会社（現サンドファーマ株式会社）に承継された。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 組織移行性が高い。（VII.4. 参照）

2. 呼吸器感染症、皮膚軟部組織感染症などに対してすぐれた臨床効果を示す。（V.3. 参照）

### 3. 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	<b>発疹・発赤</b>		
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

## Ⅱ. 名称に関する項目

### 1. 販売名

(1) 和名

アセチルスピラマイシン錠 100・200

(2) 洋名

ACETYLSPIRAMYCIN Tablets 100・200

(3) 名称の由来

原薬名 Acetylspiramycin に由来する。

### 2. 一般名

(1) 和名（命名法）

スピラマイシン酢酸エステル（JAN）

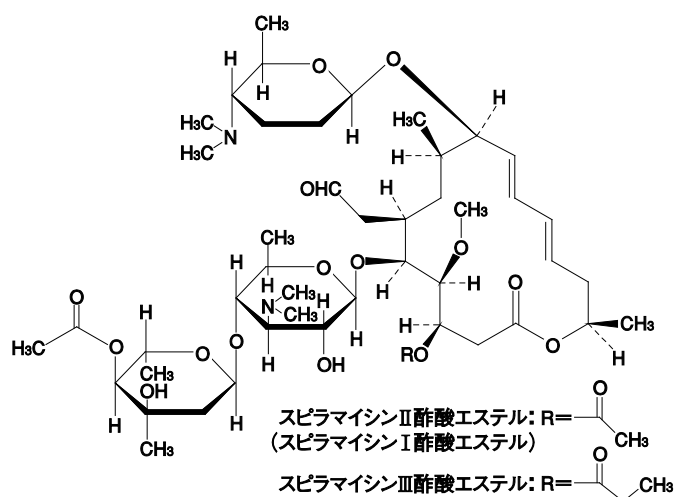
(2) 洋名（命名法）

Spiramycin Acetate（JAN）、Spiramycin（INN）

(3) ステム

-mycin: antibiotics, produced by Streptomyces strains

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

スピラマイシン酢酸エステルは、Ⅱ（Ⅰ）、Ⅲの混合物と見なされる。

## 5. 化学名（命名法）

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）

(3*R*, 4*S*, 5*S*, 6*R*, 8*R*, 9*R*, 10*E*, 12*E*, 15*R*) -3-Acetoxy-5- [4-*O*-acetyl-2, 6-dideoxy-3-*C*-methyl- $\alpha$ -*L*-ribo-hexopyranosyl- (1→4) -3, 6-dideoxy-3-dimethylamino- $\beta$ -*D*-glucopyranosyloxy] -9- (2, 3, 4, 6-tetradecoxy-4-dimethylamino- $\beta$ -*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

(3*R*, 4*S*, 5*S*, 6*R*, 8*R*, 9*R*, 10*E*, 12*E*, 15*R*) -5- [4-*O*-Acetyl-2, 6-dideoxy-3-*C*-methyl- $\alpha$ -*L*-ribo-hexopyranosyl- (1→4) -3, 6-dideoxy-3-dimethylamino- $\beta$ -*D*-glucopyranosyloxy] -9- (2, 3, 4, 6-tetradecoxy-4-dimethylamino- $\beta$ -*D*-*erythro*-hexopyranosyloxy) -6-formylmethyl-4-methoxy-8-methyl-3-propanoyloxyhexadeca-10, 12-dien-15-olide

## 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

AC-SPM

化学療法学会の正式な承認を受けた略号ではない。

SPM はスピラマイシンの略号である。

## 7. CAS 登録番号

87111-42-0（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））

112501-15-2（スピラマイシンⅢ酢酸エステル）



## 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～淡黄白色の粉末である。

#### (2) 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。

#### (3) 吸湿性

25℃、14日、75%RHにおいて吸湿量は2.6%であった。

#### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：117～119℃

#### (5) 酸塩基解離定数

pKa' : 6.9

#### (6) 分配係数

log P<sup>1</sup>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〕

#### (7) その他の主な示性値

旋光度： $[\alpha]_D^{20} = -79^\circ$  (C=1、メタノール)

### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

### 3. 有効成分の確認試験法

日局「スピラマイシン酢酸エステル」の確認試験による。







### 4. 有効成分の定量法

日局「スピラマイシン酢酸エステル」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、外観及び性状

	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〕

#### (2) 製剤の物性

硬度：9.1～11.0

崩壊試験

「日本薬局方」の崩壊試験法に適合する。

#### (3) 識別コード

アセチルスピラマイシン錠 100：KH803（錠剤本体に刻印、PTP シートに表示）

アセチルスピラマイシン錠 200：KH804（錠剤本体に刻印、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

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量

1 錠中日局スピラマイシン酢酸エステルを 100mg（力価）又は 200mg（力価）含有。

#### (2) 添加物

黄色 5 号アルミニウムレーキ、日局カルナウバロウ、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）

#### (3) その他

該当資料なし

### 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

室温 6 ヶ月、30° 6 ヶ月、ガラス容器中に密封保存では力価低下は示さなかった。

苛酷試験 (50° 6 ヶ月、ガラス容器、密封保存) では約 20~25%の力価低下が観察された。

〈参考〉未包装状態での安定性

アセチルスピラマイシン錠 100

熱安定性 (40°C)

保存期間	性 状	含 量 (%)	硬 度 (kg)
Initial	黄橙色 FC 錠	100.0	9.1~11.0
30 日	変化なし	96.6	9.1~10.9
60 日	変化なし	97.6	8.9~10.3
90 日	変化なし	95.0	8.9~9.6

湿度安定性 (25°C, 75%RH)

保存期間	性 状	含 量 (%)	硬 度 (kg)
Initial	黄橙色 FC 錠	100.0	9.1~11.0
30 日	変化なし	98.3	7.9~8.4
60 日	変化なし	96.8	7.9~8.8
90 日	変化なし	97.7	8.9~9.5

光安定性 (25°C, 60%RH, 1000Lux)

保存期間	性 状	含 量 (%)	硬 度 (kg)
Initial	黄橙色 FC 錠	100.0	9.1~11.0
30 日 (72 万 Lux・hr)	変化なし	97.5	9.1~9.9
50 日 (120 万 Lux・hr)	変化なし	98.6	8.7~10.4
90 日 (216 万 Lux・hr)	変化なし	98.8	8.9~10.1

アセチルスピラマイシン錠 200

熱安定性 (40°C)

保存期間	性 状	含 量 (%)	硬 度 (kg)
Initial	黄橙色 FC 錠	100.0	9.2~9.8
30 日	変化なし	98.8	9.8~10.3
60 日	変化なし	98.5	9.2~11.2
90 日	変化なし	101.2	9.5~10.4

湿度安定性 (25°C, 75%RH)

保存期間	性 状	含 量 (%)	硬 度 (kg)
Initial	黄橙色 FC 錠	100.0	9.2~9.8
30 日	変化なし	98.9	7.8~9.5
60 日	変化なし	100.6	8.2~8.8
90 日	変化なし	103.2	9.2~8.0

光安定性 (25°C, 60%RH, 1000Lux)

保存期間	性 状	含 量 (%)	硬 度 (kg)
Initial	黄橙色 FC 錠	100.0	9.2~9.8
30 日 (72 万 Lux・hr)	変化なし	99.9	9.2~11.0
50 日 (120 万 Lux・hr)	変化なし	97.9	9.8~10.6
90 日 (216 万 Lux・hr)	変化なし	103.2	8.8~11.6

IV. 製剤に関する項目

〈参考〉

アセチルスピラマイシン錠 100 の粉碎後の安定性

保存条件		試験項目	Initial	7 日	15 日	30 日
グラシン紙分包	40℃	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	-2.7	-2.2	-2.4
		残存率 (%)	100.0	98.8	102.4	100.3
	1,000Lux	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	0.6	0.4	0.3
		残存率 (%)	100.0	99.1	98.7	97.5
	25℃ 75%RH	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	3.8	3.5	3.7
		残存率 (%)	100.0	97.5	100	97.4
シャーレ開放	40℃	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	-1.9	-2.0	-2.5
		残存率 (%)	100.0	96.1	94.7	94.5
	1,000Lux	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	0.2	0.2	-0.3
		残存率 (%)	100.0	93.7	91.9	89.5
	25℃ 75%RH	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	2.4	2.2	1.5
		残存率 (%)	100.0	94.7	95.5	92.6

—：変化なし

〈参考〉

アセチルスピラマイシン錠 200 の粉碎後の安定性

保存条件		試験項目	Initial	7 日	15 日	30 日
グラシン紙分包	40℃	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	-1.9	-2.0	-2.2
		残存率 (%)	100.0	98.2	99.3	97.7
	1,000Lux	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	1.3	1.4	1.3
		残存率 (%)	100.0	95.2	93.2	93.9
	25℃ 75%RH	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	4.5	4.9	4.8
		残存率 (%)	100.0	92.2	94.2	93.2
シャーレ開放	40℃	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	-1.7	-2.2	-2.5
		残存率 (%)	100.0	98.5	98.3	94.8
	1,000Lux	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	0.7	0.8	0.6
		残存率 (%)	100.0	92.9	93.5	89.0
	25℃ 75%RH	外観	淡黄白色	—	—	—
		重量変化率 (%)	0.0	3.4	3.4	3.0
		残存率 (%)	100.0	92.1	91.4	95.3

—：変化なし

**5. 調製法及び溶解後の安定性**

該当資料なし

**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**

本品の力価は円筒平板法により試験菌として *Bacillus subtilis* ATCC 6633 を用いて測定する。

**9. 製剤中の有効成分の確認試験法**

紫外可視吸光度測定法

**10. 製剤中の有効成分の定量法**

局外規「アセチルスピラマイシン錠」の力価試験による。

**11. 力価**

本品の力価は、スピラマイシン II 酢酸エステル ( $C_{47}H_{78}N_2O_{16}$ :927.13) としての量をスピラマイシン酢酸エステル質量（力価）で示し、スピラマイシン酢酸エステル 1mg（力価）はスピラマイシン II 酢酸エステル ( $C_{47}H_{78}N_2O_{16}$ ) 0.7225mg に対応する。

**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**

該当資料なし

**14. その他**

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### 〈適応菌種〉

スピラマイシンに感性のブドウ球菌属、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

#### 【効能又は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、中耳炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」<sup>1)</sup>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。

#### 【用法及び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。

### 3. 臨床成績<sup>2)～9)</sup>

#### (1) 臨床データパッケージ

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）

- 1) 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）、癩瘡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。
- 2) 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。
- 3) 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。
- 4) 中耳炎83.9%（26/31）、猩紅熱76.3%（29/38）の有効率であった。
- 5) 梅毒66.7%（4/6）の有効率であった。

#### (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）

該当資料なし

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

マクロライド系抗生物質

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### ・作用部位

感染症部位

##### ・作用機序

細菌の蛋白合成を阻害する。

##### ・抗菌作用<sup>10)~13)</sup>

- 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) 薬効を裏付ける試験成績

抗菌スペクトラム<sup>10)~13)</sup>

適応菌種は、スピラマイシン感性ブドウ球菌、レンサ球菌、肺炎球菌、梅毒トレポネーマである。また、適応外であるが抗マイコプラズマ、抗トキソプラズマ作用を示す。

菌 種	最小発育阻止濃度 ( $\mu$ g/mL)
黄色ブドウ球菌*	1.56
溶血連鎖球菌*	0.39
腸球菌*	0.78
緑色連鎖球菌*	0.39
炭疽菌	0.39
枯草菌	0.39
ジフテリア菌	0.19
ガス壊疽菌群	12.5
淋菌	12.5
髄膜炎菌	1.56
破傷風菌	6.25

\*適応菌種

#### (3) 作用発現時間・持続時間

作用発現時間：投与後 1～2 時間

作用持続時間：約 6 時間



## 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

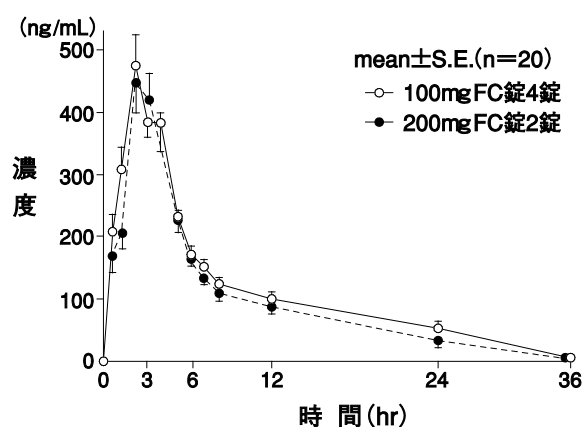
該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間<sup>3)</sup>

経口投与後約2時間

(3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>14)</sup>

健常成人にアセチルスピラマイシン錠 100 4錠又はアセチルスピラマイシン錠 200 2錠を経口投与した場合の血中濃度の推移は次のとおりである。



(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) 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<sup>14)</sup>

アセチルスピラマイシン 400mg 経口単回投与による  $AUC_{0\sim36}$  は 3450 (ng・hr/mL)

(4) 消失速度定数

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### (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

9%<sup>10)</sup>

17%<sup>9)</sup>

## 3. 吸 収

腸管より速やかに吸収される。

## 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<sup>7)</sup>

臍帯血中には母体血の 1/2 程度、胎盤組織中には母体血の 1/2～1/3 程度が移行する。

### (3) 乳汁への移行性<sup>15)</sup>

スピラマイシン酢酸エステル内服時の乳汁中移行は投与 6～8 時間後にピークを認め、おおむね血中濃度の 3 倍に達する。

### (4) 髄液への移行性<sup>4)</sup>

髄液中への移行は認められていない。

### (5) その他の組織への移行性<sup>4)～6)</sup>

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。

〈参考〉

ラットに 500mg/kg を経口投与後、血中濃度は 5 時間後にピークを示し、以後経時的に低下した。

また臓器内濃度の推移は下記のとおりであった。<sup>16)</sup>

#### Acetylspiramycin 投与時の臓器内濃度

臓器	$\mu\text{g/mL}$ or $\mu\text{g/g}$				
	1 時間	3 時間	5 時間	10 時間	20 時間
血液	4.1	4.6	6.0	1.2	1.3
肝	45	163	298	1430	570
肺	47	121	154	161	99
脾	23	124	147	170	119
腎	17	64	90	102	46

## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路<sup>8),9)</sup>

代謝部位：肝臓

代謝経路：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。

### (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

スピラマイシン、ネオスピラマイシン共に抗菌活性が認められている。

### (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<sup>9)</sup>

### (1) 排泄部位及び経路

胆汁、尿

### (2) 排泄率

健常成人に 500mg を投与した場合の 7 時間までの尿中回収率は 4.28% (3 例の平均) 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

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

「Ⅴ.1. 効能又は効果」の項参照

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「Ⅴ.2. 用法及び用量」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）  
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。]

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

### 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

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。

### (2) 重大な副作用と初期症状

該当しない

### (3) その他の副作用

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
<b>過敏症</b>	<b>発疹・発赤</b>		
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

### (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

全国101施設で調査された症例5,903例で副作用の発現した症例は、180例（3.05%）であった。  
 主なものの内訳は以下のとおりである。

副作用の種類	発現症例数 (%)
消 化 器	
食 欲 不 振	60 (1.02)
悪 心 ・ 嘔 吐	37 (0.63)
下 痢	14 (0.24)
胃 部 不 快 感	10 (0.17)
胃 腸 障 害	6 (0.10)
胃 痛	2 (0.03)
も た れ 感	2 (0.03)
腹 痛	2 (0.03)
便 秘	2 (0.03)
腹 部 膨 満 感	1 (0.02)
そ の 他	4 (0.07)
小 計	140 (2.37)

副作用の種類	発現症例数 (%)
過 敏 症	
皮 膚 発 疹 ・ 発 赤	27 (0.46)
蕁 麻 疹	2 (0.03)
紅 斑	1 (0.02)
湿 疹	1 (0.02)
小 計	31 (0.53)
そ の 他	
頭 痛	2 (0.03)
菌 交 代	2 (0.03)
口 内 炎	2 (0.03)
し び れ 感	1 (0.02)
新 生 児 便 性 悪 化	1 (0.02)
熱 感	1 (0.02)
小 計	9 (0.15)

医薬品副作用情報, NO.3, 1973

### (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

スピラマイシン酢酸エステルに対し過敏症の既往歴のある患者には投与しない。確立した試験方法はない。  
 十分に問診を行ってから投与する。

### 9. 高齢者への投与

#### 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、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。]

### 11. 小児等への投与

#### 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。

### 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

#### 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。

### 13. 過量投与

該当資料なし

### 14. 適用上の注意

#### 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。]

### 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  
麻酔ウサギの呼吸及び血圧に対し、5mg/kg（耳、静注）及びそれ以下の量ではほとんど影響はみられなかったが、10mg/kg では軽度の呼吸促進及び血圧の軽度下降（6mmHg）がみられた。
- (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<sup>16)</sup>  
LD<sub>50</sub> g/kg p.o. ラット >13.0 マウス >4.0
- (2) 反復投与毒性試験<sup>17)</sup>  
ラットに 0.2, 0.6g/kg 及びウサギに 0.3, 0.5g/kg を 6 ヶ月間経口投与したが、特記すべき異常は認められなかった。
- (3) 生殖発生毒性試験<sup>17)</sup>  
催奇形性  
マウスに 0.2, 1.7g/kg、ラットに 0.2, 1.2g/kg を器官形成期（妊娠 6～12 日目）を通じて経口投与したところ、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なかった。
- (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：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

使用期限：3年（包装に表示）

### 3. 貯法・保存条件

密閉容器、室温保存

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取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）

くすりのしおり：有り

（「Ⅷ.14. 適用上の注意」を参照）

#### (3) 調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 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）

### 7. 容器の材質

[PTP]（高防湿透明ポリオレフィンとポリプロピレンのラミネートフィルム、アルミニウム箔）

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

同効薬：マクロライド系抗生物質



## 9. 国際誕生年月日

該当資料なし

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

アセチルスピラマイシン錠 100 : 21800AMX10202 (2006年2月3日)

アセチルスピラマイシン錠 200 : 21800AMX10201 (2006年2月3日)

[アセチルスピラマイシン錠協和として 1967年6月24日 14200AZZ04446]

## 11. 薬価基準収載年月日

2006年6月9日 (アセチルスピラマイシン錠協和として 1968年2月27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

1980年6月9日 (再評価結果通知に伴う効能・効果の一部変更)

1993年11月19日 (再評価結果通知に伴う効能・効果の一部変更)

2005年1月5日 (再評価結果通知に伴う効能・効果の一部変更)

## 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 : 1975年12月26日

1993年9月8日

2004年9月30日

## 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 収載医薬品コード	レセプト電算コード
アセチルスピラマイシン錠 100	111201604	6142001F1031	620003495
アセチルスピラマイシン錠 200	111202304	6142001F2038	620003496

## 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) 塩田憲三, 他：J. Antibiotics, Ser. B., 19 (4), 292 (1966)
- 3) 上田 泰, 他：Chemotherapy, 16 (5), 755 (1968)
- 4) 柴田清人, 他：J. Antibiotics, Ser. B., 19 (3), 200 (1966)
- 5) 石井哲也, 他：J. Antibiotics, Ser. B., 19 (6), 432 (1966)
- 6) 中川圭一, 他：J. Antibiotics, Ser. B., 19 (2), 105 (1966)
- 7) 張 南薫, 他：J. Antibiotics, Ser. B., 19 (3), 211 (1966)
- 8) 松下光延, 他：J. Antibiotics, Ser. B., 19 (4), 305 (1966)
- 9) 清水喜八郎, 他：J. Antibiotics, Ser. B., 19 (6), 423 (1966)
- 10) 中沢昭三, 他：J. Antibiotics, Ser. B., 19 (2), 90 (1966)
- 11) 善養寺浩, 他：Chemotherapy, 17 (8), 1578, (1969)
- 12) 中村昭司：日本医事新報, No.2851, 23, (1978)
- 13) 青木豊治, 他：寄生虫学雑誌, 18, (2), 190, (1969)
- 14) 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等性について
- 15) 青河寛次, 他：J. Antibiotics, Ser. B., 19 (5), 387 (1966)
- 16) 高平汎志, 他：J. Antibiotics, Ser. B., 19 (2), 95 (1966)
- 17) 日本薬剤師研修センター編：日本薬局方 医薬品情報 2006, 819 (2006)

## 2. その他の参考文献

なし

## X II . 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

《経口剤》

スピラマイシン酢酸エステル製剤は 2004 年 2 月現在、中国にて販売されている。

### 2. 海外における臨床支援情報

なし

## XⅢ. 備考

その他の関連資料

なし







販 売  
**サンド株式会社**  
東京都港区虎ノ門1-23-1  
URL:<https://www.sandoz.jp/>

製造販売  
**サンドファーマ株式会社**  
東京都港区虎ノ門1-23-1  
URL:<https://www.sandoz.jp/>