

## 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

合成ペニシリン製剤  
ペングッド®錠250mg  
Pengood

剤形	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	1錠中バカンピシリン塩酸塩 250mg（力価）含有
一般名	和名：バカンピシリン塩酸塩 洋名：Bacampicillin Hydrochloride
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	承認年月日：2001年 9月 12日 薬価基準収載：2001年 9月 21日 発売年月日：2001年 11月 1日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売（輸入）元：日医工株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>

本IFは2020年9月改訂（第10版）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、医薬品医療機器総合機構ホームページ  
<https://www.pmda.go.jp/>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のホームページ（<https://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式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)

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	1	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	13
1. 開発の経緯 .....	1	1. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群	13
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 .....	1	2. 薬理作用 .....	13
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	2	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	14
1. 販売名 .....	2	1. 血中濃度の推移・測定法 .....	14
2. 一般名 .....	2	2. 薬物速度論的パラメータ .....	17
3. 構造式又は示性式 .....	2	3. 吸収 .....	17
4. 分子式及び分子量 .....	2	4. 分布 .....	17
5. 化学名（命名法） .....	2	5. 代謝 .....	19
6. 慣用名，別名，略号，記号番号 .....	2	6. 排泄 .....	20
7. CAS 登録番号 .....	2	7. トランスポーターに関する情報 .....	20
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	3	8. 透析等による除去率 .....	20
1. 物理化学的性質 .....	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	21
2. 有効成分の各種条件下における安定性 .....	4	1. 警告内容とその理由 .....	21
3. 有効成分の確認試験法 .....	5	2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） .....	21
4. 有効成分の定量法 .....	6	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 .....	21
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	7	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 .....	21
1. 剤形 .....	7	5. 慎重投与内容とその理由 .....	21
2. 製剤の組成 .....	7	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 .....	21
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 .....	7	7. 相互作用 .....	21
4. 製剤の各種条件下における安定性 .....	7	8. 副作用 .....	22
5. 調製法及び溶解後の安定性 .....	7	9. 高齢者への投与 .....	25
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） .....	8	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与 .....	25
7. 溶出性 .....	8	11. 小児等への投与 .....	25
8. 生物学的試験法 .....	9	12. 臨床検査結果に及ぼす影響 .....	25
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....	9	13. 過量投与 .....	25
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....	9	14. 適用上の注意 .....	26
11. 力価 .....	9	15. その他の注意 .....	26
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....	9	16. その他 .....	26
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 .....	9	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	27
14. その他 .....	9	1. 薬理試験 .....	27
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	10	2. 毒性試験 .....	27
1. 効能又は効果 .....	10	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	29
2. 用法及び用量 .....	10	1. 規制区分 .....	29
3. 臨床成績 .....	11		

2.	有効期間又は使用期限	29
3.	貯法・保存条件	29
4.	薬剤取扱い上の注意点	29
5.	承認条件等	29
6.	包装	29
7.	容器の材質	29
8.	同一成分・同効薬	29
9.	国際誕生年月日	29
10.	製造販売承認年月日及び承認番号	29
11.	薬価基準収載年月日	29
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	29
13.	再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容	30
14.	再審査期間	30
15.	投与期間制限医薬品に関する情報	30
16.	各種コード	30
17.	保険給付上の注意	30
<b>X I.</b>	<b>文献</b>	<b>31</b>
1.	引用文献	31
2.	その他の参考文献	31
<b>X II.</b>	<b>参考資料</b>	<b>32</b>
1.	主な外国での発売状況	32
2.	海外における臨床支援情報	32
<b>X III.</b>	<b>備考</b>	<b>33</b>
1.	調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	33
2.	その他の関連資料	34

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

アンピシリンは酸に不安定で経口投与による吸収が悪く、吸収は食事の影響を受け易い。これらの理由から吸収の良好なアンピシリンを開発するために、アンピシリンの持つカルボキシル基をエステル化する化学修飾が試みられた。スウェーデン・アストラ社は吸収の良好なアンピシリンのエステル化合物を開発するにあたり、以下の項目を目標として各種誘導体を合成し、バカンピシリン塩酸塩を見出した。

- (1) 脂肪親和性の高い化合物で容易に生体膜を通過することにより、吸収速度が速くかつバイオアベイラビリティの高い化合物であること。
- (2) 胃及び十二指腸の pH に安定で、吸収前にアンピシリンに分解しないこと。
- (3) 生体内に吸収された後、速やかに加水分解されてアンピシリンを生じる。
- (4) エステル部分が加水分解されて産生する物質が有害作用を持たないこと。
- (5) エステル誘導体自身は抗菌力が弱いこと。

本邦では、ウェルファイド株式会社により「ペングロブ錠 250」が 1981 年 5 月 1 日に承認を取得し、1981 年 9 月 1 日に販売を開始した。

2001 年 9 月 12 日に日医工株式会社はウェルファイド株式会社から「ペングロブ錠 250」の製造販売承認を承継した。その際に販売名を「ペングッド錠 250mg」に変更し、2001 年 11 月 1 日から販売を開始した。

2002 年 7 月 10 日、再評価（品質再評価）結果が公表され、薬事法第 14 条第 2 項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないとの結果を得た。

2004 年 9 月 30 日、再評価（薬効の再評価）結果が公表され、承認事項の一部を変更すれば薬事法第 14 条第 2 項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しないとの結果を得た。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤はアンピシリンのプロドラッグであるバカンピシリン塩酸塩を成分とする合成ペニシリン製剤である。
- (2) 副作用：総症例数 15,095 例中 472 例（3.13%）、574 件の副作用が報告されている。  
主な副作用は発疹 117 件（0.78%）、下痢 72 件（0.48%）、悪心 53 件（0.35%）、食欲不振 35 件（0.23%）、嘔吐 22 件（0.15%）等であった。（再審査終了時）  
重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー（0.1%未満）、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）、急性汎発性発疹性膿疱症（いずれも頻度不明）、急性腎障害（頻度不明）、偽膜性大腸炎、出血性大腸炎（いずれも頻度不明）、肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）が報告されている。

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

ペングッド®錠 250mg

#### (2) 洋名

Pengood

#### (3) 名称の由来

penicillin 系の薬剤で組織移行 (penetration) が良い (good) ことより

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

バカンピシリン塩酸塩 (JAN)

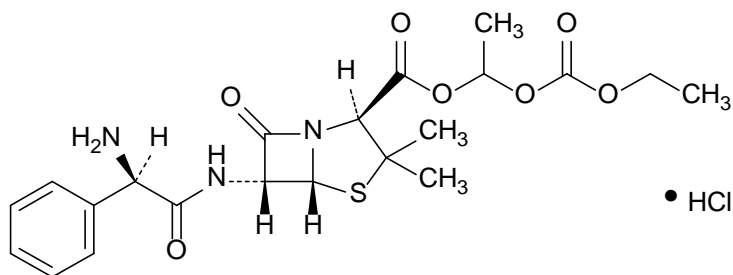
#### (2) 洋名 (命名法)

Bacampicillin Hydrochloride (JAN)

#### (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:  $C_{21}H_{27}N_3O_7S \cdot HCl$

分子量: 501.98

### 5. 化学名 (命名法)

1-Ethoxycarbonyloxyethyl (2*S*,5*R*,6*R*)-6-[(2*R*)-2-amino-2-phenylacetylaminol]-3,3-dimethyl-7-oxo-4-thia-1-azabicyclo[3.2.0]heptane-2-carboxylate monohydrochloride (IUPAC)

### 6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

略号: BAPC

別名: 塩酸アンピシリンエトキシカルボニルオキシエチル, 塩酸バカンピシリン

### 7. CAS 登録番号

50972-17-3 (Bacampicillin)

37661-08-8 (Bacampicillin Hydrochloride)

### 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～微黄色の結晶性の粉末である。(特異なおいがあり、味は苦い。)

##### (2) 溶解性

メタノール又はエタノール(95)に溶けやすく、水にやや溶けやすい。

	1gを溶かすのに必要な溶媒量	溶解性
メタノール	4mL	溶けやすい
エタノール	9mL	溶けやすい
水	18mL	やや溶けやすい
アセトン	700mL	溶けにくい
ベンゼン	10,000mL以上	ほとんど溶けない
酢酸エチル	10,000mL以上	ほとんど溶けない

(液温 23±1℃)

##### (3) 吸湿性

吸湿性である。(臨界湿度 約75%RH)

##### (4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点

融点(分解点): 測定不能(140℃付近より熱分解し明瞭な融点を示さない。)

##### (5) 酸塩基解離定数

pKa: 6.8 (室温, アミノ基, 滴定法)

##### (6) 分配係数

pH	クロロホルム/水系 (液温 25℃)	pH	オクタノール/水系
3.0	3.6	3.0	0.01
4.0	4.3		
5.0	5.6	5.0	1.6
6.0	43.4		
7.0	111.5	7.0	99
8.0	160.3		
9.0	168.5	9.0	5000以上

(Sørensen 緩衝液)

(Britton-Robinson 緩衝液)

##### (7) その他の主な示性値

旋光度  $[\alpha]_D^{20}$ : +140~+170° (脱水物に換算したもの 0.1g, エタノール(95), 25mL, 100mm)



## 2. 有効成分の各種条件下における安定性

### (1) 各種条件下における安定性

#### 1) 苛酷条件下での安定性

バカンピシリン塩酸塩の苛酷条件下での安定性

保存条件	保存期間 (月)	外観	UV	力 価				pH	[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> (°)	含湿度 (%)	ペニシロ ン酸 (%)	アンピシ リン (%)	ペニシロ ン酸 (%)	毒性 物質
				円筒平板法		酵素滴定法								
				μg/mg	%	μg/mg	%							
開始時		微黄白色	正常	656	100.0	642	100.0	3.62	+154.5	0.42	1.41	0.09	0.09	陰性
50℃	2	〃	〃	636	97.0	632	98.4	3.18	+139.9	0.37	4.51	0.17	0.17	—
	4	〃	〃	654	99.7	630	98.1	3.17	+137.5	0.33	4.92	0.15	0.14	陰性
30℃ 54%RH	2	微黄色	〃	616	93.9	583	90.8	2.80	+116.4	1.12	—	0.20	0.26	—
	4	淡黄色	〃	515	78.5	492	76.6	2.64	+102.0	0.92	—	0.21	0.35	陰性
室内散乱光	3	微黄白色	〃	651	99.2	636	99.1	3.35	+147.8	0.37	2.55	0.07	0.12	陰性
直射日光	1	〃	〃	651	99.2	639	99.5	3.30	+149.2	0.38	2.89	0.07	0.09	陰性

#### 2) 室温長期保存下での安定性

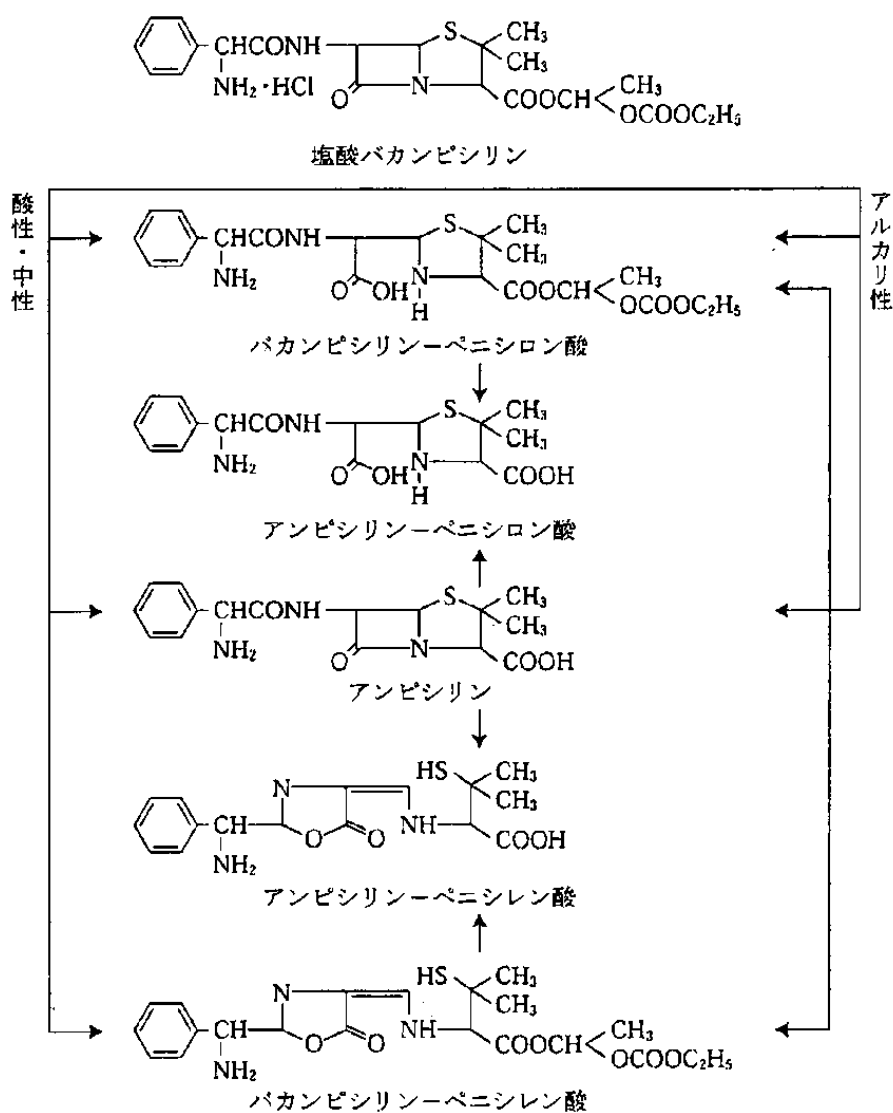
気密容器に入れ、室温で 27 ヶ月間保存した結果、外観、成分含量、毒性物質において異常は認められず安定であった。

#### 3) 水溶液中での安定性

6.65mg/mL の濃度に溶解し、室温で 4 日間保存した結果、外観は無色透明から淡黄色に着色し、ペニシロン酸の増加やわずかなアンピシリン量の増加がみられ力価は約 60%に低下した。なお、「日局一般試験法」崩壊試験法の第 1 液（人工胃液）中では分解率は低く、消化管内での安定性は高い。

## (2) 強制分解による生成物

40℃, 82%RH に保存した場合の成績と強制劣化試験の成績を考慮するとバカンピシリン塩酸塩の分解経路は以下のように推定される。



## 3. 有効成分の確認試験法

### (1) 紫外可視吸光度測定法

本品のメタノール溶液につき吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトル又はバカンピシリン塩酸塩標準品のスペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

### (2) 赤外吸収スペクトル測定法

本品につき塩化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトル又はバカンピシリン塩酸塩標準品のスペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

### (3) 定性反応

本品の水溶液は塩化物の定性反応を呈する。

#### 4. 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー



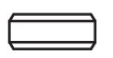
検出器：紫外吸光光度計

移動相：リン酸二水素ナトリウム試液，リン酸水素二ナトリウム試液，アセトニトリル  
混液

#### IV. 製剤に関する項目

##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別, 外観及び性状

販売名	色調 剤形	形 状			本体コード 包装コード
		質量(mg)	直径(mm)	厚さ(mm)	
ペンゴッド錠 250mg	白色の フィルムコーテ ィング錠				本体： <b>n</b> - PG250 包装： <b>n</b> - PG250
		450	15.3×6.9	5.0	

###### (2) 製剤の物性

(「IV - 4.製剤の各種条件下における安定性」の項参照)

###### (3) 識別コード

(「IV - 1.(1)剤形の区別, 外観及び性状」の項参照)

###### (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 錠中バカンピシリン塩酸塩 250mg (力価) を含有する。

###### (2) 添加物

乳糖, セルロース, ステアリン酸マグネシウム, ヒプロメロース, 酸化チタン, タルク, カルナウバロウ

###### (3) その他

該当記載事項なし

##### 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<sup>1)</sup>

試験項目		保存条件	保存期間	保存形態	結果
苛 酷 試 験	加温試験	30℃ 40℃ 50℃	4 ヶ月	気密容器	変化認められず安定
	加湿試験	30℃, 57%RH 30℃, 75%RH 30℃, 82%RH	2 ヶ月	市販包装	変化認められず安定
	曝光試験	室内散乱光	4 ヶ月	無色透明 ガラス容器	変化認められず安定
長期保存試験		室温	27 ヶ月	市販包装	変化認められず安定

測定項目：外観, 含量 (力価), 含湿度, 崩壊試験, ペニシロン酸(%), TLC

##### 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）

該当しない

## 7. 溶出性

### （1）溶出規格

日本薬局方外医薬品規格第三部「塩酸バカンピシリン錠」の項に従い溶出試験を行うとき、ペングッド錠 250mg はこれに適合する。

（試験液に水 900mL を用い、溶出試験法第 2 法により、50rpm で試験を行う）

溶出規格

表示量	規定時間	溶出率
250mg（力価）	30分	80%以上

### （2）溶出試験<sup>2)</sup>

試験条件

装置：日本薬局方 溶出試験法 パドル法

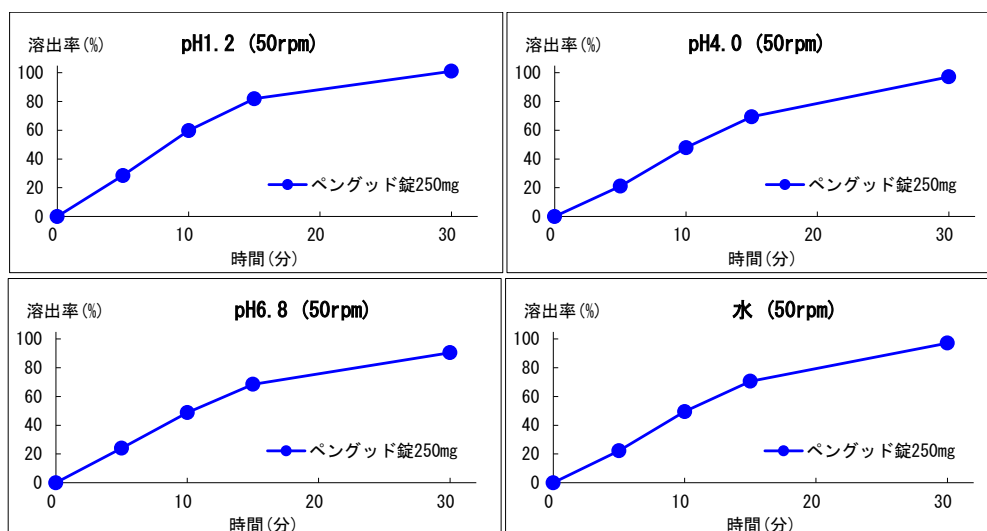
回転数及び試験液：50rpm（pH1.2, pH4.0, pH6.8, 水）

[判定]

- ・ pH1.2（50rpm）では、30分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH4.0（50rpm）では、30分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ pH6.8（50rpm）では、30分以内に平均85%以上溶出した。
- ・ 水（50rpm）では、30分以内に平均85%以上溶出した。

ペングッド錠250mgは品質再評価における「塩酸バカンピシリン錠」の標準製剤である。

（溶出曲線）



(n=6)

## 8. 生物学的試験法

円筒平板法により試験菌 *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

### (1) 呈色反応

本品の粉末を水に溶解し、クエン酸ナトリウム溶液及びニンヒドリン試液を加え加熱するとき、液は紫色を呈する。

### (2) 呈色反応

本品の粉末を塩酸試液に溶解し、塩酸ヒドロキシルアミンを加え加熱後、塩化第二鉄試液を加えるとき、液は赤紫色を呈する。

### (3) 呈色反応

本品の粉末を水に溶解し、水酸化ナトリウム試液を加え放置後、ニトロプルシドナトリウム試液を加えるとき、液は赤色を呈する。

### (4) 紫外可視吸光度測定法

本品の粉末のメタノール溶液につき吸収スペクトルを測定するとき、波長 256～259nm, 261～264nm 及び 267～270nm に吸収の極大を示す。

## 10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相：リン酸二水素ナトリウム，リン酸水素二ナトリウム，アセトニトリル混液

## 11. 力価

本剤の力価は、アンピシリン ( $C_{16}H_{19}N_3O_4S$  : 349.40) としての量を質量 (力価) で示す。

## 12. 混入する可能性のある夾雑物

ペニシロン酸，アンピシリン

## 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

特になし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### <適応菌種>

アンピシリン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

#### <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，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，淋菌感染症，腹膜炎，子宮内感染，子宮付属器炎，眼瞼膿瘍，麦粒腫，角膜炎（角膜潰瘍を含む），中耳炎，副鼻腔炎，歯周組織炎，歯冠周囲炎，抜歯創・口腔手術創の二次感染，猩紅熱

#### <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，中耳炎，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」<sup>3)</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，成人の場合，1日量 500～1000mg（力価）とし，これを 3～4 回に分割して経口投与する。

小児の場合は，1日量 15～40mg（力価）/kg とし，これを 3～4 回に分割して経口投与する。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) 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・投与間隔の適切な調整をするなど慎重に投与すること。（「薬物動態に関する項目」の項参照）

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床効果<sup>4)～12)</sup>

二重盲検比較試験を含む国内 263 施設，2,665 例について実施された臨床試験の概要は次のとおりである。

なお，1 日投与量は成人 500～1,000mg（力価），小児 15～40mg（力価）/kg であり，投与期間は 1～60 日間にわたっているが多くは 3～14 日間である。

[有効率は「有効と認められるもの」以上を集計した]

疾患	主な起炎菌	有効率
肺炎，気管支炎，咽喉頭炎	インフルエンザ菌，化膿レンサ球菌，肺炎球菌など	73.6% (485 例/659 例)
扁桃炎，副鼻腔炎，中耳炎		84.5% (534 例/632 例)
腎盂腎炎，膀胱炎，尿道炎，淋疾	大腸菌，プロテウス・ミラビリス，腸球菌など	78.9% (643 例/815 例)
腹膜炎	大腸菌，黄色ブドウ球菌など	90.9% (10 例/11 例)
リンパ節炎		66.7% (8 例/12 例)
猩紅熱	化膿レンサ球菌	94.9% (130 例/137 例)
乳腺炎，子宮付属器炎，子宮内感染	大腸菌，プロテウス・ミラビリス，黄色ブドウ球菌，表皮ブドウ球菌など	75.0% (72 例/96 例)
麦粒腫，眼瞼膿瘍，角膜潰瘍	黄色ブドウ球菌，表皮ブドウ球菌など	82.8% (24 例/29 例)
癬・癬腫症・よう，毛嚢炎，膿痂疹，膿皮症，蜂窠織炎，瘰癧，感染性粉瘤，皮下膿瘍	化膿レンサ球菌，黄色ブドウ球菌，表皮ブドウ球菌など	83.3% (165 例/198 例)
歯槽膿瘍，抜歯後感染，智歯周囲炎	化膿レンサ球菌など	87.1% (27 例/31 例)
創傷・熱傷の二次感染	黄色ブドウ球菌，大腸菌など	77.8% (14 例/18 例)

なお，二重盲検比較試験によって，細菌性肺炎，急性扁桃炎及び急性中耳炎，急性単純性膀胱炎，猩紅熱，癬・癬腫症・よう，蜂窠織炎に対するバカンピシリンの有用性が認められている。

(注：疾患名及び菌名は試験実施時の記載による。)

#### (3) 臨床薬理試験<sup>13)</sup>

健康成人男子 6 例を対象に，バカンピシリン 250mg を空腹時及び朝食後に単回投与した結果，各種検査項目において異常所見は認められなかった。

#### (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

バカンピシリンの有効性と安全性を既存の同系薬剤と比較するために、以下 5 種の二重盲検比較試験が実施された。その結果、本剤の有用性が確認された。

対象疾患	投与薬剤	文献 No.
細菌性肺炎	BAPC : 1g AMPC : 1g	4)
中耳炎, 扁桃炎	BAPC : 1g AMPC : 1g	5)
急性単純性膀胱炎	BAPC : 1g or 0.5g ABPC : 1g	6)
猩紅熱	BAPC : 400mg or 600mg TAPC : 400mg or 600mg	7)
皮膚科感染症	BAPC : 1g ABPC : 2g	8)

BAPC : バカンピシリン, ABPC : アンピシリン, AMPC : アモキシシリン, TAPC : タランピシリン

### 3) 安全性試験

該当資料なし

### 4) 患者・病態別試験

(「V - 3(5)2)比較試験」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)

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. 薬理的に関連のある化合物又は化合物群

ペニシリン系及びセフェム系抗生物質

### 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：バカンピシリンは、生体内でアンピシリンとなり<sup>14)</sup>、細菌の細胞壁合成を阻害することにより殺菌的に作用する。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 1) 試験管内での作用 <抗菌作用>

インフルエンザ菌、大腸菌、プロテウス・ミラビリス及び淋菌などのグラム陰性菌並びに肺炎球菌、腸球菌、化膿レンサ球菌、表皮ブドウ球菌及び黄色ブドウ球菌などのグラム陽性菌に対して、優れた抗菌作用を示す。

##### ◆最小発育阻止濃度 (MIC)<sup>15)</sup>

	菌種	10 <sup>6</sup> 接種		10 <sup>8</sup> 接種	
		ペンゲット※	アンピシリン	ペンゲット※	アンピシリン
グ ラ ム 陰 性 菌	大腸菌 NIHJ-JC2	3.12	3.12	6.25	6.25
	シトロバクター・フロインディ GN-346	>100	>100	>100	>100
	チフス菌 Tanaka	0.39	0.78	1.56	1.56
	シゲラ・フレクスネリ 2a	1.56	1.56	6.25	6.25
	シゲラ・フレクスネリ 2b	1.56	1.56	6.25	6.25
	肺炎桿菌 GN-69	>100	>100	>100	>100
	セラチア・マルセッセンス No-2	50	50	>100	>100
	プロテウス・ミラビリス	1.56	1.56	100	100
	プロテウス・ブルガリス	6.25	12.5	>100	>100
	緑膿菌 IFO-3445	>100	>100	>100	>100
グ ラ ム 陽 性 菌	黄色ブドウ球菌 209-P	≦0.19	≦0.19	0.39	0.39
	黄色ブドウ球菌 Smith	≦0.19	≦0.19	0.39	0.78
	黄色ブドウ球菌 Newmann	≦0.19	≦0.19	0.78	0.78
	表皮ブドウ球菌	≦0.19	≦0.19	1.56	1.56
	化膿レンサ球菌 Cook	≦0.19	≦0.19	≦0.19	≦0.19
	肺炎球菌	≦0.19	≦0.19	≦0.19	≦0.19
	マイクロコッカス・ルテウス ATCC9341	≦0.19	≦0.19	1.56	1.56
	枯草菌 PCI-219	0.39	0.78	3.12	3.12

※：ペンゲット(バカンピシリン塩酸塩)の抗菌力は、エステラーゼ処理後に測定

##### 2) 動物での作用 <抗菌作用>

マウスでの感染治療実験で、インフルエンザ菌、大腸菌、プロテウス・ミラビリス、黄色ブドウ球菌などによる感染症に対して優れた治療効果を示す<sup>15)</sup>、<sup>16)</sup>。

また、生体防御能の低下した状態のマウス(ニュートロペニック・マウス)での大腸菌による感染症において、アンピシリン、アモキシシリンより優れた治療効果が認められている<sup>15)</sup>。

##### (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

該当資料なし

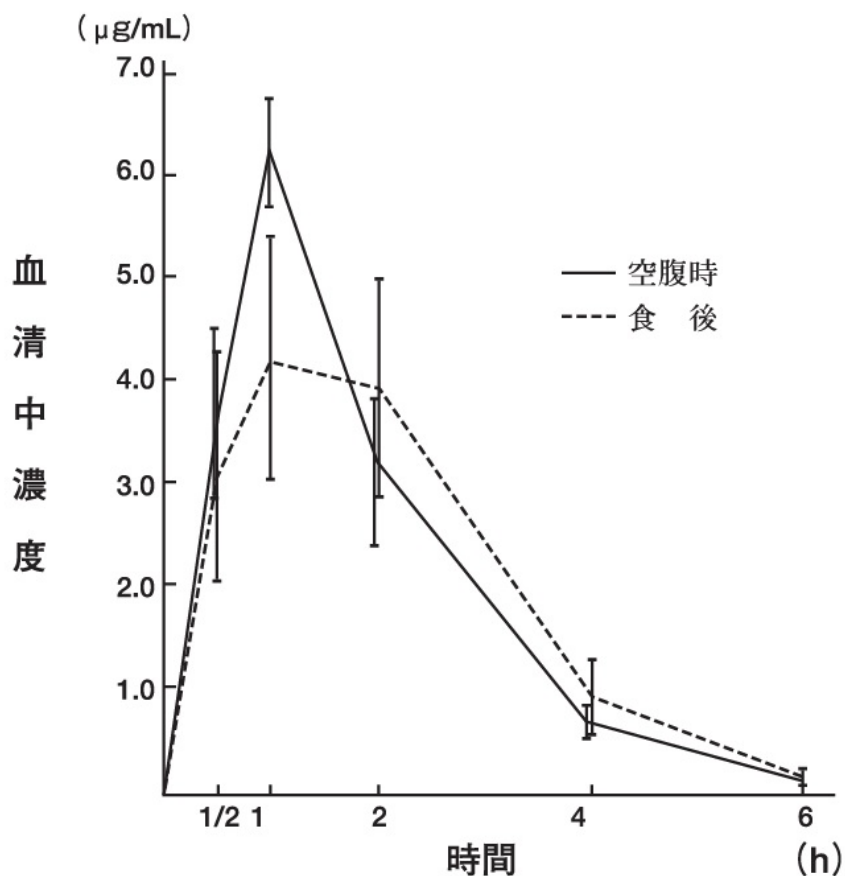
#### (2) 最高血中濃度到達時間

(「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

##### 1) 健康成人単回投与<sup>13)</sup>

健康成人男子 6 名にバカンピシリン 250mg (力価) を空腹時又は食後に経口投与した場合、血清中濃度は投与後 1 時間で最高に達し、その濃度は各々  $6.23\mu\text{g/mL}$ 、 $4.22\mu\text{g/mL}$  であり、食事の影響をほとんど受けなかった。



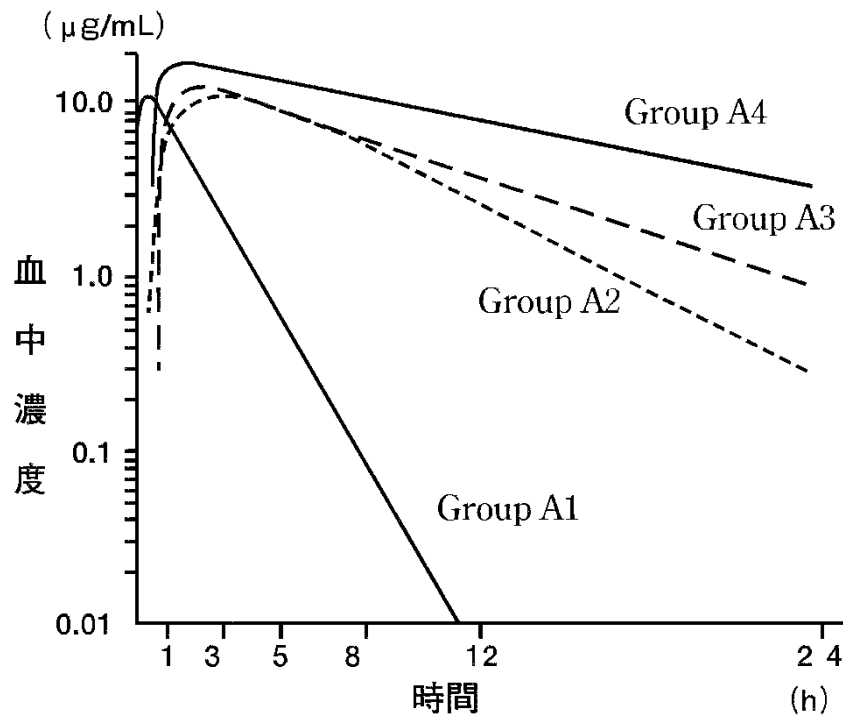
バカンピシリンを健康成人に空腹時又は食後に 1 回経口投与したときの血清中濃度 (n=6, 平均値±S.E.)

2) 腎機能障害患者単回投与<sup>17)</sup>

腎機能障害患者にバカンピシリン 500mg (力価) を経口投与した場合、腎機能低下に応じて、 $t_{1/2}$  が延長し、AUC の上昇がみられた。

◆腎機能障害患者 11 例 500mg (力価) 単回経口投与 (平均値±S.D.)

Group 例数	クレアチニン (mg/dL)	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	tmax (h)	t1/2 (h)	AUC t ( $\mu\text{g}\cdot\text{h}/\text{mL}$ )
A1 2 例	0.8 (腎機能正常例)	11.33±2.34	0.50±0.18	1.05±0.09	23.55±3.54
A2 2 例	2.7-2.8	10.93±7.46	3.55±1.55	3.69±1.44	108.50±70.73
A3 2 例	3.6-7.5	12.16±2.19	2.37±0.39	5.67±0.93	122.86±28.19
A4 5 例	7.2-15.7 (透析患者)	17.04±9.60	3.38±2.81	9.63±3.00	292.88±206.11



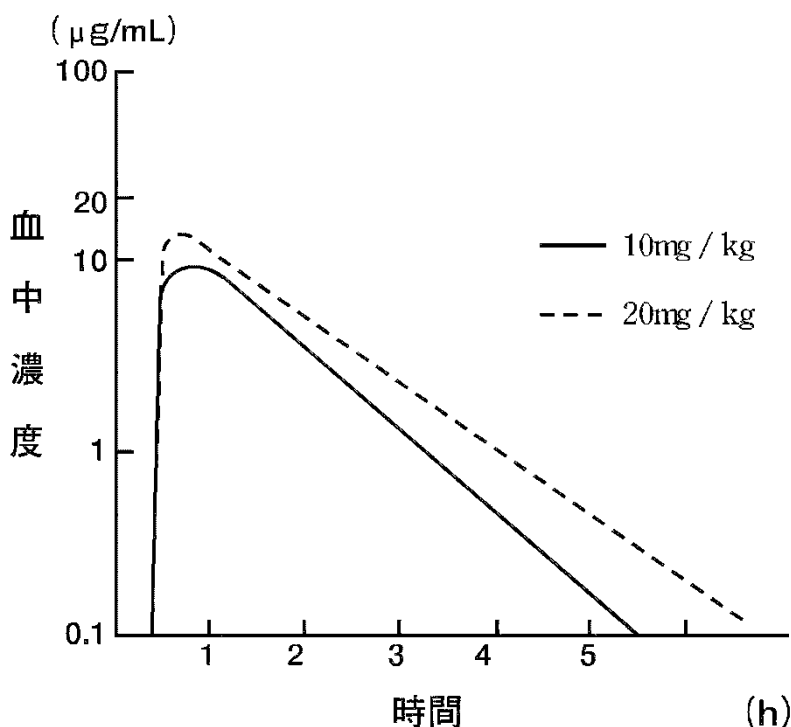
バカンピシリンを腎機能障害患者に単回経口投与したときの血中濃度  
(one-compartment open model)

3) 小児患者単回投与<sup>18)</sup>

小児患者（4～12歳）にバカンピシリン 10mg/kg 又は 20mg/kg（力価）を空腹時に経口投与した場合、血中濃度は 1～2 時間後に最高に達した。最高血中濃度及び血中濃度曲線下面積（AUC）には、年齢による差はみられなかった。

◆小児患者 19 例 空腹時単回経口投与（one-compartment model による解析）

投与量 (mg/kg)	例数	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	tmax (h)	t1/2 (min)	AUC t ( $\mu\text{g}\cdot\text{h}/\text{mL}$ )
10	11	7.02	1.02	45.23	14.67
20	8	12.81	0.76	61.16	23.26



バカンピシリンを小児患者に空腹時単回経口投与したときの血中濃度  
(one-compartment model による解析)

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

(「VII - 1.(3)1健康成人単回投与」, 「VIII - 7. 相互作用」の項参照)

(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<sup>19)</sup>

$1.400 \pm 0.508 \text{ h}^{-1}$  [外国人のデータ ; バカンピシリン 800mg 経口投与]

### (3) バイオアベイラビリティ<sup>19)</sup>

$87 \pm 21.8\%$  [外国人のデータ ; バカンピシリン 800mg 経口投与]

### (4) 消失速度定数<sup>19)</sup>

$0.776 \pm 0.115 \text{ h}^{-1}$  [外国人のデータ ; バカンピシリン 800mg 経口投与]

### (5) クリアランス<sup>20)</sup>

腎クリアランス (0→6hr) :  $202 \pm 29 \text{ mL/min}$

[外国人のデータ ; バカンピシリン 808mg 経口投与]

### (6) 分布容積<sup>19)</sup>

$25.45 \pm 6.21 \text{ L}$  [外国人のデータ ; バカンピシリン 800mg 経口投与]

### (7) 血漿蛋白結合率<sup>21)</sup>

21% (in vitro)

## 3. 吸収<sup>22)</sup>

[外国人のデータ]

健康成人にバカンピシリン塩酸塩 278mg (力価) を経口投与し、胃、十二指腸、空腸上部内容液中のバカンピシリン塩酸塩残存率を経時的に測定した。

胃では平均 20%、十二指腸までに平均 65%、空腸上部までに平均 71%が吸収された。

従ってバカンピシリン塩酸塩の主な吸収部位は十二指腸と考えられる。

## 4. 分布

### (1) 血液-脳関門通過性<sup>21)</sup>

<参考>

Sprague-Dawley 系雄ラットにバカンピシリン 100mg (力価) /kg を経口投与した時、脳への分布は投与 30 分後に最高値 (血清中濃度の約 4%) に達し、速やかに消失した。

### (2) 血液-胎盤関門通過性<sup>23) ~25)</sup>

血液-胎盤関門を通過する。

分娩直前の妊婦に、バカンピシリン 250mg (力価) 又は 500mg (力価) を経口投与し、臍帯血濃度を測定した。濃度は 250mg 投与の場合、投与後 2 時間までは検出されないが、3 時間には  $1.0 \mu\text{g/mL}$  であった。また 500mg 投与の場合、投与後 30 分までは検出されていないが、1~3 時間では  $1.3 \sim 2.8 \mu\text{g/mL}$  であった。

### (3) 乳汁への移行性<sup>26)</sup>

乳汁中へ移行する。

産婦にバカンピシリン塩酸塩 500mg (力価) を空腹時投与して、乳汁内濃度を測定した。

乳汁内へは 2 時間以降に認められ、2~4 時間では  $0.3 \sim 0.6 \mu\text{g/mL}$  であった。

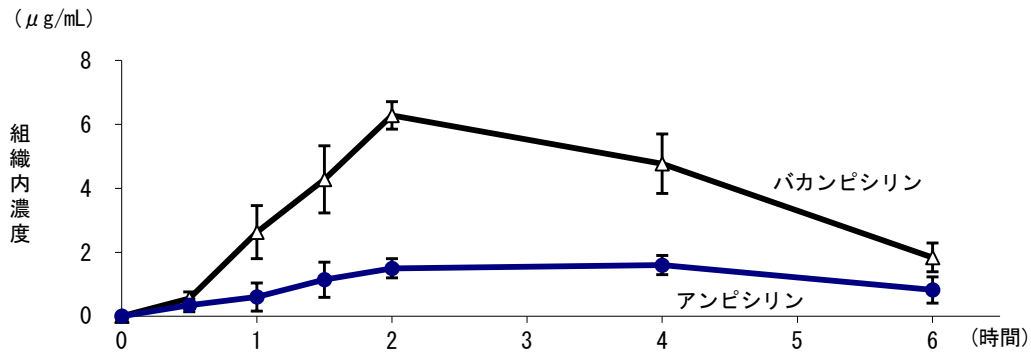
#### (4) 髄液への移行性<sup>27)</sup>

5年5カ月の男児にバカンピシリン塩酸塩 250mg (力価) を経口投与し、投与後2時間の最高血中濃度 (7.0 $\mu\text{g}/\text{mL}$ ) 到達時に髄液内濃度を測定した結果、0.1 $\mu\text{g}/\text{mL}$  が検出された。

#### (5) その他の組織への移行性

##### 1) 炎症組織への移行<sup>28)</sup> [外国人データ]

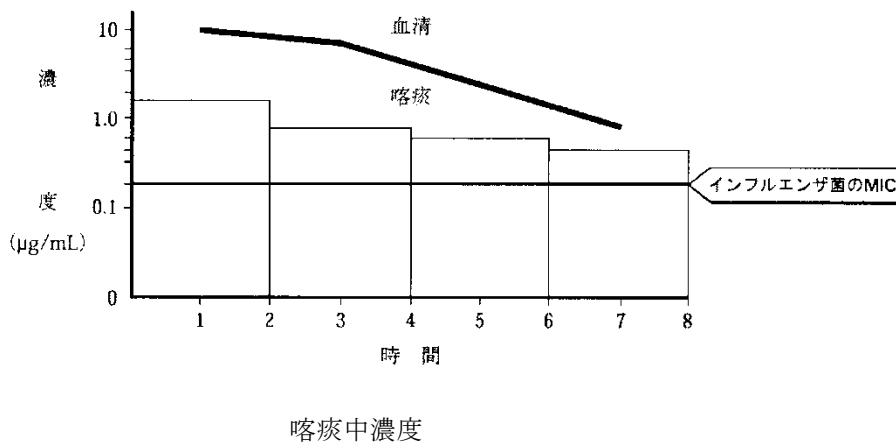
健康成人 (ドイツ人) に経口投与した場合、カンタリジンによって惹起した炎症組織への移行が良好で、その最高濃度は、アンピシリンの約4倍であった。



成人 10 名に等モルのバカンピシリン又はアンピシリン経口投与時の炎症組織内濃度推移

##### 2) 喀痰中への移行性<sup>29)</sup> [外国人データ]

慢性気管支炎患者 (オランダ人) に経口投与した場合、喀痰中への移行が良好で、その濃度は、インフルエンザ菌の最小発育阻止濃度 (MIC) を上まわる。

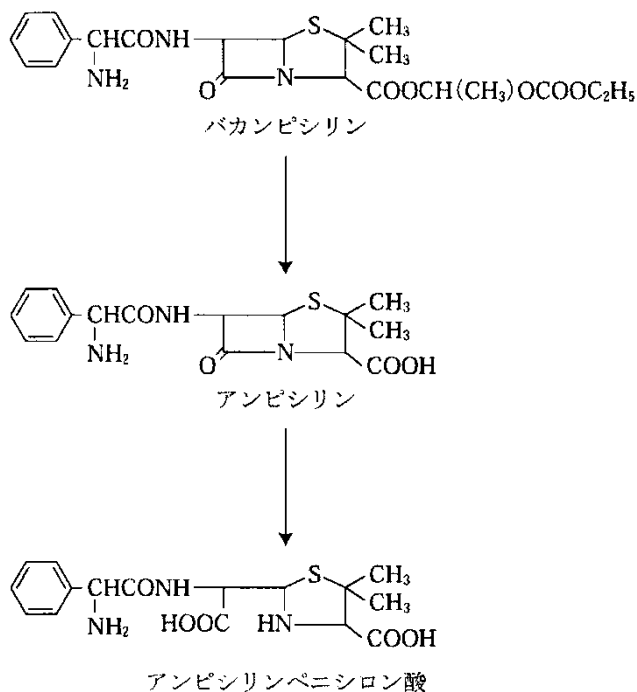


## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路<sup>22), 30)</sup>

代謝部位：腸管壁

代謝経路：バカンピシリン塩酸塩は生体内で以下のように代謝される。



### (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

有 (バカンピシリンは体内でアンピシリンに代謝される。)

### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

(「VII - 1. 血中濃度の推移・測定法」の項参照)



## 6. 排泄

### (1) 排泄部位及び経路<sup>22)</sup>

主に尿中に排泄される。

### (2) 排泄率

- 1) 健康成人にバカンピシリン 250mg (力価) を空腹時又は食後に経口投与した場合, 大部分はアンピシリンとして, 6 時間までに各々 59.4%, 55.3% が尿中に排泄された。<sup>12)</sup>
- 2) 健康成人にバカンピシリン塩酸塩 278mg (力価) を経口投与した時, 尿中排泄率は 3 時間, 24 時間及び 7 日間の累積で 62%, 79% 及び 80% であった。また糞中では 7 日間累積で 14% であった。[外国人のデータ]<sup>22)</sup>
- 3) 小児患者 (4~12 歳) にバカンピシリン 10mg/kg 又は 20mg/kg (力価) を空腹時に経口投与した場合, 投与後 6 時間までに各々 53.5%, 47.2% が尿中に排泄され, その半分以上が 2 時間までに排泄された。<sup>18)</sup>

### (3) 排泄速度

腎機能障害患者にバカンピシリン 500mg (力価) を経口投与した場合, 腎機能低下に応じて排泄速度が遅延した。<sup>17)</sup>

腎機能障害患者 11 例 500mg (力価) 単回経口投与 (平均±S.D.)

Group 例数	A1 (2 例)	A2 (2 例)	A3 (2 例)	A4 (5 例)
クレアチニン (mg/dL)	0.8 (腎機能正常例)	2.7-2.8	3.6-7.5	7.2-15.7 (透析患者)
排泄速度定数(/h)	0.66±0.06	0.20±0.08	0.12±0.02	0.08±0.02

## 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

該当記載事項なし

### 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) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 伝染性単核症の患者〔発疹の発現頻度を高めることがある。〕

#### 【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

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

（「V. 治療に関する項目」を参照）

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

（「V. 治療に関する項目」を参照）

### 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反応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〔血中濃度半減期が延長する。〕
- (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ので，観察を十分に行うこと。〕

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

ショックがあらわれるおそれがあるので，十分な問診を行うこと。

### 7. 相互作用

#### (1) 併用禁忌とその理由

該当記載事項なし

#### (2) 併用注意とその理由

##### 併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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。

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

総症例数 15,095 例中 472 例 (3.13%) , 574 件の副作用が報告されている。

主な副作用は発疹 117 件 (0.78%) , 下痢 72 件 (0.48%) , 悪心 53 件 (0.35%) , 食欲不振 35 件 (0.23%) , 嘔吐 22 件 (0.15%) 等であった。(再審査終了時)

### (2) 重大な副作用と初期症状

- 1) **ショック, アナフィラキシー** (0.1%未満) : ショック, アナフィラキシーがあらわれることがあるので, 観察を十分に行い, 不快感, 口内異常感, 喘鳴, 呼吸困難, 眩暈, 全身潮紅, 全身そう痒感, 血管浮腫, 血圧低下等の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。
- 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) , 急性汎発性発疹性膿疱症** (いずれも頻度不明) : 中毒性表皮壊死融解症, 皮膚粘膜眼症候群, 急性汎発性発疹性膿疱症があらわれることがあるので, 観察を十分に行い, 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) **急性腎障害** (頻度不明) : 急性腎障害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。
- 4) **偽膜性大腸炎, 出血性大腸炎** (いずれも頻度不明) : 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するなど適切な処置を行うこと。
- 5) **肝機能障害, 黄疸** (いずれも頻度不明) : 肝機能障害 (AST (GOT) , ALT (GPT) ,  $\gamma$  - GPT, LDH, Al - P 昇等) , 黄疸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投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

### (3) その他の副作用

	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
<b>過敏症</b> <sup>注1)</sup>	発疹, そう痒感	発熱, 蕁麻疹	
<b>血液</b>			貧血, 顆粒球減少, 血小板減少, 好酸球増多
<b>消化器</b>	下痢, 悪心・嘔吐, 胃部不快感, 食欲不振	腹部膨満感, 便秘, 胸やけ	
<b>菌交代症</b> <sup>注2)</sup>		口内炎, 大腸炎 (カンジダあるいは非感受性の Klebsiella 等による)	
<b>ビタミン欠乏症</b>			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 群欠乏症状 (舌炎, 口内炎, 食欲不振, 神経炎等)

注1) このような症状があらわれた場合には投与を中止すること。

注2) このような症状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。

#### (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

新医薬品等の副作用のまとめ No.93 (昭和 63 年 10 月)

調査施設数	1,703
調査症例数	15,095
副作用発現症例数	472
副作用発現件数	574
副作用発現症例率	3.13%

副作用の種類	副作用発現件数(%)	副作用の種類	副作用発現件数(%)
<b>皮膚付属器官障害</b>	<b>152 (1.01)</b>	胃痛	16 (0.11)
発疹	117 (0.78)	胃部不快感	37 (0.25)
発疹 (麻疹様丘疹性)	1 (0.01)	腹痛	22 (0.15)
紅斑性発疹	2 (0.01)	腹部不快感	7 (0.05)
皮疹	12 (0.08)	腹部膨満感	4 (0.03)
蕁麻疹	7 (0.05)	胃腸障害	9 (0.06)
湿疹	1 (0.01)	便秘	6 (0.04)
そう痒感	21 (0.14)	下痢	72 (0.48)
顔面毛包炎	1 (0.01)	軟便	16 (0.11)
葉疹	3 (0.02)	心窩部痛 (非食餌性)	7 (0.05)
中毒疹	1 (0.01)	咽頭痛・嚥下痛	1 (0.01)
丘疹	1 (0.01)	内服困難	2 (0.01)
<b>筋骨格系障害</b>	<b>1 (0.01)</b>	血便	3 (0.02)
関節痛	1 (0.01)	大腸炎 (出血性)	1 (0.01)
<b>中枢末梢神経障害</b>	<b>9 (0.06)</b>	胃炎	5 (0.03)
めまい	5 (0.03)	食道炎	1 (0.01)
四肢のしびれ	2 (0.01)	胃腸症状	1 (0.01)
四肢強直	1 (0.01)	<b>肝臓・胆肝系障害</b>	<b>4 (0.03)</b>
手指振戦	1 (0.01)	肝障害	1 (0.01)
<b>自律神経系障害</b>	<b>4 (0.03)</b>	血清 GOT 上昇	2 (0.01)
発汗	1 (0.01)	血清 GPT 上昇	2 (0.01)
心悸亢進	2 (0.01)	<b>呼吸器系障害</b>	<b>2 (0.01)</b>
血圧降下	1 (0.01)	喘鳴	1 (0.01)
<b>聴覚前庭障害</b>	<b>1 (0.01)</b>	咳嗽	1 (0.01)
耳鳴	1 (0.01)	呼吸困難	1 (0.01)
<b>その他の特殊感覚障害</b>	<b>1 (0.01)</b>	<b>血小板出血凝血障害</b>	<b>1 (0.01)</b>
口内苦味感	1 (0.01)	膀胱出血	1 (0.01)
<b>精神障害</b>	<b>1 (0.01)</b>	<b>一般的全身障害</b>	<b>24 (0.16)</b>
眠気	1 (0.01)	胸部圧迫感	1 (0.01)
<b>胃腸系障害</b>	<b>306 (2.03)</b>	胸内苦悶感	1 (0.01)
口渇	1 (0.01)	頭重感	3 (0.02)
口内炎	10 (0.07)	頭痛	3 (0.02)
口角炎	4 (0.03)	倦怠(感) (全身)	4 (0.03)
口唇炎	1 (0.01)	浮腫	1 (0.01)
舌炎	3 (0.02)	浮腫 (顔面)	4 (0.03)
悪心	53 (0.35)	発熱	5 (0.03)
嘔吐	22 (0.15)	腰痛	2 (0.01)
胸やけ	10 (0.07)	気分不良	1 (0.01)
食欲不振	35 (0.23)	脱力感	1 (0.01)
呑酸	1 (0.01)	ほてり	1 (0.01)
胃重感	2 (0.01)	ショック症状	1 (0.01)

#### ◇臨床検査値異常

白血球の減少, 好酸球の軽度増加が各 1 例 (検査例数 2,570 例), GOT (検査例数 2,160 例), GPT (検査例数 2,136 例) 等の上昇が 7 例, BUN (検査例数 1,857 例) の上昇が 1 例にみられている。

(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

◇使用理由別副作用発現率

	症例数	副作用発現 症例数	副作用発現 件数	副作用発現症 例率 (%)
肺炎，気管支炎，咽喉頭炎	2,354	43	50	1.83
扁桃炎，副鼻腔炎，中耳炎	1,674	36	40	2.15
腎盂腎炎，膀胱炎，尿道炎，淋疾	1,156	41	46	3.55
胆嚢炎，胆管炎	51	1	1	1.96
腹膜炎，リンパ節炎	83	3	3	3.61
猩紅熱	2	0	0	0
乳腺炎，子宮付属器炎，子宮内感染	76	4	5	5.26
麦粒腫，眼瞼膿瘍，角膜潰瘍	86	1	1	1.16
瘡・癰腫症・よう，毛嚢炎，膿痂疹， 膿皮症，蜂窠織炎，癩疽，感染性粉瘤， 皮下膿瘍	302	7	8	2.32
歯槽膿瘍，抜歯後感染，智歯周囲炎	156	1	1	0.64
創傷・熱傷の二次感染	52	0	0	0

◇合併症別副作用発現率

要因		症例数	副作用発現 症例数	副作用発現 症例率 (%)
合併症	有無	5,865	135	2.30
	無	2,617	73	2.79
	有			
	新生物	200	6	3.00
	内分泌，栄養，代謝，免疫	276	8	2.90
	血液及び造血器	76	3	3.94
	精神障害	89	2	2.24
	呼吸系	506	13	2.57
	循環系	697	27	3.87
	消化器系	267	14	5.24
	神経系及び感覚器	103	6	5.82
	泌尿器生殖系	316	7	2.21
	その他	1,138	54	4.74
	(肝疾患)	142	7	4.93
(腎疾患)	161	10	6.21	

## (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

- 1) **禁忌**：本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) **原則禁忌**：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。
- 3) **慎重投与**：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には慎重に投与すること。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反応を起こしやすい体質を有する患者には慎重に投与すること。
- 4) **重要な基本的注意**：**ショック**があらわれるおそれがあるので，十分な問診を行うこと。
- 5) **重大な副作用**：①ショック，アナフィラキシーがあらわれることがあるので，観察を十分に行い，不快感，口内異常感，喘鳴，呼吸困難，眩暈，全身潮紅，全身そう痒感，血管浮腫，血圧低下等の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。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），急性汎発性発疹性膿疱症があらわれることがあるので，観察を十分に行い，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。
- 6) **その他の副作用**：過敏症（発疹，そう痒感，発熱，蕁麻疹）の症状があらわれた場合には投与を中止すること。

## 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。〕
- (2) 動物実験（ラット）において大量（3,000mg/kg/day）投与による催奇形作用が報告されている。
- (3) 授乳中の婦人には投与しないことが望ましいが，やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。〔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

該当記載事項なし

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤の投与により，ベネディクト試薬，あるいはフェーリング試薬による尿糖検査では偽陽性を呈することがあるので，注意すること。

## 13. 過量投与

該当記載事項なし

#### 14. 適用上の注意

- (1) **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。)
- (2) **服用時**：食道に停留し崩壊すると、まれに食道潰瘍を起こすことがあるので、多めの水で服用させ、特に就寝直前の服用等には注意すること。

#### 15. その他の注意

アンピシリンとアロプリノールとの併用により、発疹の発現が増加するとの報告がある。

#### 16. その他

該当記載事項なし

## 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<sup>31) ~33)</sup>

中枢神経系，体性神経系，自律神経系，呼吸循環器系等に及ぼす作用を検討した。

バカンピシリン塩酸塩の一般薬理作用としては麻酔ネコ，イヌに静注した場合に一過性でかつ軽微な血圧下降，心拍数変動がみられたが，経口投与では 1,000mg/kg を無麻酔動物（ラット）に与えても影響はみられなかった。

また，食塩水負荷ラットに 1,000mg/kg の大量を投与したとき 4 時間尿量及び電解質の排泄抑制がみられたが，ラットの 5 週間経口投与の毒性試験においては，本剤 1,000mg/kg 投与でも尿量及び電解質排泄には影響がみられないことから食塩水負荷のラットの成績は，特殊条件下動物による非特異的变化と考えられる。その他中枢神経，体性及び自律神経系に対しほとんど影響を及ぼさなかった。

以上から，バカンピシリン塩酸塩は経口投与された場合抗菌作用の他には，特異的な一般薬理作用を示さないと考えられる。

#### (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<sup>34)</sup>

LD<sub>50</sub> (mg/kg)

		経口	皮下	静脈内
マウス	♂	10,571	10,345	184
	♀	8,529	9,475	209
ラット	♂	>10,000	>10,000	176
	♀	>10,000	>10,000	176

中毒症状として自発運動低下，歩行失調などの運動抑制があらわれ，瀕死期には間代性痙攣を示し，呼吸停止によって死亡した。

#### (2) 反復投与毒性試験<sup>34), 35)</sup>

ラット，イヌを用いた経口投与の実験では，最大無影響量は，ラットの亜急性毒性試験（1 ヶ月投与）で 1,000mg/kg/day，慢性毒性試験（6 ヶ月投与）で 500mg/kg/day，イヌの慢性毒性試験（3 ヶ月投与）で 250mg/kg/day である。

本剤の腎，肝に対する毒性所見は認められていない。



### (3) 生殖発生毒性試験<sup>36)</sup>

1) 妊娠前及び妊娠初期投与試験 (ラット：50, 250, 1,000, 3,000mg/kg 経口)

母体重増加は 1,000mg/kg 以上で抑制されたが、親動物の生殖機能に影響は認められず、胎児の発生・発育にも異常はみられていない。

2) 胎児の器官形成期投与試験 (ラット：50, 250, 1,000, 3,000mg/kg 経口, ウサギ：50, 100, 250mg/kg 経口)

ラットの 3,000mg/kg で母体重の増加が抑制され、胎児の体重も小さかったが、催奇形性は認められず、出産児の発育及び生殖機能にも影響は認められていない。また、ウサギの 250mg/kg で母体の死亡及び流産が観察されたが、催奇形性は認められていない。

3) 周産期及び授乳期投与試験 (ラット：50, 250, 1,000, 3,000mg/kg 経口)

母体重の増加が抑制される 3,000mg/kg で出産直後の哺育児の死亡率が増加したが、1,000mg/kg 以下では母獣、出産児の発育及び生殖機能に影響はみられていない。

### (4) その他の特殊毒性

1) 抗原性<sup>37)</sup>

赤血球凝集反応でアンピシリンに比し弱い感作原性を示す。なお、ハプテン阻止反応により検討した結果、アンピシリンと比較的強い交叉性を示し、ペニシリン G との交叉性は弱い。

2) 変異原性試験<sup>38)</sup>

微生物を用いた DNA 損傷試験、及び復帰変異試験において変異原性を示さない。

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤	ペングッド錠 250mg	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	バカンピシリン塩酸塩	なし

### 2. 有効期間又は使用期限

外箱等に表示の使用期限内に使用すること。(2年：安定性試験結果に基づく)

### 3. 貯法・保存条件

室温保存, 防湿保存

### 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

(「規制区分」, 「貯法・保存条件」の項参照)

#### (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

(「VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目」を参照)

#### (3) 調剤時の留意点について

該当記載事項なし

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

100錠(10錠×10; PTP), 500錠(10錠×50; PTP)

### 7. 容器の材質

PTP：ポリプロピレンフィルム, アルミニウム箔

### 8. 同一成分・同効薬

同効薬：アンピシリン, アモキシシリン

### 9. 国際誕生年月日

1975年

### 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	承認年月日	承認番号
ペングッド錠 250mg	2001年9月12日	21300AMY00425000

### 11. 薬価基準収載年月日

2001年9月21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

該当しない

### 13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容

◇再審査結果通知日：1988年9月6日（既終了）

内容：薬事法第14条第2項各号（承認拒否事由）のいずれにも該当しない

◇再評価結果：2002年7月10日

内容：品質再評価

◇再評価結果：2004年9月30日

販売名：ペングッド錠 250mg

内容：薬効再評価

	承認内容	再評価結果
効能・効果	黄色ブドウ球菌, 表皮ブドウ球菌, 化膿レンサ球菌, 腸球菌, 肺炎球菌, 淋菌, 大腸菌, プロテウス・ミラビリス, インフルエンザ菌のうちアンピシリン感性菌による下記感染症 肺炎, 気管支炎, 咽喉頭炎, 扁桃炎, 副鼻腔炎, 中耳炎, 腎盂腎炎, 膀胱炎, 尿道炎, 淋疾, 胆嚢炎, 胆管炎, 腹膜炎, リンパ節炎, 猩紅熱, 乳腺炎, 子宮付属器炎, 子宮内感染, 麦粒腫, 眼瞼膿瘍, 角膜潰瘍, 癬・癬腫瘍・よう, 毛嚢炎, 膿痂疹, 膿皮症, 蜂窠織炎, 感染性粉瘤, 瘰癧, 皮下腫瘍, 歯槽膿瘍, 抜歯後感染, 智歯周囲炎, 創傷・熱傷の二次感染	<適応菌種> アンピシリン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 <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, 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, 淋菌感染症, 腹膜炎, 子宮内感染, 子宮付属器炎, 眼瞼膿瘍, 麦粒腫, 角膜炎(角膜潰瘍を含む), 中耳炎, 副鼻腔炎, 歯周組織炎, 歯冠周囲炎, 抜歯創・口腔手術創の二次感染, 猩紅熱
用法・用量	通常, 成人の場合, 1日量500~1,000mg(力価)とし, これを3~4回に分割して経口投与する。 小児の場合は, 1日量を15~40mg(力価)/kgとし, これを3~4回に分割して経口投与する。 なお, 年齢, 症状により適宜増減する。	承認内容に同じ

### 14. 再審査期間

6年：1981年5月1日~1987年4月30日

### 15. 投与期間制限医薬品に関する情報

本剤は, 投薬期間制限の対象となる医薬品ではない。

(「V-2. 用法及び用量」の項参照)

### 16. 各種コード

販売名	薬価基準収載 医薬品コード	レセプト 電算コード	HOT(9桁) コード
ペングッド錠 250mg	6131004F2054	610451023	114397301

### 17. 保険給付上の注意

特になし

## X I. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 日医工株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 2) 日医工株式会社 社内資料 (溶出試験)
- 3) 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
- 4) 三木文雄, 他：Chemotherapy, 27 (5), 725, 1979
- 5) 三辺武右衛門, 他：耳鼻と臨床, 25 (5), 1398, 1979
- 6) 河田幸道, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 318, 1979
- 7) 中溝保三, 他：感染症学雑誌, 53 (3), 121, 1979
- 8) 荒田次郎, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 416, 1979
- 9) 西田直己, 他：診療と新薬, 19, 1551, 1982
- 10) 藤村宣夫, 他：Prog.Med.2, 1313, 1982
- 11) 前川暢夫, 他：日本胸部臨床, 42, 616, 1983
- 12) 杉田麟也, 他：新薬と臨床, 31, 767, 1982
- 13) 三木文雄, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 132, 1979
- 14) 加藤安之, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 59, 1979
- 15) 川崎賢二, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 1, 1979
- 16) 大槻雅子, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 7, 1979
- 17) 平野 尚, 他：Chemotherapy, 32 (3), 156, 1984
- 18) 杉田守正, 他：小児科診療, 49 (2), 321, 1986
- 19) Bergan,T. : Antimicrob.Agents Chemother., 13 (6), 971, 1978
- 20) Mats E., 他：J.Pharmacokinet.Biopharm., 7, 429, 1979
- 21) 田中悌二, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 52, 1979
- 22) Swahn,A. : Europ.J.Clin.Pharmacol., 9, 299, 1976
- 23) 張 南薫, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 342, 1979
- 24) 松田静治, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 336, 1979
- 25) 高瀬善次郎, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 368, 1979
- 26) 青河寛次, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 362, 1979
- 27) 中沢 進, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 184, 1979
- 28) Simon,C., 他：Scand.J.Infect.Dis., Suppl.14, 228, 1978
- 29) Maesen,Fr,P.V., 他：未発表
- 30) 榎垣一憲, 他：未発表
- 31) 丸山 裕, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 42, 1979
- 32) Hans.E : 未発表
- 33) Hans.E : 未発表
- 34) 枝長正修, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 17, 1979
- 35) 枝長正修, 他：未発表
- 36) 野口曇弘, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 30, 1979
- 37) 寺沢道夫, 他：Chemotherapy, 27 (Suppl.4), 36, 1979
- 38) 加藤安之, 他：未発表

### 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**

該当資料なし

### **2. 海外における臨床支援情報**

なし

### XIII. 備考

#### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

##### 本項の情報に関する注意

本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。

試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。

医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

#### (1) 粉砕

##### 粉砕物の安定性試験

##### ペングッド錠 250mg

粉砕物の安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は開始時白色の粉末であり、2週で黄色みを帯びた。含量は4週で規格外が認められた。

検体作成：試験製剤を乳鉢で粉砕した。

試験実施期間：2013/1/11～2013/3/18

#### ● 粉砕物 25℃・75%RH [遮光, 開放]

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2週	4週	6週	8週
性状 n=10	FI22B1	白色の粉末	黄色みを帯びる	黄色みを帯びる	黄色みを帯びる	黄色みを帯びる
含量 (%) ※ n=3 <90.0～120.0%>	FI22B1	95.4～98.5	93.3～95.9	<b>81.7～82.7</b>	<b>69.5～70.2</b>	<b>51.4～53.1</b>
(参考値) 重量変化 (%)	FI22B1	—	+1.8	+2.0	+2.1	+2.0

※：表示量に対する含有率 (%)      規格外：太字

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

### ペンゲッド錠 250mg

#### 1) 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

本剤 1 錠を分包し（セロポリ製分包紙使用）、分包シートの上から錠剤を乳棒で数回（10～15 回程度）叩いて錠剤を砕き、コーティングを破壊し、ディスペンサー内に注意して投入し、水 20mL を注意して加え、激しく振り混ぜ、経管チューブに装着し、懸濁液を注入した。

##### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2～3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

#### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
ペンゲッド錠 250mg	破壊した検体を用いて試験したとき 5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

備考：55℃の温湯を用いると、容器へこびりつき容易に除去できなかったため、懸濁には水を用いた。  
本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック（(株) じほう）」を一部改変して実施しました。

## 2. その他の関連資料

なし