

貯法	室温保存
使用期限	外装に記載

合成抗菌製剤

\* 処方せん医薬品

	錠250	錠500
承認番号	21400AMZ00147000	(39A)4593
薬価収載	2002年7月	1974年3月
販売開始	2002年9月	1972年11月
再評価結果	2004年9月	

WINTOMYLON®

# ウイントマイロン錠250

# ウイントマイロン錠500

ナリジクス酸錠

注意 - 医師等の処方せんにより使用すること

【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. 生後3か月未満の乳児  
〔代謝・排泄能が不完全なため、本剤の血中濃度が上昇するおそれがある。〕

【組成・性状】

販売名	1錠中日本薬局方ナリジクス酸含量	添加物	剤形	色	外形				識別コード
					長径(mm)	短径(mm)	厚さ(mm)	重量(mg)	
ウイントマイロン錠250	250mg	注)	素錠 キャブレット型 割線入	灰かっ色	○w	○703	—		703
					13.3	5.3	4.0	約285	
ウイントマイロン錠500	500mg	注)	素錠 キャブレット型 割線入	灰かっ色	○w500	○704	—		704
					17.2	6.7	4.7	約570	

注) トウモロコシデンプン, カルメロースカルシウム, ポリビニルアルコール(部分けん化物), 三二酸化鉄, ステアリン酸マグネシウム

【効能・効果】

適応菌種

本剤に感性の淋菌, 大腸菌, 赤痢菌, サルモネラ属(チフス菌, パラチフス菌を除く), 肺炎桿菌, プロテウス属, 腸炎ビブリオ

適応症

膀胱炎, 腎盂腎炎, 前立腺炎(急性症, 慢性症), 淋菌感染症, 感染性腸炎

【用法・用量】

ナリジクス酸として, 通常成人1日1~4g(錠250: 4~16錠, 錠500: 2~8錠)を2~4回に分割経口投与する。

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)
  - 1) てんかん等の痙攣性疾患のある患者またはこれらの既往歴のある患者  
〔痙攣を起こすことがある。〕

- 2) 高度の脳動脈硬化症のある患者  
〔痙攣を起こすことがある。〕
- 3) 肝障害のある患者  
〔肝障害が悪化することがある。〕
- 4) 高度の腎障害のある患者  
〔高い血中濃度が持続することがある。〕

2. 相互作用

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
クマリン系抗凝固薬(ワルファリン)	ワルファリンの作用を増強することがある。	蛋白結合部位でワルファリンと置換し, 遊離のワルファリンが増加するとの報告がある。

3. 副作用

副作用発生状況の概要

総症例8,388例中報告された主な副作用は悪心・嘔吐2.0%(171件), 発疹1.0%(87件), 食欲不振0.4%(33件), 視覚異常0.3%(29件), めまい0.3%(22件)であった。〔文献集計による(再審査対象外)〕

1) 重大な副作用(頻度不明<sup>注)</sup>)

下記の重大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投与を中止し, 適切な処置を行うこと。

(1) ショック

(症状: 血圧低下, 心悸亢進, 呼吸困難等)

(2) 痙攣

(3) 溶血性貧血

特にG-6PD欠乏症患者にあらわれやすいとの報告がある。

2) その他の副作用

下記の副作用があらわれることがあるので, 異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

種類	副作用発現頻度		
	0.1~5%未満	0.1%未満	不明 <sup>注)</sup>
精神神経系	めまい, 頭痛, 眠気	抑うつ	興奮, 幻覚, 錯乱等
過敏症	発疹, じん麻疹, 光線過敏症等	痒痒感等	発熱
消化器	悪心, 嘔吐, 食欲不振, 下痢	便秘, 口渴	
眼	視覚異常		
肝臓			AST(GOT)上昇, ALT(GPT)上昇, ALP上昇, アレルギー性肝障害等
血液		血液障害(白血球減少, 好酸球増多, 血小板減少等)	

注) 自発報告または海外において認められている副作用のため頻度不明。

#### 4. 高齢者への投与

本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、用量に留意すること。

#### 5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

1) 妊婦また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まわ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) 授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。

〔ヒト母乳中へ移行することが報告されている。〕

#### 6. 小児等への投与

頭蓋内圧の上昇(頭痛、嘔吐、うっ血乳頭等)があらわれることがある。特に、生後3か月未満の乳児には投与しないこと(「禁忌」の項参照)。

#### 7. 臨床検査結果に及ぼす影響

1) テステープ反応を除くベネディクト試薬、フェーリング試薬、クリニテスト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。

2) チモール混濁反応および*m*-dinitrobenzeneを用いる検査値(尿中17-KS等)に影響を及ぼすことがある。

#### 8. 過量投与

代謝性アシドーシスがあらわれることがある。

#### 9. 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)。

#### 10. その他の注意

動物実験(幼若犬、幼若ラット)で関節異常が認められている。

### 〔薬物動態〕

#### 1. 血中濃度

##### 1) 血中および尿中濃度

健康成人にナリジクス酸500mgを単回経口投与した場合、血中濃度は投与後2時間で最高濃度(13.0μg/mL)に達し、尿中濃度は4時間後に最高濃度(450μg/mL)に達した<sup>1)</sup>。

参考(海外データ)

抗菌活性体(ナリジクス酸および7-ヒドロキシナリジクス酸)の血漿中半減期は、6~7時間であった<sup>2)</sup>。

##### 2) 胆汁中濃度<sup>3)</sup>

胆道感染患者に2g経口投与した場合、十二指腸液中濃度を測定すると投与後2時間で90μg/mL、3時間で87μg/mLであった。

#### 2. 分布<sup>3)</sup>

参考(動物実験)

ウサギに100mg/kg筋注した場合、肝、筋肉、肺、脾における濃度は血中濃度とほぼ同等であるが、腎では血中濃度の4~5倍の濃度が認められている。

#### 3. 代謝

参考(動物実験)

ナリジクス酸投与により、未変化体、7-ヒドロキシナリジクス酸、それらのグルクロン酸抱合体および7-カルボキシナリジクス酸が尿中に検出される。これらの代謝物への転換率は、ラット、マウス、ウサギ、サル等各種動物およびヒトで差が認められている<sup>2)</sup>。また妊娠動物にナリジクス酸を高用量で投与した場合、ラットで胎児異常を生じたが、マウス、ウサギ、サルには生じなかった。

#### 4. 排泄<sup>4)</sup>

参考(海外データ)

健康成人にナリジクス酸500mgを単回経口投与した場合、24時間までに投与量の約81%が尿中に排泄され、その内訳は未変化体および7-ヒドロキシナリジクス酸(20%)、それらのグルクロン酸抱合体(60%)、7-カルボキシナリジクス酸(少量)であった。

### 〔臨床成績〕

尿路感染症、腸管感染症を対象とした一般臨床試験成績は次のとおりである。

#### 1. 尿路感染症<sup>5)6)</sup>

疾患名	1日投与量	投与期間	有効率(%)(有効症例/総症例)
膀胱炎			85.0 [ 374/440 ]
急性単純性膀胱炎	2g	3日間	85.6 [ 368/430 ]
慢性膀胱炎	3g	7日間	60.0 [ 6/10 ]
腎盂腎炎 (上部尿路感染を合併する尿路感染症)	3g	7日間	80.0 [ 4/5 ]

#### 2. 腸管感染症<sup>7)</sup>

疾患名	1日投与量	投与期間	有効率(%)(有効症例/総症例)
感染性腸炎	1.5~2g	-	82.3 [ 93/113 ]

検出菌型別有効率は、病原大腸菌性大腸炎83.3%(5/6例)、細菌性赤痢85.7%(12/14例)、サルモネラ腸炎50.0%(4/8例)、腸炎ピブリオ食中毒100.0%(16/16例)であった。

### 〔薬効薬理〕

ウイントマイロン錠は、キノロン系合成抗菌剤である。

#### 1. 抗菌力<sup>8)</sup>

グラム陰性桿菌である大腸菌(MIC; 3.12~6.25μg/mL)、赤痢菌(MIC; 6.25μg/mL)、肺炎桿菌(MIC; 3.12~6.25μg/mL)、プロテウス・ブルガリス(MIC; 12.5μg/mL)、腸炎ピブリオ(MIC; 1.56~3.12μg/mL)に対し、抗菌活性を示す。

#### 2. 作用機序<sup>9)</sup>

細菌のDNA合成を特異的に阻害する。

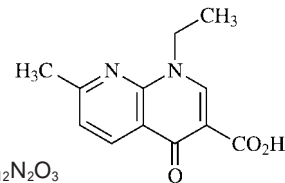
### 〔有効成分に関する理化学的知見〕\*

一般名: nalidixic acid(ナリジクス酸)

略名: NA

化学名: 1-Ethyl-7-methyl-4-oxo-1,4-dihydro-1,8-naphthyridine-3-carboxylic acid

構造式:



分子式: C<sub>12</sub>H<sub>12</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>

分子量: 232.24

融点: 225~231

性状: 白色~淡黄色の結晶または結晶性の粉末である。N,N-ジメチルホルムアミドにやや溶けにくく、エタノール(99.5)にきわめて溶けにくく、水にほとんど溶けない。水酸化ナトリウム試液に溶ける。

### 〔包装〕

ウイントマイロン錠250(1錠中250mg含有)

(PTP)100錠 300錠

ウイントマイロン錠500(1錠中500mg含有)


(PTP)100錠

## 【 主 要 文 献 】

- 1) 金沢ら : Chemotherapy 12 ( 3 ) 176 ( 1964 )
- 2) Ferry, N. et al. : Clin. Pharmacol. Ther. 29 695 ( 1981 )
- 3) 清水ら : Chemotherapy 12 ( 5 ) 384 ( 1964 )
- 4) Mc Chesney, E. W. et al. : Toxicol. Appl. Pharmacol.  
6 292 ( 1964 )
- 5) 大越ら : 日泌尿会誌 73 ( 4 ) 488 ( 1982 )
- 6) 今林ら : 新薬と臨床 26 ( 1 ) 86 ( 1977 )
- 7) 高橋 : 薬物療法 9 ( 9 ) 1269 ( 1976 )
- 8) 中沢ら : Chemotherapy 13 ( 3 ) 139 ( 1965 )
- 9) Sugino, A. et al. : Proc. Natl. Acad. Sci. USA 74( 11 ) 4767  
( 1977 )



〔文献請求先・製品情報お問い合わせ先〕\*\*  
第一三共株式会社 製品情報部  
〒103-8426 東京都中央区日本橋本町3-5-1  
TEL : 0120-189-132

製造販売元  
 **第一三共株式会社**  
東京都中央区日本橋本町3-5-1

®登録商標

504164-01

