



※2014年7月改訂（第10版）
 ※2013年7月改訂

ストレプトグラミン系抗生物質製剤

劇薬、処方箋医薬品^注

日本標準商品分類番号

876119

03712

D0189712

注射用シナシッド[®]

Synercid[®] for Injection

注射用キヌプリスチン・ダルホプリスチン

承認番号	21400AMY00007
薬価収載	2002年4月
販売開始	2003年5月
再審査結果	2014年3月
国際誕生	1999年7月

貯法：2～8℃で保存
 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

【警告】

本剤の耐性菌の発現を防ぐため、「用法・用量に関連する使用上の注意」の項を熟読の上、適正使用に努めること。

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 本剤の成分又は他のストレプトグラミン系抗生物質（ミカマイシン等）に対し過敏症の既往歴のある患者
2. スパルフロキサシン、ピモジド、キニジン又はシサプリドを投与中の患者〔相互作用〕の項参照

【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）】

重篤な肝障害のある患者〔血漿中濃度が上昇し、肝障害が悪化するおそれがある。ただし、やむを得ず投与する場合は、頻回に肝機能検査を行うこと。必要に応じ投与回数を1日3回から2回に減ずる等適宜減量して投与すること。〔薬物動態〕の項参照〕

【組成・性状】

1. 組成

1 バイアル中：

成分	販売名	注射用シナシッド
有効成分	キヌプリスチン	150mg
	ダルホプリスチン	350mg
		(キヌプリスチン・ダルホプリスチンとして500mg)
添加物	メタンスルホン酸	67.2mg
		pH調節剤

2. 性状

本剤は微黄色～黄色の塊で、注射用水、5%ブドウ糖液に溶解したときのpH及び浸透圧比は下表のとおりである。

濃度	溶解液	pH	浸透圧比*
50mg/mL	注射用水	4.5～5.0	－
2.4mg/mL	5%ブドウ糖液	約4.8	約1

※生理食塩液に対する比

【効能・効果】

〈適応菌種〉

キヌプリスチン・ダルホプリスチンに感性的バンコマイシン耐性エンテロコッカス・フェシウム

〈適応症〉

各種感染症

【用法・用量】

通常、成人にはキヌプリスチン・ダルホプリスチンとして、1回7.5mg/kg、1日3回、60分かけて点滴静注する。本剤の溶解には5%ブドウ糖液又は注射用水を用い、希釈には5%ブドウ糖液を用いること。糖尿病患者に対しては10%マルトース液を用いてもよい。なお、生理食塩液やヘパリン含有液は用いないこと。

【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、耐性菌の発現を防ぐため、次のことに注意すること。
 - (1) 感染症の治療に十分な知識と経験を持つ医師又はその指導のもとで行うこと。
 - (2) 原則として他の抗菌薬及び本剤に対する感受性（耐性）を確認すること。
 - (3) 投与期間は、感染部位、重症度、患者の症状等を考慮し、適切な時期に、本剤の継続投与が必要か判定し、疾病の治療上必要な最低限の期間の投与にとどめること。
2. 末梢静脈投与による注射部位の炎症、疼痛、浮腫等を軽減するため、本剤投与直後に5%ブドウ糖液で静脈をフラッシュし、血管刺激を最小限に抑えること。なお、糖尿病患者に対しては10%マルトース液を使用してもよい。〔適用上の注意〕の項参照
3. 本剤は生理食塩液やヘパリンと混和すると沈殿を生ずるので、投与直後に生理食塩液あるいはヘパリンによるフラッシュは行わないこと。
4. 末梢静脈からの投与により注射部位に局所性の静脈性副作用を生じた場合は、中心静脈カテーテルによる投与を考慮する。

【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) 肝障害のある患者〔高ビリルビン血症やトランスアミナーゼ値の上昇等の肝機能の悪化を認めることがある。また、代謝能の低下により、血漿中濃度が持続するおそれがある。〔薬物動態〕の項参照〕
- (2) 腎障害のある患者〔海外の慢性腎不全患者を対象とした臨床薬理試験でAUCが高くなったとの報告がある。〕

2. 重要な基本的注意

- (1) 本剤はバンコマイシン耐性エンテロコッカス・フェシウム(VREF)感染症に対してのみ有用性が認められているためVREF感染症のみに使用すること。
- (2) 本剤の使用にあたっては、副作用発現等を防ぐため、必ず60分かけて点滴静注し、急速なワンショット静注では使用しないこと。また、短時間の点滴静注は行わないこと。
- (3) 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。
- (4) 本剤投与中に、関節痛及び筋痛があらわれることがあるので、重度の疼痛を認めた場合には、投与中止等の適切な処置を行うこと。



3. 相互作用

本剤は肝チトクロームP450 3A4 (CYP3A4) を阻害するため、主にCYP3A4で代謝される薬剤の代謝を阻害し、血中濃度を上昇させる可能性がある。他の薬剤との相互作用はすべての薬剤との組み合わせについて検討されているわけではないので、他剤による治療中に新たに本剤を併用したり、本剤による治療中に新たに他の薬剤を併用する場合には、患者の状態を十分観察し、慎重に投与すること。

(1) 併用禁忌 (併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ビモジド (オーラップ) キニジン (硫酸キニジン) シサブリド (国内承認整理済)	これらの薬剤の血中濃度を上昇させ、QT延長、心室性不整脈、血液障害、痙攣等の副作用を起こすことがある。	本剤はこれらの薬剤の主たる代謝酵素 (CYP3A4) を阻害する。
スバルフロキサシン (スバラ)	QT延長、心室性不整脈を起こすことがある。	併用によりQT延長作用が相加的に増強する。

(2) 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
シクロスボリン タクロリムス	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがあるので、併用する場合には血中濃度モニタリング (TDM) を行い、必要に応じてこれらの薬剤の投与量を減量するなど用量に注意すること。	本剤のCYP3A4に対する阻害作用により、これらの薬剤の代謝が阻害される。
ジヒドロピリジン系Ca拮抗剤 ニフェジピン ニルバジピン ニソルジピン等 ネビラピン インジナビル サキナビル リトナビル ピンカアルカロイド系抗悪性腫瘍剤 ビンブラスチン等 プロチゾラム アルプラゾラム ドセタキセル バクリタキセル 麦角アルカロイド ベラパミル ジルチアゼム ベンゾジアゼピン系薬剤 ジアゼパム ミダゾラム トリアゾラム等 クラリスロマイシン カルバマゼピン リドカイン ジソピラミド シルデナフィル シンバスタチン セレギリン メチルプレドニゾロン ジゴキシン	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがあるので、併用する場合には必要に応じてこれらの薬剤の投与量を減量するなど用量に注意すること。	腸内細菌叢への影響により、ジゴキシンの代謝が抑制されると考えられている。

※※4. 副作用

外国で実施された第Ⅲ相臨床試験において、比較試験の1,099例を含む総症例2,298例中、1,062例 (46.2%) に副作用 (臨床検査値異常を含む) が認められた。静脈投与による注射部位反応 (炎症426件、疼痛421件、浮腫174件、腫脹24件等) は768例 (33.4%) に認められ、その他の副作用として主なものは関節痛101件 (4.4%)、悪心96件 (4.2%)、筋痛75件 (3.3%)、嘔吐50件 (2.2%)、発疹46件 (2.0%)、下痢37件 (1.6%)、疼痛30件 (1.3%)、そう痒23件 (1.0%)、頭痛20件 (0.9%) 等であった。

国内においては、第Ⅱ相臨床試験6例、治験外提供2例 (いずれも最終的にはVREF感染症ではなかった) に対して本剤が投与されている。本剤を1回7.5mg/kg、1日2回^(注)又は3回点滴静注した7例に副作用32件が認められた。その内訳は、AST (GOT) 上昇、倦怠感、背痛、γ-GTP上昇が各2件認められ、また、その他に急性膀胱炎・肺炎による麻痺性イレウス、黄疸、BUN上昇、紅斑、

心房細動、潮紅等が各1件認められた。(承認時:2002年1月) 使用成績調査において、安全性評価対象症例10例中、1例 (10.0%) に副作用2件が認められた。その内訳は、肝障害、血中クレアチンホスホキナーゼ増加が各1件であった。(再審査終了時)

注:本剤の承認された用量は1回7.5mg/kg、1日3回である。

(1) 重大な副作用

- 1) ショック (頻度不明)、アナフィラキシー (0.1%未満): ショック、アナフィラキシーを起こすことがあるので、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。
- 2) 汎血球減少症 (0.1%未満)、貧血 (0.22%)、血小板減少症 (頻度不明): 汎血球減少症、溶血性貧血、低形成性貧血等の貧血、血小板減少症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。
- 3) 肝炎、肝機能障害 (各0.1%未満)、黄疸 (頻度不明): 肝炎、AST (GOT)・ALT (GPT) 上昇等の肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、このような場合は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 4) 心室細動 (頻度不明)、心室性期外収縮、心停止 (各0.1%未満): 心室細動、心室性期外収縮等の重篤な不整脈、心停止があらわれることがあるので、このような場合は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 5) 偽膜性大腸炎 (0.1%未満): 偽膜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。
- 6) 肺炎 (0.26%)、尿路感染症 (頻度不明)、敗血症 (0.1%未満): 肺炎、尿路感染症、敗血症等の感染症があらわれることがあるので、このような場合は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 7) 呼吸不全、無呼吸、低換気、低酸素症 (いずれも頻度不明): 呼吸不全、無呼吸、低換気、低酸素症があらわれることがあるので、このような場合は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 8) 出血傾向 (脳出血、消化管出血 (各0.1%未満))、血尿 (0.1%未満): 脳出血、消化管出血等の出血、血尿があらわれることがあるので、このような場合は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 9) 痙攣 (0.1%未満): 下肢痙攣、痙攣大発作等の痙攣があらわれることがあるので、異常が認められた場合は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 10) 血栓性静脈炎、腸間膜動脈閉塞症 (いずれも頻度不明): 血栓性静脈炎、腸間膜動脈閉塞症があらわれることがあるので、異常が認められた場合は投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(注) 本項に記載した副作用の中には、原疾患又は合併症に関わると考えられる事象であるが、本剤との因果関係が否定できない有害事象を含む。また、頻度不明は、自発報告のため頻度が算出できないことを示す。

(2) その他の副作用

	5%以上	0.1~5%未満	0.1%未満
過敏症 ^(注)		発疹、皮疹、そう痒、蕁麻疹、発熱	
循環器		胸痛、静脈炎、低血圧、頻脈、血管拡張	不整脈、徐脈、心悸亢進、上室性頻拍、心臓滲出液、心膜炎
消化器		腹痛、食欲不振、便秘、下痢、消化不良、悪心、嘔吐	肺炎
肝臓 ^(注)		AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、LDH上昇	AI-P上昇、γ-GTP上昇、BUN上昇、ビリルビン上昇
血液			好酸球増多、凝固障害、血液量減少
筋・骨格系 ^(注)		関節痛、筋痛、疼痛、筋無力症、無力症	背痛、骨痛、頸部痛・硬直

	5%以上	0.1~5%未満	0.1%未満
精神神経系		頭痛、錯乱、めまい、緊張亢進、不眠、感覚異常	倦怠感、不安、ニューロパシー、自律神経異常症、対麻痺、脳症、失神、振戦
菌交代症		カンジダ症、口内炎	
投与部位	注射部疼痛・浮腫・炎症、注射部反応	注射部出血・腫脹	注射部萎縮、蜂巣炎
※※その他		低ナトリウム血症、浮腫、腫炎、発汗	アシドーシス、痛風、高血糖、低血糖、高カリウム血症、低カリウム血症、皮膚潰瘍、咽頭炎、胸水、血中クレアチンホスホキナーゼ増加

注：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。

5. 高齢者への投与

高齢者では一般に生理機能が低下しているので慎重に投与すること。必要に応じ投与回数を1日3回から2回に減らす等適宜減量して投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1)妊婦等：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)授乳婦：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避けさせること。〔動物実験(ラット)で乳汁中に移行することが認められている。〕

7. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。(使用経験が少ない。)

8. 過量投与

本剤は、腹膜透析や血液透析では除去されないため、過量投与した患者に対しては注意深く観察し対症療法を行うこと。

9. 適用上の注意

(1)調製方法

- 1) 本剤1バイアルに、5%ブドウ糖液又は注射用水5mLを徐々に加える。
- 2) 液がなるべく泡立たないように穏やかにバイアルを回転させ、内容物を完全に溶解させる。
- 3) 生じた泡が完全に消え、澄明になるまで数分間放置する。
- 4) 得られた溶解液は、1mLあたり100mgの有効成分を含有するので、患者の体重に応じた量(7.5mg/kg)を30分以内に5%ブドウ糖液200~250mLに加える。なお、5%ブドウ糖液の代わりに10%マルトース液を使用してもよい。

(2)調製時

- 1) 本剤は生理食塩液で希釈しないこと。
- 2) 本剤は5%ブドウ糖液又は10%マルトース液以外の注射液と混注又は希釈して使用しないこと。

(3)調製後

- 1) 調製した注射液は速やかに使用すること(本剤は注射液中で分解しやすいため、25℃で5時間、2~8℃で54時間以上保存しないこと)。
- 2) 本剤のバイアルの残液は廃棄すること。

(4)投与方法

- 1) 注射液は必ず60分かけて点滴静注すること。〔重要な基本的注意〕の項参照
- 2) 中心静脈カテーテルによる投与にあたっては、配合変化を避けるため、高カロリー輸液等の食塩を含む輸液の投与に用いられている主流は一時止め、本剤の溶解に用いた液で輸液チューブをフラッシュした後、側流から本剤を投与すること。また、本剤の投与終了後にも同様にフラッシュしてから、高カロリー輸液等の投与を再開すること。

10. その他の注意

(1)モルモットを用いて能動全身性アナフィラキシー反応及び受け身皮膚アナフィラキシー反応を実施した結果、本剤とアジュバントとの併用感作時においてのみ抗原性陽性反応が認められたが、本剤の単独感作ではいずれも陰性であった。マウスラットを用いた試験においてIgE抗体の産生はみられなかった。

(2)ラット、イス、サルを用いて実施した一般薬理試験において、ヒスタミン遊離によると考えられる血圧低下・徐脈が認められた。

(3)生殖に及ぼす影響の検討において、ラット、マウスでは胎児に異常は認められなかったが、ウサギを用いた胎児器官形成期投与試験において、腸内細菌叢への影響から生じた母動物の摂餌量減少、体重低下等によると推察される、流産、胎児体重の低値、胎児の化骨遅延が認められた。なお、これらの流産及び胎児の異常は、一般に良く知られているウサギを用いた抗生物質の器官形成期投与試験においてみられる、母動物の腸内細菌叢に対する作用によると推察される。

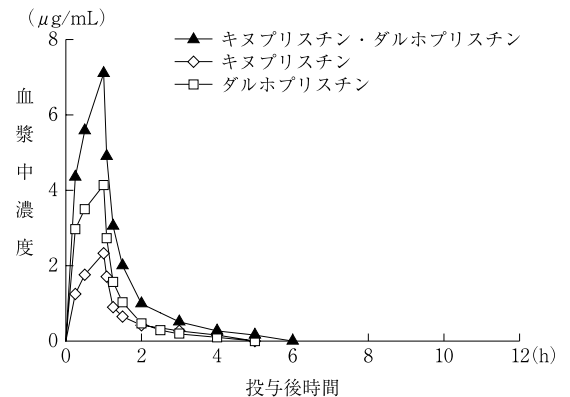
【薬物動態】

1. 血漿中濃度

(1)健康成人

1)単回投与¹⁾

健康成人男子(n=6)に本剤7.5mg/kgを1時間かけて点滴静注したときの最高血漿中濃度は7.10μg/mLを示し、消失相半減期は1.11時間であった。



	C _{max} (μg/mL)	AUC _(0-∞) (μg·h/mL)	t _{1/2β} (h)
キヌプリスチン・ダルホプリスチン	7.10±0.72	9.08±1.39	1.11±0.09
キヌプリスチン	2.33±0.21	3.19±0.31	1.31±0.32
ダルホプリスチン	4.14±0.56	5.02±0.92	0.90±0.13

Mean±S. D. n=6

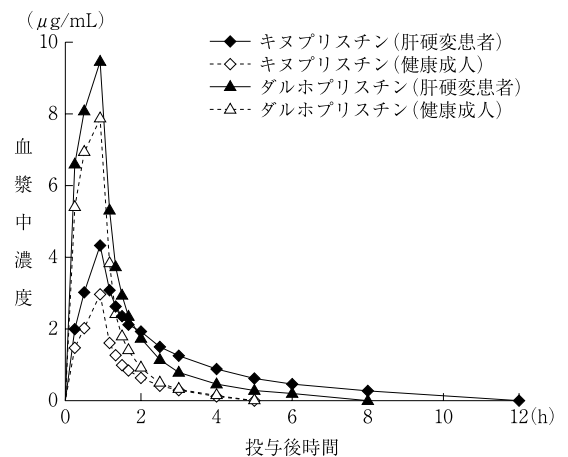
(バイオアッセイ法)

2)反復投与²⁾

健康成人男子(n=6)に本剤7.5mg/kgを8時間間隔で3日間、1時間かけて点滴静注したとき、血漿中濃度は投与2日目にほぼ定常状態に達した。投与3日目におけるC_{max}は10.1μg/mLを示し、消失相半減期は1.70時間であった。

(2)肝硬変患者(外国人データ)³⁾

肝硬変患者に本剤7.5mg/kgを1時間かけて点滴静注したとき、健康成人に比べて血漿中濃度の上昇がみられた。



		C _{max} ($\mu\text{g/mL}$)	AUC _(0-∞) ($\mu\text{g} \cdot \text{h/mL}$)	t _{1/2β} (h)
キヌプリスチン	肝硬変患者	4.33±0.90	11.39±3.53	3.03±1.01
	健康成人	2.97±0.66	4.00±0.96	1.08±0.30
ダルホプリスチン	肝硬変患者	9.46±1.90	13.67±3.47	1.91±0.57
	健康成人	7.86±1.72	9.33±2.05	1.00±0.26

Mean ± S. D. 肝硬変患者: n = 9, 健康成人: n = 14 (バイオアッセイ法)

2. 分布

(1) 組織移行性 (外国人データ)

健康成人男子 (n = 12) に本剤7.5mg/kgを8時間間隔で3回、1時間かけて点滴静注したとき、多形核白血球中AUCは血漿中AUCと比べて約2.5~10倍であり、多形核白血球中への移行は良好であった⁴⁾。また、健康成人男子 (n = 12) に本剤7.5mg/kgを1時間かけて点滴静注したとき、水疱液中への移行が認められた⁵⁾。

(2) 蛋白結合率⁶⁾

キヌプリスチン (1~15 $\mu\text{g/mL}$) 及びダルホプリスチン (0.2~15 $\mu\text{g/mL}$) の*in vitro*でのヒト血清タンパクとの結合率は、それぞれ87.9~93.8%及び11.0~26.0%であった (限外過法)。

3. 代謝

非酵素的に、抗菌活性を有する代謝物に速やかに変換される⁷⁾¹⁵⁾。また、本剤はCYP3A4の基質の代謝を阻害する作用を示した (*in vitro*)⁸⁾。

4. 排泄 (日本人データ及び外国人データ)

健康成人男子 (n = 6) に本剤7.5mg/kgを1時間かけて点滴静注したとき、活性体 (未変化体、活性代謝物) としての0~24時間の尿中排泄率は投与量の19.2%、0~48時間の糞便中排泄率は投与量の1.8%であった (バイオアッセイ法)¹⁾。一方、海外において健康成人男子 (n = 6) に¹⁴C標識した本剤500mgを投与したところ、主に糞便中に排泄され、投与後7日までの排泄率は約75~77%であった⁹⁾。ラットにおいては主として胆汁中に排泄されることが明らかになっており¹⁰⁾、ヒトにおいても胆汁中排泄が主要経路であると推測される。

【臨床成績】

1. VREF感染症での802例を対象に海外で実施された第Ⅲ相試験における有効性評価対象例は358例であり、各疾患における有効率 (治癒+改善/症例数) の合計は74.0% (265/358例) であった¹¹⁾。

疾患名	有効率 (%)
腹腔内感染症	89/124 (71.8)
菌血症	78/106 (73.6)
尿路感染症	35/40 (87.5)
皮膚及び皮膚組織感染症	31/39 (79.5)
骨及び関節感染症	12/15 (80.0)
呼吸器感染症	9/10 (90.0)
心内膜炎	1/6 (16.7)
腹腔以外の深部創傷	5/6 (83.3)
血管内部感染症	1/5 (20.0)
その他	10/16 (62.5)

2. VREFに対する細菌学的効果は69.4% (197/284例) の菌消失率であった¹¹⁾。

【薬効薬理】

1. 抗菌作用¹²⁾

本剤はVanA及びVanBタイプのVREFに対して抗菌力を有する。日本で臨床分離されたVREFに対する本剤のMICは0.5~2 $\mu\text{g/mL}$ であった。また、バンコマイシン感受性エンテロコッカス・フェシウムに対するMICは0.5~8 $\mu\text{g/mL}$ であった。本剤のエンテロコッカス・フェシウムに対する抗菌作用は静菌的であった。なお、本剤のエンテロコッカス・フェカリスに対する効果は弱く、エンテロコッカス・フェカリスは適応外である。

2. 感受性検査法及び判定基準

NCCLS (National Committee for Clinical Laboratory Standards) の標準法に準じたMIC測定法及びディスク拡散法を用い、次表の判定基準に従い本剤に対するVREFの感受性を評価する。

感受性判定基準

病原菌	MIC ($\mu\text{g/mL}$)			ディスク拡散法による阻止円の直径 (mm)		
	S	I	R	S	I	R
VREF	≤ 1	2	≥ 4	≥ 19	16-18	≤ 15

S: 感受性、I: 中等度感受性あるいは中等度耐性、R: 耐性

3. 作用機序

本剤の有効成分であるキヌプリスチン及びダルホプリスチンは、いずれも細菌リボソームに作用し蛋白合成を阻害するが、リボソーム上の作用部位は異なる¹³⁾。ダルホプリスチンはキヌプリスチンの細菌リボソームへの結合親和性を高め、両成分が共存することにより相乗的な*in vitro*抗菌力を示す¹⁴⁾。本剤の作用機序はグリコペプチド系抗生物質とは異なっており、VREFに対して効果を示す。また、キヌプリスチン及びダルホプリスチンの主要代謝物も親化合物と同様の活性を示すことが*in vitro*で証明されている¹⁵⁾。

4. 耐性

- (1) 日本で1997~1998年に臨床分離されたエンテロコッカス・フェシウム (57株) のうち本剤のMICが4又は8 $\mu\text{g/mL}$ である耐性株が10.5又は3.5%認められた。
- (2) 細菌の本剤に対する耐性機序として、キヌプリスチン又はダルホプリスチンの酵素による不活化¹⁶⁾¹⁷⁾、ダルホプリスチンの菌体外への排出機構¹⁸⁾、キヌプリスチンの作用部位の修飾¹⁹⁾が報告されている。

【有効成分に関する理化学的知見】

1. 一般名: キヌプリスチン Quinupristin (JAN)

略号: QPR (WHO recommended INN: Quinupristin)

化学名: RP68888; (キヌプリスチンの主成分)

(-)-N-[(6R,9S,10R,13S,15aS,18R,22S,24aS)-22-(4-Dimethylaminobenzyl)-6-ethyl-docosahydro-10,23-dimethyl-5,8,12,15,17,21,24-heptaaxo-13-phenyl-18-[[(3S)-(3-quinuclidinyl)thio]methyl]-12H-pyrido[2,1-f]pyrrolo[2,1-l][1,4,7,10,13,16]-oxapentaazacyclononadecan-9-yl]-3-hydroxypyridine-2-carboxamide

分子式: C₃₃H₆₇N₉O₁₀S

分子量: 1022.22

化学名: RP60844; (キヌプリスチンの含有成分)

(-)-N-[(6R,9S,10R,13S,15aS,18R,22S,24aS)-22-(4-Methylaminobenzyl)-6-ethyl-docosahydro-10,23-dimethyl-5,8,12,15,17,21,24-heptaaxo-13-phenyl-18-[[(3S)-(3-quinuclidinyl)thio]methyl]-12H-pyrido[2,1-f]pyrrolo[2,1-l][1,4,7,10,13,16]-oxapentaazacyclononadecan-9-yl]-3-hydroxypyridine-2-carboxamide

分子式: C₃₂H₆₅N₉O₁₀S

分子量: 1008.19

化学名: RP67648; (キヌプリスチンの含有成分)

(-)-N-[(6R,9S,10R,13S,15aS,18R,22S,24aS)-22-(4-Dimethylaminobenzyl)-6-methyl-docosahydro-10,23-dimethyl-5,8,12,15,17,21,24-heptaaxo-13-phenyl-18-[[(3S)-(3-quinuclidinyl)thio]methyl]-12H-pyrido[2,1-f]pyrrolo[2,1-l][1,4,7,10,13,16]-oxapentaazacyclononadecan-9-yl]-3-hydroxypyridine-2-carboxamide

分子式: C₃₂H₆₅N₉O₁₀S

分子量: 1008.19

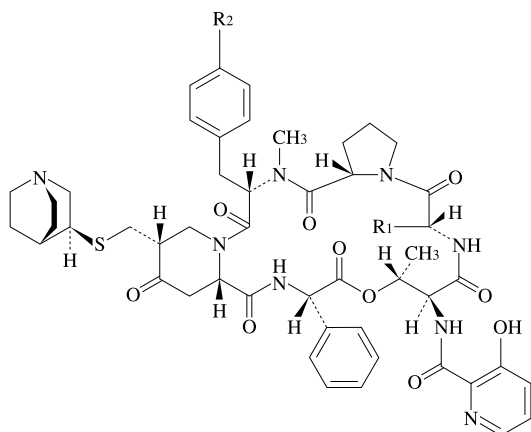
化学名: RP57886; (キヌプリスチンの含有成分)

(-)-N-[(6R,9S,10R,13S,15aS,18R,22S,24aS)-22-(4-Dimethylaminobenzyl)-6-ethyl-docosahydro-10,23-dimethyl-5,8,12,15,17,21,24-heptaaxo-13-phenyl-18-[[(3R)-(3-quinuclidinyl)thio]methyl]-12H-pyrido[2,1-f]pyrrolo[2,1-l][1,4,7,10,13,16]-oxapentaazacyclononadecan-9-yl]-3-hydroxypyridine-2-carboxamide

分子式: C₃₃H₆₇N₉O₁₀S

分子量: 1022.22

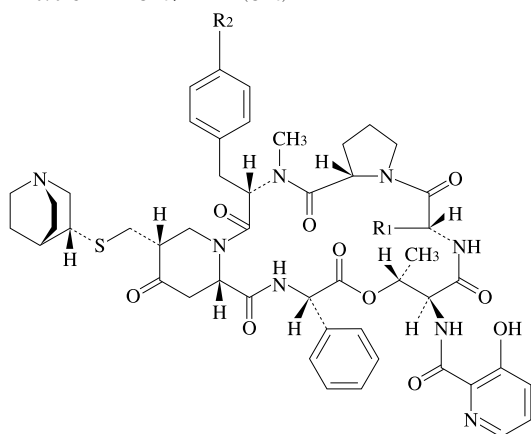
構造式：キヌプリスチン



RP68888 : R₁ = CH₂CH₃, R₂ = N(CH₃)₂

RP60844 : R₁ = CH₂CH₃, R₂ = NHCH₃

RP67648 : R₁ = CH₃, R₂ = N(CH₃)₂



RP57886 : R₁ = CH₂CH₃, R₂ = N(CH₃)₂

性状：キヌプリスチンは白色～微帯黄色の粉末である。メタノール、エタノール（99.5）に溶けやすく、アセトンにやや溶けにくく、水に極めて溶けにくい。

2. 一般名：ダルホプリスチン Dalbapristin (JAN)

略号：DPR (WHO recommended INN : Dalbopristin)

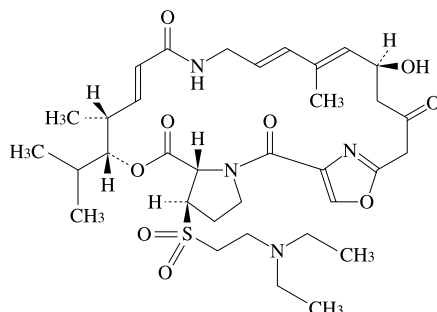
化学名：RP54476 : (ダルホプリスチン)

(-)-(3*R*,4*R*,5*E*,10*E*,12*E*,14*S*,26*R*,26*aS*)-26-[2-(Diethylamino)ethylsulfonyl]-8,9,14,15,24,25,26,26*a*-octahydro-14-hydroxy-3-isopropyl-4,12-dimethyl-3*H*-21,18-nitrilo-1*H*,22*H*-pyrrolo[2,1-*c*][1,8,4,19]dioxadiazacyclotetracosine-1,7,16,22(4*H*,17*H*)-tetrone

分子式：C₃₄H₅₀N₄O₉S

分子量：690.85

構造式：ダルホプリスチン



性状：ダルホプリスチンは微黄色～黄色の粉末である。メタノール、エタノール（99.5）、アセトンに溶けやすく、水に極めて溶けにくい。

※【承認条件】

患者より検出されたバンコマイシン耐性エンテロコッカス・フェシウムのパンコマイシン及び本薬に対する感受性について調査を実施すること。

【包装】

注射用シナシッド500mg：6バイアル

【主要文献】

- 1) 社内資料(健康成人・薬物動態) [L20130321006]
- 2) 社内資料(健康成人・血漿中濃度) [L20130321007]
- 3) 社内資料(海外肝硬変患者・血漿中濃度) [L20130321008]
- 4) 社内資料(海外健康成人・薬物動態) [L20130321009]
- 5) 社内資料(海外健康成人・薬物動態) [L20130321010]
- 6) 社内資料(ヒト血清・蛋白結合) [L20130321011]
- 7) 社内資料(ヒトミクロソーム・代謝) [L20130321012]
- 8) 社内資料(ヒト肝ミクロソーム・代謝) [L20130321013]
- 9) 社内資料(海外健康成人・排泄) [L20130321014]
- 10) 社内資料(ラット・排泄) [L20130321015]
- 11) 社内資料(海外VREF感染症患者・第Ⅲ相試験) [L20130321016]
- 12) 社内資料(*in vitro*・抗菌作用) [L20130321017]
- 13) 社内資料(細菌リボソーム・薬理作用) [L20130321018]
- 14) 社内資料(*in vitro*・抗菌作用) [L20130321019]
- 15) 社内資料(*in vitro*・抗菌作用) [L20130321020]
- 16) Soltani, M. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 44 : 433, 2000 [L20130321021]
- 17) Bozdogan, B. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 43 : 2720, 1999 [L20130321022]
- 18) Haroche, J. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 44 : 2271, 2000 [L20130321023]
- 19) Jensen, L. B. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 44 : 2231, 2000 [L20130321024]

※【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