

\*\* : 2017年4月改訂 (第7版)  
\* : 2008年7月改訂

貯 法	室温保存
使用期限	容器および外装に記載

合成抗菌製剤

処方箋医薬品\*

日本標準商品分類番号  
876241

* 承認番号	22000AMX00189
* 薬価収載	2008年6月
* 販売開始	2008年7月
再評価結果	2004年9月

# ウイントマイロンシロップ<sup>®</sup>5%

WINTOMYLON<sup>®</sup> SYRUP

ナリジクス酸シロップ

※ 注意—医師等の処方箋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〕

1mL中日本薬局方ナリジクス酸含量	色	pH	におい	外観
50mg	うすい黄 だいたい色	4.9～ 5.5	芳香 (オレンジミルク臭)	粘稠な 水性懸濁液

添加物として、カンテン末、カルメロースナトリウム、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル、精製白糖、サッカリンナトリウム水和物、D-ソルビトール液、ステアリン酸ポリオキシシラン40、ジメチルポリシロキサン、二酸化ケイ素、グリセリン脂肪酸エステル、ソルビン酸、pH調節剤、黄色5号、香料、エチルパニリン、バニリンを含有する。

## 〔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(20～80mL)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。

### 参考

(小児の1日投与量例)

1～3歳	4～6歳	7～12歳
10～15mL	15～20mL	20～40mL

(小児用量は体重換算50mg/kgによる)

### 〈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>※</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>※</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)	

※) 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. 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(13.0 $\mu$ g/mL)に達し、尿中濃度は4時間後に最高濃度(450 $\mu$ g/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90 $\mu$ g/mL、3時間で87 $\mu$ g/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)、腸炎ビブリオ食中毒100.0%(16/16例)であった。

### 〔薬効薬理〕

ウイントマイロンシロップ5%は、キノロン系合成抗菌製剤である。

#### 1. 抗菌力<sup>8)</sup>

グラム陰性桿菌である大腸菌(MIC: 3.12~6.25 $\mu$ g/mL)、赤痢菌(MIC: 6.25 $\mu$ g/mL)、肺炎桿菌(MIC: 3.12~6.25 $\mu$ g/mL)、プロテウス・ブルガリス(MIC: 12.5 $\mu$ g/mL)、腸炎ビブリオ(MIC: 1.56~3.12 $\mu$ g/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。

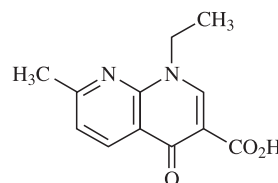
### 〔有効成分に関する理化学的知見〕

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。

### 〔取扱い上の注意〕

瓶をよくふってから使用すること。

〔 包 装 〕

ウイントマイロンシロップ5%(1mL中50mg含有) 500mL


〔 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 製品情報センター  
〒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  
\*\*  **ニプロファーマ株式会社**  
大阪市中央区道修町2丁目2番7号

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

®登録商標

03

