

貯法	室温、遮光保存
使用期限	包装に表示の使用期限内に使用すること。

処方せん医薬品*

日本標準商品分類番号	876213
------------	--------

	静注500mg	静注1000mg
*承認番号	22000AMX01803	22000AMX01900
*薬価収載	2008年12月	2008年12月
*販売開始	2008年12月	2008年12月
再評価結果	2004年9月	2004年9月

アプシード® 静注500mg アプシード® 静注1000mg

ABCID® INTRAVENOUS INJECTION

スルファジメトキシシ注

※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. サルファ剤に対し過敏症の既往歴のある患者
2. 妊娠末期の婦人(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
3. 低出生体重児、新生児(「小児等への投与」の項参照)

【組成・性状】

1. 組成

1 アンブル中にそれぞれ次の成分を含有

販売名	有効成分	添加物
アプシード 静注500mg	スルファジメトキシシ 500mg/5mL(10 ^W /%)	乾燥亜硫酸ナトリウム10mg、 水酸化ナトリウム
アプシード 静注1000mg	スルファジメトキシシ 1000mg/10mL(10 ^W /%)	乾燥亜硫酸ナトリウム20mg、 水酸化ナトリウム

2. 製剤の性状

販売名	pH	浸透圧比 (生理食塩液対比)	外観
アプシード 静注500mg	9.0~10.5	約2	無色澄明の液
アプシード 静注1000mg			

【効能・効果】

〈適応菌種〉

本剤に感性の髄膜炎菌、大腸菌

〈適応症〉

膀胱炎、腎盂腎炎、化膿性髄膜炎

【用法・用量】

通常成人、スルファジメトキシシとして、初日1.0~2.0g(10~20mL)、2日目以降は0.5~1.0g(5~10mL)を1日1回静脈内注射する。

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) 血液障害のある患者[血液障害が悪化することがある。]
- (2) 肝障害のある患者[重篤な肝障害があらわれるおそれがある。]
- (3) 腎障害のある患者[本剤は主として腎臓から排泄されるため、血中濃度が高くなるおそれがある。]
- (4) 気管支喘息、又は他の薬物に対し過敏症の既往歴のある患者
- (5) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)

2. 重要な基本的注意

- (1) 本剤によるショック、アナフィラキシー様症状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。

(2) 本剤は長時間作用型サルファ剤であるので、排泄が遅い点に特に注意すること。

3. 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
経口糖尿病用薬 スルホニルアミド系及びスルホニルウレア系	血糖降下作用を増強し、低血糖症状があらわれることがある。頻回に血糖値を測定し、必要に応じ経口糖尿病用薬を減量する。	これらの薬剤の肝代謝を抑制、又は蛋白結合部位での置換により、遊離したこれらの薬剤が増加すると考えられている。
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し、出血があらわれることがある。	ワルファリンの肝代謝を抑制、又は蛋白結合部位での置換により、遊離ワルファリンが増加すると考えられている。

4. 副作用

総症例703例中報告された副作用は4.3%(30例)で、主な副作用は悪心4.0%(28件)、嘔吐0.1%(1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^{※)})

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(血圧低下、痙攣、チアノーゼ、意識障害等)
- 2) 再生不良性貧血、溶血性貧血
- 3) 皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、中毒性表皮壊死症(Lyell症候群)
- 4) PIE症候群(好酸球増多を伴う肺浸潤：発熱、咳嗽、喀痰を伴うことが多い。)

(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。

	0.1~5%未満	0.1%未満
血液		顆粒球減少、 血小板減少等
腎臓		腎障害
肝臓		肝障害
消化器	食欲不振、 悪心・嘔吐、下痢	
過敏症	発疹等	光線過敏症
精神神経系	発熱、頭痛	末梢神経炎、 うとうと状態、めまい

注) 自発報告において認められている副作用のため頻度不明。

5. 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、用量ならびに投与間隔に留意して慎重に投与すること。

6. 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投与しないことが望ましい。〔動物実験(ラット、マウス)で催奇形作用が報告されている。〕
- (2) 妊娠末期の婦人には投与しないこと。〔薬剤の胎盤通過により、新生児に高ビリルビン血症があらわれることがある。〕
- (3) 授乳婦への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は、低出生体重児、新生児への授乳を避けさせること。〔母乳を通じて薬剤が移行し、高ビリルビン血症があらわれることがある。〕

7. 小児等への投与

高ビリルビン血症があらわれることがあるので、低出生体重児、新生児には投与しないこと。

8. 適用上の注意

- (1) 投与時：静脈内注射により血管痛、血栓、又は静脈炎を起こすことがあるので、注射部位、注射方法等について十分注意し、注射の速度をできるだけ遅くすること。
- (2) 開封時：アンプルカット時の異物混入を避けるため、エタノール消毒綿等で清拭しカットすること。

9. その他の注意

動物実験(ラット)で甲状腺腫及び甲状腺機能異常を起こすことが報告されている。

【薬物動態】

1. 血中濃度

(1) 血中濃度の推移¹⁾

健康成人にスルファジメトキシンを初回1g、翌日より毎日0.6g静脈内注射した場合、血中濃度は初回投与後15分で135 μ g/mL、4時間で115 μ g/mL、8時間で100 μ g/mL、24時間で53 μ g/mLであり、また、96時間(4日後)では88 μ g/mLとほぼ安定した値を示した。血中アセチル化率は低く、静注直後を除いて初回1g維持量0.6g静注では8.1%であった。

(2) 血清蛋白結合率²⁾

セロファンバッグ透析法、限外濾過法、寒天拡散法の3法により測定した血清蛋白結合率は約90%であった。

2. 排泄

健康成人にスルファジメトキシン1gを静脈内注射した場合、投与後24時間までの尿中排泄率は13.1%であった。

【臨床成績】

膀胱炎及び腎盂腎炎患者65例を対象にした一般臨床試験における有効率は75.4%(49例)であった。

【薬効薬理】

作用機序

パラアミノ安息香酸(PABA)と拮抗することにより細菌の増殖を阻止する。

【有効成分に関する理化学的知見】

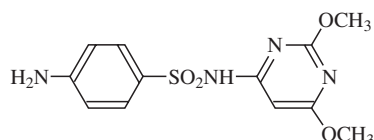
一般名：スルファジメトキシン(Sulfadimethoxine)

化学名：N¹-(2,6-dimethoxy-4-pyrimidinyl)sulfanilamide

分子式：C₁₂H₁₄N₄O₄S

分子量：310.33

構造式：



性状：白色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。ピリジンに溶けやすく、アセトンにやや溶けにくく、メタノール又はエタノールに溶けにくく、クロロホルムに極めて溶けにくく、水又はエーテルにほとんど溶けない。希塩酸又は水酸化ナトリウム試液に溶ける。

融点：198~203℃

【取扱い上の注意】

本品は、「ワンポイントカットアンプル」を使用しているため、アンプル枝部のマークを上にして、反対方向に折りとること。

【包装】

アプシード静注500mg (5 mL) 50アンプル

アプシード静注1000mg (10mL) 50アンプル

【主要文献】

1) 百瀬俊朗：皮膚と泌尿 1960;22(1):78-84

2) 真下啓明ほか：最新医学 1960;15(7):1873-1881

【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

第一三共株式会社
東京都中央区日本橋本町3-5-1

