

貯 法：室温保存  
有効期間：3年

	承認番号	販売開始
25mg	22200AMX01003000	2009年 6月
75mg	22200AMX01007000	2008年11月
100mg	22200AMX01001000	2000年 2月
200mg	22200AMX01002000	2009年11月

## アミノグリコシド系抗生物質製剤

劇薬、処方箋医薬品<sup>注)</sup>

### 日本薬局方 アルベカシン硫酸塩注射液

アルベカシン硫酸塩注射液25mg「ケミファ」

アルベカシン硫酸塩注射液75mg「ケミファ」

アルベカシン硫酸塩注射液100mg「ケミファ」

アルベカシン硫酸塩注射液200mg「ケミファ」

Arbekacin Sulfate Injection 25mg・75mg・100mg・200mg “Chemiphar”

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

#### 2. 禁忌 (次の患者には投与しないこと)

本剤の成分並びにアミノグリコシド系抗生物質又はバシトラシンに対し過敏症の既往歴のある患者

#### 3. 組成・性状

##### 3.1 組成

販売名	アルベカシン硫酸塩注射液 25mg 「ケミファ」	アルベカシン硫酸塩注射液 75mg 「ケミファ」	アルベカシン硫酸塩注射液 100mg 「ケミファ」	アルベカシン硫酸塩注射液 200mg 「ケミファ」
有効成分	1アンプル 0.5mL中 (日局) アルベカシン硫酸塩 25mg (力価)	1アンプル 1.5mL中 (日局) アルベカシン硫酸塩 75mg (力価)	1アンプル 2mL中 (日局) アルベカシン硫酸塩 100mg (力価)	1アンプル 4mL中 (日局) アルベカシン硫酸塩 200mg (力価)
添加剤	亜硫酸水素ナトリウム0.25mg、 pH調節剤、等 張化剤	亜硫酸水素ナトリウム0.75mg、 pH調節剤、等 張化剤	亜硫酸水素ナトリウム1mg、 pH調節剤、等 張化剤	亜硫酸水素ナトリウム2mg、 pH調節剤、等 張化剤

##### 3.2 製剤の性状

販売名	アルベカシン硫酸塩注射液 25mg 「ケミファ」	アルベカシン硫酸塩注射液 75mg 「ケミファ」	アルベカシン硫酸塩注射液 100mg 「ケミファ」	アルベカシン硫酸塩注射液 200mg 「ケミファ」
性状	無色澄明の注射液			
pH	6.0～8.0			
浸透圧比	約1 (生理食塩液に対する比)			

#### 4. 効能・効果

##### (適応菌種)

アルベカシンに感性的メチシリン耐性黄色ブドウ球菌 (MRSA)

##### (適応症)

敗血症、肺炎

#### 5. 効能・効果に関連する注意

本剤はメチシリン耐性黄色ブドウ球菌 (MRSA) 感染症に対してのみ有用性が認められている。なお、MRSAが検出されただけではMRSA感染症とは限らないので、本剤投与にあたっては、次の点に留意すること。

- MRSA感染症の診断が確定した場合にのみ投与することを原則とする。
- 臨床症状及び菌の検出状況からMRSA感染症であることが推定された場合には、個々の患者背景や臨床症状の推移などを考慮のうえ、本剤の投与の可否を判断する。

#### 6. 用法・用量

##### 成人への投与

通常、成人にはアルベカシン硫酸塩として、1日1回150～200mg (力価) を30分～2時間かけて点滴静注する。必要に応じて、1日150～200mg (力価) を2回に分けて点滴静注することもできる。また、静脈内投与が困難な場合、アルベカシン硫酸塩として、1日150～200mg (力価) を1回又は2回に分けて筋肉内注射することもできる。なお、年齢、体重、症状により適宜増減する。

##### 小児への投与

通常、小児にはアルベカシン硫酸塩として、1日1回4～6mg (力価) /kgを30分かけて点滴静注する。必要に応じ、1日4～6mg (力価) /kgを2回に分けて点滴静注することもできる。なお、年齢、体重、症状により適宜増減する。

#### 7. 用法・用量に関連する注意

- 本剤の薬効は最高血中濃度と最も相関するとされていることから、1日1回静脈内投与が望ましい。
- 本剤の使用にあたっては、腎機能異常及び聴力障害等の副作用に留意し、本剤の投与期間は、原則として14日以内とすること。患者の状態などから判断して、14日以上にわたって本剤を投与する場合には、その理由を常時明確にし、漫然とした継続投与は行わないこと。[11.1.3、11.1.4 参照]
- 体の大きい小児に投与するときには、成人の1日最高量200mg (力価) を超えないよう注意すること。

#### 8. 重要な基本的注意

- 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。
- 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。[11.1.1 参照]
  - 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。
  - 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。
  - 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。
- 投与期間中は血中濃度をモニタリングすることが望ましい。[9.7.2、9.7.3、9.8、16.6.1 参照]
- 眩暈、耳鳴、難聴等の第8脳神経障害があらわれることがあるので慎重に投与すること。特に腎機能障害患者、小児、高齢者、長期間投与患者及び大量投与患者等では血中濃度が高くなり易く、聴力障害の危険性がより大きくなるので、可能な限り聴力検査を実施することが望ましい。アミノグリコシド系抗生物質の聴力障害は、高周波音に始まり低周波音へと波及するので、障害の早期発見のために、聴力検査の最高周波数である8kHzでの検査が有用である。[9.1.1、9.2、9.7.4、9.8、11.1.3 参照]
- 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、投与中は定期的に腎機能検査を行うこと。[9.1.3、9.7.5、9.8、11.1.4 参照]
- 肝機能障害があらわれることがあるので、投与中は肝機能検査を行うこと。
- 汎血球減少、貧血、白血球減少、血小板減少、好酸球増多があらわれることがあるので、定期的に検査を行うこと。[11.1.5、11.2 参照]

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

### 9.1 合併症・既往歴等のある患者

#### 9.1.1 本人又はその血族がアミノグリコシド系抗生物質による難聴又はその他の難聴のある患者

難聴が発現又は増悪するおそれがある。[8.4、11.1.3 参照]

#### 9.1.2 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

観察を十分に行うこと。ビタミンK欠乏症状があらわれることがある。

#### 9.1.3 重篤な基礎疾患・合併症を有する患者

投与量の設定等にも十分留意し、観察を十分に行うこと。急性腎障害等の重篤な腎障害があらわれることがある。[8.5、11.1.4 参照]

#### 9.1.4 重症筋無力症の患者

神経筋遮断作用による呼吸抑制があらわれるおそれがある。

### 9.2 腎機能障害患者

高い血中濃度が持続し、腎障害が悪化するおそれがあり、また、第8脳神経障害等の副作用が強くなるおそれがある。[8.4、11.1.3、16.6.1 参照]

### 9.3 肝機能障害患者

肝障害を悪化させるおそれがある。

### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。新生児に第8脳神経障害があらわれるおそれがある。また、ラットの筋注による器官形成期投与試験で出生児の発育遅滞が認められている。

### 9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

### 9.7 小児等

#### 〈投与経路共通〉

9.7.1 本剤により症状が改善されない場合は、速やかに他剤に切り替えること。小児（特に低出生体重児・新生児）では防御機構が未熟であるため、容易に症状が増悪するおそれがある。

9.7.2 原則として本剤の投与終了直後と次回投与直前に血中濃度を測定し、適切な投与計画をたてること。[8.3 参照]

9.7.3 投与量を減ずるか、投与間隔をあけるなど慎重に投与すること。腎の発達段階にあるため、特に低出生体重児、新生児においては血中濃度の半減期が延長し、高い血中濃度が長時間持続することにより、最低血中濃度2μg/mLを超えるおそれがある。

少なくとも次回投与直前に血中濃度を測定し、投与間隔を調整すること。特に低出生体重児においては、正常な新生児と比較しても著しく半減期が延長し、かつ、個体差が大きいために知られている。[8.3、16.1.2 参照]

9.7.4 特に低出生体重児及び新生児には聴力検査を実施し慎重に投与すること。第8脳神経障害があらわれることがある。また、3歳未満の患者においては、ABR（聴性脳幹反応）を用いた聴力検査が有用である。[8.4、11.1.3 参照]

9.7.5 腎毒性の発現を防ぐため、腎機能検査を行い、慎重に投与すること。[8.5、11.1.4 参照]

#### 〈点滴静注〉

9.7.6 低出生体重児を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

#### 〈筋肉内注射〉

9.7.7 小児等を対象とした有効性及び安全性を指標とした臨床試験は実施していない。[14.2.2 参照]

### 9.8 高齢者

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。

- 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り、第8脳神経障害、腎障害等の副作用があらわれやすい。[8.3-8.5、11.1.3、11.1.4 参照]
- 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. 相互作用

### 10.2 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
腎障害を起こすおそれのある血液代用剤 デキストラン ヒドロキシエチルデンプン等	腎障害が発現、悪化することがあるので、併用は避けることが望ましい。 腎障害が発生した場合には、投与を中止し、透析療法等適切な処置を行うこと。	機序は明確ではないが、併用によりアミノグリコシド系抗生物質の血中への蓄積、近位尿管上皮の空胞変性が生じるという報告がある。
ループ利尿剤 フロセミド アゾセミド等	腎障害及び聴器障害が発現、悪化することがあるので、併用は避けることが望ましい。	機序は明確ではないが、併用によりアミノグリコシド系抗生物質の血中濃度の上昇、腎への蓄積が起こるといった報告がある。
腎毒性及び聴器毒性を有する薬剤 バンコマイシン塩酸塩 エンピオマイシン硫酸塩 白金含有抗悪性腫瘍剤（シスプラチン、カルボプラチン、ネダプラチン）等	腎障害及び聴器障害が発現、悪化することがあるので、併用は避けること。やむを得ず併用する場合は、減量するなど慎重に投与すること。 ただし、小児（特に低出生体重児・新生児）では、バンコマイシンは原則併用しないこと。	両薬剤ともに腎毒性、聴器毒性を有するが相互作用の機序は不明。
（小児に投与する場合） 他のアミノグリコシド系抗生物質（注射剤）	腎障害及び聴器障害が発現、悪化することがある。	小児（特に低出生体重児・新生児）では腎機能が未発達であるため。
麻酔剤 筋弛緩剤 ベクロニウム臭化物 A型ボツリヌス毒素等	呼吸抑制があらわれるおそれがある。 呼吸抑制があらわれた場合には、必要に応じ、コリンエステラーゼ阻害剤、カルシウム製剤の投与等の適切な処置を行うこと。	両薬剤ともに神経筋遮断作用を有しており、併用によりその作用が増強される。
腎毒性を有する薬剤 シクロスポリン アムホテリシンB等	腎障害が発現、悪化することがある。	両薬剤ともに腎毒性を有するが、相互作用の機序は不明。

## 11. 副作用

次の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するなど適切な処置を行うこと。

### 11.1 重大な副作用

#### 11.1.1 ショック（0.1%未満）

[8.2 参照]

#### 11.1.2 痙攣（0.1%未満）

#### 11.1.3 眩暈、耳鳴、耳閉感（いずれも0.1%未満）、難聴（0.1～5%未満）等の第8脳神経障害

[7.2、8.4、9.1.1、9.2、9.7.4、9.8 参照]

#### 11.1.4 急性腎障害等の重篤な腎障害（0.1～5%未満）

[7.2、8.5、9.1.3、9.7.5、9.8 参照]

#### 11.1.5 汎血球減少（0.1%未満）

[8.7 参照]

### 11.2 その他の副作用

種類\頻度	0.1～5%未満	0.1%未満
肝臓	AST、ALT、Al-P、LDH、 $\gamma$ -GTPの上昇	黄疸
腎臓	BUN、クレアチニンの上昇、蛋白尿、カリウム等電解質の異常	浮腫、血尿
過敏症	発疹	そう痒、発赤、発熱、蕁麻疹
血液 <sup>注)</sup>	貧血、白血球減少、血小板減少、好酸球増多	
消化器	下痢	下血、軟便、腹痛、悪心・嘔吐、食欲不振
注射部位		注射局所の疼痛又は硬結（筋肉内注射時）
ビタミン欠乏症		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）
その他		頭痛、手指しびれ感、全身倦怠感

注) [8.7 参照]

### 13. 過量投与

#### 13.1 症状

腎障害、聴覚障害、前庭障害、神経筋遮断症状、呼吸麻痺があらわれることがある。

#### 13.2 処置

血液透析、腹膜透析による薬剤の除去を行う。神経筋遮断症状、呼吸麻痺に対してはコリンエステラーゼ阻害剤、カルシウム製剤の投与又は機械的呼吸補助を行う。

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤調製時の注意

##### (投与経路共通)

14.1.1 現在までに、次の注射剤と混合後、配合変化をおこすことが確認されているので、混注しないこと。

- セフォペラゾンナトリウム・スルバクタムナトリウム、セファゾリンナトリウム、フェノバルビタール、D-マンニトール、ブロムヘキシシン塩酸塩、ヒドロコルチゾンコハク酸エステル、塩化カルシウム水和物、ドキシロピジン塩酸塩と混注すると、白濁・沈殿を生じることがある。
- アンピシリンナトリウム、アンピシリンナトリウム・クロキサシリンナトリウム、イミペネム・シラスタチンナトリウム、セフメタゾールナトリウム、ピペラシリンナトリウム、フロモキシセフナトリウム、ラタモキシセフナトリウムと混注すると、両剤の反応によりアミドを形成し、本剤の活性低下を来すので、それぞれ別経路で投与すること。

##### (点滴静注)

14.1.2 希釈後は速やかに使用すること。

#### 14.2 薬剤投与時の注意

##### (点滴静注)

14.2.1 副作用の発生を防ぐため、必ず30分以上かけて投与すること。

##### (筋肉内注射)

14.2.2 組織・神経などへの影響を避けるため、下記の点に注意すること。

- 同一部位への反復注射はなるべく行わないこと。また、小児には特に注意すること。[9.7.7 参照]
- 神経走行部位を避けるよう注意すること。なお、注射針を刺入したとき、神経に当たったと思われるような激痛を訴えた場合は、直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。
- 注射器の内筒を軽くひき、血液の逆流がないことを確かめて注射すること。
- 硬結をきたすことがあるので、注射直後は局所を十分にむすこと。

### 15. その他の注意

#### 15.1 臨床使用に基づく情報

クエン酸水和物で抗凝固処理した血液を大量輸血された患者にアミノグリコシド系抗生物質を投与すると、投与経路にかかわらず、神経筋遮断症状、呼吸麻痺があらわれることがある。

### 16. 薬物動態

#### 16.1 血中濃度

##### 16.1.1 健康成人

健康成人にアルベカシン硫酸塩注射剤200mg (力価) を1時間かけて点滴静注したときの血中濃度は、図1のとおりで、薬物動態パラメータは、表1のとおりであった。また、75mg (力価) 又は100mg (力価) を1時間かけて点滴静注したときの薬物動態パラメータは、表1のとおりであった<sup>1,2)</sup>。

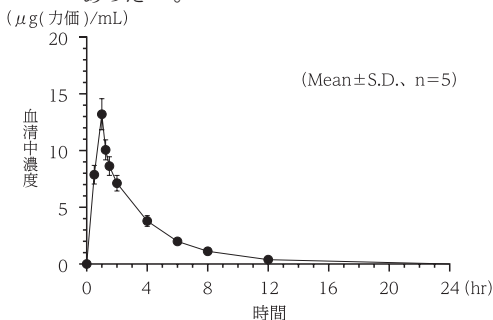


図1 200mg (力価) 1時間点滴静注 (単回投与) したときの血中濃度推移 (健康成人)

表1 健康成人における薬物動態パラメータ

投与方法	1時間点滴静注		
	200	100	75
投与量 (mg (力価))	200	100	75
例数	5	3	3
T <sub>max</sub> (hr)	点滴終了時		
C <sub>max</sub> (μg/mL)	13.2	7.56	6.80
T <sub>1/2</sub> (hr)	2.3	2.1	2.8
V <sub>d</sub> (L/man)	15.4	12.5	12.7
AUC (μg · hr/mL)	40.5	22.0	18.7

##### 16.1.2 小児患者

乳児・幼児 (生後29日以上6歳未満まで)、新生児 (生後28日まで) にアルベカシン硫酸塩注射剤2~3mg (力価) /kgを30分間点滴静注したときの薬物動態パラメータは表2のとおりであった。CL<sub>tot</sub>は新生児よりも乳児・幼児の方が大きかった<sup>3)</sup>。[9.7.3 参照]

表2 小児における薬物動態パラメータ

年齢区分 (実測年齢)	乳児・幼児 (n=3) (1歳9ヵ月~4歳8ヵ月)	新生児 (n=4) (1~18日)
投与量 (mg (力価) /kg)	2.38~2.92	1.99~2.99
C <sub>max</sub> (μg/mL)	7.91	6.64
T <sub>1/2</sub> (hr)	1.73	3.20
V <sub>dss</sub> (L/kg)	0.304	0.382
CL <sub>tot</sub> (L/hr/kg)	0.154	0.091
AUC <sub>0-∞</sub> (μg · hr/mL)	17.77	28.71

##### 16.1.3 生物学的同等性試験

〈アルベカシン硫酸塩注射液25mg「ケミファ」、アルベカシン硫酸塩注射液200mg「ケミファ」〉

アルベカシン硫酸塩注射液75mg「ケミファ」とハベカシン注射液75mgを、クロスオーバー法によりそれぞれアルベカシン硫酸塩として75mg (力価) 健康成人男性に絶食単回筋肉内投与して、血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、C<sub>max</sub>) について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log (0.80) ~ log (1.25) の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>4)</sup>。

アルベカシン硫酸塩注射液25mg「ケミファ」及びアルベカシン硫酸塩注射液200mg「ケミファ」は、アルベカシン硫酸塩注射液75mg「ケミファ」と同一処方の容れ目違いの製剤であることから、試験を省略した。

表3 健康成人における75mg (力価) 単回筋肉内投与したときの薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-10</sub> (μg (力価) · hr/mL)	C <sub>max</sub> (μg (力価) /mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
アルベカシン硫酸塩注射液75mg「ケミファ」	14.3 ± 2.0	4.5 ± 0.7	0.5 ± 0.2	2.1 ± 0.4
ハベカシン注射液75mg	14.4 ± 1.5	4.5 ± 0.5	0.5 ± 0.1	2.1 ± 0.3

(Mean ± S.D., n=16)

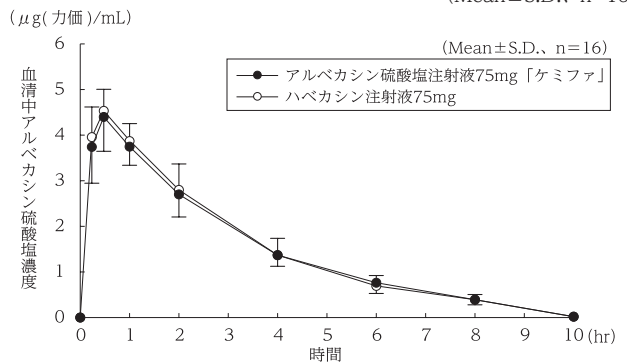


図2 75mg (力価) 筋肉内単回投与したときの血中濃度推移 (健康成人)

〈アルベカシン硫酸塩注射液75mg「ケミファ」、アルベカシン硫酸塩注射液100mg「ケミファ」〉

アルベカシン硫酸塩注射液75mg「ケミファ」とハベカシン注射液75mgを、クロスオーバー法によりそれぞれアルベカシン硫酸塩として75mg (力価) 健康成人男性に絶食単回筋肉内投与して、血清中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、C<sub>max</sub>) について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>5)</sup>。アルベカシン硫酸塩注射液100mg「ケミファ」は、アルベカシン硫酸塩注射液75mg「ケミファ」と同一処方の容れ目違いの製剤であることから、試験を省略した。

表4 健康成人における75mg（力価）単回筋肉内投与したときの薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-10</sub> ( $\mu\text{g}$ (力価)・hr/mL)	C <sub>max</sub> ( $\mu\text{g}$ (力価) /mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
アルベカシン硫酸塩注射液75mg「ケミファ」	15.01±0.25	4.93±0.15	0.53±0.05	1.97±0.06
ハベカシン注射液75mg	14.93±0.31	4.88±0.13	0.50±0.04	1.86±0.04

(Mean±S.E., n=16)

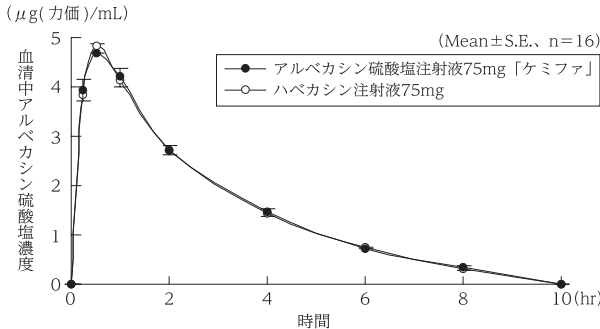


図3 75mg（力価）筋肉内単回投与したときの血清中濃度推移（健康成人）

血清中濃度並びにAUC、C<sub>max</sub>等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

### 16.3 分布

#### 16.3.1 蛋白結合

平衡透析法により測定したヒト血清蛋白との結合率は5～20  $\mu\text{g}/\text{mL}$ の濃度範囲で3～12%であった<sup>6)</sup> (*in vitro*)。

#### 16.3.2 体液・組織内濃度

##### (1) 喀痰中濃度

慢性気道感染症患者にアルベカシン硫酸塩注射液100mg（力価）を点滴静注したときの喀痰中濃度の最高値は1.15～1.32  $\mu\text{g}/\text{mL}$ を示した<sup>7,8)</sup>。

##### (2) 腹水中濃度

腹膜炎患者にアルベカシン硫酸塩注射液75mg（力価）を点滴静注したときの最高腹水中濃度は0.36～5.29  $\mu\text{g}/\text{mL}$ であった<sup>9,10)</sup>。

##### (3) 胆汁中濃度

胆道手術患者にアルベカシン硫酸塩注射液75mg（力価）を筋注したときの胆汁中濃度は2時間後に最高値0.67  $\mu\text{g}/\text{mL}$ を示した<sup>11)</sup>。

### 16.5 排泄

アルベカシン硫酸塩は、主として腎臓より排泄される。健康成人にアルベカシン硫酸塩注射液200mg（力価）を1時間点滴静注（単回投与）したとき、投与24時間までの尿中排泄率は約80%であった。また、75mg（力価）又は100mg（力価）を投与したとき、投与8時間までの尿中排泄率は点滴静注で70～80%、筋注で約70%であった<sup>1,2,12)</sup>。

### 16.6 特定の背景を有する患者

#### 16.6.1 腎機能障害患者

##### (1) 200mg（力価）30分間点滴静注

腎機能障害程度の異なる患者にアルベカシン硫酸塩注射液200mg（力価）を30分間点滴静注したときの薬物動態パラメータは表5のとおりであった。腎機能が正常な患者と軽度腎機能障害患者では各パラメータはほぼ同様であり、中等度-高度腎機能障害患者では、腎機能正常患者と比較してC<sub>min</sub>、T<sub>1/2</sub>、AUC<sub>0-24</sub>が大きく、CL<sub>tot</sub>は小さかった<sup>13)</sup>。[8.3、9.2 参照]

表5 患者における腎機能別の薬物動態パラメータ

腎機能程度 (mL/min)	正常 Ccr≥80		軽度腎機能障害 50≤Ccr<80 (n=3)	中等度-高度 腎機能障害 Ccr<50 (n=4)
		n		
C <sub>max</sub> ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	15.2±5.7	10	14.8±2.4	19.8±3.7
C <sub>min</sub> ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	0.3±0.4	10	0.2±0.3	3.9±1.1
T <sub>1/2</sub> (hr)	3.51±2.67	5	3.95±2.32	16.82±6.02
Vd <sub>ss</sub> (L/man)	14.6±4.3	5	15.9±3.9	15.7±3.5
CL <sub>tot</sub> (L/hr/man)	3.71±1.31	5	3.30±1.06	0.70±0.14
AUC <sub>0-24</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	58.6±22.5	5	62.9±18.0	188.8±24.0

(Mean±S.D.)

### (2) 100mg（力価）1時間点滴静注

健康成人及び腎機能障害程度の異なる患者にアルベカシン硫酸塩注射液100mg（力価）を1時間点滴静注したところ、障害の程度に応じてT<sub>1/2</sub>の延長が認められた<sup>14)</sup> (表6)。[9.2 参照]

表6 健康成人及び腎機能障害患者における薬物動態パラメータ

腎機能程度 (mL/min)	健康成人 Ccr100	腎機能障害患者	
		50≤Ccr<70	30≤Ccr<50
T <sub>1/2β</sub> (hr)	2.46±0.40	2.91±1.20	4.85±1.63
Vdβ (L/man)	19.12±4.20	16.05±2.34	15.74±3.44
CL <sub>tot</sub> (L/hr/man)	5.40±0.31	4.10±1.03	2.35±0.51
AUC <sub>0-∞</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	18.56±1.04	25.51±6.72	43.85±8.63

(Mean±S.D., n=3)

また、クレアチニン・クリアランス (Ccr) が50未満の患者の24時間までの尿中排泄率は56.9%でCcrが100の健康成人のそれは90.3%で明らかに障害程度が高くなるにつれ、尿中排泄の遅延傾向が認められた。

## 17. 臨床成績

### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

#### 17.1.1 臨床薬理試験

成人のMRSA感染症における臨床試験では、肺炎に対して1日1回200mg（力価）を30分かけて点滴静注し、14例中10例に有効であった<sup>13)</sup>。

#### 17.2 製造販売後調査等

##### 17.2.1 特定使用成績調査

成人では、1日1回150～200mg（力価）を投与し、敗血症に対して19例中17例、肺炎に対して78例中63例に有効であった。

小児（15歳未満）では、1日1回4～6mg（力価）/kgを投与し、敗血症に対して2例中1例、肺炎に対して1例中1例に有効であった<sup>15)</sup>。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

細菌のリボソームの30Sサブユニットに結合し、タンパク合成の開始反応を阻害することにより抗菌作用を示す<sup>16)</sup>。

### 18.2 抗菌作用

#### 18.2.1 *in vitro*抗菌作用

メチシリン耐性黄色ブドウ球菌（MRSA）に対して強い抗菌力を有し、アミノグリコシド系抗生物質の中で最も優れた抗菌力を示した<sup>17,18)</sup>。

また、MRSAの産生する各種の不活化酵素に対して安定であった<sup>19)</sup>。

#### 18.2.2 *in vivo*有効性

MRSAによる実験的マウス皮下膿瘍に対して優れた防御効果を示した<sup>20)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：アルベカシン硫酸塩 (Arbekacin Sulfate)

化学名：3-Amino-3-deoxy- $\alpha$ -D-glucopyranosyl-(1→6)-[2,6-diamino-2,3,4,6-tetra-deoxy- $\alpha$ -D-erythro-hexopyranosyl-(1→4)]-1-N-[(2S)-4-amino-2-hydroxybutanoyl]-2-deoxy-D-streptomine sulfate

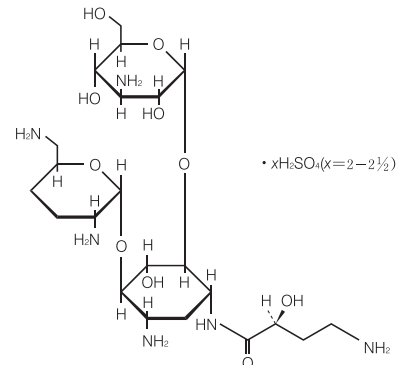
分子式：C<sub>22</sub>H<sub>44</sub>N<sub>6</sub>O<sub>10</sub>・xH<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> (x=2-2<sup>1/2</sup>)

分子量：552.62（ただし遊離塩基）

性状：アルベカシン硫酸塩は白色の粉末である。

本品は水に極めて溶けやすく、エタノール（99.5）にほとんど溶けない。

化学構造式：



## 22. 包装

〈アルベカシン硫酸塩注射液25mg「ケミファ」〉

0.5mL×10アンプル

〈アルベカシン硫酸塩注射液75mg「ケミファ」〉

1.5mL×10アンプル

〈アルベカシン硫酸塩注射液100mg「ケミファ」〉

2mL×10アンプル

〈アルベカシン硫酸塩注射液200mg「ケミファ」〉

4mL×10アンプル

## 23. 主要文献

- 1) 戸塚恭一, 他: Jpn J Antibiot. 1994; 47 (6): 676-692
- 2) 山本 敬, 他: Chemotherapy. 1986; 34 (S-1): 104-116
- 3) 砂川慶介, 他: 日本化学療法学会雑誌. 2003; 51 (2): 91-96
- 4) シオノケミカル株式会社: 生物学的同等性に関する資料 (アルベカシン硫酸塩注射液25mg/200mg「ケミファ」) (社内資料)
- 5) シオノケミカル株式会社: 生物学的同等性に関する資料 (アルベカシン硫酸塩注射液75mg/100mg「ケミファ」) (社内資料)
- 6) 三富奈由, 他: Jpn J Antibiot. 1987; 40 (2): 357-364
- 7) 重野芳輝, 他: Chemotherapy. 1986; 34 (S-1): 317-331
- 8) 吉田俊昭, 他: Chemotherapy. 1986; 34 (S-1): 332-343
- 9) 田中承男, 他: Chemotherapy. 1986; 34 (S-1): 583-592
- 10) 中村 孝, 他: 薬理と治療. 1986; 14 (11): 7115-7130
- 11) 岡 隆宏, 他: Chemotherapy. 1986; 34 (S-1): 575-582
- 12) 山作房之輔, 他: Chemotherapy. 1986; 34 (S-1): 117-128
- 13) 相川直樹, 他: 日本化学療法学会雑誌. 2008; 56 (3): 299-312
- 14) 公文裕巳, 他: Jpn J Antibiot. 1989; 42 (1): 200-207
- 15) 河野 仁, 他: TDM研究. 2010; 27 (2): 55-71
- 16) 吉田眞一, 他: 戸田新細菌学. 2010; 33版: 165-167、(株)南山堂
- 17) 神田佳代子, 他: Chemotherapy. 1988; 36 (4): 289-293
- 18) 出口浩一, 他: Chemotherapy. 1987; 35 (6): 476-481
- 19) 松橋祐二, 他: Jpn J Antibiot. 1988; 41 (5): 523-529
- 20) 渡辺忠洋, 他: Jpn J Antibiot. 1987; 40 (2): 349-356

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

日本ケミファ株式会社 安全管理部  
〒101-0032 東京都千代田区岩本町2丁目2-3  
TEL 0120-47-9321 03-3863-1225  
FAX 03-3861-9567

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

 **シオノケミカル株式会社**  
東京都中央区八重洲2丁目10番10号

### 26.2 販売元

 **日本ケミファ株式会社**  
東京都千代田区岩本町2丁目2-3