

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

ペニシリン系抗生物質製剤

アンピシリン水和物カプセル

ビクシリン®カプセル250mg

VICCILLIN® CAPSULES

シロップ用アンピシリン水和物

ビクシリン®ドライシロップ10%

VICCILLIN® DRY SYRUP

剤 形	ビクシリンカプセル250mg：硬カプセル剤 ビクシリンドライシロップ10%：細粒			
製 剤 の 規 制 区 分	処方箋医薬品 ^{注)} 注) 注意－医師等の処方箋により使用すること			
規 格 ・ 含 量	カプセル：1カプセル中 日局アンピシリン水和物250mg (力価) ドライシロップ：1g中 日局アンピシリン水和物100mg (力価)			
一 般 名	和名：アンピシリン水和物 (JAN) 洋名：Ampicillin (JAN)			
製 造 販 売 承 認 年 月 日 薬価基準収載・販売開始年月日		製造販売承認年月日	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
	ビクシリン®カプセル 250mg	2009年 7月1日 (販売名変更による)	2009年 9月25日 (販売名変更による)	1965年11月
	ビクシリン®ドライシ ロップ10%	2009年 6月19日 (販売名変更による)	2009年 9月25日 (販売名変更による)	1967年 7月
製 造 販 売 (輸 入) ・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	製造販売元： Meiji Seika ファルマ株式会社			
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先				
問 い 合 わ せ 窓 口	Meiji Seikaファルマ株式会社 くすり相談室 TEL (0120) 093-396、(03) 3273-3539 FAX (03) 3272-2438 受付時間：9時～17時 (土、日、祝日、その他当社の休業日を除く) 医療関係者向けホームページ https://www.meiji-seika-pharma.co.jp/medical/			

本 IF はビクシリンカプセル 250mg 2022 年 9 月改訂（第 1 版）及びビクシリンドライシロップ 10% 2022 年 9 月改訂（第 1 版）の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 ―日本病院薬剤師会―

(2020年4月改訂)

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切に審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあ

たっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1	6. 製剤の各種条件下における安定性	5
1. 開発の経緯	1	7. 調製法及び溶解後の安定性	6
2. 製品の治療学的特性	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	6
3. 製品の製剤学的特性	1	9. 溶出性	6
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	10. 容器・包装	6
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特 殊な容器・包装に関する情報	6
(1) 承認条件	1	(2) 包装	6
(2) 流通・使用上の制限事項	1	(3) 予備容量	6
6. RMP の概要	1	(4) 容器の材質	7
II. 名称に関する項目	2	11. 別途提供される資材類	7
1. 販売名	2	12. その他	7
(1) 和名	2	V. 治療に関する項目	8
(2) 洋名	2	1. 効能又は効果	8
(3) 名称の由来	2	2. 効能又は効果に関連する注意	8
2. 一般名	2	3. 用法及び用量	8
(1) 和名（命名法）	2	(1) 用法及び用量の解説	8
(2) 洋名（命名法）	2	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠	9
(3) ステム（stem）	2	4. 用法及び用量に関連する注意	9
3. 構造式又は示性式	2	5. 臨床成績	9
4. 分子式及び分子量	2	(1) 臨床データパッケージ	9
5. 化学名（命名法）又は本質	2	(2) 臨床薬理試験	9
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	(3) 用量反応探索試験	9
III. 有効成分に関する項目	3	(4) 検証的試験	9
1. 物理化学的性質	3	(5) 患者・病態別試験	9
(1) 外観・性状	3	(6) 治療的使用	9
(2) 溶解性	3	(7) その他	9
(3) 吸湿性	3	VI. 薬効薬理に関する項目	13
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点	3	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	13
(5) 酸塩基解離定数	3	2. 薬理作用	13
(6) 分配係数	3	(1) 作用部位・作用機序	13
(7) その他の主な示性値	3	(2) 薬効を裏付ける試験成績	13
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(3) 作用発現時間・持続時間	14
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	VII. 薬物動態に関する項目	15
IV. 製剤に関する項目	4	1. 血中濃度の推移	15
1. 剤形	4	(1) 治療上有効な血中濃度	15
(1) 剤形の区別	4	(2) 臨床試験で確認された血中濃度	15
(2) 製剤の外観及び性状	4	(3) 中毒域	15
(3) 識別コード	4	(4) 食事・併用薬の影響	15
(4) 製剤の物性	4	2. 薬物速度論的パラメータ	16
(5) その他	4	(1) 解析方法	16
2. 製剤の組成	4	(2) 吸収速度定数	16
(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添 加剤	4	(3) 消失速度定数	16
(2) 電解質等の濃度	5	(4) クリアランス	16
(3) 熱量	5	(5) 分布容積	16
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	(6) その他	16
4. 力価	5	3. 母集団（ポピュレーション）解析	16
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	(1) 解析方法	16
		(2) パラメータ変動要因	16

4. 吸収	16	2. 毒性試験.....	25
5. 分布	16	(1) 単回投与毒性試験.....	25
(1) 血液－脳関門通過性	16	(2) 反復投与毒性試験.....	25
(2) 血液－胎盤関門通過性	16	(3) 遺伝毒性試験.....	25
(3) 乳汁への移行性	16	(4) がん原性試験.....	25
(4) 髄液への移行性	16	(5) 生殖発生毒性試験.....	25
(5) その他の組織への移行性.....	17	(6) 局所刺激性試験.....	26
(6) 血漿蛋白結合率	18	(7) その他の特殊毒性.....	26
6. 代謝	18	X. 管理的事項に関する項目.....	27
(1) 代謝部位及び代謝経路	18	1. 規制区分.....	27
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分		2. 有効期間.....	27
子種、寄与率	18	3. 包装状態での貯法.....	27
(3) 初回通過効果の有無及びその割合.....	18	4. 取扱い上の注意.....	27
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存		5. 患者向け資材.....	27
在比率	18	6. 同一成分・同効薬.....	27
7. 排泄	19	7. 国際誕生年月日.....	27
8. トランスポーターに関する情報.....	19	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基	
9. 透析等による除去率	19	準収載年月日、販売開始年月日.....	27
10. 特定の背景を有する患者.....	19	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加	
11. その他	19	等の年月日及びその内容.....	28
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目... 20		10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びそ	
1. 警告内容とその理由	20	の内容.....	28
2. 禁忌内容とその理由	20	11. 再審査期間.....	28
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由.....	20	12. 投薬期間制限に関する情報.....	28
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由.....	20	13. 各種コード.....	28
5. 重要な基本的注意とその理由.....	20	14. 保険給付上の注意.....	28
6. 特定の背景を有する患者に関する注意... 20		XI. 文献.....	29
(1) 合併症・既往歴等のある患者.....	20	1. 引用文献.....	29
(2) 腎機能障害患者	21	2. その他の参考文献.....	29
(3) 肝機能障害患者	21	XII. 参考資料.....	30
(4) 生殖能を有する者	21	1. 主な外国での発売状況.....	30
(5) 妊婦	21	2. 海外における臨床支援情報.....	31
(6) 授乳婦	21	XIII. 備考	33
(7) 小児等	21	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うに	
(8) 高齢者	21	あたっての参考情報.....	33
7. 相互作用	21	(1) 粉碎.....	33
(1) 併用禁忌とその理由	21	(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ	
(2) 併用注意とその理由	21	の通過性.....	33
8. 副作用	22	2. その他の関連資料.....	33
(1) 重大な副作用と初期症状.....	22		
(2) その他の副作用	22		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	23		
10. 過量投与	23		
11. 適用上の注意	24		
12. その他の注意	24		
(1) 臨床使用に基づく情報	24		
(2) 非臨床試験に基づく情報.....	24		
IX. 非臨床試験に関する項目	25		
1. 薬理試験	25		
(1) 薬効薬理試験	25		
(2) 安全性薬理試験	25		
(3) その他の薬理試験	25		

略語表

なし（個別に各項目において解説する）

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

アンピシリンは、1961年に英国 Beecham 研究所の F.P.Doyle らによって、6-Aminopenicillanic acid から α -Carbobenzyl-oxyaminobenzyl penicillin を経て合成され、同研究所の G.N.Rolinson らによって、グラム陰性菌にも作用する広範囲合成 Penicillin として同年発表された。明治製菓株式会社（現 Meiji Seika ファルマ株式会社）は、そのアンピシリン水和物を内服剤として 1965 年 11 月に「ビクシリン®カプセル」を、次いで 1967 年 7 月に「ビクシリン®ドライシロップ」を発売した。

その後、1973 年 11 月 21 日に再評価結果が公示されると共に、新たに梅毒及び胆道感染症に対する有効性が確認されたことから、明治製菓株式会社（現 Meiji Seika ファルマ株式会社）と武田薬品工業株式会社が共同で基礎ならびに臨床試験成績をまとめ、一部変更承認申請を行った。その結果、1977 年 6 月 14 日に梅毒トレポネーマの適応菌種及び梅毒、胆のう炎、胆管炎の適応症が追加承認された。

「ビクシリン®カプセル」及び「ビクシリン®ドライシロップ」は 2009 年 9 月 25 日付厚生労働省告示第 420 号にて医療事故防止等に係る販売名変更品として、それぞれ「ビクシリン®カプセル 250mg」及び「ビクシリン®ドライシロップ 10%」の販売名で薬価基準収載され、「ビクシリン®カプセル 250mg」は 2009 年 9 月に、「ビクシリン®ドライシロップ 10%」は 2009 年 10 月に発売となった。

2. 製品の治療学的特性

- (1) グラム陽性菌及び陰性菌に対して殺菌的に作用する。（「VI. 2. (2) 薬効を裏付ける試験成績」の項参照）
- (2) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）、急性汎発性発疹性膿疱症、無顆粒球症、溶血性貧血、急性腎障害等の重篤な腎障害、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。（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

該当資料なし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、 最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

（2022年9月8日現在）

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

Ⅱ．名称に関する項目

1．販売名

(1) 和名

ビクシリン®カプセル 250mg
ビクシリン®ドライシロップ 10%

(2) 洋名

VICILLIN® CAPSULES
VICILLIN® DRY SYRUP
(以下、販売名の「®」は省略する。)

(3) 名称の由来

Victory(勝利)と Penicillin を合成した名称

2．一般名

(1) 和名 (命名法)

アンピシリン水和物 (JAN)

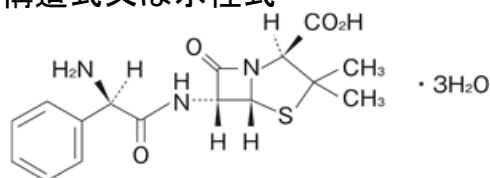
(2) 洋名 (命名法)

Ampicillin Hydrate (JAN)
Ampicillin (INN)

(3) ステム (stem)

-cillin (x): antibiotics, 6-aminopenicillanic acid derivatives¹⁾

3．構造式又は示性式



4．分子式及び分子量

分子式: $C_{16}H_{19}N_3O_4S \cdot 3H_2O$
分子量: 403.45

5．化学名 (命名法) 又は本質

(2*S*, 5*R*, 6*R*)-6-[(2*R*)-2-Amino-2-phenylacetyl-amino]-3,3-dimethyl-7-oxo-4-thia-1-azabicyclo[3.2.0]heptane-2-carboxylic acid trihydrate(IUPAC)

6．慣用名、別名、略号、記号番号

略号: ABPC
記号番号: BRL1341

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～淡黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

水にやや溶けにくく、メタノールに溶けにくく、エタノール（95）に極めて溶けにくく、アセトニトリルにほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

($\log_{10}$ 1-オクタノール層/水層、 $20 \pm 5^\circ\text{C}$)

pH2.0	pH4.0	pH6.0
-2.7	-2.7	-3.0

(7) その他の主な示性値

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$: $+280 \sim +305^\circ$ （脱水物に換算したもの 0.5g、水 100mL、100mm）²⁾

pH : 3.5～5.5 (2.5mg/mL 溶液)²⁾

2. 有効成分の各種条件下における安定性

遊離酸は、酸に対して比較的安定で、pH2 では 2 時間後 95%、6 時間後 80%、24 時間後 42% の力価を保つ。110℃ に加熱すると力価を失う。Penicillinase によって破壊されやすい。

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法：（日局「アンピシリン水和物」による）²⁾

赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

定量法：（日局「アンピシリン水和物」による）²⁾

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

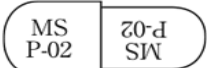
(1) 剤形の区別

ビクシリンカプセル 250mg：硬カプセル剤

ビクシリンドライシロップ 10%：細粒

(2) 製剤の外観及び性状

ビクシリンカプセル 250mg

剤形	色	外形		カプセル番号
硬カプセル剤	キャップ：赤色 ボディ：黄色			2
		直径 (mm)	重量 (g)	
		長径：17.9 短径：6.3	約 0.39	

ビクシリンドライシロップ 10%

剤形	色	味	におい
細粒	淡紅色	味は甘い	芳香

(3) 識別コード

製品名	識別コード	記載場所
ビクシリンカプセル 250mg	MS P-02	カプセル、PTP シート

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

ビクシリンカプセル 250mg

有効成分（1 カプセル中）	添加剤
日局アンピシリン水和物 250mg（力価）	トウモロコシデンプン、ステアリン酸マグネシウム カプセル本体：酸化チタン、赤色三号、黄色五号、青色一号、ラウリル硫酸ナトリウム

ビクシリンドライシロップ 10%

有効成分（1g 中）	添加剤
日局アンピシリン水和物 100mg（力価）	ヒドロキシプロピルセルロース、安息香酸ナトリウム、塩化ナトリウム、サッカリンナトリウム水和物、シリコーン樹脂、精製白糖、黄色五号アルミニウムレーキ 香料、プロピレングリコール、グリセリン脂肪酸エステル、カルボキシメチルセルロースナトリウム、微結晶セルロース、微粒二酸化ケイ素、乳糖、精製カラギナン、バニリン、エチルバニリン、ジブチルヒドロキシトルエン、トコフェロール

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

ビクシリンドライシロップ 10%

本剤 1g あたりの熱量は約 3.26kcal である。

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

アンピシリン ($C_{16}H_{19}N_3O_4S$) としての量を質量(力価)で示す。

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

ビクシリンカプセル 250mg

1) 温度及び湿度に対する安定性

① 気密容器における安定性

室温で 39 箇月間、40℃ 6 箇月、25℃ 91%RH 6 箇月保存し、それぞれ力価、含湿度及び外観について試験した結果、規格内であった。

② 開放容器における安定性

25℃ 91%RH 及び 40℃ 81%RH で 4 週間保存し、力価、含湿度及び外観について試験した結果、規格内であった。

2) 光に対する安定性

直射日光 6 時間及び蛍光灯光下(約 4500 ルクス)で 14 日間曝光下において、力価、含湿度及び外観について試験した結果、規格内であった。

(一部変更承認時のデータ)

ビクシリンドライシロップ 10%

1) 温度及び湿度に対する安定性

① 気密容器における安定性

室温で 39 箇月間保存し力価、含湿度、外観について試験した結果、規格内であった。

高温 (40℃ 6 箇月及び 45℃ 3 箇月) で保存し力価、含湿度、外観について試験した結果、規格内であった。

加湿条件下 (25℃ 81%RH 39 箇月) に保存し力価、含湿度、外観について試験した結果、力価の低下が認められ 12 箇月から規格外となった。それ以外の項目は規格内であった。

加温、加湿条件下 (37℃ 81%RH 3 箇月) に保存し力価、含湿度、外観について試験した結果、規格内であった。

② 開放容器における安定性

25℃ 61%RH 3 箇月保存し力価、含湿度、外観について試験した結果、力価の低下が認められ 2 箇月から規格外となった。それ以外の項目は規格内であった。

25℃ 81%RH 1 箇月保存し力価、含湿度、外観について試験した結果、力価の低下及び外観の変化が認められ 0.5 箇月から規格外となった。また、含湿度の上昇が認められ 1 箇月から規格外となった。

37℃ 61%RH 2 箇月保存し力価、含湿度、外観について試験した結果、力価の低下が認められ 1 箇月から規格外となった。それ以外の項目は規格内であった。

2) 光に対する安定性

直射日光 6 時間及び蛍光灯下 (約 4500 ルクス) に 14 日間曝光下において力価、含湿度、外観について試験した結果、規格内であった。

(一部変更承認時のデータ)

7. 調製法及び溶解後の安定性

ビクシリンドライシロップ 10%

ビクシリンドライシロップ 10% 1g を水に懸濁して 4mL (25mg (力価)/mL) とし、ボトルに入れ蓋をして 5℃、25℃で 14 日間遮光保存したところ、5℃では、力価、pH、外観共、ほとんど変化なく安定であった。25℃では、10 日間保存で、力価、pH にはほとんど変化ないが、外観でわずかな変化がみられた。

(「VIII. 11. 適用上の注意」の項参照)

8. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

該当資料なし

9. 溶出性

ビクシリンカプセル 250mg

試験方法：公的溶出試験に準ずる。

試験液に水 900mL を用い、パドル法 (毎分 50 回転) で実施した。

ロット a)	90 分間の溶出率 (%)		
	最大値	最小値	平均値
1	99	86	89
2	90	82	86
3	90	84	86

a) 測定は各ロット 6 検体で行った。

ビクシリンドライシロップ 10%

試験方法：公的溶出試験に準ずる。

試験液に水 900mL を用い、パドル法 (毎分 50 回転) で実施した。

ロット a)	90 分間の溶出率 (%)		
	最大値	最小値	平均値
1	106	99	102
2	103	99	102
3	97	94	95

a) 測定は各ロット 6 検体で行った。

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

ビクシリンカプセル 250mg

PTP 包装 100 カプセル (10 カプセル×10)

ビクシリンドライシロップ 10%

ボトル (乾燥剤入) 100g

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ビクシリンカプセル 250mg	ビクシリンドライシロップ 10%
PTPシート：ポリ塩化ビニル、アルミニウム ピロー：ポリエチレン、アルミニウム	ボトル：ポリエチレン キャップ：ポリプロピレン 中栓：ポリエチレン パッキン：ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. その他

ビクシリンドライシロップ 10%

本剤のフレーバーは、ミックスフルーツ臭である。

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

ビクシリンカプセル 250mg

〈適応菌種〉

本剤に感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、淋菌、炭疽菌、放線菌、大腸菌、赤痢菌、プロテウス・ミラビリス、インフルエンザ菌、梅毒トレポネーマ

〈適応症〉

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、膿胸、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、淋菌感染症、梅毒、腹膜炎、肝膿瘍、感染性腸炎、子宮内感染、眼瞼膿瘍、麦粒腫、角膜炎（角膜潰瘍を含む）、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、拔牙創・口腔手術創の二次感染、猩紅熱、炭疽、放線菌症

ビクシリンドライシロップ 10%

〈適応菌種〉

本剤に感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、淋菌、炭疽菌、放線菌、大腸菌、赤痢菌、プロテウス・ミラビリス、インフルエンザ菌

〈適応症〉

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、膿胸、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、淋菌感染症、腹膜炎、肝膿瘍、感染性腸炎、子宮内感染、眼瞼膿瘍、麦粒腫、角膜炎（角膜潰瘍を含む）、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、拔牙創・口腔手術創の二次感染、猩紅熱、炭疽、放線菌症

2. 効能又は効果に関連する注意

ビクシリンカプセル 250mg・ビクシリンドライシロップ 10%

5. 効能・効果に関連する注意

〈咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、感染性腸炎、中耳炎、副鼻腔炎〉

「抗微生物薬適正使用の手引き」³⁾を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

ビクシリンカプセル 250mg

通常、成人には1回アンピシリン水和物として250～500mg（力価）を、1日4～6回経口投与する。

なお、年齢、症状に応じて適宜増減する。

ビクシリンドライシロップ 10%

用時溶解し、通常成人には1回本剤2.5～5g〔アンピシリン水和物として250～500mg（力価）〕を1日4～6回経口投与する。

小児には体重1kg当り本剤0.25～0.5g〔アンピシリン水和物として25～50mg（力価）〕を1日量とし、4回に分けて経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

ビクシリнкаプセル 250mg・ビクシリンドライシロップ 10%
設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない（2009 年 4 月以前の承認のため）

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

総症例1,272例中73.0%の有効率（やや有効以上78.9%）を示した。（再評価結果、適応外を含む#）

#：承認された効能又は効果、用法及び用量は「V. 1. 効能又は効果」、「V. 3. 用法及び用量」の項参照

表V-1 疾患別一覧表

疾患名	総例数		有効以上		やや有効		無効・不明	
敗血症	2	(2)	2	(2)				
心内膜炎	46	(46)	37	(37)	1	(1)	8	(8)
蜂窩織炎	8	(5)	8	(5)				
疔(フルンケル)	7	(4)	5	(4)			2	
扁桃炎	26	(6)	22	(6)			4	
上気道感染症	4		4					
膿瘍	11	(2)	6		1		4	(2)
咽喉炎	4	(4)	4	(4)				
膿皮症	9	(9)	2	(2)	5	(5)	2	(2)
膿痂疹	3	(1)	3	(1)				
皮膚感染症	1	(1)	1	(1)				
癰腫症	3	(2)	3	(2)				
咽頭炎	11	(1)	11	(1)				
骨髄炎	4	(2)	4	(2)				
リンパ節炎	3	(1)	2	(1)			1	
乳腺炎	2	(2)	1	(1)			1	(1)
肺炎	19	(9)	17	(9)			2	
肺化膿症	4	(3)	3	(2)			1	(1)
気管支炎	26	(17)	24	(16)			2	(1)
気管支拡張症	4	(4)	3	(3)			1	(1)
膿胸	1		1					
呼吸器感染	5	(5)	2	(2)			3	(3)
細菌性赤痢	169	(149)	134	(119)	4	(1)	31	(29)
小児下痢症	3	(3)	3	(3)				
大腸炎	20	(13)	16	(13)			4	
パラチフス	5	(5)	3	(3)	1	(1)	1	(1)
腸チフス	12	(7)	9	(4)			3	(3)
腹膜炎	4	(1)	4	(1)				
胆嚢炎	10	(10)	9	(9)			1	(1)
胆道感染	113	(113)	3	(3)			110	(110)
腎盂腎炎	71	(58)	53	(43)	8	(7)	10	(8)
化膿性腎盂炎	15	(3)	11	(1)			4	(2)
膀胱炎	321	(289)	260	(235)	29	(25)	32	(29)
腎盂膀胱炎	6	(5)	6	(5)				
尿路感染症	75	(72)	59	(57)	4	(4)	12	(11)
尿道炎	6	(2)	5	(1)			1	(1)
尿道狭窄	1	(1)	1	(1)				
前立腺炎	7	(6)	5	(5)	2	(1)		
副睾丸炎	10	(7)	8	(5)	2	(2)		
卵管炎	2		2					
子宮内感染	5	(2)	2				3	(2)
骨盤炎	6	(1)	4	(1)			2	
産褥熱	1						1	
性器淋疾	2	(2)	2	(2)				
淋菌性尿道炎	26	(26)	21	(21)	2	(2)	3	(3)
ジフテリア	1	(1)	1	(1)				
猩紅熱	65	(65)	64	(64)			1	(1)
中耳炎	39	(23)	27	(19)	8	(2)	4	(2)
副鼻腔炎	1	(1)	1	(1)				
放線菌症	1	(1)	1	(1)				
外科感染症	7	(7)	4	(4)			3	(3)
感染予防	10		10					
その他	55	(19)	36	(15)	7	(1)	12	(3)
計	1,272	(1,018)	929	(738)	74	(52)	269	(228)

()は菌検出症例

(1972年社内資料)

①梅毒に対する臨床成績

1) 投与量別臨床効果

総症例 59 例の投与量別臨床効果を表 V-2 に示した。

表 V-2 投与量別臨床効果

() はやや有効以上

1 日投与量	例数	臨床効果				有効率 (%)
		著 効	有 効	やや有効	無 効	
1.0g (分 4)	23	3	6	7	7	39.1 (69.6)
1.5g (分 3) #	8	0	6	1	1	6/8 (7/8)
2.0g (分 4)	15	2	13			100 (100)
1～1.5g	3	2	1			3/3 (3/3)
不明	10	1	4	5		50.0 (100)
計	59	8	30	13	8	64.4 (86.4)

2) 疾患別臨床効果

総症例 59 例中有効以上は 38 例で、その有効率は 64.4%、やや有効以上については 51 例で、その有効率は 86.4%であった。

疾患別で最も多くの施設で占めている早期潜伏梅毒 17 例に対する有効率は 94.1% (やや有効以上も同じ) であった。また、例数の最も多い先天性梅毒 20 例に対する有効率は 55.0% (やや有効以上 80.0%) であり、晩期梅毒については 28.6% (やや有効以上 57.1%) であった。

3) 副作用は総症例 59 例中 8 例に認め、その発現率は 13.6%であり、その内訳は胃腸系 4 例 (下痢 2 例、胃腸障害 1 例、随伴性胃炎 1 例)、過敏症 2 例 (発疹・掻痒症 1 例、掻痒症 1 例)、カンジダ症 2 例であった。なお、本副作用は既承認の使用上の注意の範囲内であった。

#:承認された効能又は効果、用法及び用量は「V.1. 効能又は効果」、「V.3. 用法及び用量」の項参照

②胆道感染症に対する臨床効果

1) 投与量別臨床効果

総症例 93 例の投与量別臨床効果を表 V-3 に示した。1 日投与量 1.0g では有効率 58.1%、1.5g では有効率 81.1%、2.0g では有効率 92.3%であった。総症例 93 例の総有効率は 72.0%であった。

表 V-3 投与量別臨床効果

1 日投与量	例数	臨床効果				*有効率 (%)	
		著 効	有 効	やや有効	無 効		
1.0g	43	4	21	10	8	25/45	58.1
1.5g	37	13	17	4	3	30/37	81.1
2.0g	13	2	10		1	12/13	92.3
計	93	19	48	14	12	67/93	72.0

$$* \text{有効率} = \frac{\text{著効} + \text{有効}}{\text{例 数}} \times 100$$

2) 疾患別臨床効果

疾患別で最も多くを占める胆のう炎に対する有効率は 71.3%であった。

一方、起炎菌を検出し得た 67 例の総有効率は 74.6%であり、起炎菌の多くはグラム陰性菌であった。最も多く分離された大腸菌に対する有効率は 79.3%であった。また、グラム陽性菌に対する有効率は 90.0%であった。

表 V-4 疾患別臨床効果

疾患名	例数	臨床効果				＊有効率 (%)		起炎菌検索例 有効率 (%)	
		著 効	有 効	やや有効	無 効				
胆のう炎	80	18	39	12	11	57/80	71.3	45/61	73.8
胆管炎	4		3		1	3/4	－	3/4	－
胆のう胆管炎	4	1	3			4/4	－	2/2	－
胆のう周囲炎	1		1			1/1	－		
分類不明 胆道感染症	4		2	2		2/4	－		
計	93	19	48	14	12	67/93	72.0	50/67	74.6

$$＊有効率 = \frac{\text{著効} + \text{有効}}{\text{例数}} \times 100$$

3) 総症例 98 例中何ら副作用は認められなかった。

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

ペニシリン系抗生物質：アモキシシリン水和物、バカンピシリン塩酸塩 等⁴⁾

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

細菌の細胞壁合成阻害により、殺菌的に作用する。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) *in vitro* 抗菌作用

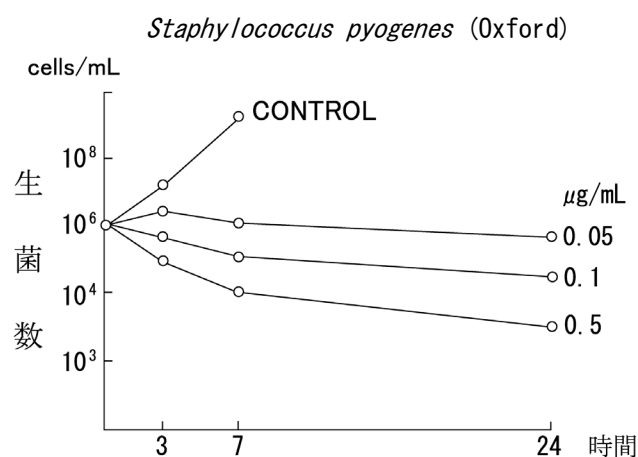
①アンピシリンは、ベンジルペニシリン感性黄色ブドウ球菌、化膿レンサ球菌、肺炎球菌、エンテロкокカス・フェカーリスなどのグラム陽性菌及び赤痢菌、大腸菌、プロテウス・ミラビリス、インフルエンザ菌などのグラム陰性菌に強い抗菌作用を示した⁵⁾。

被 験 菌	最小発育阻止 濃度 (μg/mL)
<i>Staphylococcus pyogenes</i> (Oxford) 1227	0.05
<i>Staphylococcus pyogenes</i> (Smith) 1474	0.05
<i>Staphylococcus aureus</i> 1232	0.05
<i>Staphylococcus aureus</i> 1233 ★	0.05
<i>Staphylococcus aureus</i> NCIB8588	0.06
<i>Staphylococcus aureus</i> 1399 ★	0.05
<i>Staphylococcus aureus</i> 1402 ★	0.05
<i>Streptococcus pyogenes</i> β type 1489 ★	0.01
<i>Streptococcus pyogenes</i> β type 1490 ★	0.02
<i>Streptococcus pyogenes</i> β type 1488 ★	0.01
<i>Streptococcus pyogenes</i> α type 1479 ★	0.02
<i>Streptococcus pyogenes</i> α type 1482 ★	0.01
<i>Diplococcus pneumoniae</i> 1222 ★	0.02
<i>Diplococcus pneumoniae</i> 1224 ★	0.05
<i>Diplococcus pneumoniae</i> 1251 ★	0.02
<i>Enterococcus faecalis</i> 1591	1.25
<i>Enterococcus faecalis</i> NCIB8191	5.0
<i>Enterococcus faecalis</i> NCIB8192	5.0
<i>Enterococcus faecalis</i> 1274	1.25
<i>Neisseria catarrhalis</i> ※ ¹ NCTC3622	0.12
<i>Haemophilus influenzae</i> 1584 ★	0.5
<i>Haemophilus influenzae</i> 1585 ★	0.25
<i>Haemophilus influenzae</i> 1583 ★	0.25
<i>Escherichia coli</i> 1014 ★	5.0
<i>Escherichia coli</i> 1015 ★	2.5
<i>Escherichia coli</i> 1590 ★	5.0
<i>Escherichia coli</i> 1589 ★	2.5
<i>Escherichia coli</i> 1013 ★	5.0
<i>Shigella shigae</i> NCTC4837	0.5
<i>Shigella schmitzii</i> 1079	0.6
<i>Shigella flexneri</i> 1078	1.25
<i>Shigella sonnei</i> NCTC8220	5.0
<i>Proteus vulgaris</i> ※ ¹ NCTC 401	5.0
<i>Proteus mirabilis</i> 1431 ★	1.25
<i>Morganella morganii</i> ※ ¹ NCTC2815	62.5

★ 患者からの新鮮分離株

※¹ 適応外菌種。(承認された効能又は効果は「V. 1. 効能又は効果」の項参照)

アンピシリンは *Staphylococcus pyogenes* (Oxford) に対し、 $0.1 \mu\text{g/mL}$ では生菌数を顕著に減少させ、 $0.5 \mu\text{g/mL}$ 、24 時間で殺菌した⁵⁾。



図VI-1 アンピシリンの抗菌活性

②抗トレポネーマ作用 (家兎、*in vitro*)⁶⁾

病原トレポネーマ (*Treponema pallidum* Nichols 株：以下、Tp) に対するアンピシリンの MIC は $0.1 \mu\text{g/mL}$ であり、この濃度で 20 時間処理した Tp の家兎背皮内再感染実験では、梅毒性丘疹の形成は認められず、MIC で Tp の完全死滅が確認された。

2) *in vivo* 抗菌作用

①家兎における抗トレポネーマ作用⁶⁾

家兎背皮内及び睾丸に Tp を接種し、梅毒性丘疹及び睾丸の腫脹と実質内の硬結の触知を確認した後、アンピシリンを投与した。投与量は背皮内感染群、睾丸内感染群とも 100mg/kg/day を 1 日 2 回に分割し、連続 5 日間経口投与とした。

その結果、背皮内感染治療群では薬剤投与終了後 10 日で皮疹の腫脹は消退をきたした。一方、睾丸内感染治療群では精子形成は認められなかったが、精細管の修復像との間質の線維化、細胞浸潤の限局化という組織学的治癒機転が認められた。

②イヌにおける実験的胆のう炎に対する作用⁷⁾

胆のう内に desoxycholate と *E. coli* を同時に注入して作成した実験的胆のう炎に対して、アンピシリンを 1 日 1 回 100mg/kg を 1 週間投与して本剤による炎症発現の抑制効果又は炎症の治療効果を細菌の定着状況及び組織学的に検討した。

その結果、本剤投与群では、胆汁中菌数は全例消失し、粘膜上皮脱落、漿膜浮腫などの組織学的所見は認められなかった。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

ビクシリンカプセル 250mg

腎機能正常である尿路感染症患者 (n=4) に本剤 250mg (力価) を単回経口投与した場合の血中濃度のピークは、投与 1 時間後にみられ $3.3 \mu\text{g/mL}$ の値を示し、以後漸減した⁸⁾。

ビクシリンドライシロップ 10%

本剤 250mg (力価) を小児 (n=5、体重 15.0~18.3kg ; 平均 16.8kg) に単回経口投与した場合の血中濃度のピークは、投与 1 時間後にみられ、 $2.24 \mu\text{g/mL}$ の値を示し、以後漸減した⁹⁾。

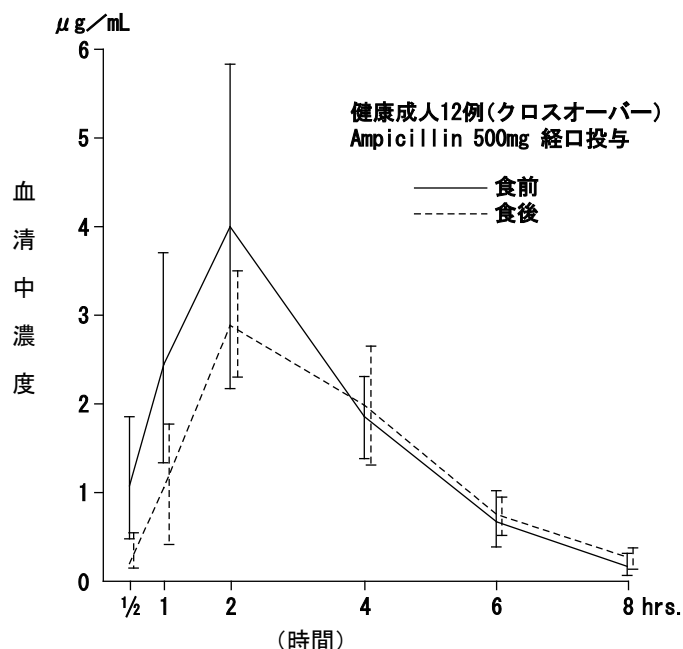
(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

食事の影響¹⁰⁾

健康成人 12 名にアンピシリンとして 1 回 500mg、朝食前と朝食後に 1 週間の間隔を置いて cross-over 法によりアンピシリンの食事の影響を検討した。2 時間後にピークに達し、血清中濃度は空腹時投与では $4.02 \mu\text{g/mL}$ 、食後投与では $2.90 \mu\text{g/mL}$ であった (図VII-1)。また、投与 8 時間までの累積尿中排泄率はそれぞれ 41.9%及び 33.9%であった。これらのことから、アンピシリン経口投与時の食事の影響は少ないものと考えられた。



図VII-1 アンピシリンの食前及び食後経口投与時の血清中濃度

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

全身クリアランス 1.7mL/min/kg ¹¹⁾

(5) 分布容積

分布容積 0.28L/kg ¹¹⁾

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

「VII. 5. (5) その他の組織への移行性」の項参照

(2) 血液－胎盤関門通過性

アンピシリン 250mg (n=3～5 例) を経口投与したところ羊水への移行が確認された ¹²⁾。

「VIII. 6. (5) 妊婦」「VII. 5. (5) その他の組織への移行性」の項参照

(3) 乳汁への移行性

アンピシリン 250mg (n=3～5 例) を経口投与したところ乳汁への移行が確認された ¹²⁾。

「VIII. 6. (6) 授乳婦」「VII. 5. (5) その他の組織への移行性」の項参照

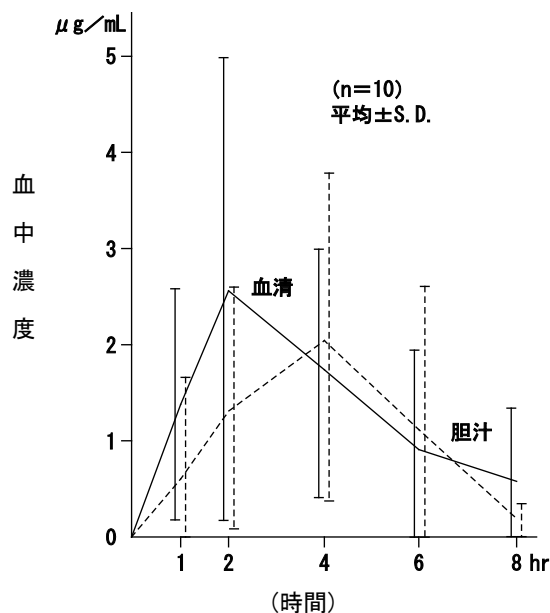
(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

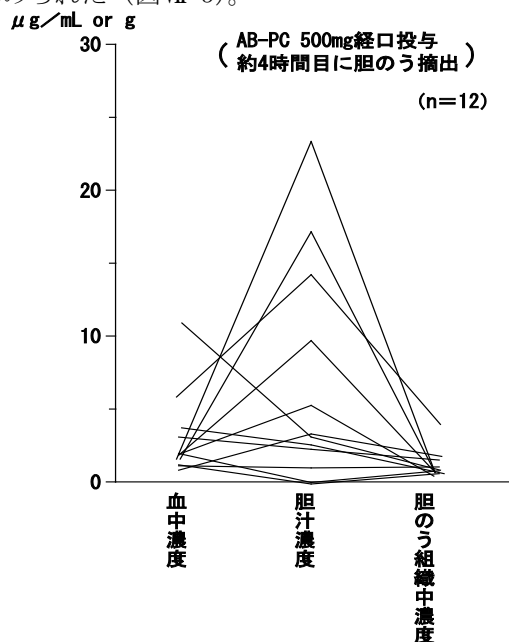
1) ヒトにおける血中濃度及び胆汁中濃度

①総胆管に留置した T 字管から胆汁排泄の比較的良好な 10 症例にアンピシリン 500mg を経口投与し、経時的に血中濃度及び胆汁中濃度を測定した。症例によるバラツキは大きかったが、平均血中濃度は投与後 2 時間に最高値 $2.58 \mu\text{g/mL}$ を示し、一方平均最高胆汁中濃度は投与後 4 時間に $2.05 \mu\text{g/mL}$ に達し、血中濃度にほぼ匹敵した(図VII-2)。



図VII-2 ヒトにおける血中及び胆汁中濃度 (500mg 経口投与)

②胆のう摘出手術約 4 時間前にアンピシリン 500mg を経口投与し、摘出胆のう組織中及びその時点の血中・胆汁中濃度を測定した。その結果、胆汁中濃度が血中濃度を上廻った例が多く、また胆のう組織中にも移行が認められた(図VII-3)。



図VII-3 ヒトにおけるアンピシリンの血中・胆汁中・胆のう組織中濃度

③胆石症及び胆道系感染症患者に経口投与し、手術によって摘出した胆嚢について、胆嚢壁内濃度及び胆嚢内胆汁中濃度を測定した。

表Ⅶ-1 胆嚢壁内濃度及び胆嚢内胆汁中濃度

疾患名	1 日投与量 (mg)	胆嚢壁内濃度 ($\mu\text{g/mL}$)	胆汁中濃度 ($\mu\text{g/mL}$)
胆 石	1500	1.1	0.73
胆嚢炎	2000	0.5	2.0

2) 産婦人科領域

アンピシリン 250mg (n=3~5 例) を経口投与した際の産婦人科領域の各種移行濃度を測定したところ表Ⅶ-2 の通りであった¹²⁾。

表Ⅶ-2 アンピシリンの各種移行濃度 (250mg 内服)

時 間	1	2	3	3.5	4.5	5	6	7.5	8
血 清	0.83	1.7	1.0			0.43			0.07
羊 水	0.3	0.2		0.4	0.3		0.4		
臍帯血	0.6	0.8	0.5		0.4			0	
乳 汁	0	0.14	0.2			0.2			0.14

($\mu\text{g/mL}$)<参考> (ラット)¹³⁾

アンピシリンをラットに経口投与した場合、下記の組織内移行を示した。

表Ⅶ-3 アンピシリン $9\mu\text{g/g}$ 経口投与時の臓器内濃度 (ラット)

時間	1/2	1	2	4
肝	12.6	4.7	1.8	0.2
脾	0.59	0.3	0.14	0.22
腎	3.43	3.1	1.5	2.3
肺	0.75	0.75	0.31	0.42
筋	0	0	0	0
脳	0	0	0	0
血液	0.78	0.57	0.17	—

($\mu\text{g/g}$)

(6) 血漿蛋白結合率

8~20%¹⁴⁾

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

排泄部位：主として腎臓

排泄率：

ビクシリンカプセル 250mg

腎機能正常者（n=4）に本剤 250mg（力価）を単回経口投与した場合の尿中排泄率は 6 時間後で 21% であった⁸⁾。

ビクシリンドライシロップ 10%

本剤 250mg（力価）を小児（n=5、体重 15.0～18.3kg；平均 16.8kg）に単回経口投与した場合、6 時間までの尿中排泄は約 30%であった⁹⁾。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 伝染性単核症のある患者〔発疹の発現頻度を高めることがある。〕

<理 由>

2.2 本症は発熱、全身性のリンパ節腫脹をおもな症状とする伝染病の一種であり、リンパ芽球の異常な活性化による免疫能亢進がみられ、血液中の単核細胞が著明に増加している。本症の患者にアムピシリンを投与した場合に、早期に抗体が産生されアレルギー反応、特に皮膚発疹が高率に発現することが報告されている¹⁵⁾。

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 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。

8.2 ショックを起こすおそれがあるので、十分な問診を行うこと。〔11. 1. 1 参照〕

8.3 無顆粒球症、溶血性貧血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. 3 参照〕

8.4 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、定期的に検査を行うこと。〔11. 1. 4 参照〕

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9. 1 合併症・既往歴等のある患者

9. 1. 1 ペニシリン系又はセフェム系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者（ただし、本剤に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと）

9. 1. 2 本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー症状を起こしやすい体質を有する患者

9. 1. 3 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。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 高度の腎障害のある患者

投与間隔をあけて使用すること。血中濃度が持続する。

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

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にのみ投与すること。大量（3,000mg/kg/day）投与でラットに催奇形性が報告されている。

(6) 授乳婦

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。母乳中へ移行することが報告されている。

(7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

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。

- ・生理機能が低下していることが多く副作用が発現しやすい。
- ・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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

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
経口避妊薬	経口避妊薬の効果が減弱するおそれがある。	腸内細菌叢を変化させ、経口避妊薬の腸肝循環による再吸収を抑制すると考えられる。

8. 副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー（いずれも 0.1%未満）

不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴等があらわれた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。[8.2 参照]

11.1.2 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis : TEN）¹⁶⁾（0.1%未満）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）^{17, 18)}（0.1%未満）、急性汎発性発疹性膿疱症（頻度不明）

11.1.3 無顆粒球症、溶血性貧血（いずれも 0.1%未満）

[8.3 参照]

11.1.4 急性腎障害等の重篤な腎障害（0.1%未満）

[8.4 参照]

11.1.5 偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎¹⁹⁾（0.1%未満）

腹痛、頻回の下痢があらわれた場合には、直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

ビクシリンカプセル 250mg

11.2 その他の副作用

種類\頻度	5%以上又は 頻度不明	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症	発熱、発疹、蕁麻疹等		
血液			好酸球増多、顆粒球減少、血小板減少、貧血
肝臓			AST 上昇
消化器		下痢、悪心、食欲不振等	
菌交代症			口内炎、カンジダ症
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	梅毒患者における、ヤリッシュ・ヘルクスハイマー反応（発熱、全身倦怠感、頭痛等の発現、病変部の増悪）		

11.2 その他の副作用			
種類\頻度	5%以上又は 頻度不明	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症	発熱、発疹、蕁麻疹等		
血液			好酸球増多、顆粒球減少、血小板減少、貧血
肝臓			AST 上昇
消化器		下痢、悪心、食欲不振等	
菌交代症			口内炎、カンジダ症
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）

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

本剤の投与により、ベネディクト試薬、フェーリング試薬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。

10. 過量投与

設定されていない

<参考> ペニシリン系抗生物質（内服用）の急性中毒について²⁰⁾

中毒症状：悪心、嘔吐、上腹部痛、下痢、黒毛舌症（時として発熱、腹痛、白血球増多、粘液・血液便を伴う激症下痢を主症状とする重篤な偽膜性大腸炎を惹起する）、末梢神経炎、発熱、発疹、出血傾向、溶血性貧血、白血球減少症、血中好酸球増多、肝障害（AST・ALT の上昇）、腎障害（腎不全、血尿、尿中好酸球増多を特徴とした急性間質性腎炎）
 （注意）特に心・腎不全患者が過量服用した時には意識障害、痙攣発作、反射亢進、溶血性貧血、白血球減少、血小板機能低下などが起こることが十分考えられる。

処置法：極めて大量に服用した時以外には、下記の②、③の処置でよい。

- ① 胃洗浄（大量に服用し、かつ服用後 1 時間以内ならば行う）
- ② 吸着剤 活性炭（40～60g → 水 200mL）
- ③ 下剤 硫酸マグネシウム（30g → 水 200mL）または、マグコロール[®]P（1 包 → 水 200mL）
- ④ 輸液（肝保護剤、ビタミン B 群、ビタミン K₃ 注を加える）
- ⑤ 対症療法

偽膜性大腸炎；バンコマイシン 1 回 500mg、1 日 4～6 回内服を 7～10 日間継続するか、メトロニダゾール 1 回 500mg、1 日 3～4 回内服を 7～10 日間継続する。

急性間質性腎炎；ステロイド剤が有効と考えられる。

痙攣；ジアゼパム注、フェノバルビタール注など

アナフィラキシーショック；エピネフリン注、副腎皮質ホルモン剤

気管支痙攣；アミノフィリン注

- ⑥ 重症の場合・腎障害時 血液透析（HD）を行う。

11. 適用上の注意

ビクシリンカプセル 250mg

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

ビクシリンドライシロップ 10%

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

シロップ剤にする際は、以下の点に注意するよう指導すること。

- ・シロップ剤にして冷蔵庫中に 10 日間保存しても力価の低下は認められないが、なるべく早く服用すること。
- ・シロップ剤にしてしばらくすると沈殿を生じるので、使用の際はよく振盪すること。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

アンピシリンとアロプリノールとの併用により、発疹の発現が増加するとの報告がある。

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

①末梢作用（ガマ、家兎）²¹⁾

摘出ガマ心臓に対する作用、摘出腸管に対する作用、血液灌流量に対する作用、血管透過性に対する作用、家兎呼吸及び血圧に対する作用について検討したところ、低・中等量ではほとんど影響はないが、大量では摘出心臓運動、摘出腸管運動を抑制し、血管を拡張し、血管透過性を亢進し、血圧を降下させた。なお、摘出腸管運動を低濃度では亢進した。

②中枢作用（家兎、マウス）²²⁾

家兎大槽内及びマウス脳内適用時の中枢作用を検討したところ、軽度であった。

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

マウス、ラットにアンピシリン 5g/kg を経口投与した場合、毒性は認められなかった²³⁾。

(2) 反復投与毒性試験

ラット（雄 2 匹）にアンピシリン 100 及び 500mg/kg を週 5 日、12 週間連続経口投与し生化学的検査、病理組学的検査を行った結果、異常所見は認められなかった²³⁾。

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

大量(3,000mg/kg/day)投与でラットに催奇形性が報告されている。

「VIII. 6. (5) 妊婦」の項参照

<参考>（マウス、ラット、ウサギ）^{24～26)}

ビクシリン注射用 0.25g・0.5g・1g・2g

妊娠マウス及びラットを用いて、器官形成期に 500～5000mg/kg を腹腔内投与した試験で、マウスでは催奇形性は認められなかったが、ラットにおいて胚死亡及び指趾異常が認められた。このラットにおける指趾異常について投与量 2700～2900mg/kg の腹腔内投与試験で再検証したところ、同様に指趾異常が認められた。

また、ウサギを用いて 400mg/kg を静脈内投与した試験では、本剤による胎仔及び新生仔に対する催奇形性は認められなかった。

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製剤：ビクシリンカプセル 250mg 処方箋医薬品^{注)}

ビクシリンドライシロップ 10% 処方箋医薬品^{注)}

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：アンピシリン水和物 該当しない

2. 有効期間

有効期間：3 年

3. 包装状態での貯法

貯法：室温保存

4. 取扱い上の注意

ビクシリンカプセル 250mg

設定されていない

ビクシリンドライシロップ 10%

20. 取扱い上の注意

ボトル開封後は密栓し、湿気を避けて保存すること。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：無

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし

同効薬：無水アンピシリン、アモキシシリン水和物

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 ビクシリンカプセル	1963 年 1 月 24 日	(49EM) 第 253 号	1965 年 11 月 1 日	1965 年 11 月
販売名変更 ビクシリンカプセル 250mg	2009 年 7 月 1 日	22100AMX01682000	2009 年 9 月 25 日	2009 年 9 月

販売名	製造承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
旧販売名 ビクシリンドライシロップ	1966 年 10 月 26 日	(41A) 第 5442 号	1967 年 7 月 1 日	1967 年 7 月
販売名変更 ビクシリンドライシロップ 10%	2009 年 6 月 19 日	22100AMX00957000	2009 年 9 月 25 日	2009 年 10 月

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

ビクシリンカプセル 250mg

1977 年 6 月 14 日：効能又は効果の追加

有効菌種；梅毒トレポネーマ

適応症；梅毒、胆のう炎、胆管炎

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再評価結果通知年月日 1973 年 11 月 21 日（薬発第 1142 号 再評価結果通知）

以下の再評価結果のとおり評価判定された。

再評価結果（「有効と判定する根拠がないもの」と判定した適応）

耳下腺炎、化膿性関節炎、肺炎桿菌性肺炎、ジフテリア

再評価結果通知年月日 2004 年 9 月 30 日（薬食発第 0930002 号 抗菌薬の再評価）

「抗菌薬臨床評価ガイドライン」に基づく適応菌種および適応症の読み替え

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT (9 桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
ビクシリンカプセル 250mg	6131002M1147	6131002M1147	110747001	621074701
ビクシリドライシロップ 10%	6131002R1110	6131002R1110	110751701	621075101

14. 保険給付上の注意

該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) The use of stems in the selection of International Nonproprietary Names(INN) for pharmaceutical substances 2018 (Stem Book 2018) (World Health Organization)
- 2) 第十八改正日本薬局方<<https://www.mhlw.go.jp/stf/seisakunitsuite/bunya/0000066530.html>> (2022/1/7 アクセス)
- 3) 厚生労働省健康局結核感染症課編：抗微生物薬適正使用の手引き
- 4) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2022/9/8 アクセス)
- 5) Rolinson, G.N., et al. : Br Med J. 1961 ; 2(5246):191-196 (PMID:13742934)
- 6) 大久保暢夫ほか：基礎と臨床 Vol.11, 1977 ; No.1 : 1-4
- 7) 小島愛司ほか：Chemotherapy, 1967 ; 15 (5) : 549-559
- 8) 市川篤二ほか：J. Antibiotics, Ser. B, 1963 ; 16 (1) : 13-16
- 9) 中沢 進ほか：ビクシンドライシロップ臨床文献集, 1966 : 4-7
- 10) 三木文雄ほか：Chemotherapy, 1973 ; 21(8) : 1504-1517
- 11) 第十八改正日本薬局方解説書 (廣川書店)
- 12) 高瀬善次郎ほか：Chemotherapy, 1967 ; 15(6) : 671-675
- 13) 藤本安男ほか：Chemotherapy, 1968 ; 16(5) : 702-706
- 14) 柴田昌雄ほか：腎と透析, 1985 ; 19(1) : 51-56
- 15) 中野眞汎監修：医薬品の使用禁忌とその理由 改訂4 版, 1998 : 319-320 (医薬ジャーナル社)
- 16) 立田京子ほか：臨床皮膚科, 1981 ; 35 (4) : 339-342
- 17) Howell, C. G., et al. : J. Pediatr. Surg, 1987 ; 22 (11) : 994-995
- 18) Frank, S., et al. : Clin. Pediatr, 1984 ; 23 (7) : 412-414
- 19) Keating, J. P., et al. : Am. J. Dis. Child, 1974 ; 128 (3) : 369-370
- 20) 森 博美ほか：急性中毒情報ファイル 第4 版, 2008 : 497 (廣川書店)
- 21) 荒谷春恵ほか：J. Antibiotics, Ser. B, 1963 ; 16(1) : 33-39
- 22) 荒谷春恵ほか：J. Antibiotics, Ser. B, 1963 ; 16(1) : 40-44
- 23) Acred, P., et al. : Br J Pharmacol Chemother. 1962 ; 18:356-369 (PMID:13859205)
- 24) 小枝武美ほか：注射用ビクシリンの胎仔に及ぼす影響 (社内資料)
- 25) 小枝武美ほか：ビクシリンをラットに腹腔内投与した場合の催奇形性 (社内資料)
- 26) 小枝武美ほか：ビクシリンの催奇形性について (社内資料)

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

主な海外での発売状況は以下のとおりである。(2022年1月現在)

販 売 名	会 社 名	国 名
VICCILLIN® CAPSULES 500	Thai Meiji Pharmaceutical Co., Ltd.	タイ
Penbritin® 250mg・500mg Capsules	Chemidex Pharma Ltd.	英国

以下は、ライセンス関係のない企業が販売している主な国名及び販売名である。

国 名	販 売 名
米国	Ampicillin Capsules 他
英国	Penbritin 500mg Capsules 他

(2022年9月時点)

本邦における効能・効果、用法・用量は以下のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。国内の承認内容の範囲で本剤を使用すること。

ビクシリンカプセル 250mg

4. 効能・効果

〈適応菌種〉

本剤に感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、淋菌、炭疽菌、放線菌、大腸菌、赤痢菌、プロテウス・ミラビリス、インフルエンザ菌、梅毒トレポネーマ

〈適応症〉

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、膿胸、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、淋菌感染症、梅毒、腹膜炎、肝膿瘍、感染性腸炎、子宮内感染、眼瞼膿瘍、麦粒腫、角膜炎（角膜潰瘍を含む）、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、抜歯創・口腔手術創の二次感染、猩紅熱、炭疽、放線菌症

6. 用法・用量

通常、成人には1回アンピシリン水和物として250～500mg（力価）を、1日4～6回経口投与する。
なお、年齢、症状に応じて適宜増減する。

ビクシリンドライシロップ 10%

4. 効能・効果

〈適応菌種〉

本剤に感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、淋菌、炭疽菌、放線菌、大腸菌、赤痢菌、プロテウス・ミラビリス、インフルエンザ菌

〈適応症〉

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、膿胸、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、淋菌感染症、腹膜炎、肝膿瘍、感染性腸炎、子宮内感染、眼瞼膿瘍、麦粒腫、角膜炎（角膜潰瘍を含む）、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、抜歯創・口腔手術創の二次感染、猩紅熱、炭疽、放線菌症

6. 用法・用量

用時溶解し、通常成人には1回本剤2.5～5g〔アンピシリン水和物として250～500mg（力価）〕を1日4～6回経口投与する。

小児には体重1kg当り本剤0.25～0.5g〔アンピシリン水和物として25～50mg（力価）〕を1日量とし、4回に分けて経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（FDA、オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意「9.5 妊婦」「9.6 授乳婦」の項の記載は以下の通りであり、米国の添付文書、オーストラリア分類とは異なる。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

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にのみ投与すること。大量（3,000mg/kg/day）投与でラットに催奇形性が報告されている。

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。母乳中へ移行することが報告されている。

出典	記載内容
米国の添付文書 (2020年8月)	Pregnancy <i>Teratogenic Effects</i> Reproduction studies in animals have revealed no evidence of impaired fertility or harm to the fetus due to penicillin. There are, however, no adequate and well-controlled studies in pregnant women. Because animal reproduction studies are not always predictive of human response, penicillin should be used during pregnancy only if clearly needed. Labor and Delivery Oral ampicillin-class antibiotics are poorly absorbed during labor. Studies in guinea pigs showed that intravenous administration of ampicillin slightly decreased the uterine tone and frequency of contractions, but moderately increased the height and duration of contractions. However, it is not known whether use of these drugs in humans during labor or delivery has immediate or delayed adverse effects on the fetus, prolongs the duration of labor, or increases the likelihood that forceps delivery or other obstetrical intervention or resuscitation of the newborn will be necessary. Nursing Mothers Ampicillin-class antibiotics are excreted in milk. Ampicillin used by nursing mothers may lead to sensitization of infants; therefore, a decision should be made whether to discontinue nursing or to discontinue ampicillin, taking into account the importance of the drug to the mother.

オーストラリアの分類	分類
The Australian categories for prescribing medicines in pregnancy	A (2022年5月)

参考：分類の概要

オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)

A : Drugs which have been taken by a large number of pregnant women and women of childbearing age without any proven increase in the frequency of malformations or other direct or indirect harmful effects on the fetus having been observed.

小児等に関する記載

本邦における使用上の注意「9.7 小児等」の項は設定されていない。米国の添付文書及び英国の SmPC は以下の通りである。

出典	記載内容
米国の添付文書 (2020 年 8 月)	Pregnancy Pediatric Use Penicillins are excreted primarily unchanged by the kidney; therefore, the incompletely developed renal function in neonates and young infants will delay the excretion of penicillin. Administration to neonates and young infants should be limited to the lowest dosage compatible with an effective therapeutic regimen.
英国の SmPC (2015 年 10 月)	4.2 Posology and method of administration Usual children's dosage (under 10 years): Half adult routine dosage. All recommended dosages are a guide only. In severe infections the above dosages may be increased, or ampicillin given by injection. Oral doses of ampicillin should be taken half to one hour before meals.

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

個別に照会すること。

問い合わせ先：Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室

TEL (03) 3273-3539 (0120) 093-396 FAX (03) 3272-2438

2. その他の関連資料

製造販売元

Meiji Seika ファルマ株式会社

東京都中央区京橋 2 - 4 - 16

IFPA003410