

アメパロモ[®]カプセル250mg

AMEPAROMO[®]capsules 250mg

パロモマイシン硫酸塩カプセル

貯法：室温保存
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

| | |
|------|---------------|
| 承認番号 | 22400AMX01491 |
| 薬価収載 | 2013年2月 |
| 販売開始 | 2013年4月 |
| 国際誕生 | 1959年9月 |

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. イレウスのある患者 [イレウス（腸閉塞）の症状が悪化するおそれがある。]
2. 本剤の成分並びに他のアミノグリコシド系抗生物質及びバンシラシンに対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

1. 組成

1 カプセル中：

| | |
|------|--|
| 販売名 | アメパロモカプセル 250 mg |
| 成分 | パロモマイシン硫酸塩 250 mg（力価） |
| 有効成分 | パロモマイシン硫酸塩 250 mg（力価） |
| 添加物 | 軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム （カプセル本体）黒酸化鉄、三酸化鉄、黄色三酸化鉄、酸化チタン |

2. 性状

| 外形（mm） | 識別コード | 色調等 |
|--|-------------|-------------------|
|  <p>1号カプセル</p> | PARKE DAVIS | キャップ：褐色 ボディ：黄色 |

【効能・効果】

腸管アメーバ症

【効能・効果に関連する使用上の注意】

本剤は腸内原虫及びシスト（嚢子）に対してのみ活性を有するため、本剤を腸管外アメーバ症の治療に使用しないこと。

【用法・用量】

通常、成人には、パロモマイシン硫酸塩1500 mg（力価）を1日3回に分けて10日間、食後に経口投与する。

【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) 便秘のある患者、消化管潰瘍等の腸病変のある患者 [想定されない本剤の消化管吸収が生じ、本剤の血中濃度が高まる可能性がある。]
- (2) 腎障害のある患者 [微量に吸収された本剤の排泄が滞り、血中濃度が高まる可能性がある。]
- (3) 重症筋無力症の患者 [神経筋遮断作用により症状が悪化するおそれがある。]
- (4) 前庭器官又は蝸牛器官に損傷のある患者、難聴のある患者 [めまい、耳鳴、難聴等の第8脳神経障害の副作用が強くなる可能性がある。]
- (5) 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 [ビタミンK欠乏症状があらわれることがある。]
- (6) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人、授乳婦 [「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照]
- (7) 高齢者 [「高齢者への投与」の項参照]

2. 重要な基本的注意

- (1) 本剤は消化管からほとんど吸収されないが、一般にアミノグリコシド系抗生物質では回転性めまい、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、高齢者、腸病変を有する患者では血中濃度が高まる可能性が考えられ、聴力障害の危険性がより大きくなるので、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8 kHzでの検査が有用である。
- (2) 本剤による治療中又は治療後に重篤な下痢が持続する場合には、抗生物質に関連する偽膜性大腸炎の発現の可能性があるため、本剤の投与中止など、適切な処置を行うこと。
- (3) 本剤の治療効果を確実に得るために、必ず10日間服用するよう患者に十分指導すること。

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 |
|---|---|---|
| 聴器毒性又は腎毒性を有する薬剤 カナマイシン、ゲンタマイシン、コリスチン、フロセミド等 | 聴器障害（難聴など）又は腎障害があらわれるおそれがある。 聴器障害又は腎障害があらわれた場合には、必要に応じ、投与中止等の適切な処置を行うこと。 | いずれの薬剤も、神経筋遮断作用又は腎障害を悪化させる作用を有しており、併用によりそれらの作用が増強される可能性がある。 |
| 麻酔剤、筋弛緩剤 ツボクラリン、バンクロニウム臭化物、ベクロニウム臭化物、トルペリゾン、A型ボツリヌス毒素等 | 神経筋遮断作用により、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。 |

4. 副作用

本剤は臨床試験等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用（頻度不明[※]）

1) 腎障害

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。

2) 第8脳神経障害

回転性めまい、難聴等の第8脳神経障害があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状があらわれた場合には投与を中止することが望ましいが、やむを得ず投与を続ける必要がある場合には慎重に投与すること。

(2) その他の副作用

| | 頻度不明 [※] |
|------------|---|
| 血管及びリンパ系障害 | 好酸球増加症 |
| 代謝及び栄養障害 | 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、食欲減退、神経炎等） |
| 神経系障害 | 頭痛、浮動性めまい |
| 耳及び迷路障害 | 難聴 |
| 胃腸障害 | 下痢、食欲減退、悪心、嘔吐、腹痛、吸収不良、消化不良、膀胱炎 |

| | |
|----------|---------------------|
| | 頻度不明 ^(注) |
| 皮膚及び皮下組織 | 蕁麻疹、発疹 |
| 腎及び尿路障害 | 血尿 |

注：外国での市販後報告のため頻度不明

5. 高齢者への投与

高齢者では、ビタミンK欠乏症による出血傾向があらわれることがあるため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、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。また、妊娠する可能性のある婦人には、本剤投与中、適切な避妊を行うよう指導すること。[全身への影響を完全に否定することはできないため、初期胚発生への影響、妊娠初期の胎児毒性／催奇性のリスク、並びに妊娠中期及び後期の胎児毒性のリスクを否定できない。妊娠の全期間中、聴覚の中毒性障害が起きる可能性がある。]

(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。[本剤が乳汁中に移行するかどうかは不明である。]

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

【薬物動態】

血中濃度及び排泄¹⁾

本剤は消化管からほとんど吸収されず、経口投与後ほとんど未変化体で糞便中に排泄される。健康成人10例にパロモマイシン硫酸塩4g（力価）^(注)を経口投与したとき、投与後2時間に平均最高血清中濃度1.48 µg/mLに達した後、12時間後には定量限界付近まで減少した。12時間までの尿中排泄率は0.53%であった。

注：本剤の臨床用量は1回500 mg（力価）

【薬効薬理】

抗アメーバ作用

作用機序

パロモマイシンは、30Sリボソームに結合し、遺伝コードの読解を不完全にさせ、転座を阻害することにより、感受性の高い病原体のタンパク質合成を阻害する（抗原虫作用を含む）。

他のアミノグリコシド系抗生物質（或いは抗菌薬）と同様に、パロモマイシンは殺菌作用を有する。

In vitro抗アメーバ活性²⁾

パロモマイシンは3.9～10 µg/mLの濃度で*Entamoeba histolytica*に対して殺アメーバ作用を示した。

In vivo抗アメーバ活性²⁾

ラット及びイスの腸管アメーバ症に対するパロモマイシンの治療効果が経口投与でそれぞれ22及び2.75～5.5 mg（力価）/kg/日の用量で認められた。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：パロモマイシン硫酸塩

略号：PRM

化学名：パロモマイシンA硫酸塩

2-Amino-2-deoxy-α-D-glucopyranosyl-(1→4)-[2,6-diamino-2,6-dideoxy-β-L-idopyranosyl-(1→3)-β-D-ribofuranosyl-(1→5)]-2-deoxy-D-streptamine Sulfate

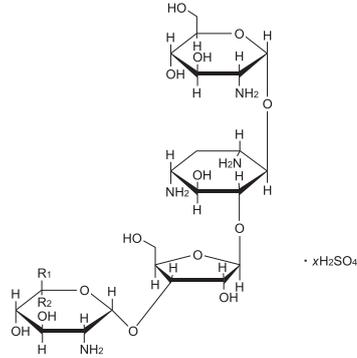
パロモマイシンB硫酸塩

2-Amino-2-deoxy-α-D-glucopyranosyl-(1→4)-[2,6-diamino-2,6-dideoxy-α-D-glucopyranosyl-(1→3)-β-D-ribofuranosyl-(1→5)]-2-deoxy-D-streptamine Sulfate

分子式：C₂₃H₄₅N₅O₁₄・xH₂SO₄

分子量：615.63（遊離塩基として）

構造式：



パロモマイシンA硫酸塩：R₁=H, R₂=CH₂NH₂

パロモマイシンB硫酸塩：R₁=CH₂NH₂, R₂=H

力価：パロモマイシン硫酸塩の力価は、パロモマイシン（C₂₃H₄₅N₅O₁₄：615.63）としての量を質量（力価）で示す。

性状：パロモマイシン硫酸塩は白色の微粉末で、水に溶けやすい。

【包装】

アメパロモカプセル250 mg：12カプセル（瓶）

【主要文献】

1) 岩城 進ほか：Jpn J Antibiot 34(7)：1078, 1981 [L20120924355]

2) Thompson PE, et al.：Antibiot Chemother 9(10)：618, 1959

[L20120911154]

【文献請求先】

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

