



**2020年9月改訂（第12版）
*2019年3月改訂

日本標準商品分類番号
876111

貯法	室温保存
使用期限	バイアル及び外箱 に最終年月表示

ペニシリン系抗生物質製剤
処方箋医薬品^{注)}

日本薬局方 注射用ベンジルペニシリンカリウム
注射用ペニシリンGカリウム20万単位
PENICILLIN G POTASSIUM 200,000 UNITS FOR INJECTION
注射用ペニシリンGカリウム100万単位
PENICILLIN G POTASSIUM 1,000,000 UNITS FOR INJECTION

承認番号	20万:21400AMZ00177000 100万:21500AMY00147000
薬価収載	20万:2002年7月 100万:2003年10月
販売開始	20万:2002年10月 100万:2004年1月
再評価結果	2004年9月
効能追加	2012年2月

禁忌 (次の患者には投与しないこと)
* 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

原則禁忌 (次の患者には投与しないことを原則とする
が、特に必要とする場合には慎重に投与すること)
* ペニシリン系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者

効能・効果に関連する使用上の注意

** 咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、中耳炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」¹⁾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。

【用法・用量】

- <化膿性髄膜炎・感染性心内膜炎・梅毒を除く感染症>
通常、成人には、ベンジルペニシリンとして1回30～60万単位を1日2～4回筋肉内注射する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。
- <化膿性髄膜炎>
通常、成人には、ベンジルペニシリンとして1回400万単位を1日6回、点滴静注する。
なお、年齢、症状により適宜減量する。
- <感染性心内膜炎>
通常、成人には、ベンジルペニシリンとして1回400万単位を1日6回、点滴静注する。
なお、年齢、症状により適宜増減するが、1回500万単位、1日3000万単位を超えないこと。
- <梅毒>
通常、成人には、ベンジルペニシリンとして1回300～400万単位を1日6回、点滴静注する。
なお、年齢、症状により適宜減量する。

【組成・性状】

(1)組成

注射用ペニシリンGカリウム20万単位又は注射用ペニシリンGカリウム100万単位は、1バイアル中にそれぞれ下記の成分を含有する。

有効成分	注射用ペニシリンGカリウム20万単位	注射用ペニシリンGカリウム100万単位
日局ベンジルペニシリンカリウム	20万単位	100万単位

(2)製剤の性状

形 状	色
結晶又は結晶性の粉末	白色

pH

5.0～7.5	1.0×10 ⁵ 単位/10mL (水)
---------	---------------------------------

浸透圧比

約1	10万単位/mL (日局注射用水)
----	-------------------

(浸透圧比：日局生理食塩液対比)

【効能・効果】

<適応菌種>

ベンジルペニシリン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、髄膜炎菌、ジフテリア菌、炭疽菌、放線菌、破傷風菌、ガス壊疽菌群、回帰熱ボレリア、ワイル病レプトスピラ、鼠咬症スピリルム、梅毒トレポネーマ

<適応症>

敗血症、感染性心内膜炎、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、乳腺炎、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、淋菌感染症、化膿性髄膜炎、中耳炎、副鼻腔炎、猩紅熱、炭疽、ジフテリア(抗毒素併用)、鼠咬症、破傷風(抗毒素併用)、ガス壊疽(抗毒素併用)、放線菌症、回帰熱、ワイル病、梅毒

【注射液の調製法】

筋肉内注射の場合、溶解には通常、日局生理食塩液又は日局注射用水を使用する。
点滴静注の場合、溶解には通常、日局生理食塩液又は日局ブドウ糖注射液等を使用する。

用法・用量に関連する使用上の注意

- 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。
- 2)高度の腎障害のある患者には、投与量・投与間隔の適切な調節をするなど慎重に投与すること。(「慎重投与」の項参照)
- 3)化膿性髄膜炎、感染性心内膜炎、梅毒への適用については、国内外の各種ガイドライン等、最新の情報を参考にして投与すること。
- 4)小児に対する用法・用量は確立していないので、小児に投与する場合は、国内外の各種ガイドライン等を参考にして、患者の状態を十分に観察しながら慎重に投与すること。(「小児等への投与」の項参照)

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

【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)セフェム系抗生物質に対し、過敏症の既往歴のある患者
- 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
- 3)高度の腎障害のある患者 [血中濃度が持続するので、投与量を減するか、投与間隔をあけて使用すること。]
- 4)心疾患のある患者 [血中のカリウム濃度の上昇により、循環器系に影響を及ぼすおそれがある。] (「重要な基本的注意」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**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100万単位中に59.8mg (1.53mEq) のカリウムを含有するため、点滴静注する場合には、患者の腎機能や血清電解質及び心電図の変化に注意すること。また、高カリウム血症があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(3)副作用

本剤は使用成績調査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。(再審査対象外)

1)重大な副作用 (頻度不明)

- ①**ショック**を起こすことがあるので、観察を十分に行い、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。
- ②**溶血性貧血**、**無顆粒球症**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。
- ③**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。
- ④**痙攣等の神経症状**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、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- ⑤**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ので、観察を十分に行い、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。
- ⑥**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)**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、投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- ⑦**出血性膀胱炎**があらわれることがあるので、観察を十分に行い、頻尿、排尿痛、血尿、残尿感等の膀胱炎症状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。

2)その他の副作用

下記副作用があらわれることがあるので、このような異常が認められた場合には、症状に応じ、投与を中止するなど、適切な処置を行うこと。

種類\頻度	頻度不明
過敏症	発熱、発疹、蕁麻疹
血液	好酸球増多、顆粒球減少、血小板減少、貧血
肝臓	AST (GOT) 上昇
投与部位	血管痛、静脈炎
その他	梅毒患者における、ヤーリッシュ・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)

(4)高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているので減量するなど注意すること。

(5)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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
- 2)本剤投与中は、授乳を中止させることが望ましい。[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

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 (国内における使用経験が少ない)。

(7)適用上の注意

1)筋肉内注射時

筋肉内注射にあたっては、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。

- ①同一部位への反復注射は行わないこと。また、低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児には特に注意すること。
- ②神経走行部位を避けるよう注意すること。
- ③注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合には、直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。
- ④注射部位に疼痛、硬結をみることもある。

2)点滴静注時

点滴静注により、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、注射方法等に十分注意し、点滴速度をできるだけ遅くすること。

【薬物動態】

【参考】

(1)血中濃度²⁾

健常成人 (n=24) にペニシリンGナトリウム40万単位を筋肉内投与した場合、血中濃度のピークは15分後にあり、その平均値は5.73単位/mLを示し、以後漸減し、3時間後には0.25単位/mLを認めた。

(2)排泄²⁾

健常成人 (n=21) にペニシリンGナトリウム40万単位を筋肉内投与した場合、投与後3時間までの平均尿中排泄率は49.3%であった。

(3)組織内移行³⁾

ウサギに2万単位/kgを筋注した場合、1時間後の各臓器への移行は腎>胆汁>血液>子宮・卵巣>副腎>骨髄>肺>肝の順に高値を示した。

【薬効薬理】

(1)in vitro抗菌作用⁴⁻⁶⁾

ベンジルペニシリンは、グラム陽性菌及びグラム陰性球菌にすぐれた抗菌作用を示した。

被 験 菌	最小発育阻止濃度 (μg/mL)
<i>Staphylococcus aureus</i> 209P	0.03
<i>Staphylococcus aureus</i> Smith	0.03
<i>Streptococcus pyogenes</i> ATCC12344	≤0.008
<i>Streptococcus pneumoniae</i> ATCC10813	0.015
<i>Streptococcus pneumoniae</i> ATCCBAA-255	0.015
<i>Streptococcus pneumoniae</i> ATCC49619	0.25
<i>Neisseria meningitidis</i> ATCC13077	0.015
<i>Neisseria gonorrhoeae</i>	<0.008

(2)作用機序⁷⁾

ベンジルペニシリンの作用機序は細菌細胞壁のペプチドグリカン合成阻害であり、生育中の菌に対して殺菌的に作用する。耐性ブドウ球菌などの産生するペニシリナーゼにより容易に不活化される。

【有効成分に関する理化学的知見】

性状：ベンジルペニシリンカリウムは白色の結晶又は結晶性の粉末である。
本品は水に極めて溶けやすく、エタノール(99.5)に溶けにくい。

一般名：ベンジルペニシリンカリウム
Benzylpenicillin Potassium

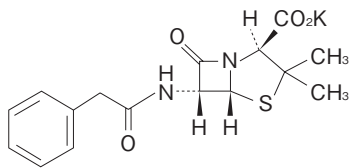
略号：PCG

化学名：Monopotassium (2S, 5R, 6R) -3, 3-dimethyl-7-oxo-6-[(phenylacetyl) amino] -4-thia-1-azabicyclo [3.2.0] heptane-2-carboxylate

分子式：C₁₆H₁₇KN₂O₅S

分子量：372.48

構造式：



分配係数： (log₁₀ 1-オクタノール層/水層、20±5℃)

pH2.0	pH4.0	pH6.0
2.6	0.83	-0.68

【取扱い上の注意】

本剤溶解後は速やかに使用すること。

【包 装】

注射用ペニシリンGカリウム20万単位

1バイアル中 20万単位含有 10バイアル

注射用ペニシリンGカリウム100万単位

1バイアル中 100万単位含有 10バイアル

【主要文献】

- 1) 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
- 2) Holland, S. M., *et al.* : Antibiot. Chemother., 10 (1) : 25, 1960
- 3) 齊藤達郎ほか：J. Antibiot., 4 (9) : 537, 1951
- 4) Gourevitch, G. A., *et al.* : Antibiot. Annu., 1959-1960 : 111, 1960
- 5) 山田恵子ほか：日本化学療法学会雑誌, 57 (S-1) : 1, 2009
- 6) Williamson, G. M., *et al.* : Lancet, (7182) : 847, 1961
- 7) 第十七改正日本薬局方解説書：C-5088 - C-5092, 2016

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室

〒104-8002 東京都中央区京橋2-4-16

フリーダイヤル (0120) 093-396 電話 (03) 3273-3539

FAX (03) 3272-2438