

2024年5月改訂 Z10

貯法 密封容器 室温保存

承認指令書番号	農林水産省指令 31動薬第96号
販売開始	2017年5月

セファロスポリン系抗菌剤  
要指示医薬品 使用基準 指定医薬品

# エクセーデS

本剤は、動物専用の医薬品として開発されたセファロスポリン系抗生物質であるセフチオフル(結晶性遊離酸)を主成分とする油性懸濁注射剤である。セフチオフルは細胞壁合成阻害により殺菌作用を示し、ベータラクタマーゼ産生菌を含むグラム陽性菌、グラム陰性菌に有効な広範囲抗菌スペクトルを有する。

本剤は、セフチオフルナトリウムの水性注射剤及びセフチオフル塩酸塩の油性懸濁注射剤とは異なり、単回投与で優れた効果を発揮することから、治療の省力化と患畜の負担を軽減することが期待できる。

**【成分及び分量】**

品名	エクセーデS
有効成分	セフチオフル
含量	1mL中100mg(力価)

**【効能又は効果】**

[有効菌種] アクチノバチルス プロニューモニエ、パストレラ ムルトシダ、ヘモフィルス パラスイス、ストレプトコッカス スイス

[適応症] 豚：細菌性肺炎

**【用法及び用量】**

豚：体重1kg当たりセフチオフルとして5.0mg(力価)を頸部筋肉内に単回投与する。

**【使用上の注意】**

**警告**  
本剤は、承認された対象動物以外(鶏・種卵など)には使用しないこと(セフチオフルナトリウムの水性注射剤の種卵への投与により、細菌の薬剤耐性率上昇を招いたとの報告がある。)

**(基本的事項)****1. 守らなければならないこと**

(一般的注意)

- ・本剤は、要指示医薬品であるので獣医師等の処方箋・指示により使用すること。
- ・本剤は、効能・効果において定められた適応症の治療にのみ使用すること。
- ・本剤は、定められた用法・用量を厳守すること。なお、用法・用量に定められた単回の投与であってもそれを反復する投与は避けること。
- ・本剤は、「使用基準」の定めるところにより使用すること。

**注意**：本剤は医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律第83条の4の規定に基づき上記の用法及び用量を含めて使用者が遵守すべき基準が定められた動物用医薬品ですので、使用対象動物(豚)について上記の用法及び用量並びに次の使用禁止期間を遵守して下さい。

**豚：食用に供するためにと殺する前14日間**

**(取扱い及び廃棄に関する注意)**

- ・小児の手の届かないところに保管すること。
- ・本剤の保管は直射日光及び高温を避けること。
- ・開封後12週間以内に使用すること。
- ・注射器具は滅菌又は煮沸消毒されたものを使用すること。薬剤により消毒した器具又は他の薬剤に使用した器具は使用しないこと(ガス滅菌によるものを除く)。なお、乾熱、高圧蒸気滅菌又は煮沸消毒等を行った場合は、室温まで冷えたものを使用すること。
- ・使用済みの容器は、地方公共団体条例等に従い処分すること。
- ・本剤を廃棄する際は、環境や水系を汚染しないように注意し、地方公共団体条例等に従い処分すること。
- ・使用済みの注射針は、針回収用の専用容器に入れること。針回収用の容器の廃棄は、産業廃棄物収集運搬業及び産業廃棄物処分業の許可を有した業者に委託すること。

**2. 使用に際して気を付けること**

(使用者に対する注意)

- ・誤って注射された者は、直ちに医師の診察を受けること。
- ・皮膚炎等のアレルギー症状を起こすことがあるため、皮膚に付着した場合は直ちに洗い流すこと。特に、ペニシリン系及びセファロスポリン系薬剤に過敏症反応を示したことがある人は注意すること。

(豚に関する注意)

- ・体重40kgを超える豚に投与する場合は、投与容量を分割して、1ヵ所への投与量を2mL以下にすること。
- ・副作用が認められた場合には、速やかに獣医師の診察を受けること。
- ・本剤投与後、注射部位に硬結がみられることがある。
- ・本剤投与後、注射部位筋肉に変色等の軽度の組織反応がみられることがある。

(専門的事項)

- ①対象動物の使用制限等
  - ・次の動物には投与しないこと。
    - －過去にペニシリン系及びセファロスポリン系薬剤に過敏症反応を示したことがある豚
- ②重要な基本的注意
  - ・本剤は第一次選択薬が無効である症例に限り使用すること。
  - ・本剤の使用に当たっては、耐性菌の発現等を防ぐため、原則として感受性を確認し、適応症の治療上必要な最小限の投与に止めること。
- ③副作用
  - ・ペニシリン系及びセファロスポリン系薬剤は、まれに過敏症反応を起こすことが考えられるので、観察を十分に行い、症状があらわれた場合は投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- ④取扱い上の注意
  - ・よく振り混ぜてから使用すること。

【薬理学的情報等】

(薬物動態)

セフチオフルは、体内で速やかに主代謝物であるデスフロイルセフチオフル(DFC)に変換される。DFCは、セフチオフルと同様の抗菌活性を示すことが確認されている。[1]

(1)吸収

本剤5mg(力価)/kgを単回筋肉内投与したとき、血漿中セフチオフル<sup>注)</sup>は投与後22時間に最高濃度4.17 $\mu$ g/mLに達し、その後約50時間の半減期で減少した。血漿中濃度推移から、一定レベルの濃度が長時間維持されることが確認された(図1)。

注)セフチオフル、DFC及びジチオエリスリトールによりDFCに変換される代謝物をセフチオフル相当量に換算

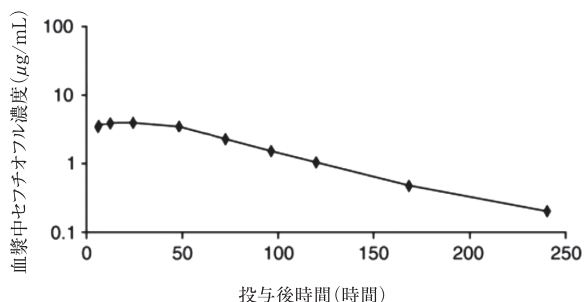


図1 本剤5mg(力価)/kgを単回筋肉内投与したときの血漿中セフチオフル濃度推移(平均値)

(2)排泄

[<sup>14</sup>C]-セフチオフルナトリウム約5mg(力価)/kgを1日1回、3日間筋肉内投与して総放射能残留物を測定した結果、投与12時間後までに約60%及び10%が、それぞれ尿および糞中に排泄された[2]。また、セフチオフルは、腸内細菌によって分解されることが報告されている[3]。

(臨床成績)

野外条件下における本剤の有効性を国内3施設において評価した。肺炎と診断された豚120頭を供試し、うち60頭に本剤5.0mg(力価)/kgを単回筋肉内投与して、本剤の有効性を評価した。呼吸状態、発咳、活力、食欲及び体温の改善状況に基づく有効率は、投与3日後で55.0%、7日後で88.3%であった。また、肺炎を発症して第一次選択薬(アモキシシリン)が投与されたものの、その治療効果が十分に認められなかった豚15頭を供試して、本剤の第二次選択薬としての有効性を国内2施設で評価した。有効率は本剤投与3日後で33.3%、7日後で80.0%であった。

(対象動物安全性試験)

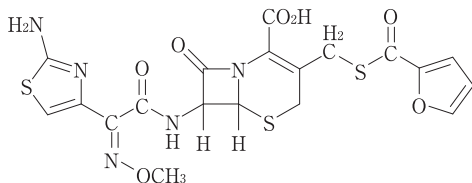
2ヵ月齢の豚3頭を1群として、本剤を常用量(5.0mg(力価)/kg)又は10倍量で1日1回、3日間筋肉内投与した。試験期間中(初回投与後14日間)に本剤投与に関連すると考えられる臨床所見は、両投与群で認められた一過性の注射部位の硬結のみであった。剖検では注射部位筋肉の変色等が認められた。さらに、4ヵ月齢の豚8頭に、本剤を常用量で別部位に計2回、筋肉内投与し、投与21、28、42及び56日後における投与局所反応の消失状況を評価した。その結果、投与42日後には変色等が認められたが、56日後には異常は認められなくなった。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般的名称：セフチオフル

化学名：(6*R*,7*R*)-7-[[[(2*Z*)-2-(2-amino-1,3-thiazol-4-yl)-2-(methoxyimino)acetyl]amino]-3-[[[furan-2-ylcarbonyl]sulfonyl]methyl]-8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylic acid

構造式：



分子式：C<sub>19</sub>H<sub>17</sub>N<sub>5</sub>O<sub>7</sub>S<sub>3</sub>

分子量：523.56

**【主要文献】**

- [1]Hornish RE, et al. : Curr Top Med Chem, 2, 717-731(2002)  
[2]Gilbertson TJ, et al. : J Agric Food Chem, 43, 229-234 (1995)  
[3]Gilbertson TJ, et al. : J Agric Food Chem, 38, 890-894 (1990)

**【有効期間】**

24ヵ月

**【包装】**

50mL(50mL×1ガラスバイアル入)

**【製品情報お問い合わせ先】**

ゾエティス・ジャパン株式会社

〒151-0053

東京都渋谷区代々木3-22-7

TEL : 03-5309-9224 FAX : 03-5309-9914

月曜日～木曜日 9:00～12:30、13:30～18:00

金曜日 9:00～12:30、13:30～16:00受付

※土日祝祭日および弊社休業日は除く。

**【製造販売(輸入)】**

**ゾエティス・ジャパン株式会社**

〒151-0053 東京都渋谷区代々木3-22-7

獣医師、薬剤師等の医薬関係者は、本剤による副作用などによると疑われる疾病、障害若しくは死亡の発生又は本剤の使用によるものと疑われる感染症の発症に関する事項を知った場合において、保健衛生上の危害の発生又は拡大を防止するために必要があると認めるときは、上記【製品情報お問い合わせ先】に連絡するとともに、農林水産省動物医薬品検査所(<http://www.maff.go.jp/nval/iyakutou/fukusayo/sousa/index.html>)にも報告をお願いします。