

## ◎パシル点滴静注液、▼バズクロス点滴静注液 [注]

【重要度】★★ 【一般製剤名】バズフロキサシンメシル酸塩 (PZFX) pazufloxacin mesilate 【分類】合成抗菌剤 [キノロン系]

【単位】◎300mg/袋 [100mL], ◎500mg/袋 [100mL], ▼1000mg/袋 [200mL]

【常用量】1000mg/日 [敗血症, 肺炎球菌による肺炎, 重症・難治性の呼吸器感染症の場合: 2000mg/日] ■年齢, 症状に応じ, 600mg/日に減量

【用法】1日2回, 30分~1時間で点滴静注 [1回1,000mgの場合は1時間で点滴静注]

【透析患者への投与方法】週3回透析後に300~500mg投与 [週2回HDの例でも週3回投与が選択できると思われる] (5, 古久保 拓 日化療会誌 56: 462-6, 2008) 体重60kg以上なら1回500mg (5)

【PD】単回投与時の半減期が16~28hrに延長するため, 投与間隔を延長する必要がある (石田裕一郎, 他: 日化療会誌 43(S2): 547-9, 1995)

【保存期 CKD患者への投与方法】 $20 \leq \text{Ccr} < 30 \text{ mL/min}$ : 1回500mgを1日2回,  $\text{Ccr} < 20 \text{ mL/min}$ : 1回500mgを1日1回 [それぞれ2000mg/日の適応でも同じ] (1)

【特徴】従来のニューキノロン薬に比し痙攣誘発作用、急性毒性、細胞毒性が軽度。細菌由来のDNA ジャイレースおよびトポイソメラーゼIVと呼ばれるDNA高次構造を変換する酵素に作用しDNA複製を阻害することにより殺菌的に作用する。各種体液・組織内への移行は良好であり、特に、肺組織、喀痰、胆汁にすぐれた移行性を示す。15分作用時でも約2時間と優れたPAEを示す。緑膿菌にも抗菌活性を示すが、肺炎球菌への抗菌力は比較弱い。

【主な副作用・毒性】ショック、アナフィラキシー、急性腎不全、肝機能障害、黄疸、偽膜性大腸炎、血小板減少、横紋筋融解症、痙攣、SJS・TEN、無顆粒球症、間質性肺炎、PIE症候群、低血糖、アキレス腱炎、腱断裂、注射部位反応など。

【安全性に関する情報】注射部位反応は1日2000mg投与時に多い傾向 (1)

【吸収】良好に吸収される (Tanimura H, et al: Drugs 49 Suppl2: 337-340, 1995) 速やかに吸収される (Matsuda S: Drugs 49 Suppl 2: 393-394, 1995)

【Cmax】30分点滴で, 300mg投与時 $8.99 \mu\text{g/mL}$ , 500mg投与時 $11.0 \mu\text{g/mL}$  (1) 高齢者に500mgを30分点滴時 $18.3 \mu\text{g/mL}$  (1)

【代謝】ほとんど代謝を受けずに尿中排泄 (1) 代謝物にはM1、M2、M3があるがそれらの尿中排泄率は各々ND、0.03%、0.09%と非常に低く、グルクロン酸抱合体の尿中排泄率は5.7% (1) 代謝物M1、M2、M3にはほとんど活性がない (前花淳子, 他: Jpn J Antibiotics 48: 610-620, 1995) CYPによる代謝は受けないが、CYP1A2を阻害する (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率93.9% (早川大善, 他: 日化療会誌 47 (S-1): 81-87, 1999) 経口投与後24hr以内に約80%が尿中に排泄 (Tanimura H, et al: Drugs 49, S2: 337-40, 1995) 尿中への排泄の一部はP糖蛋白によって行われる[ラット] (Shimizu A, et al: Eur J Pharmacol 501:151-9, 2004)

【CL】 $390 \text{ mL/min}$ , 高齢者では $230 \text{ mL/min}$  (1) CcrとCLは正相関 (1)

【t<sub>1/2</sub>】1.65~1.88hr, 高齢者でも延長しない (1) 【透析患者のt<sub>1/2</sub>】17.9~23.2hr (1) 1日~2日 (1) PD患者で16~28hr (石田裕一郎, 他: 日化療会誌 43: S547-9, 1995)

【蛋白結合率】 $30.7 \pm 8.9\%$  (1) アルブミン、グロブリン濃度により変動する (三星 知, 他: TDM 研究 30: 46-52, 2013)

【分布】肺組織には血清濃度の1.33倍, 胸水には4.21倍, 腹水には1.07倍, 創傷汁には0.52倍, 乳汁には血中濃度の1.5~3.2倍, 髄液には0.062倍移行 (1) 胆汁中にも良好に移行シグラム陰性菌に対しても効果が期待できる (岡元 泉, 他: TDM 研究 27: S186, 2010) 前立腺への移行率はCmax比0.89, AUC比0.89 (小池純平, 他: 臨床薬理 45: S268, 2014)

【Vd】 $36 \sim 72 \text{ L/man}$  (1)

【MW】414.41

【透析性】みかけの血中濃度はHD前の50%以下になるもののリバウンド現象が認められ, HD前値に比べ平均45%低下する [生体クリアランスを含む] (古久保 拓 日化療会誌 56: 462-6, 2008) 300mgを30分点滴から24hr後のHDによる除去量は55~66mg. 透析時t<sub>1/2</sub>は2.83~3.6hrで除去率は約40% (1) 8hrのCHDF [8L置換・QD500]での除去率は40% (吉澤寿宏, 他: TDM 研究 28: s175, 2011) PD液への回収率3~6% (石田裕一郎, 他: 日化療会誌 43(S2): 547-9, 1995)

【OW係数】0.44 [1-オクタノール水系, pH7.0] (1) 【TDMのポイント】TDMの対象にならない。腎障害患者への投薬時には分割投与ではなく投与間隔をあける方法を選択する。

【相互作用】CYP1A2を阻害することによりテオフィリンの血中濃度を上昇させるが $414 \mu\text{g/mL}$ で約37%の阻害作用しか示さない (1)

【備考】投与3日を目安として継続投与が必要か判定し, 投与中止またはより適切な他剤への切り替えを検討。投与期間は原則として14日以内 (1)

【更新日】20170128

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。