

## ○サイクロセリンカプセル明治 [内]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】サイクロセリン (CS) (U) Cycloserine 【分類】抗結核性抗生物質製剤

【単位】○250mg/Cap

【常用量】1回250mg, 1日2回

■10mg/kg/日 [最大500mg/日] (結核診療ガイドライン)

【用法】分2 [他の抗結核薬と併用]

【透析患者への投与方法】250mgを24hr毎(12)

【その他の報告】250~500mgを週3回HD後(17) 10~15mg/kgを週3回HD後(サンフォード感染症治療ガイド) 腎不全では精神神経症状が発現しやすい(5) 腎不全患者では本剤の血中濃度が上昇し中枢神経等の副作用が発現しやすくなる(1) 尿中未変化体排泄率が高いため腎不全患者では減量すべき(11)

【PD】データなし(17)

【CRRT】250~500mgを24hr毎(17)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 50mL/min以上:250mgを12hr毎, Ccr 10~50mL/min:250mgを12~24hrおき, Ccr 10mL/min以下:250mgを24hr毎(3)

【その他の報告】Ccr 50mL/min以上:常用量を24hrごと, Ccr 50mL/min未満:避ける(10)

GFR 10~50mL/min:1回250~500mgを24hr毎, GFR 10mL/min未満:1回250~500mgを36~48hr毎(12,17)

慎重投与(1)

Ccr >20mL/min:10~15mg/kg/日を2回に分割投与, Ccr 10~20mL/min:10~15mg/kg/日を分割して12~24hr毎, Ccr 10mL/min未満:10~15mg/kgを24hr毎(サンフォード感染症治療ガイド)

【特徴】細胞壁合成の特異的阻害剤。MICは5~20 $\mu$ g/mLとあまり強力ではないが、臨床効果は比較的良好である。0.5g内服でMIC程度の血中濃度を得られる。他剤との交差耐性はないが試験管内耐性の上昇は速やか。脳脊髄液中にはほぼ血中濃度と等しく移行するため投与量の増加に伴い不安感、焦燥感、幻聴、錯乱などの中枢神経系の副作用発現率が高く、頻度は5%以上。

【主な副作用・毒性】精神錯乱、てんかん発作、痙攣、眩暈、頭痛、振戦、眠気、反射亢進、関節痛、記憶力喪失・減退、不眠、発疹、発熱、搔痒感等、消化器症状など

【安全性に関する情報】てんかん等の精神障害のある患者ではてんかん様発作等の精神障害を悪化させるおそれがあるので禁忌(1) VB6はサイクロセリンによる神経毒性に有効である[経口60~90mgをめやす](Cohen, et al: N Y Acad Sci 166: 346-9,1969)

【モニターすべき項目】BUN、Cr、血清サイクロセリン濃度、ヘモグロビン濃度

【吸収】速やかにほぼ完全に吸収される(11)

【tmax】3~4hr(1) 【Cmax】250mg投与後のピーク値10 $\mu$ g/mL(11)

【代謝】30~40%が肝で代謝されるが代謝経路は不明(11)

【排泄】経口投与量の60~70%が糸球体濾過により尿中に未変化体として排泄され、残りの30~40%が代謝物として排泄される。糞便中への排泄は無視してよい(11) 尿中未変化体排泄率65%(12)

【t1/2】約10hr(1) 平均10 [4~30] hr(11) 0.5hr(12) 【透析患者のt1/2】延長する(U) 不明(12)

【蛋白結合率】20%以下(11) 不明(12)

【分布】体中に広く分布し、組織、脳脊髄液、腹水を含む体液にも血漿濃度とほぼ等しく移行する(11)

【Vd】0.11~0.26L/kg(12)

【MW】102.09

【透析性】透析液中に56%回収される(Malone RS, et al: Chest 116: 984-90,1999)

【TDMのポイント】安全性が低く(中毒濃度/有効濃度が小さい)、腎排泄性であるため特に腎不全患者では可能ならば実施する意義がある可能性がある。結核治療では血漿濃度は25~30 $\mu$ g/mLに保つ。血清濃度上昇と毒性が相関するため、30 $\mu$ g/mLは避ける(U) 用量不足、吸収遅延などが起こるためTDMによる調整が有用である可能性(Hung WY, et al: Int J Tuberc Lung Dis 18: 601-6, 2014 PMID: 24903799)

【OW係数】低い(11) 資料なし(1) 【pKa】4.4, 7.4(1)

【更新日】20211218

※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、当院では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などでご確認ください。

※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。