

○シプロキササン注 [注]・○錠 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】シプロフロキサシン (CPFX) (U) Ciprofloxacin 【分類】合成抗菌剤 [ニューキノロン系]

【単位】○200mg/100mL・▼400mg/200mL, ▼100mg・○200mg/錠

【常用量】■注：1回400mg 1日2回 [最大1日3回]

■内服：1回100～200mg, 1日2～3回

【用法】■注：1日2回点滴静注。原則として生理食塩液、ブドウ糖注射液又は補液で希釈して、1時間かけて投与する（30分以内の点滴静注は避ける）

■Y字管を用いるなどして生食100mL以上に希釈しつつ1hr以上かけて投与するが、水分負荷がかけられない場合には太い血管から希釈せずに投与可能 (1)

【透析患者への投与方法】■注射：初回投与量400mgを1日1回, 2回目以降は200mgを1日1回 (5) ■内服：1回200mgを1日1回 (5)

【その他の報告】■注射：250～500mgを24hr毎 (U) 200mgを12hr毎 (3, 17, サンフォード感染症治療ガイド)

■内服：250mgを12hr毎 (17, サンフォード感染症治療ガイド)

【PD】PD 腹膜炎に50mg/Lで交換毎に腹腔内投与、もしくは500～750mg/日、CCPDなら750mgを1日2回経口 (Li PK, et al: Perit Dial Int. 2022 PMID: 35264029 [ISPD 2022])

250～500mgを24hr毎 (U) 250mgを8hr毎 (3) 経口で250mgを12hr毎, 静注で200mgを12hr毎 (17)

出口部およびトンネル感染に1回250mgを1日2回 (Li PK, et al: Perit Dial Int 30: 393-423, 2010) PD液濃度25μg/mLとして添加 (17)

【CRRT】12hr毎に200mg (3) 400mgを24hrごと (サンフォード感染症治療ガイド) 200～400mgを8～12hr毎 (17)

CRRT時の薬物動態 (Shotwell MS, et al: Am J Kidney Dis 66: 173-5, 2015 PMID: 25912840)

【保存期CKD患者への投与方法】■内服：Ccr>50mL/min：1回200mgを1日2回, Ccr 10～50mL/min：100～200mgを1日2回, Ccr<10mL/min：200mgを1日1回 (5)

■注射：Ccr 30～60mL/min：1回200mgを12hrごと, Ccr<30mL/min：1回200mgを24hrごと [病状により必要と判断された場合は1回400mg] (1)

【その他の報告】■注射：Ccr 10～50mL/min：50～75%に減量, Ccr 10mL/min未満：50%に減量 (サンフォード感染症治療ガイド)

Ccr>50mL/min：200～400mg/12hr, Ccr 30～50mL/min：200～400mg/12hr, Ccr 10～30mL/min：200～400mg/12～24hr, Ccr<10mL/min：200～400mg/12～24hr (7) GFR>50mL/min：常用量, GFR 10～50mL/min：50～75%に減量, GFR<10mL/min：50%に減量 (3, 10, 12)

Ccr>50mL/min：100%, Ccr 10～50mL/min：50%, Ccr<10mL/min：33%に減量 (3)

Ccr 30～50mL/min：250～500mgを12hr毎, Ccr 5～29mL/min：250～500mgを18hr毎 (U)

GFR>50mL/min：400mgを12hr毎, GFR 10～50mL/min：200mgを12hr毎, GFR 10mL/min未満：200mgを12hr毎 (17)

■内服：Ccr 60mL/min/1.73m²以上：1回400mgを8hr毎, Ccr 31～60mL/min：1回400mgを12hr毎, Ccr 30mL/min以下：1回400mgを24hr毎 (Shah A, et al: J Antimicrob Chemother 38: 103-16, 1996)

Ccr>50mL/min：500mg/12hr, Ccr 30～50mL/min：500mg/12hr, Ccr 10～30mL/min：250～500mg/12～24hr, Ccr<10mL/min：250～500mg/12～24hr (7)

GFR>50mL/min：500～750mgを12hr毎, GFR 10～50mL/min：250～500mgを12hr毎, GFR 10mL/min未満：250mgを12hr毎 (17)

【特徴】緑膿菌を含むグラム陰性菌に対して優れた抗菌力を示す。炭疽菌に対しても適応。組織移行性が良い。血中濃度の上昇に伴い中枢神経系に高濃度に移行し、中枢興奮作用によるてんかん等の痙攣発作がおこることがある。血管痛や静脈炎の危険性を軽減するため補液で希釈して緩徐に注入する。

【主な副作用・毒性】痙攣、偽膜性大腸炎、横紋筋融解症、急性腎不全、間質性腎炎、肝障害、間質性肺炎、無顆粒球症、汎血球減少症、血管炎、低血糖、アキレス腱炎、腱断裂、重症筋無力症、錯乱、抑うつ、錯乱、血管炎など。

【安全性に関する情報】尿細管で析出することによる腎症が報告されている (Stratta P, et al: Am J Kidney Dis 50: 330-5, 2007) 透析患者での低血糖症例 (Matoi A, et al: Clin Case Rep 2021 PMID: 33936612)

【F】65～80% (14) 60% (13) 70～80% (U)

【tmax】0.6hr (13) 1～2hr (U) 食事により遅延 (U) 【Cmax】慢性気管支炎患者に500mgを1日2回投与し3日以上経過したときのCmaxは2.5μg/mL (13)

【代謝】脱エチレン体、N-硫酸抱合体、オキソ体に代謝される (1) 腎不全患者では腎外クリアランスが33%低下する (Lam YW, et al: Clin Pharmacokinetics 32: 30-57, 1997) 20%が代謝を受ける (U)

【排泄】主として腎から排泄され、尿中に未変化体58.1%、脱エチレン体1.0%、N-硫酸抱合体2.6%、オキソ体4.6% (1) 尿中未変化体排泄率30～50% (14) 50% (13) 50～70% (12) 50～70% [iv] (U) 胆汁排泄率15% [iv] (U)

【CL】7.6mL/min/kg, 腎障害・加齢により低下 (13) 30～40L/hr (1)

【t1/2】2.6～3.5hr (1) 2相性に消失 (1) 3.3hr, 腎疾患で延長 (13) 3～6hr (12) 5～6hr [iv], 腎障害時6～8hr [po] (U)

【透析患者のt1/2】11.4～12.5hr (1) 6～9hr (12) CCPD患者で10hr (Lee C, et al: Perit Dial Int 2018 PMID: 29311199) PD患者で6.2hr (米田尚生, 他: 透析会誌 31: 1437-1442, 1998)

【蛋白結合率】26.1～31.6% (1) 40% (13) 20～40% (U, 12)

【Vd】111～117L/man (1) 3L/kg (14) 2.2L/kg (13) 2.5L/kg (12) 2L/kg (U)

【分布】フルオロキノロン薬は腎、胆嚢、肝、肺、婦人科領域臓器、前立腺、食細胞、尿、痰、胆汁などの体液、臓器に高濃度で分布し、本剤は皮膚、脂肪、筋肉、骨、軟骨にも分布し、脳脊髄液にも移行するが髄膜に炎症がないときで血清ピーク値の10%程度 (U) 皮膚、皮下組織、末梢脂肪組織への移行は低い (Daschner FD, et al:

Eur J Clin Microbiol 5: 212-3, 1986)

【MW】 331.35

【透析性】 10%程度除去される (1) HD, PD とも除去率 10%未満 (U)

【TDM のポイント】 有効治療域 0.03~8 $\mu\text{g/mL}$ (14) 通常は TDM の対象にならない。グラム陰性菌による sepsis には AUC/MIC 250 以上が有効性のブレイクポイント (Zelenitsky SA and Ariano RE: J Antimicrob Chemother 65:1725-1732, 2010) 【O/W 係数】 0.0799 [1-オクタノール水系, pH7] (1) 0.60 (オクタノール/リン酸 buffer, pH7.4) (U,11) 【pKa】 6.5, 8.9 (1)

【相互作用】 CYP1A2 を阻害する (1) リファンピシン併用による影響を受けない (Chandler MH, et al: Antimicrob Agents Chemother 34: 442-7, 1990) 【併用禁忌】 ケトプロフェン: 痙攣を誘発するおそれ (1) チザニジンの Cmax が 7 倍, AUC が 10 倍それぞれ上昇し, 血圧低下, 傾眠, めまい等があらわれたとの報告 (Granfors MT: Clin Pharmacol Ther 76:598-606, 2004) があるため併用禁忌 (1)

【併用注意】 肝薬物代謝酵素の競合によりテオフィリンクリアランスが低下し, テオフィリンの血中濃度を上昇させる。シクロスポリンの代謝酵素を阻害する。プロピオン酸系 NSAIDs (ロキソプロフェンなどは痙攣をおこすことがある)。ワルファリンの作用を増強する。シクロスポリンの代謝酵素を阻害する。Al, Mg, Fe, Ca などの金属カチオンとの併用により吸収低下するため, 金属カチオン製剤は食間投与すること。CaCO₃ との併用時も同時服用は避ける (1) 塩酸セベラマーもしくは酢酸 Ca と同時投与によりバイオアベイラビリティが 48%低下する (Kays MB, et al: Am J Kidney Dis 42: 1253-9, 2003) SU 剤併用時の低血糖の原因として SU 剤の代謝阻害やインスリン分泌刺激作用が推定 (1)

【備考】 血管痛や静脈炎の危険を軽減するため, 原則として希釈して投与するが側管から点滴してもよい。希釈できない場合は原液投与も可能であるが, できるだけ太い血管を選択する (1) 注射剤で炭疽菌の治療を行った場合, 臨床症状が緩解した場合には速やかに経口剤に切り替え, 計 60 日間投与を行う (1)

【更新日】 20220505

※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。