

## ◎グレースピット錠・▼細粒 [内]

【重要度】★★ 【一般製剤名】シタフロキサシン水和物 Sitafloracin Hydrate 【分類】キノロン系抗菌剤

【単位】◎50mg/錠, ▼10%細粒

【常用量】1回100mgを1日1回1回(または50mgを1日2回) [最大1回100mg 1日2回]

【その他の報告】市中気道感染に対して100mg分1と分2で比較すると効果は同等だが、高いピーク濃度が得られる特性から(そのようなケースには)分1投与を推奨

(Kohno S, et al: J Infect Chemother 19: 486-94, 2013 PMID: 23525983)

【用法】1日1回(または1日2回) ※原則1日1回に設定 (5)

【透析患者への投与方法】HDで23%除去されるので、50mg/日 [HD日はHD後投与 [これにより健康人に100mg/日投与時と同程度の濃度が得られる] (Tsuruoka S, et al: Ther Apher Dial 17: 319-24, 2013)]

【その他の報告】50mg/日か100mgを週3回HD後 (5)

【PD】データがないが、末期腎不全患者の用量に準じて50mg/2日に設定して必要期間もしくは50mg/日をごく短期間 (5)

【保存期CKD患者への投与方法】原則分割投与は行わない (5)

Ccr 50mL/min以上: 100mg 1日1回, Ccr 30~49mL/min: 50mg 1日1回, Ccr 10~29mL/min: 1回50mgを48hr以上の間隔 [常用量100mgとした場合の体重60kgでの推測] (1)

【その他の報告】慎重投与: 血中濃度が上昇するため投与量、投与間隔を調節する (1)

60≤Ccr<90: 減量の必要なし, 30≤Ccr<60: 1日1回50mg (中島光好, 河田幸道: 日治療誌 56: 21-24, 2008)

【特徴】DNAジャイレース, トポイソメラーゼIVを阻害する。組織移行性に優れた経口キノロン。

【主な副作用・毒性】ショック, アナフィラキシー, SJS, 急性腎不全, 肝機能障害, 血小板減少, 錯乱, 幻覚, 偽膜性大腸炎, 下痢, 軟便, 頭痛など

【安全性に関する情報】下痢が起こりやすく, 高用量投与時は注意 (神田裕子, 他: 日薬理誌 133:43-51, 2009) アキレス腱障害のリスク上昇を検出せず (Chinen T, et al: Ann Fam Med 2021 PMID: 34180840)

【吸収】食事の影響を受けない (Nakashima M, et al: Antimicrob Agents Chemother 39:170-174, 1995)

【F】70%以上 (1) 80%以上と思われる (5) 89% [84-94%] (O' Grady J, et al: Xenobiotica 31:811-822, 2001)

【tmax】1.2~2.0hr (1) 1.0~1.3hr (Nakashima M, et al: Antimicrob Agents Chemother 39:170-174, 1995) 0.85~1.21hr (Wu G, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 52: 1037-44, 2014 PMID: 25250613) 100mg投与後のCmax 1μg/mL程度 (1)

【代謝】代謝物としてグルクロナイド, 7'-オキシ体, 7'-S-水酸化体, 7'-S-水酸化体グルクロナイド, N-アセチル抱合体が同定されているが, ほとんど代謝を受けない (1) CYP1A1と1A2に対して弱い阻害作用を示すが, 2C9, 2D6, 3A4の阻害はしない (1) アシルグルクロニドの生成にはUGT1A1が主に関与している (Tachibana M, et al: Drug Metab Dispos 33: 803-11, 2005)

【排泄】尿中未変化体排泄率72% [po, 48hrまで] (1) 75% (42~101%) [iv, 48hrまで] 61% (22~86%) [po, 48hrまで] (O' Grady J, et al: Xenobiotica 31: 811-22, 2001) 69~74% [48hrまで] (Nakashima M, et al: Antimicrob Agents Chemother 39:170-4, 1995)

【CL】CL/F 327±57mL/min (1) 263mL/min (iv), 腎CL198mL/minで尿管分泌の寄与を示唆 (O' Grady J, et al: Xenobiotica 31: 811-22, 2001)

【t1/2】7hr (O' Grady J, et al: Xenobiotica 31: 811-22, 2001) 4.4~5.0hr (Nakashima M, et al: Antimicrob Agents Chemother 39:170-4, 1995) 6hr (神田裕子, 他: 日薬理誌 133: 43-51, 2009) 5.19~6.28hr (Wu G, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 52: 1037-44, 2014 PMID: 25250613)

【腎障害患者のt1/2】Ccr 60~89mL/min: 7.5±1.3hr, Ccr 30~59mL/min: 11.5±2.2hr, Ccr 10~29mL/min: 16.3±2.1hr (神田裕子, 他: 日薬理誌 133: 43-51, 2009)

【蛋白結合率】46%~55% (1) 約50% (Nakashima M, et al: Antimicrob Agents Chemother 39: 170-4, 1995)

【Vd/F】2.3~2.8L/kg (1) 150L/man [iv] (O' Grady J, et al: Xenobiotica 31: 811-22, 2001) 1L/kg以上で組織移行性に優れている (Nakashima M, et al: Antimicrob Agents Chemother 39: 170-4, 1995) 前立腺液/血清中濃度比は0.287~0.506で他のキノロンと同様, 移行性は良好である (守殿貞夫, 他: 日治療誌 60: 492-5, 2012)

【MW】436.84

【透析性】資料なし (1) 4hrのHD [平均QB204], QD500, PS膜, 平均面積1.5]で濃度低下率53%, 除去率23%, リバウンドなし (Tsuruoka S, et al: Ther Apher Dial 17: 319-24, 2013)

【薬物動態】線形動態 (Wu G, et al: Int J Clin Pharmacol Ther 52: 1037-44, 2014 PMID: 25250613)

【TDMのポイント】呼吸器感染症におけるPK-PD解析では, 原因菌の消失にはAUC/MICまたはCmax/MICが関連するパラメータである (神田裕子, 他: 日薬理誌 133:43-51, 2009) 軽度~中等度気道感染症に対する効果に関連するPK-PDパラメータはfAUC/Cmax 30以上, fCmax/MIC 2以上である (Tanigawara Y, et al: J Infect Chemother 19: 858-66, 2013 PMID: 23529500)

【O/W係数】0.244 [1-オクタノール系] (1)

【相互作用】金属イオン製剤との併用によりAUCは25~68%, Cmaxは18~63%低下するため同時投与を避ける (神田裕子, 他: 日薬理誌 133:43-51, 2009) ラニチジン併用によっても体内動態の変化は認めない (柴孝也: 日治療誌 56 (S1): 32-35, 2008)

【主な臨床報告】呼吸器感染, 複雑性尿路感染, 耳鼻咽喉科感染には1回50mg 1日2回, 有熱性複雑性腎盂腎炎には1回100mg 1日2回の臨床試験成績がある (日治療誌 56: S1, 2008)

【更新日】20210701

※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。