

## ◎ロセフィン静注用 [注]

【重要度】★★ 【一般製剤名】セフトリアキソン ナトリウム水和物 (U) Ceftriaxone Sodium Hydrate [CTRX] 【分類】セフェム系抗生物質製剤

【単位】▼0.5g・○1g/V

【常用量】■通常：1～2g/日

■難治性又は重症感染症：最大 4g/日

■淋菌感染症：咽頭・喉頭炎，尿道炎，子宮頸管炎，直腸炎には 1g を単回，精巣上体炎，骨盤内炎症性疾患には 1g/日

【用法】1日 1～2回静注，点滴静注（30分以上かけて）

Ca 含有輸液との混注，同時投与を避ける

【透析患者への投与方法】1日 1回 1g [HD 後] (5) 2g 適用する場合は数日まで (5) 初回投与は必ずしも HD 後でなくてもよいが，必要に応じ初日のみ HD 後追加可 (5)

【その他の報告】減量の必要なし（サンフォード感染症治療ガイド）通常用法（3,4,10）1～2g を 24hr 毎（6,7）HD 後に 1g（5）外来通院 HD 時の投与方法：重症時もしくは次回投与まで 48hr を超える場合には毎 HD 後に 2g 投与，その他は毎 HD 後に 1g 投与（Simon N, et al: Clin Pharmacokinetics 2006 PMID: 16640454）

2g/日 9 日間で肝機能障害と中枢毒性発現（Inoue Y, et al: Kidney Int Rep 2017 PMID: 29270508）

2g/日 3 日間で舞踏様症状を発現した症例（Tan ML, et al: Cureus 2019 PMID: 31723523）

2g/日 2 日間で意識障害を発現した 80 歳代女性の症例（高野知憲，他：第 70 回日本化学療法学会 O2-074）

1g/日 10 日間で意識障害を発現した低 Alb 血症のある透析症例（Nishioka H, et al: Int J Infect Dis 2022 PMID: 35063677）

MIC 1  $\mu$ g/mL 未満なら 2g×週 3 回が適用できるが HD 中投与をお避ける [ピリルピンが高値なら 1回 1g でもよい]（Tsai D, et al: J Antimicrob Chemother 2023 PMID: 37367723）

2g/日 5～10 日間で脳症を認めた 2 症例（Onogi C, et al: Hemodial Int 2022 PMID: 35441472）

【PD】PD 腹膜炎に 1日 1回 1g を腹腔内投与（Li PK, et al: Perit Dial Int 2022 PMID: 35264029 [ISPD 2022]）

高度の腎障害患者には 1g/日を超えない (1) 減量の必要なし (3) 1g を腹腔内に負荷投与し，125mg/L で 1日 4 回交換で 10～14 日投与で MIC 以上の濃度を保つことが可能。バンコマイシンやアミノ配糖体の様な副作用が少ない（Trimarchi H, et al: Am J Nephrol 20: 391-5, 2000）

PD 腹膜炎に対して 2g/日・3 日間の静注で急性脳症を発現した症例（Safadi S, et al: Case Rep Nephrol 2014 PMID: 25544915）

【CRRT】減量の必要なし (3) 全身 CL (7.46mL/min) の 70% が CRRT クリアランスであり，半減期が 26.5hr に延長しているため，MIC 2  $\mu$ g/mL 以下なら 1g を 2～3 日毎投与でも良いかもしれない（Goto K, et al: J Basic Clin Physiol Pharmacol 2016 PMID: 27497425）

【保存期 CKD 患者への投与方法】高度腎機能障害患者には 1g/日を超えない (1) 腎障害患者には 2g/日を超えない (1,U)

【その他の報告】減量の必要なし（サンフォード感染症治療ガイド）Ccr 10mL/min 以上：減量の必要なし，Ccr < 10mL/min : 1g を 24hr 毎 (5)

減量の必要なし (3,7,10,12)

意識消失，意識レベル低下，痙攣，不随意運動などの精神神経症状が，高度腎障害患者で多数報告 (1)

細菌性髄膜炎への高用量投与時の腎機能に応じたノモグラム [free]（Gregoire M, et al: Antimicrob Agents Chemother 2019 PMID: 31235630）

腎不全患者における 2g/日による脳症 [2 日目より症状出現]（Takano T, et al: Cureus 2023 PMID: 37927711）

【特徴】第三世代セフェム。半減期が長く 1日 1回の投与可能。セフェム系の中では胆汁排泄率が高い。組織移行性にも優れ，特に髄液，胆汁，腹水に移行性が高い。特に脳脊髄液に治療濃度で分布するセフェムであり，細菌性髄膜炎治療に 2～4g/日（1日 1回）で使用される。

【主な副作用・毒性】ショック，アナフィラキシー，劇症肝炎，溶血性貧血，無顆粒球症，血小板減少，肝機能障害，黄疸，AKI，偽膜性大腸炎，SJS，TEN，間質性肺炎，PIE 症候群，胆石・胆嚢内沈着物 [CTRX を成分とする。小児大量投与時に多い]，腎・尿路結石など

【安全性に関する情報】透析患者に 4g/日で適用して 10 日後にジスキネジア，12 日後に意識障害，中止 5 日後に改善（廣坂雄介，他：日腎会誌 59: 752, 2017）

2g/日を 13 日投与して脳症を認めた症例 [血中濃度 100mg/L 以上，脳脊髄液濃度 10mg/L]（Suzuki S, et al: Intern Med 2019 PMID: 30799339）

【モニターすべき項目】出血時間，プロトロンビン時間，便検査（偽膜性大腸炎をチェック）

【吸収】PD 患者への腹腔内投与時，投与量の平均 74.1% が吸収（Eur J Clin Pharmacol 30: 303-7, 1986）健康人での腹腔内投与時の血中吸収率は 39%（Albin H, et al: Eur J Clin Pharmacol 31: 479-83, 1986 PMID: 3816928）

【tmax】筋注時 2～2.4hr (13) 【Cmax】1g 静注後 151  $\mu$ g/mL (1) 1g を 30 分点滴を 1日 2 回投与し定常状態の Cmax は 168  $\mu$ g/mL，同様に筋注後の定常状態 Cmax は 114  $\mu$ g/mL (13)

【代謝】代謝されない (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 30～65% (10) 46% (7) 50% (14) 30～65% (12) 55% (4) 49% (13) 約 50% [iv, 24hr まで] (1) 胆汁中排泄率 45% (4) 尿中に代謝物は確認されない (1)

【CL】0.92±0.04L/hr [iv] (1) 0.23mL/min/kg (7) 0.24mL/min/kg，腎不全・高齢者で低下，肝硬変で上昇 (13)

【透析患者の CL】0.19mL/min/kg (7) 14.0mL/min (Eur J Clin Pharmacol 31: 479-83, 1986) 0.36 L/h (Simon N, et al: Clin Pharmacokinetics 45: 493-501, 2006)

【非腎 CL/総 CL】50% (10)

【t1/2】 6.0～8.0hr (2) 7～9hr (10) 7hr (14) 7.3hr、腎不全・高齢者で延長 (13)7～9hr (12)  $ke=0.19\pm 0.01/hr$  (1) 【透析患者の t1/2】 12～24hr (4,10) 12hr (6) 14.7hr (7) 12～24hr (12)  $t1/2\beta 27.5hr$  (Simon N, et al: Clin Pharmacokinet 45: 493-501, 2006) 【PD 患者の t1/2】 1g 静注時 12.3hr (Eur J Clin Pharmacol 31: 479-83,1986)

【蛋白結合率】 85～95% (U) 90～95% (13) 90% (12) 96.3～83.3% (1) 測定法により異なり 70～85%程度で、高濃度で飽和する (Sanz-Codina M, et al: J Antimicrob Chemother 2023 PMID: 36433819) 【透析患者の蛋白結合率】 88% (7) 95%(11)

【Vd】 0.12～0.14L/kg (U)  $Vdss=9.63\pm 0.46L/body$  (1) 0.1～0.2L/kg (10,14) 0.16L/kg ((13) 0.12～0.18L/kg (12) 【透析患者の Vd】 0.21L/kg (7)  $Vc$  4.53L,  $Vt$  9.54L/man (Simon N, et al: Clin Pharmacokinet 45: 493-501, 2006) 【PD 患者の Vd】 0.18L/kg (Eur J Clin Pharmacol 31: 479-83, 1986)

【MW】 661.60

【透析性】 除去されない (U) 5%以下 (4) 透析クリアランスは非 HD 時の 10 倍 [QB 不明] (Tsai D, et al: J Antimicrob Chemother 2023 PMID: 37367723) 少なくとも遊離型分率の割合が除去されるため、通常は HD 後投与を選択 [初回を除く] (1)

【透析 CL】 12～31mL/min (7) 【透析時 t1/2】 5～16hr (7)

【PD】 投与量の 5.5%が排液中に排泄, PD クリアランス 0.59mL/min (Eur J Clin Pharmacol 31: 479-83,1986)

【TDM のポイント】 TDM の対象にならない。有効治療域 0.2～8  $\mu g/mL$  (14) 腎不全を含む特殊病態下での TDM の有用性示唆 (Dailly E, et al: Therapie 67: 145-9, 2012 PMID: 22850101 [abstract])

【O/W 係数】  $1.26\times 10^{-4}$  (1) 【pKa】 1.72, 3.15, 4.34 (1)

【配合変化】 アミノグリコシド系抗生物質と混合しない。Ca 含有輸液と配合しない (1) 高濃度 Ca 製剤併用は有害転帰の増大に関連せず安全と思われる (Dalton RR, et al: Ann Pharmacother 44:1158-63, 2010)

【更新日】 20240706

---

※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。