

▼シベクトロ錠 [内]・▼点滴静注 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 テジゾリド リン酸エステル Tedizolid Phosphate 【分類】 抗菌薬 [オキサゾリジノン系]

【単位】 ▼200mg/錠, ▼200mg

【常用量】 200mg/日

【用法】 1日1回

■1hrかけて点滴静注 [溶剤液は注射用水 4mLとし、生食 250mLで希釈する (二価カチオン含有液不可)]

【透析患者への投与方法】 透析性も低く AUC も同程度であり減量の必要なし (Flanagan S, et al: Antimicrob Agents Chemother 58: 6471-6, 2014 PMID: 25136024)

【CRRT】 PS 膜に吸着するものの投与量を調節するほどの影響はないだろう (Lewis SJ, et al: Blood Purif 40: 66-71, 2015 PubMed PMID: 26138225)

【保存期 CKD 患者への投与方法】 腎機能は PK に影響せず減量の必要なし (Flanagan S, et al: Antimicrob Agents Chemother 58: 6471-6, 2014 PMID: 25136024)

【その他の報告】 高齢者でも PK 変化なし (Flanagan SD, et al: Clin Pharmacol Drug Dev 2018 PMID: 29319932)

【特徴】 オキサゾリジノン系抗菌剤。MRSA による皮膚感染症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、びらん・潰瘍の二次感染に適用。

MRSA, CNS, 腸球菌に抗菌スペクトラムを有する (McBride D, et al: Expert Opin Drug Metab Toxicol 13: 331-337, 2017 PMID: 28140693)

【主な副作用・毒性】 偽膜性大腸炎、可逆的骨髄抑制、肝障害、消化器症状、過敏症、皮膚障害、発熱、注射部位反応など

【安全性に関する情報】 ごく軽度で可逆的な MAO-A, B 阻害作用がある (Flanagan S, et al: Antimicrob Agents Chemother 57: 3060-6, 2013 PMID: 23612197) ミトコンドリア障害のポテンシャルがリネゾリドより低く、骨髄障害の軽微に関連している可能性 (Flanagan S, et al: Antimicrob Agents Chemother 59: 178-85, 2015 PMID: 25331703) 血球系の異常や消化器症状がリネゾリドより有意に少ない (Ortiz-Covarrubias A, et al: Braz J Infect Dis 20: 184-92, 2016 PMID: 26859064) 400mg/日の投与は血小板減少のため許容されない (Lodise TP, et al: J Antimicrob Chemother 71: 2553-8, 2016 PMID: 27317442)

血小板減少はリネゾリド、テジゾリド共に多い (Lee EY, et al: Antimicrob Agents Chemother 2017 PMID: 29038274)

【吸収】 食事の影響を受けない (Flanagan SD, et al: Pharmacotherapy 34: 240-50, 2014 PMID: 23926058)

【F】 82.6% (1) 91% (Flanagan S, et al: Pharmacotherapy 34: 891-900, 2014 PMID: 24989138) 86% (Flanagan S, et al: Antimicrob Agents Chemother 58: 6462-70, 2014 PMID: 25136028) 85.5% (Chen R, et al: Clin Ther 38: 1869-79, 2016 PMID: 27461846) 95.2% (Kim Y, et al: Clin Ther 39: 1849-1857, 2017 PMID: 28865799) 注射と経口の切り替えは同量 (1)

【tmax】 1.28hr (Ong V, et al: Drug Metab Dispos 42: 1275-84, 2014 PMID: 24875463) 1.5~2.5hr (Kim Y, et al: Clin Ther 39: 1849-1857, 2017 PMID: 28865799)

【代謝】 硫酸塩抱合される [活性なし] (Ong V, et al: Drug Metab Dispos 42: 1275-84, 2014 PMID: 24875463)

【排泄】 糞便中の 80~90%排泄され、硫酸塩抱合体がメイン (Ong V, et al: Drug Metab Dispos 42: 1275-84, 2014 PMID: 24875463) 尿中回収率 18% [po, 288hr まで] (1)

【CL/F】 6.33L/hr (1)

【t_{1/2}】 9.23hr (Housman ST, et al: Antimicrob Agents Chemother 56: 2627-34, 2012 PMID: 22330925) 半減期はリネゾリドの 2 倍程度であり 1 日 1 回投与が可能 (Flanagan SD, et al: Pharmacotherapy 34: 240-50, 2014 PMID: 23926058) 10.6hr (Ong V, et al: Drug Metab Dispos 42: 1275-84, 2014 PMID: 24875463) 投与ルートにかかわらず 10hr (Chen R, et al: Clin Ther 38: 1869-79, 2016 PMID: 27461846)

【蛋白結合率】 80% (1) 89% (Housman ST, et al: Antimicrob Agents Chemother 56: 2627-34, 2012 PMID: 22330925) 87% (Sahre M, et al: Int J Antimicrob Agents 40: 51-4, 2012 PMID: 22584101)

【Vd】 Vc=51L/man (1) 108L/man, 気管支肺胞洗浄液、肺胞マクロファージへの移行性は血中遊離型濃度の 20~40 倍 (Housman ST, et al: Antimicrob Agents Chemother 56: 2627-34, 2012 PMID: 22330925) 間質液濃度はと血中遊離型濃度と同程度 (Sahre M, et al: Int J Antimicrob Agents 40: 51-4, 2012 PMID: 22584101) DM 性足病変部位への移行性は健康人の組織間液への移行率と同程度 (Stainton SM, et al: Antimicrob Agents Chemother 62: e01880-17, 2017 PMID: 29109162)

【MW】

【透析性】 HD 前後の濃度変化率 10% (1) 4hrHD で 10%が除去されるのみ (Flanagan S, et al: Antimicrob Agents Chemother 58: 6471-6, 2014 PMID: 25136024) ほとんど除去されない (1)

【薬物動態】 PK は肥満の影響をほぼ受けず、用量調節の必要はない (Pai MP: Antimicrob Agents Chemother 60: 4585-9, 2016 PMID: 27185808) AUC は理想体重と負に相関 (Flanagan S, et al: Antimicrob Agents Chemother 2016 PMID: 26926636)

【OW 係数】

【相互作用】 腸管 BCRP を阻害し、基質薬剤 (ロスバスタチン等) の吸収亢進 (1)

【肝障害患者への投与方法】 中等度~高度肝障害が AUC が 22~34%上昇 (Flanagan S, et al: Antimicrob Agents Chemother 58: 6471-6, 2014 PMID: 25136024)

【小児 CKD 患者における報告】

【妊婦・授乳婦への投薬】

【主な臨床報告】 皮膚軟部組織感染症においてリネゾリドと比較した phase III 試験で有効性は同程度、安全性に優れる可能性 (Mikamo H, et al: J Infect Chemother 2018 PMID: 29530544)

【更新日】 20211009

※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。