

▼ゲンタシン注 [注]

【重要度】★★★ 【一般製剤名】 ゲンタマイシン硫酸塩 (GM) (U) Gentamicin Sulfate 【分類】 アミノ配糖体系抗生物質

【単位】 ▼10mg/1mLA・▼40mg/1mLA・▼60mg/1.5mLA

【常用量】 80～120mg/日

【その他の投与方法】 GNR に対する標準治療としていずれもトラフ $1\mu\text{g/mL}$ 未満を目標とし、高 MIC で重症なら 7mg/kg を 1 日 1 回 (ピーク 15～20, 5 日以内の使用とする), 低 MIC で中等症以下なら 5mg/kg を 1 日 1 回 (ピーク 8～10), 尿路感染なら 3mg/kg を 1 日 1 回 (目標ピーク設定なし) (抗菌薬 TDM ガイドライン 2016)

■IE の場合, 1mg/kg を 12hr 毎または 8hr 毎

【用法】 1 日 2～3 回

■1 日 1 回投与の方が効果が高く腎毒性が低い報告が多い; 体重 60kg 以上では 160mg を 1 日 1 回投与する (U)

■IE の経験的治療には 1 回 1mg/kg の 1 日 3 回投与にて併用薬との相乗効果をねらう

【透析患者への投与方法】 初回 2.5mg/kg , 維持量 1.7mg/kg HD 後 [2 回目の維持量投与予定の HD 前のトラフ $3\sim 5\mu\text{g/mL}$ 未満として調節] (抗菌薬 TDM ガイドライン 2016)

【その他の報告】

HD 後に 3mg/kg [血中濃度をモニター] (サンフォード感染症治療ガイド)

初回投与量 40mg , 維持量 20mg を 24～48hr おきに投与 (1) 50%に減量 [HD 後] (12) 20～30%に減量して 24hr おきに投与 (10)

20～30%量を 1～3 日毎 (3)

感染症の重症度にあわせて塩基として $1\sim 1.7\text{mg/kg}$ を透析後に投与 (U,17) 常用量の 1/2 量を HD 後に投与 (12)

ICU 領域で HD60 分前に 30 分点滴で 6mg/kg 投与により C_{max} , AUC/MIC パラメータでの有効レベルを得る (Veinstein A, et al: Antimicrob Agents Chemother 57: 977-82, 2013)

【PD】 PD 腹膜炎に 1 日 1 回 0.6mg/kg ip (Li PK, et al: Perit Dial Int. 2022 PMID: 35264029 [ISPD 2022])

PD 液に $3\sim 4\text{mg/L}$ の濃度で添加 (12) PD 液に $4\sim 8\text{mg/L}$ の濃度で添加 (17)

PD 液に 0.6mg/kg 添加すると PD 液中の C_{max} は対象最近に対する MIC の 8 倍であり, C_{max} は $3\mu\text{g/mL}$ (Varghese JM, et al: Clin J Am Soc Nephrol 7: 1249-56, 2012)

腹腔内投与としてのブレイクポイント MIC は 0.6mg/kg で 2mg/L , 1.2mg/kg で 4mg/L (Farkas A, et al: Antimicrob Agents Chemother 2022 PMID: 34902267)

【CRRT】 2mg/kg を 24hr 毎 (Kuang D, et al: Clin Nephrol 67: 267-84, 2007) $1.5\sim 2.5\text{mg/kg}$ を 24～48hr 毎 (17) 初回 3mg/kg , $Q_{\text{outflow}} 0.8\text{L/hr}$ ならば 0.8mg/kg ～を 24hr 毎, GPC ターゲットの併用療法では 0.4mg/kg を 24～36hr 毎 (抗菌薬 TDM ガイドライン 2022)

【保存期 CKD 患者への投与方法】

●高 MIC で重症: $e\text{GFR } 80 [\text{mL}/\text{min}/1.73\text{m}^2]$ 以上: 7mg/kg 24hr 毎, $e\text{GFR } 60\sim 79$: 5mg/kg 24hr 毎, $e\text{GFR } 40\sim 59$: 4mg/kg 24hr 毎, $e\text{GFR } 30\sim 39$: 5mg/kg 48hr 毎, $e\text{GFR } 20\sim 29$: 4mg/kg 48hr 毎, $e\text{GFR } 10\sim 19$: 3mg/kg 48hr 毎 [原則 5 日以内の使用]

●低 MIC で中等症以下: $e\text{GFR } 80 [\text{mL}/\text{min}/1.73\text{m}^2]$ 以上: 5mg/kg 24hr 毎, $e\text{GFR } 60\sim 79$: 4mg/kg 24hr 毎, $e\text{GFR } 50\sim 59$: 3.5mg/kg 24hr 毎, $e\text{GFR } 30\sim 49$: 2.5mg/kg 24hr 毎, $e\text{GFR } 20\sim 29$: 4mg/kg 48hr 毎, $e\text{GFR } 10\sim 19$: 3mg/kg 48hr 毎 (抗菌薬 TDM ガイドライン 2016)

【その他の報告】 $\text{GFR } 10\sim 50\text{mL}/\text{min}$: 30～70%を 12hr おき, $\text{GFR} < 10\text{mL}/\text{min}$: 20～30%を 24～72hr おき (3)

血中濃度に応じて調節 (7)

$\text{Ccr} > 50\text{mL}/\text{min}$: 常用量を 8～12hr おき, $\text{Ccr } 10\sim 50\text{mL}/\text{min}$: 常用量を 12hr おき, $\text{Ccr} < 10\text{mL}/\text{min}$: 常用量を 24hr おき (10)

1 回量 1.7mg/kg で $\text{GFR} > 50\text{mL}/\text{min}$: 常用量の 60～90%を 8～12hr おき又は 100%を 12～24hr おき, $10 \leq \text{GFR} \leq 50$: 常用量の 30～70%を 12hr おき又は 100%を 24～48hr おき, $\text{GFR} < 10\text{mL}/\text{min}$: 常用量の 20～30%を 24～48hr おき又は 100%を 48～72hr おき (1,12,18)

$\text{GFR} > 50\text{mL}/\text{min}$: 初回 $2\sim 2.5\text{mg/kg}$, 以後 1.7mg/kg を 8～12hr 毎, もしくは $4\sim 7\text{mg/kg}$ [巴満者は 9mg/LBM] を 24hr 毎, $\text{GFR } 10\sim 50\text{mL}/\text{min}$: 初回 $2\sim 2.5\text{mg/kg}$, 以後 1.7mg/kg を 24～48hr 毎, $\text{GFR } 10\text{mL}/\text{min}$ 未満: 1.7mg/kg を 72hr 毎 (17)

$\text{Ccr } 51\sim 90\text{mL}/\text{min}$: $5\sim 7\text{mg/kg}/24\text{hr}$ または $1.7\sim 2.3\text{mg/kg}/8\text{hr}$, $\text{Ccr } 10\sim 50\text{mL}/\text{min}$: $1.7\text{mg/kg}/12\sim 48\text{hr}$, $\text{Ccr } 10\text{mL}/\text{min}$ 未満: $1.7\text{mg/kg}/48\sim 72\text{hr}$ (サンフォード感染症治療ガイド)

腎毒性が強いのでできるだけ選択しない (5)

■1 日 1 回法: $\text{Ccr } 80\text{mL}/\text{min}$ 超: $5.1\text{mg/kg}/24\text{hr}$, $\text{Ccr } 60\sim 80\text{mL}/\text{min}$: $4\text{mg/kg}/24\text{hr}$, $\text{Ccr } 40\sim 60\text{mL}/\text{min}$: $3.5\text{mg/kg}/24\text{hr}$, $\text{Ccr } 30\sim 40\text{mL}/\text{min}$: $2.5\text{mg/kg}/24\text{hr}$, $\text{Ccr } 20\sim 30\text{mL}/\text{min}$: $4\text{mg/kg}/48\text{hr}$, $\text{Ccr } 10\sim 20\text{mL}/\text{min}$: $3\text{mg/kg}/48\text{hr}$, $\text{Ccr } 10\text{mL}/\text{min}$ 未満: $2\text{mg/kg}/72\text{hr}$ (サンフォード感染症治療ガイド)

【特徴】 アミノグリコシド系の中で聴器毒性、腎毒性が最も強いが抗菌力が優れている。緑膿菌、大腸菌、エンテロバクター、肺炎桿菌、インドール変形菌、セラチアなどに対して強い抗菌力を示す。但し肺炎球菌、溶血連鎖球菌、リケッチア、真菌に対する効果はほとんどない。

【副作用】 高血中濃度を持続すれば聴覚障害、めまい、ふらつき、腎障害、運動失調、筋麻痺が現れる。悪心、肝障害、呼吸抑制、過敏症、胃腸障害、造血器障害、VK・VB 欠乏

【モニターすべき項目】 聴覚機能、腎機能、内耳機能、尿検査 (アルブミン、円柱、細胞)

【F】 経口 0% (14) 筋注 100%近く (13)

【tmax】0.3~0.75hr [im] (13) 【Cmax】100mgを単回1時間点滴後のCmaxは4.9 μ g/mL、100mg単回筋注後のCmaxは5.0 μ g/mL (13)

【代謝】代謝されない (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率90% (14) 90%以上 (13) 90~98% (10) 95% (12)

【CL】(0.82CLCr+0.11) mL/min、肥満で低下 (13) 【透析患者のCL】非透析時5.9mL/min (Vercaigne LM, et al: Clin Pharmacokinet 43: 206-10,2004) 非HD時0.453L/hで残存腎機能に関連 (Teigen MM, et al: J Clin Pharmacol 46: 1259-67, 2006)

【t1/2】1~4hr (11) 2hr (14) 2~5hr (10) 1.8~5hr (12) 2~3hr, t1/2terminalは臓器からゆっくりと遊離するため53hrと長い (13) 【腎不全患者のt1/2】30~50hr (10) 40~96hr (12) 非透析時48hr、透析時3hr (Vercaigne LM, et al: Clin Pharmacokinet 43: 206-10, 2004) PD患者で24.7hr (Varghese JM, et al: Clin J Am Soc Nephrol 7: 1249-56, 2012)

【蛋白結合率】25%以下 (11) 10%以下 (13) 5%未満 (12)

【Vd】0.25L/kg (14) 0.23~0.26L/kg (12) 0.31L/kg、肥満患者で低下 (13) 透析患者0.288L/kg (Vercaigne LM, et al: Clin Pharmacokinet 43: 206-10, 2004) PD患者で0.3L/kg (Varghese JM, et al: Clin J Am Soc Nephrol 7: 1249-56, 2012)

【MW】約700

【透析性】4~6hrの透析で血中濃度は最大50%低下する (U) 【HDクリアランス】91mL/min (Vercaigne LM, et al: Clin Pharmacokinet 43: 206-10,2004) 4.69 L/hr (Teigen MM, et al: J Clin Pharmacol 46: 1259-67,2006)

【PD】20% (Lam YW, et al: Clin Pharmacokinet 32: 30-57,1997) 48~72hrで約25%除去される (U) 【PDクリアランス】2.9mL/min (Lam YW, et al: Clin Pharmacokinet 32: 30-57,1997)

【TDMのポイント】臨床効果および細菌学的効果はCpeak/MICと相関し、8~10以上が必要 (抗菌薬TDMガイドライン2016)

目標ピーク濃度4~10 μ g/mL [最大10 μ g/mL]、トラフ2 μ g/mL以下 (U, SRL検査案内) トラフを1 μ g/mL以下にする (17)

有効治療域：ピーク濃度を6~10 μ g/mL、トラフ濃度を2 μ g/mL以下にする。ピーク値の採血は点滴終了時 (点滴時間は0.5~1時間) に、点滴と逆の腕より採血し、トラフ値の測定は次回投与直前に行う。細胞外液量の増大に伴い、Vdが上昇するため、浮腫、胸水、腹水貯留患者では血中濃度は低下する。Vdが増加している例では通常予想される半減期より延長することが多い。また発熱時ではアミノ配糖体系抗生剤は腎血流量の増加により血中濃度が40%程度低下する (Pennington JE, et al: J Infect Dis 132: 270-5,1975)

【OW係数】低い (11)

【相互作用】ピペラシリンと併用するとin vivoでもゲンタマイシンの半減期が短縮する (Halstenson CE, et al: Antimicrob Agents Chemother 36: 1832-1836,1992)

【更新日】20221228

※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。