

## ◎エクサシン注射液 [注]

【重要度】★★★ 【TDM】 【一般製剤名】イセパマイシン硫酸塩 (ISP) isepamicin 【分類】アミノグリコシド系抗生物質

【単位】◎200mg・▼400mg/A [2mL]

【常用量】400mg/日【その他の報告】15 mg/kg を1日1回か 7.5 mg/kg を1日2回 (Tod M, et al: Clin Pharmacokin 38: 205-23,2000)

【用法】筋注又は点滴静注。点滴時間：400mg 投与時は1時間，200mg 投与時は0.5～1時間

【透析患者への投与方法】初回300～400mg (6～8mg/kg)，以後は透析後に200～300mg (4～6mg/kg) (5)

【その他の報告】透析後に2～3mg/kg，PDでは1～1.5mg/kgを48時間毎 (透析会誌 26: 1299-1303,1993)

【PD】初回200mg，以後維持量1日1回100mgを腹腔内投与 (5)

【保存期CKD患者への投与方法】腎毒性を有するためできるだけ選択しない (5)

【その他の報告】Ccr>40mL/min：8mg/kg/24hr 毎，Ccr 20～40mL/min：8mg/kg/48hr 毎，Ccr 10～20mL/min：8mg/kg/72hr 毎，Ccr<10mL/min：8mg/kg/96hr 毎 (サンフォード感染症治療ガイド)

【その他の報告】中等度腎障害では8 mg/kg を24hr 毎，Ccr 10～19mL/min：72hr 毎，Ccr 6～9mL/min：96hr 毎 (Tod M, et al: Clin Pharmacokin 38: 205-23, 2000)

【特徴】グラム陰性菌に強い抗菌力 (ゲンタマイシンと同等、アミカシンより強力)。多くの不活性化酵素に安定なため耐性菌が少ない。腎・聴器毒性、神経筋遮断作用 (麻酔薬、筋弛緩薬との併用で呼吸抑制が起こることがある) は弱い

【主な副作用・毒性】高血中濃度を持続すれば聴器毒性、めまい、ふらつき、悪心、運動失調、腎障害、肝障害、筋麻痺、呼吸抑制、過敏症、胃腸障害、造血器障害、VK・VB 欠乏など

【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)

【tmax】0.8hr [im] (1)

【代謝】代謝されない (1)

【排泄】尿中未変化体排泄率 80～94% [iv, 24hr まで] (1)

【CL】1.1～1.3mL/min/kg (Barr WH, et al: J Chemother 7 Suppl 2:53-61,1995) 83mL/min [im] (1) 【腎 CL】75.8mL/min (1)

【t1/2】 $\alpha$ 相0.17 hr， $\beta$ 相2.1 hr， $\gamma$ 相34 hr (Barr WH, et al: J Chemother 7 Suppl 2: 53-61,1995) 2～2.5hr (J Chemother 7 Suppl 2: 53-61,1995) 2～3hr (Tod M, et al: Clin Pharmacokin 38: 205-23, 2000) 【透析患者の t1/2】47.9hr (Antimicrob Agents Chemother 36: 1832-6,1992)

【蛋白結合率】3.46～6.30% (1)

【Vd】12.31±2.75L/man (1) 0.23～0.29L/kg (J Chemother 7 Suppl 2:53-61,1995) HD患者: 0.19L/kg (Antimicrob Agents Chemother 36:1832-6,1992)

【MW】569.60

【透析性】48.9% [5hrHD] (1) 60.6% (Halstenson CE, Antimicrob Agents Chemother 35: 2382-7,1991) 【PD クリアランス】2.56±0.97mL/min (1)

【TDMのポイント】最高血中濃度 35  $\mu$ g/mL 以上，最低血中濃度 10  $\mu$ g/mL 以上の繰り返しで第8脳神経障害，腎障害が現れることがあるため，血中濃度を測定することが望ましく，ピーク値は20～30  $\mu$ g/mL，トラフ値は4～8  $\mu$ g/mL 以下を目標とする。ただし，検査会社による濃度測定は対応されていないことがある。発熱時に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: 270-275,1975) 肥満者、貧血患者では血中濃度が高くなる。30分点滴後、30分に採血し血清濃度が40  $\mu$ g/mL 以上なら最大の効果を期待でき、トラフ値を5  $\mu$ g/mL 以下にすれば毒性を最小限にできる (Tod M, et al: Clin Pharmacokin 38: 205-23,2000)

【pKa】8.25 (1) 【O/W 係数】資料なし (1)

【更新日】20180711

※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。