

日本標準商品分類番号 876241	
承認番号	100mg 16300AMY00066
	200mg 16300AMY00067
薬価収載	100mg 1988年5月
	200mg 1988年5月
販売開始	100mg 1988年7月
	200mg 1988年7月
再審査結果	100mg 1996年3月
	200mg 1996年3月
再評価結果	100mg 2004年9月
	200mg 2004年9月
効能追加	100mg 2006年2月
	200mg 2006年2月

貯法：室温、遮光した
気密容器に保存
使用期限：外箱に表示

処方箋医薬品[※]

広範囲経口抗菌剤

シプロキサシ[®]錠100mg
シプロキサシ[®]錠200mg

(シプロフロキサシン塩酸塩錠)



Ciproxan[®]100 / Ciproxan[®]200

D1

■ 禁忌 (次の患者には投与しないこと)

- (1)本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
 - (2)ケトプロフェン(皮膚外用剤を除く)を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕
 - (3)チザニジン塩酸塩を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕
 - (4)ロミタピドメシル酸塩を投与中の患者〔「相互作用」の項参照〕
 - (5)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人〔「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照〕
 - (6)小児等〔「小児等への投与」の項参照〕
- ただし、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人及び小児等に対しては、炭疽に限り、治療上の有益性を考慮して投与すること。

囊炎、胆管炎、感染性腸炎、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、涙囊炎、麦粒腫、瞼板腺炎、中耳炎、副鼻腔炎、炭疽

* 効能・効果に関連する使用上の注意

咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、感染性腸炎、副鼻腔炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」¹⁾を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

■ 用法・用量

シプロフロキサシンとして、通常成人1回100～200mgを1日2～3回経口投与する。

なお、感染症の種類及び症状に応じ適宜増減する。炭疽に対しては、シプロフロキサシンとして、成人1回400mgを1日2回経口投与する。

用法・用量に関連する使用上の注意

- (1)本剤の使用にあたっては、耐性菌の発現等を防ぐため、原則として感受性を確認し、疾病の治療上必要な最小限の期間の投与にとどめること。
- (2)小児の炭疽に対しては、米国疾病管理センター (CDC) が、シプロフロキサシンとして、1回15mg/kg体重(ただし、成人用量を超えないこと)を1日2回経口投与することを推奨している。
- (3)炭疽の発症及び進展抑制には、米国疾病管理センター (CDC)が、60日間の投与を推奨している。

■ 組成・性状

販売名	シプロキサシ錠100mg	シプロキサシ錠200mg
成分・含量	1錠中、シプロフロキサシン100mg(日局シプロフロキサシン塩酸塩水和物として116.4mg)含有	1錠中、シプロフロキサシン200mg(日局シプロフロキサシン塩酸塩水和物として232.8mg)含有
添加物	結晶セルロース、トウモロコシデンプン、クロスボビドン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール4000、酸化チタン	
色・剤形	白色～淡黄色のフィルムコーティング錠	
外形(識別コード)		
直径(mm)	8	10
厚さ(mm)	3.1	4.0
重さ(mg)	153	305

■ 効能・効果

〈適応菌種〉

シプロフロキサシンに感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、淋菌、炭疽菌、大腸菌、赤痢菌、シトロバクター属、クレブシエラ属、エンテロバクター属、セラチア属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、プロビデンシア属、インフルエンザ菌、緑膿菌、アシネトバクター属、レジオネラ属、ペプトストレプトコッカス属

〈適応症〉

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、慢性膿皮症、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、肛門周囲膿瘍、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、前立腺炎(急性症、慢性症)、精巣上体炎(副睾丸炎)、尿道炎、胆

■ 使用上の注意

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1)本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、蕁麻疹等のアレルギー症状を起こしやすい体質を有する患者
- (2)高度の腎障害のある患者〔高い血中濃度が持続するので、投与量を減量するか、あるいは投与間隔をあけて使用すること。〔「薬物動態」の項参照〕〕
- (3)てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者〔痙攣を起こすことがある。〕
- (4)重症筋無力症患者〔症状を悪化させることがある。〕
- (5)高齢者〔「高齢者への投与」の項参照〕
- (6)QT延長を起こすおそれのある患者〔QT延長を起こすことがある。〔「重大な副作用」の項参照〕〕

** (7)大動脈瘤又は大動脈解離を合併している患者、大動脈瘤又は大動脈解離の既往、家族歴もしくはリスク因子(マルファン症候群等)を有する患者〔海外の疫学研究において、フルオロキノロン系抗菌薬投与後に大動脈瘤及び大動脈解離の発生リスクが増加したとの報告がある。〔「重要な基本的注意」, 「重大な副作用」の項参照〕〕

****2.重要な基本的注意**

大動脈瘤、大動脈解離を引き起こすことがあるので、観察を十分に行うとともに、腹部、胸部又は背部に痛み等の症状があらわれた場合には直ちに医師の診察を受けるよう患者に指導すること。大動脈瘤又は大動脈解離を合併している患者、大動脈瘤又は大動脈解離の既往、家族歴もしくはリスク因子を有する患者では、必要に応じて画像検査の実施も考慮すること。【「慎重投与」、「重大な副作用」の項参照】

3.相互作用

本剤はチトクロームP4501A2 (CYP1A2) を阻害するので、本酵素で代謝される薬剤の代謝を阻害し、血中濃度を上昇させるおそれがある。

(1)併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ケトプロフェン (皮膚外用剤を除く) カピステン等	痙攣を起こすことがあるので、併用しないこと。	併用により、ニューキノロン系抗菌剤のGABA _A 受容体への阻害作用が増強され、痙攣が誘発されると考えられている。てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者、腎障害のある患者では特に注意すること。
チザニジン塩酸塩 テルネリン等	チザニジンのCmaxが7倍、AUCが10倍それぞれ上昇し、血圧低下、傾眠、めまい等があらわれたとの報告がある。チザニジンの作用を増強させるおそれがあるため、併用しないこと。	チザニジンの肝での代謝を阻害し、チザニジンの血中濃度を上昇させると考えられている。
*ロミタピドメシル酸塩 ジャクスタピッド	ロミタピドの血中濃度が著しく上昇するおそれがある。	ロミタピドの代謝酵素(CYP3A4)が阻害されるおそれがある。

(2)併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
テオフィリン アミノフィリン 水和物	テオフィリンのCmaxが17%、AUCが22%それぞれ上昇したとの報告がある ²⁾ 。テオフィリンの作用を増強させる可能性があるため、併用する場合にはテオフィリンを減量するなど適切な処置を行うこと。	テオフィリンの肝での代謝を抑制し、クリアランスを減少させるためと考えられている。肝障害のある患者、高齢者では特に注意すること。
カフェイン デュロキセチン 塩酸塩	これらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。	これらの薬剤の肝での代謝を抑制し、クリアランスを減少させるためと考えられている。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
フェニル酢酸系非ステロイド性消炎鎮痛剤 ジクロフェナク、アンフェナク等 プロピオン酸系非ステロイド性消炎鎮痛剤(ただし、皮膚外用剤以外のケトプロフェンとは併用禁忌) ロキソプロフェン、プラノプロフェン、ザルトプロフェン等	痙攣を起こすおそれがある。症状が認められた場合、両剤の投与を中止するなど適切な処置を行うこと。	併用により、ニューキノロン系抗菌剤のGABA _A 受容体への阻害作用が増強され、痙攣が誘発されると考えられている。てんかん等の痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者、腎障害のある患者では特に注意すること。
シクロスポリン	相互に副作用(腎障害等)が増強されるおそれがあるため、頻回に腎機能検査(クレアチニン、BUN等)を行うなど患者の状態を十分に観察すること。	発現機序の詳細は不明であるが、相互に肝での代謝を抑制し、一方又は両方の血中濃度が上昇するためと考えられている。肝障害のある患者、高齢者では特に注意すること。
ワルファリン	ワルファリンの作用を増強し、出血、プロトロンビン時間の延長等があらわれることがある。本剤を併用する場合は、プロトロンビン時間国際標準比(INR)値等を測定するなど、観察を十分に行うこと。	発現機序の詳細は不明であるが、ワルファリンの肝での代謝を抑制し、クリアランスを減少させるためと考えられている。
スルホニル尿素系血糖降下剤 グリメピリド、グリベンクラミド等	スルホニル尿素系血糖降下剤の作用を増強し、低血糖があらわれることがある。	発現機序の詳細は不明であるが、グリベンクラミドの肝での代謝を阻害するとの報告 ³⁾ がある。また、膵臓のβ細胞を用いた <i>in vitro</i> 試験において、本剤がインスリン分泌作用を促進するとの報告がある。
ロビニロール塩酸塩	ロビニロールのCmaxが60%、AUCが84%それぞれ上昇したとの報告がある。ロビニロールの投与中に本剤を投与開始又は投与中止する場合には、必要に応じてロビニロールの用量を調節すること。	併用により、ロビニロールの肝での代謝が阻害されるためと考えられている。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
メトトレキサート	メトトレキサートの血中濃度が上昇し、作用が増強されるおそれがある。併用する場合には患者の状態を十分に観察すること。	発現機序の詳細は不明であるが、メトトレキサートの腎尿細管からの排泄が阻害されるためと考えられている。
アルミニウム又はマグネシウム含有の制酸剤等 ケイ酸アルミニウム、水酸化アルミニウムゲル・水酸化マグネシウム、スクラルファート水和物等 鉄剤 カルシウム含有製剤 マグネシウム含有製剤 ジタノシン錠	本剤の吸収が低下し、効果が減弱されるおそれがある。本剤服用後2時間以上あけるなど注意すること。	多価金属イオン含有製剤を併用した場合、難溶性のキレートを形成し、本剤の消化管からの吸収を減少させ、血中濃度を低下させるためと考えられている。
カルシウムを多量に含有する飲料 牛乳等	本剤を空腹時にカルシウムを多量に含有する飲料と同時に服用すると、本剤の吸収が低下し、効果が減弱されるおそれがある。	多価金属イオンと難溶性のキレートを形成し、本剤の消化管からの吸収を減少させ、血中濃度を低下させるためと考えられている。
クラスIA抗不整脈薬 キニジン、プロカインアミド等 クラスIII抗不整脈薬 アミオダロン、ソタロール等	本剤を併用した場合、QT延長がみられるおそれがある。	併用により、QT延長作用が相加的に増加するおそれがある。
セベラマー塩酸塩 炭酸ランタン水和物	本剤の吸収が低下し、効果が減弱されるおそれがある。本剤服用後2時間以上あけるなど注意すること。	左記薬剤を併用した場合、難溶性のキレートを形成し、本剤の消化管からの吸収を減少させ、血中濃度を低下させるためと考えられている。
クロザピン オランザピン	クロザピン及びその代謝物の血中濃度が29%と31%それぞれ上昇したとの報告がある。左記薬剤の投与中に本剤を投与開始又は投与中止する場合には、必要に応じて左記薬剤の用量調節をすること。	併用により、左記薬剤の肝での代謝が阻害されるためと考えられている。
シルデナフィル クエン酸塩	シルデナフィルのCmax及びAUCがそれぞれ約2倍上昇したとの報告がある。	CYP3A4阻害によりクリアランスが減少するとの報告もあるが、発現機序の詳細は不明である。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
フェニトイン	フェニトインの血中濃度が低下したとの報告がある。本剤を併用する場合は、フェニトインの血中濃度を測定するなど、観察を十分に行うこと。	機序不明

4. 副作用

承認時及び使用成績調査での調査症例17,359例中498例(2.87%)に副作用(臨床検査値の異常変動を含む)が認められ、主な副作用は、発疹34件(0.20%)、胃不快感36件(0.21%)、下痢27件(0.16%)、嘔気27件(0.16%)、食欲不振25件(0.14%)等であった。

(1) 重大な副作用

- 1) ショック、アナフィラキシー(0.1%未満)：ショック、アナフィラキシー(呼吸困難、浮腫、蕁麻疹等)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 2) 大腸炎(0.1%未満)：偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎があらわれることがある。腹痛、頻回の下痢があらわれた場合には直ちに投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 3) 横紋筋融解症(0.1%未満)：筋肉痛、脱力感、CK(CPK)上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とし、急激な腎機能悪化を伴う横紋筋融解症があらわれることがあるので注意すること。
- 4) 間質性肺炎(0.1%未満)：発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常、好酸球増多等を伴う間質性肺炎があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。
- 5) 低血糖(0.1%未満)：重篤な低血糖があらわれることがある(高齢者、特にスルホニル尿素系血糖降下剤併用患者であらわれやすい)ので、観察を十分に行い、異常があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 6) 骨髄抑制、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少(0.1%未満)：骨髄抑制、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少等があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 7) 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸(0.1%未満)：劇症肝炎、著しいAST(GOT)、ALT(GPT)等の上昇を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 8) 中毒性表皮壊死融解症(Toxic Epidermal Necrolysis：TEN)、皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)、多形紅斑、急性汎発性発疹性膿疱症(0.1%未満)：中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群、多形紅斑、急性汎発性発疹性膿疱症があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- *9) 急性腎障害、間質性腎炎(0.1%未満)：急性腎障害、間質性腎炎があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- 10) 痙攣(0.1%未満)：痙攣があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 11) アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害(0.1%未満)：アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害があらわれることがあるので、腱の疼痛や炎症がみられた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。なお、外国において、投与終了数ヵ月後にこれらの症状を発現した症例も報告されている。
- 12) 錯乱、抑うつ等の精神症状(0.1%未満)：錯乱、抑うつ等の精神症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 13) 重症筋無力症の悪化(0.1%未満)：重症筋無力症の患者で症状の悪化があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 14) 血管炎(0.1%未満)：血管炎があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 15) QT延長、心室頻拍(Torsades de pointesを含む)(0.1%未満)：QT延長、心室頻拍(Torsades de pointesを含む)があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- ※※ 16) 大動脈瘤、大動脈解離(頻度不明)：大動脈瘤、大動脈解離を引き起こすことがあるので、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。〔「慎重投与」、「重要な基本的注意」の項参照]

(2) その他の副作用

以下のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。太字の副作用については投与を中止すること。

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明*
過敏症	発疹	光線過敏症、蕁麻疹、痒疹、発熱、発赤(結節性紅斑)、浮腫(末梢、血管、顔面、咽頭)	固定薬疹、血清病様反応
腎臓		BUN上昇、クレアチニン上昇	血尿、結晶尿
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、AI-P上昇、LDH上昇、γ-GTP上昇		
循環器			頻脈、失神、ほてり、低血圧、片頭痛

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明*
血液	好酸球増多	白血球減少、赤血球減少、ヘモグロビン減少、ヘマトクリット減少	貧血、血小板増加、白血球増加、点状出血、プロトロンビン量増加、溶血性貧血
消化器	食欲不振、下痢、胃不快感、嘔気	口内炎、嘔吐、腹痛、腹部膨満感	消化不良、膵炎
感覚器		眼内異物感、味覚異常	無嗅覚、嗅覚錯誤、一過性難聴、耳鳴、視覚異常
精神神経系		振戦、頭痛、めまい、眠気	無力症、不眠症、不安、発汗、悪夢、幻覚、精神病、失調、末梢性ニューロパシー(しびれ感等)、筋緊張亢進、頭蓋内圧亢進、激越、意識障害
その他		関節痛、倦怠感、筋肉痛	モニリア症、呼吸困難、胸痛、背部痛、関節障害、高血糖、筋無力症、CK(CPK)上昇

※自発報告又は海外のみで認められている副作用については頻度不明とした。

5. 高齢者への投与

本剤は主として腎臓から排泄される(「薬物動態」の項参照)が、高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがあるので、用量ならびに投与間隔に留意し、慎重に投与すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕
- (2) 授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること。〔母乳中へ移行することが報告されている。〕

7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していないので、小児等には投与しないこと。〔「その他の注意」の項参照〕

8. 過量投与

徴候と症状：腎毒性があらわれたとの報告がある。
処置：腎機能をモニターするとともに、本剤の吸収を減少させるためにマグネシウム、カルシウム等を含む制酸剤を投与し、水分及び電解質の補給を行う。シプロフロキサシンは腹膜透析、血液透析では少量(10%程度)しか除去されない。

9. 適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。〔PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。〕

10. その他の注意

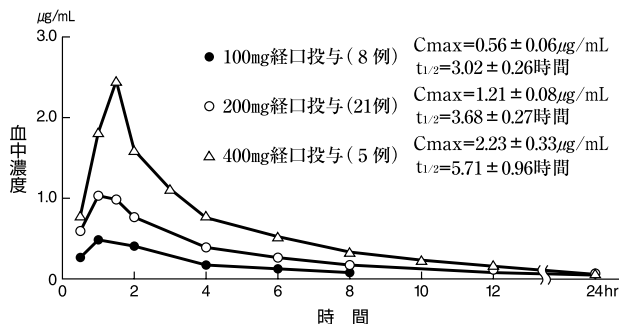
- (1) 動物実験(幼若イス、幼若ラット)で関節異常が認められている。

- (2)大量投与[750mg/回以上(経口剤)]により結晶尿が認められたとの報告がある。
- (3)遺伝毒性については、*in vitro*試験の一部(マウスリンパ腫細胞を用いた遺伝子突然変異試験, ラット肝初代培養細胞を用いた不定期DNA合成試験, チャイニーズハムスターCHL細胞を用いた染色体異常試験)成績において、陽性を示したとする報告がある。
- (4)光遺伝毒性については、ネズミチフス菌TA104を用いた復帰突然変異試験, チャイニーズハムスターV79細胞を用いた染色体異常試験, マウスリンパ腫細胞を用いたコメットアッセイにおいて陽性を示す所見が認められている。
- (5)プロベネシドによる影響
プロベネシドとの併用により、本剤の最高血中濃度は大きく変化しなかったが、 $t_{1/2}$ の延長とAUCの増加が認められたとの報告がある。

■ 薬物動態

血中濃度

健康成人に1回100mg, 200mg又は400mgを経口投与した場合、血中濃度は図のとおりである⁴⁻⁶⁾。



分布

健康成人又は患者に経口投与した場合、胆汁、前立腺で高く(血中濃度の2~10倍)、扁桃、鼻粘膜、上顎洞粘膜、副鼻腔粘膜、喀痰、皮膚、創部浸出液、乳腺組織、女性性器(陰、卵巣、卵管、子宮)、唾液、涙液へ良好な移行(血中濃度の1/3~1倍)が認められる⁷⁻¹⁵⁾。

代謝

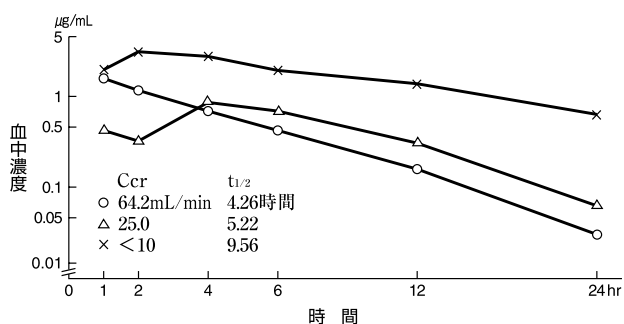
健康成人に経口投与した場合、生体内でほとんど代謝を受けず尿中排泄量の約80%が未変化体であり、その他3種の代謝物が認められる。

排泄

健康成人に1回100mg又は200mgを経口投与した場合、尿中濃度は0~2時間で最高濃度を示し、それぞれ平均141µg/mL, 256µg/mLであり、24時間までの尿中排泄率は約40~50%である。また同様に1日3回5日間連続経口投与した場合、糞中濃度は投与終了1日後に最高濃度を示し、それぞれ平均249µg/g, 554µg/gであり、投与終了6日後ではいずれも検出限界以下である^{4-6, 16)}。

腎機能障害時の血中濃度

間欠的腹膜透析中の腎機能障害患者等3例に200mg単回経口投与した場合、クレアチニンクリアランスの低下とともに $t_{1/2}$ が延長、また投与24時間までの尿中排泄率も各々32.6, 13.9, 0.04%と低下する¹⁷⁾。



〈参考〉

1. 関節毒性

幼若ラット及び幼若ビーグル犬を用いた反復投与試験(経口)において、関節軟骨のびらん等が認められた。成熟動物(サル)を用いた反復静脈内投与試験においてはいずれの試験でも関節毒性は認められなかった。

2. 眼毒性

サルを用いた4, 13, 26週間反復静脈内投与試験において、いずれの試験でも眼毒性を示唆する所見は認められなかった。ネコを用いた2週間静脈内投与試験において、ERG(網膜電位図)及びVEP(視覚誘発脳波)に関して異常は認められなかった。

3. 腎毒性

ラット及びサルを用いた反復静脈内投与試験において、それぞれ高用量群[ラット(4週間:80mg/kg/日, 26週間:20, 40mg/kg/日), サル(4週間:30mg/kg/日, 13週間:18mg/kg/日, 26週間:20mg/kg/日, 4週間/点滴静脈内投与:20mg/kg)]で尿中に排泄されたシプロフロキサシンが再結晶化したことに起因すると考えられる尿管管変化が認められた。

また、ウサギを用いた反復静脈内投与試験において、30mg/kg/日群で正常ウサギに尿管管拡張が、腎障害ウサギに病理組織学的所見の悪化がみられ、無毒性量は10mg/kg/日であった。

4. 光毒性

マウスに静脈内投与後UVAを照射したが、光毒性は100mg/kg/日においても認められなかった。

5. ヒスタミン遊離能

ラット腹腔肥満細胞及びヒト皮膚肥満細胞を用いた*in vitro*試験¹⁸⁾において、200µg/mL以上の高濃度ではヒスタミン遊離が認められた。

■ 臨床成績

総計3,633例について実施された臨床試験の概要は次のとおりである。

なお、細菌性肺炎、慢性気道感染症、急性陰窩性扁桃炎、複雑性尿路感染症、化膿性中耳炎、浅在性化膿性疾患、腸管感染症、産婦人科領域感染症で二重盲検比較試験により有用性が認められている^{19, 20)}。

効能・効果		有効率
呼吸器感染症	咽頭・喉頭炎	93.2% (41/44)
	急性気管支炎	75.4% (104/138)
	扁桃炎	80.5% (157/195)
	慢性呼吸器病変の二次感染	73.9% (430/582)
	肺炎	81.6% (129/158)
小計		77.1% (861/1,117)
尿路感染症	腎盂腎炎	80.5% (136/169)
	膀胱炎	85.0% (740/871)
	前立腺炎(急性症, 慢性症)	86.2% (25/29)
	精巣上体炎(副睾丸炎)	92.0% (23/25)
	尿道炎	99.0% (101/102)
小計		85.7% (1,025/1,196)
胆感染症	胆嚢炎	79.2% (19/24)
	胆管炎	75.0% (9/12)
小計		77.8% (28/36)
腸感染症	感染性腸炎	97.8% (88/90)
	小計	97.8% (88/90)
耳域鼻科感染症	中耳炎	64.4% (130/202)
	副鼻腔炎	83.3% (75/90)
	小計	70.2% (205/292)

効能・効果		有効率
皮膚科 領域症	表在性皮膚感染症	84.3% (75/89)
	深在性皮膚感染症	90.8% (216/238)
	リンパ管・リンパ節炎	100% (17/17)
	慢性膿皮症	84.8% (112/132)
	小計	88.2% (420/476)
外科 領域症	乳腺炎	75.6% (31/41)
	肛門周囲膿瘍	87.5% (35/40)
	外傷・熱傷及び手術創等の 二次感染	76.1% (86/113)
	小計	78.4% (152/194)
眼感科 領域症	麦粒腫	85.7% (30/35)
	涙囊炎	63.6% (7/11)
	睑板腺炎	83.3% (25/30)
	小計	81.6% (62/76)
産婦人科 領域症	子宮付属器炎	88.0% (44/50)
	子宮内感染	89.4% (59/66)
	バルトリン腺炎	72.5% (29/40)
	小計	84.6% (132/156)
合計		81.8% (2,973/3,633)

炭疽に対する臨床試験は国内外とも実施されていない。

■ 薬効薬理

抗菌作用

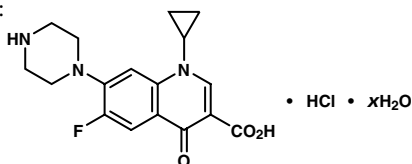
- グラム陽性菌及びグラム陰性菌に対し広い抗菌スペクトルを有し、ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、淋菌、炭疽菌、大腸菌、赤痢菌、シトロバクター属、クレブシエラ属、エンテロバクター属、セラチア属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、プロビデンシア属、インフルエンザ菌、緑膿菌、アシネトバクター属、レジオネラ属、ペプトストレプトコッカス属に対して優れた抗菌作用を示す^{21, 22)}。
- ほとんどの臨床分離株に対して同系統のオフロキサシン、ノルフロキサシン及びエノキサシン水和物より2～4倍強い抗菌作用を示し、その作用はまたセフェム剤(セフトジジム水和物)、アミノグリコシド剤(ゲンタマイシン)、カルバペネム剤(イミペネム水和物)より優れた抗菌作用を示す²³⁻²⁵⁾。
- 各種のマウス実験の感染症治療試験においてオフロキサシンと同等もしくはそれ以上、ノルフロキサシン、ピペミド酸より優れた治療効果を示す²⁶⁾。
- 雌雄アカゲザルに炭疽菌芽胞を吸入曝露させた後の肺炎炭疽に対する発症抑制効果が検討された。同菌株に対するMICは0.08 μ g/mLであった。吸入曝露24時間後より本剤を30日間経口投与した結果、非治療群(10例中9例死亡：吸入曝露後3～8日以内)と比較し、本剤投与群(9例中1例死亡：投与終了6日目)で有意な死亡率の低下が認められた²⁷⁾。

作用機序

細菌のDNAジャイレースに作用し、DNA合成を阻害する。抗菌作用は殺菌的で溶菌作用が認められる。最小発育阻止濃度は最小殺菌濃度とほぼ一致し、細菌の対数増殖期だけでなく休止期にも作用する²⁸⁾。

■ 有効成分に関する理化学的知見

構造式：



一般名：シプロフロキサシン塩酸塩水和物
(Ciprofloxacin Hydrochloride Hydrate) JAN
(Ciprofloxacin INN)
(略号：CPFXX)

化学名：1-Cyclopropyl-6-fluoro-4-oxo-7-(piperazin-1-yl)-
1, 4-dihydroquinoline-3-carboxylic acid
monohydrochloride hydrate

分子式：C₁₇H₁₈FN₃O₃・HCl・xH₂O

分子量：367.80(無水物)

性状：本品は白色～微黄色の結晶性の粉末である。

本品は水にやや溶けにくく、メタノールに溶けにくく、エタノール(99.5)に極めて溶けにくい。

本品は光によって徐々に僅かに褐色を帯びた淡黄色となる。

■ 包装

錠剤

100mg PTP包装 100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50)

200mg PTP包装 100錠(10錠×10)、600錠(10錠×60)

■ 主要文献

- 厚生労働省健康局結核感染症課編：抗微生物薬適正使用の手引き
- 二木芳人他：基礎と臨床，20(17)，8903(1986)
- Roberge, R. J. et al. : *Ann. Emerg. Med.*, **36**(2), 160(2000)
- 村中幸二他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 684(1985)
- 小林宏行他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 140(1985)
- 鈴木恵三他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 632(1985)
- 谷村 弘他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 892(1985)
- 水野全裕他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 714(1985)
- 森 慶人他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 978(1985)
- 斎藤 寿他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 995(1985)
- 那須 勝他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 548(1985)
- 矢田浩二他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 1022(1985)
- 張 南薫他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 810(1985)
- 渡辺晋一他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 932(1985)
- 酒井克治他： *Chemotherapy*, **38**(6), 582(1990)
- 本廣 孝他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 100(1985)
- 柴 孝也他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 305(1985)
- 中川武正他： *Chemotherapy*, **15**(4), 337(1995)
- 小田切繁樹他：日本化学療法学会雑誌，**44**(11)，842(1996)
- 渡辺晋一他：西日本皮膚科，**58**(6)，1006(1996)
- 西野武志他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 39(1985)
- Saito, A. et al. : *J. Antimicrob. Chemother.*, **18**, 251(1986)
- Fass, R. J. et al. : *Antimicrob. Agents Chemother.*, **24**(4), 568(1983)
- Wise, R. et al. : *Antimicrob. Agents Chemother.*, **23**(4), 559(1983)
- Chin, N-X. et al. : *Antimicrob. Agents Chemother.*, **25**(3), 319(1984)
- 五島瑛智子他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 18(1985)
- Friedlander, A. M. et al. : *J. Inf. Dis.*, **167**, 1239(1993)
- 山下 悟他： *Chemotherapy*, **33**(S-7), 1(1985)

■ 文献請求先

バイエル薬品株式会社・メディカルインフォメーション
〒530-0001 大阪市北区梅田二丁目4番9号

■ バイエル医療用医薬品のお問い合わせ先

バイエル薬品株式会社・くすり相談 ☎0120-106-398

製造販売元 バイエル薬品株式会社
大阪市北区梅田二丁目4番9号