

## 広範囲経口抗菌剤

処方箋医薬品<sup>注</sup>

シプロフロキサシン塩酸塩錠

シプロフロキサシン錠100mg「トーフ」  
シプロフロキサシン錠200mg「トーフ」

CIPROFLOXACIN TABLETS 100mg “TOWA”/ TABLETS 200mg “TOWA”

貯 法：室温保存

有効期間：3年

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

|      | 錠100mg        | 錠200mg        |
|------|---------------|---------------|
| 承認番号 | 22500AMX01091 | 22500AMX01090 |
| 販売開始 | 2009年11月      | 2002年7月       |

## 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

（効能共通）

- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
  - 2.2 ケトプロフェン（注射剤、坐剤）を投与中の患者 [10.1参照]
  - 2.3 チザニジン塩酸塩を投与中の患者 [10.1参照]
  - 2.4 ロミタピドメシル酸塩を投与中の患者 [10.1参照]
- （炭疽以外）
- 2.5 妊婦又は妊娠している可能性のある女性 [9.5.1参照]
  - 2.6 小児等 [9.7.1参照]

## 3. 組成・性状

## 3.1 組成

| 販売名      | シプロフロキサシン錠<br>100mg「トーフ」   | シプロフロキサシン錠<br>200mg「トーフ」   |
|----------|--|--|
| 1錠中の有効成分 | 日局 シプロフロキサシン塩酸塩水和物 ……116.4mg<br>(シプロフロキサシンとして100mg)                      | 日局 シプロフロキサシン塩酸塩水和物 ……232.87mg<br>(シプロフロキサシンとして200mg)   |
| 添加剤      | 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、酸化チタン、マクロゴール4000 | トウモロコシデンプン、クロスボビドン、デンプングリコール酸ナトリウム、ヒドロキシプロピルスターチ、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6000、酸化チタン、クエン酸水和物 |

## 3.2 製剤の性状

| 販売名    | シプロフロキサシン錠<br>100mg「トーフ」 | シプロフロキサシン錠<br>200mg「トーフ」 |       |
|--------|--------------------------|--------------------------|-------|
| 性状・剤形  | 白色～淡黄色のフィルムコーティング錠       |                          |       |
| 識別コード  | 本体                       | Tw701                    | Tw217 |
|        | 包装                       |                          |       |
| 外形     | 表                        |                          |       |
|        | 裏                        |                          |       |
|        | 側面                       |                          |       |
| 直径(mm) | 7.1                      | 10.1                     |       |
| 厚さ(mm) | 3.5                      | 4.7                      |       |
| 質量(mg) | 153                      | 310                      |       |

## 4. 効能又は効果

（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、胆嚢炎、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、涙嚢炎、麦粒腫、瞼板腺炎、中耳炎、副鼻腔炎、炭疽

## 5. 効能又は効果に関連する注意

（咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、感染性腸炎、副鼻腔炎）

「抗微生物薬適正使用の手引き」<sup>1)</sup>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。

## 6. 用法及び用量

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。

## 7. 用法及び用量に関連する注意

（炭疽）

- 7.1 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。
- 7.2 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。

## 8. 重要な基本的注意

8.1 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。 [9.1.5、11.1.16参照]

8.2 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。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 本人又は両親、兄弟に気管支喘息、発疹、じん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

9.1.2 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。 [11.1.10参照]

9.1.3 重症筋無力症患者

症状を悪化させることがある。 [11.1.13参照]

9.1.4 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。 [11.1.15参照]

9.1.5 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、家族歴若しくはリスク因子（マルファン症候群等）を有する患者

必要に応じて画像検査の実施を考慮すること。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。 [8.1、11.1.16参照]

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 高度の腎障害のある患者

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。高い血中濃度が持続する。 [16.6.1参照]

9.5 妊婦

(炭疽以外)

9.5.1 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。  
[2.5参照]

(炭疽)

9.5.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性を考慮して投与すること。

9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。母乳中へ移行することが報告されている。

9.7 小児等

(炭疽以外)

9.7.1 投与しないこと。動物実験(幼若イヌ、幼若ラット)で関節毒性が認められている。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。小児等を対象とした臨床試験は実施していない。[2.6参照]

(炭疽)

9.7.2 治療上の有益性を考慮して投与すること。

9.8 高齢者

9.8.1 臍障害があらわれやすいとの報告がある。[11.1.11参照]

9.8.2 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。本剤は主として腎臓から排泄され、高齢者では腎機能が低下していることが多い。[16.5、16.6.1参照]

10. 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。

10.1 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(注射剤、坐剤)(カピステン等)<br>[2.2参照] | 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 <sub>A</sub> 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)<br>[2.3参照]         | チザニジンのC <sub>max</sub> 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)<br>[2.4参照]    | 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。   |

10.2 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C <sub>max</sub> が17%、AUCが22%それぞれ上昇したとの報告がある <sup>2)</sup> 。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<br>ジクロフェナク、アンフェナク等<br>プロピオン酸系非ステロイド性消炎鎮痛剤(ただし、ケトプロフェン(注射剤、坐剤)とは併用禁忌)<br>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 <sub>A</sub> 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。       |
| シクロスボリン   | 相互に副作用(腎障害等)が増強されるおそれがあるので、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、観察を十分にを行うこと。             | 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<br>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 <sup>3)</sup> 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C <sub>max</sub> 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。   |
| 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<br>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<br>鉄剤<br>カルシウム含有製剤<br>マグネシウム含有製剤                  | 本剤の吸収が低下し、効果が減弱されるおそれがあるため、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<br>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。   |

| 薬剤名等   | 臨床症状・措置方法   | 機序・危険因子   |
|--|---|---|
| クラスⅠA抗不整脈薬<br>キニジン、プロカインアミド等<br>クラスⅢ抗不整脈薬<br>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<br>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ので、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<br>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。                   |
| 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  |
| 副腎皮質ホルモン剤（経口剤、注射剤）<br>プレドニゾロン、ヒドロコルチゾン等                    | 腱障害のリスクが増大するとの報告がある。これらの薬剤との併用は、治療上の有益性が危険性を上回る場合のみとすること。                                   | 機序不明  |

## 11. 副作用

次の副作用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するなど適切な処置を行うこと。

### 11.1 重大な副作用

#### 11.1.1 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

ショック、アナフィラキシー（呼吸困難、浮腫、じん麻疹等）があらわれることがある。

#### 11.1.2 偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎（頻度不明）

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。

#### 11.1.3 横紋筋融解症（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK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。

#### 11.1.4 間質性肺炎（頻度不明）

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。

#### 11.1.5 低血糖（頻度不明）

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れやすい。

#### 11.1.6 骨髄抑制、汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少（いずれも頻度不明）

#### 11.1.7 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

劇症肝炎、著しいAST、ALT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。

#### 11.1.8 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（いずれも頻度不明）

#### 11.1.9 急性腎障害、間質性腎炎（いずれも頻度不明）

#### 11.1.10 痙攣（頻度不明）

[9.1.2参照]

#### 11.1.11 アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害（いずれも頻度不明）

腱周辺の痛み、浮腫、発赤等の症状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。なお、外国において、投与終了数カ月後にこれらの症状を発現した症例も報告されている。

[9.8.1参照]

#### 11.1.12 錯乱、抑うつ等の精神症状（いずれも頻度不明）

#### 11.1.13 重症筋無力症の悪化（頻度不明）

[9.1.3参照]

#### 11.1.14 血管炎（頻度不明）

#### 11.1.15 QT延長、心室頻拍（Torsades de pointesを含む）（いずれも頻度不明）

[9.1.4参照]

#### 11.1.16 大動脈瘤、大動脈解離（いずれも頻度不明）

[8.1、9.1.5参照]

### 11.2 その他の副作用

|       | 0.1～5%未満                         | 0.1%未満                   | 頻度不明  |
|-------|----------------------------------|--------------------------|---|
| 過敏症   | 発疹                               | じん麻疹、そう痒、発熱、発赤（結節性紅斑）    | 固定薬疹、血清病様反応、光線過敏症、浮腫（末梢、血管、顔面、咽頭）               |
| 腎臓    | BUN上昇、クレアチニン上昇、血尿                |                          | 結晶尿   |
| 肝臓    | AST上昇、ALT上昇、Al-P上昇、LDH上昇、γ-GTP上昇 |                          |   |
| 循環器   | 片頭痛                              | 低血圧                      | 頻脈、失神、ほてり                                       |
| 血液    | 好酸球増多                            | 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、白血球減少      |
| 消化器   | 食欲不振、下痢、胃不快感、嘔気、腹部膨満感            | 口内炎、嘔吐、腹痛                | 消化不良、痔炎   |
| 感覚器   |                                  | 耳鳴                       | 無嗅覚、嗅覚錯誤、一過性難聴、視覚異常、眼内異物感、味覚異常                  |
| 精神神経系 | 頭痛、めまい                           | 眠気、発汗、末梢性ニューロパシー（しびれ感等）  | 無力症、不眠症、不安、悪夢、幻覚、精神病、失調、筋緊張亢進、頭蓋内圧亢進、激越、意識障害、振戦 |
| その他   | CK上昇                             | 関節痛、倦怠感                  | 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、筋肉痛             |

## 13. 過量投与

### 13.1 症状

腎毒性があらわれたとの報告がある。

### 13.2 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充を行う。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。

## 14. 適用上の注意

### 14.1 薬剤交付時の注意

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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

## 15. その他の注意

### 15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 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 (外国人データ)。

### 15.1.2 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 (外国人データ)。

### 15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 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。

15.2.2 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。

15.2.3 眼毒性については、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。

15.2.4 腎毒性については、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細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。

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

15.2.6 ヒスタミン遊離能については、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<sup>9)</sup>において、200  $\mu$ g/mL以上の高濃度ではヒスタミン遊離が認められた。

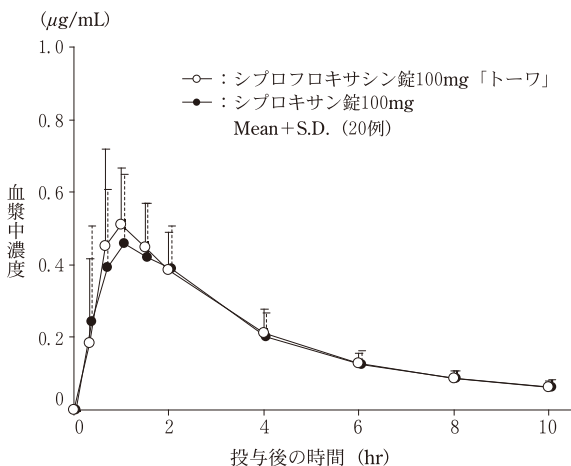
## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

#### 16.1.1 生物学的同等性試験

##### 〈シプロフロキサシン錠100mg「トーワ」〉

シプロフロキサシン錠100mg「トーワ」とシプロキサシン錠100mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠 (シプロフロキサシンとして100mg) 健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>5)</sup>



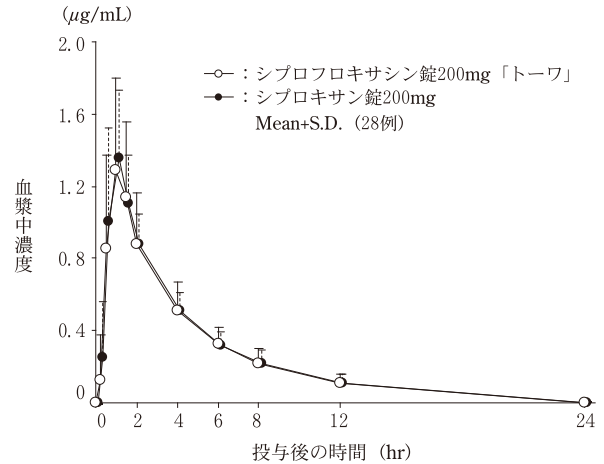
|                      | 判定パラメータ                                 |                       | 参考パラメータ      |                          |
|----------------------|---|-----------------------|--------------|--------------------------|
|                      | AUC <sub>0-10</sub><br>( $\mu$ g·hr/mL) | Cmax<br>( $\mu$ g/mL) | Tmax<br>(hr) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| シプロフロキサシン錠100mg「トーワ」 | 2.056±0.378                             | 0.621±0.141           | 1.07±0.45    | 2.80±0.29                |
| シプロキサシン錠100mg        | 1.987±0.414                             | 0.597±0.148           | 1.11±0.64    | 2.79±0.32                |

Mean±S.D. (20例)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

##### 〈シプロフロキサシン錠200mg「トーワ」〉

シプロフロキサシン錠200mg「トーワ」とシプロキサシン錠200mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠 (シプロフロキサシンとして200mg) 健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、-20%~+20%の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>6)</sup>



|                      | 判定パラメータ                                 |                       | 参考パラメータ      |                          |
|----------------------|---|-----------------------|--------------|--------------------------|
|                      | AUC <sub>0-24</sub><br>( $\mu$ g·hr/mL) | Cmax<br>( $\mu$ g/mL) | Tmax<br>(hr) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| シプロフロキサシン錠200mg「トーワ」 | 5.867±1.755                             | 1.424±0.438           | 1.28±0.66    | 3.91±0.90                |
| シプロキサシン錠200mg        | 5.958±1.264                             | 1.430±0.318           | 1.02±0.29    | 3.90±1.08                |

Mean±S.D. (28例)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

### 16.5 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141  $\mu$ g/mL、256  $\mu$ g/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249  $\mu$ g/g、554  $\mu$ g/gであり、投与終了6日後ではいずれも概ね検出限界以下である。<sup>7)~11)</sup> [9.8.2参照]

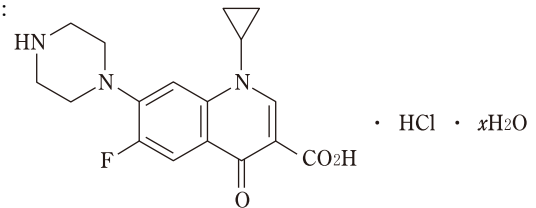
### 16.6 特定の背景を有する患者

#### 16.6.1 腎機能障害患者

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。<sup>12)</sup> [9.2.1、9.8.2参照]

## 19. 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)

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

分子式: C<sub>17</sub>H<sub>18</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>3</sub>·HCl·xH<sub>2</sub>O

性状: 白色〜微黄色の結晶性の粉末である。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。光によって徐々に僅かに褐色を帯びた淡黄色となる。

## 22. 包装

〈シプロフロキサシン錠100mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10: PTP]

〈シプロフロキサシン錠200mg「トーワ」〉

100錠 [10錠×10: PTP]

1000錠 [10錠×100: PTP]

## 23. 主要文献

- 1) 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
- 2) 二木芳人他：基礎と臨床. 1986；20：8903-8913
- 3) Roberge RJ, et al. : Ann Emerg Med. 2000；36：160-163
- 4) 中川武正他：炎症. 1995；15：337-338
- 5) 社内資料：生物学的同等性試験（錠100mg）
- 6) 水山和之他：新薬と臨床. 2003；52(3)：296-300
- 7) 村中幸二他：Chemotherapy. 1985；33(S-7)：684-692
- 8) 小林宏行他：Chemotherapy. 1985；33(S-7)：140-170
- 9) 鈴木恵三他：Chemotherapy. 1985；33(S-7)：632-670
- 10) 第十八改正日本薬局方解説書：2021；C-2333-2344
- 11) 本廣孝他：Chemotherapy. 1985；33(S-7)：100-139、559-562
- 12) 柴孝也他：Chemotherapy. 1985；33(S-7)：305-316

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

東和薬品株式会社 学部部DIセンター  
〒570-0081 大阪府守口市日吉町2丁目5番15号  
☎0120-108-932 FAX 06-7177-7379

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

**東和薬品株式会社**

大阪府門真市新橋町2番11号