



合成セファロスポリン系抗生物質製剤

処方箋医薬品^{注1)}

日本薬局方 注射用セファゾリンナトリウム

セファゾリンNa注射用0.25g「NP」
セファゾリンNa注射用0.5g「NP」
セファゾリンNa注射用1g「NP」
セファゾリンNa注射用2g「NP」
セファゾリンNa点滴静注用1gバッグ「NP」

CEFAZOLIN SODIUM FOR INJECTION, I.V. INFUSION

	0.25g (バイアル)
承認番号	22500AMX01875
薬価収載	2014年6月
販売開始	2011年11月
再評価結果	—————

	0.5g (バイアル)	1g (バイアル)
承認番号	22500AMX01876	22500AMX01877
薬価収載	2014年6月	2014年6月
販売開始	2010年11月	1987年12月
再評価結果	—————	2004年9月

	2g (バイアル)	1gバッグ
承認番号	22500AMX01878	22500AMX01879
薬価収載	2014年6月	2014年6月
販売開始	1987年12月	2006年8月
再評価結果	2004年9月	—————

貯 法：バイアル製品 室温保存
 （光により徐々に着色することがあるので開封後の保存に注意）
 バッグ製品 室温保存
 使用期限：容器等に記載（製造後2年）
 注 意：「取扱い上の注意」参照

※ 禁忌（次の患者には投与しないこと）
 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

※ 原則禁忌（次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること）
 セフェム系抗生物質に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

1. 組成、製剤の性状

- 1) セファゾリンNa注射用0.25g「NP」、セファゾリンNa注射用0.5g「NP」、セファゾリンNa注射用1g「NP」、セファゾリンNa注射用2g「NP」

販売名	セファゾリンNa注射用0.25g「NP」	セファゾリンNa注射用0.5g「NP」	セファゾリンNa注射用1g「NP」	セファゾリンNa注射用2g「NP」
規格	0.25g	0.5g	1g	2g
有効成分(1バイアル中)	日本薬局方 セファゾリンナトリウム			
	0.25g (力価)	0.5g (力価)	1g (力価)	2g (力価)
性状	白色～淡黄白色の結晶又は結晶性の粉末又は塊			

- 2) セファゾリンNa点滴静注用1gバッグ「NP」

本剤は、用時溶解の注射剤（日本薬局方 注射用セファゾリンナトリウム）本体と、溶解液（日本薬局方 生理食塩液）からなるバッグ製品である。

販売名	セファゾリンNa点滴静注用1gバッグ「NP」		
注射剤	有効成分(1キット中)	日本薬局方 セファゾリンナトリウム 1g (力価)	
	性状	白色～淡黄白色の結晶又は結晶性の粉末	
溶解液	成分(100mL中)	日本薬局方 塩化ナトリウム	0.9g
	容器	プラスチックバッグ	

2. 製剤学的事項

溶解液	単位/容量	pH	浸透圧比 (生理食塩液に対する比)
注射用水	1g (力価)/10mL	4.5～6.5	約1
生理食塩液	1g (力価)/100mL	4.0～6.0	約1

【効能・効果】

〈適応菌種〉

セファゾリンに感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、大腸菌、肺炎桿菌、プロテウス・ミラビリス、プロピデンシア属

〈適応症〉

敗血症、感染性心内膜炎、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、びらん・潰瘍の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、関節炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、膿胸、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、腹膜炎、胆嚢炎、胆管炎、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、子宮旁結合織炎、眼内炎（全眼球炎を含む）、中耳炎、副鼻腔炎、化膿性唾液腺炎

※※ 〈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、中耳炎、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】

1. セファゾリンNa注射用0.25g「NP」、セファゾリンNa注射用0.5g「NP」、セファゾリンNa注射用1g「NP」、セファゾリンNa注射用2g「NP」

セファゾリンとして、通常、1日量成人には1g（力価）、小児には体重kg当り20～40mg（力価）を2回に分けて緩徐に静脈内へ注射するが、筋肉内へ注射することもできる。症状及び感染菌の感受性から効果不十分と判断される場合には、1日量成人1.5～3g（力価）を、小児には体重kg当り50mg（力価）を3回に分割投与する。

症状が特に重篤な場合には、1日量成人5g（力価）、小児には体重kg当り100mg（力価）までを分割投与することができる。

また、輸液に加え、静脈内に点滴注入することもできる。

点滴静注時の注意

点滴静注を行う場合、注射用水を用いると溶液が等張とならないため用いないこと。

注1) 注意－医師等の処方箋により使用すること

2. セファゾリンNa点滴静注用1gバッグ「NP」

セファゾリンとして、通常、1日量成人には1g（力価）、小児には体重kg当り20～40mg（力価）を2回に分けて点滴静注する。

症状及び感染菌の感受性から効果不十分と判断される場合には、1日量成人1.5～3g（力価）を、小児には体重kg当り50mg（力価）を3回に分割投与する。

症状が特に重篤な場合には、1日量成人5g（力価）、小児には体重kg当り100mg（力価）までを分割投与することができる。

投与に際しては、用時、添付の溶解液にて溶解し、静脈内に点滴注入する。

〈注射液の調製法〉

○セファゾリンNa注射用0.25g「NP」、セファゾリンNa注射用0.5g「NP」、セファゾリンNa注射用1g「NP」、セファゾリンNa注射用2g「NP」の調製方法

1. 静脈内注射：本品を注射用水、生理食塩液又はブドウ糖注射液に溶解する。
2. 筋肉内注射：本品をリドカイン注射液(0.5w/v%) 約2～3mLに溶解する。

○セファゾリンNa点滴静注用1gバッグ「NP」の調製方法

カバーシートをはがし、溶解液（生理食塩液）部分を手で押して隔壁を開通させ、薬剤部分と溶解液部分を交互に押して薬剤を完全に溶解する。
（詳しい溶解操作方法については、バッグ製品の外袋及びカバーシートに記載の「溶解操作方法」を参照）

〈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. 高度の腎障害のある患者では、血中濃度が持続するので、腎障害の程度に応じて投与量を減量し、投与の間隔をあけて使用すること。

※※【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) ペニシリン系抗生物質に対し、過敏症の既往歴のある患者
- 2) 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
- 3) 高度の腎障害のある患者（「用法・用量に関連する使用上の注意」の項参照）
- 4) 経口摂取の不良な患者又は非経口栄養の患者、全身状態の悪い患者〔ビタミンK欠乏症状があらわれることがあるので、観察を十分に行うこと。〕
- 5) 高齢者（「5. 高齢者への投与」の項参照）
- 6) バッグ製品は、生理食塩液100mLに溶解するため、次の患者には慎重に投与すること。
 - (1) 心臓、循環器系機能障害のある患者〔循環血液量を増すことから心臓に負担をかけ、症状が悪化するおそれがある。〕
 - (2) 腎障害のある患者〔水分、塩化ナトリウムの過剰投与に陥りやすく、症状が悪化するおそれがある。〕

2. 重要な基本的注意

※※本剤によるショック、アナフィラキシーの発生を確実に予知できる方法がないので、次の措置をとること。

- 1) 事前に既往歴等について十分な問診を行うこと。なお、抗生物質等によるアレルギー歴は必ず確認すること。
- 2) 投与に際しては、必ずショック等に対する救急処置のとれる準備をしておくこと。
- 3) 投与開始から投与終了後まで、患者を安静の状態に保たせ、十分な観察を行うこと。特に、投与開始直後は注意深く観察すること。

3. 相互作用

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
クマリン系抗凝血剤 ・ワルファリン	ワルファリンの作用が増強されるおそれがある。ただし、本剤に関する症例報告はない。	本剤は、腸内細菌によるビタミンKの産生を抑制することがある。
エダラボン	腎機能障害が増悪するおそれがあるため、併用する場合には頻回に腎機能検査を実施するなど観察を十分に行うこと。	機序は不明であるが、本剤は主として腎臓から排泄されるため、腎排泄型のエダラボンとの併用により、腎臓への負担が増強する可能性が考えられている。
利尿剤 ・フロセミド等	腎障害が増強されるおそれがある。	機序は明らかではないが、ラット、ウサギにおいて、腎障害が増強されるとの報告がある。

4. 副作用

本剤は、副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

1) 重大な副作用（頻度不明）

(1) ショック

ショックを起こすことがあるので、観察を十分に行い、不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴、発汗等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) アナフィラキシー

アナフィラキシー（呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、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。

(3) 血液障害

汎血球減少、無顆粒球症（初期症状：発熱、咽頭痛、頭痛、倦怠感等）、溶血性貧血（初期症状：発熱、ヘモグロビン尿、貧血症状等）、血小板減少（初期症状：点状出血、紫斑等）があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、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。

(4) 肝障害

黄疸、AST (GOT)、ALT (GPT)、Al-Pの上昇等があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、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。

※※(5) 腎障害

急性腎障害等の重篤な腎障害があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、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。

(6) 大腸炎

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し、適切な処置を行うこと。

※※(7) 皮膚障害

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）があらわれることがあるので、観察を十分に行い、発熱、頭痛、関節痛、皮膚や粘膜の紅斑・水疱、皮膚の緊張感・灼熱感・疼痛等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)間質性肺炎、PIE症候群

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、PIE症候群等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。

(9)痙攣

腎不全の患者に大量投与すると、痙攣等の神経症状を起こすことがある。

2)その他の副作用

種類\頻度	頻度不明
過敏症 ^{注2)}	発疹、蕁麻疹、紅斑、そう痒、発熱、浮腫
血液	顆粒球減少、好酸球増多
腎臓	BUN・血清クレアチニン上昇
消化器	悪心、嘔吐、食欲不振、下痢
菌交代症	口内炎、カンジダ症
ビタミン欠乏症	ビタミンK欠乏症状（低プロトロンビン血症、出血傾向等）、ビタミンB群欠乏症状（舌炎、口内炎、食欲不振、神経炎等）
その他	頭痛、めまい、全身倦怠感

注2) このような症状が認められた場合には、投与を中止すること。

5.高齢者への投与

高齢者には、次の点に注意し、用量並びに投与間隔に留意するなど患者の状態を観察しながら、慎重に投与すること。

- 1) 高齢者では生理機能が低下していることが多く、副作用が発現しやすい。
- 2) 高齢者ではビタミンK欠乏による出血傾向があらわれることがある。

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、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[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、新生児に対する安全性は確立していない（使用経験が少ない）。

なお、低出生体重児、新生児では乳児、幼児等に比べて血清中濃度半減期が延長するとの報告がある。

8.臨床検査結果に及ぼす影響

- 1) テステープ反応を除くベネディクト試薬、フェーリング試薬、クリニテストによる尿糖検査では偽陽性を呈することがあるので注意すること。
- 2) 直接クームス試験陽性を呈することがあるので注意すること。

9.適用上の注意

1)投与前

- (1) 使用にあたっては、完全に溶解したことを確認し、溶解後は速やかに使用すること。なお、やむを得ず保存を必要とする場合でも、室温保存では48時間以内に使用すること。
- (2) バッグ製品は、分割投与しないこと。

2)静脈内投与時

静脈内大量投与により、血管痛、血栓性静脈炎を起こすことがあるので、これを予防するために注射液の調製、注射部位、注射方法等について十分注意し、その投与速度はできるだけ遅くすること。

3)筋肉内投与時（バイアル製品：静脈内注射が困難な場合にのみ使用すること）

筋肉内注射にあたっては、下記の点に注意すること。

- (1) 筋肉内注射はやむを得ない場合にのみ、必要最小限に行うこと。同一部位への反復注射は行わないこと。特に低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児には注意すること。
- (2) 神経走行部位を避けること。
- (3) 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は直ちに針を抜き、部位を変えて注射すること。
- (4) 筋注用に溶解した溶液は、静脈内への注射を絶対に避けること。
- (5) 注射部位に疼痛、硬結をみることがある。

4)調製方法

温度による溶解度の差により、澄明に溶解しない場合があるが、この場合は液量を増やす（バイアル製品のみ）か温湯で温め澄明な溶液としてから使用すること。

5)調製時

ガベキサート、ナファモスタット、シメチジン、ファモチジン、アミノグリコシド系抗生物質と混合すると混濁することがある。

【薬物動態】

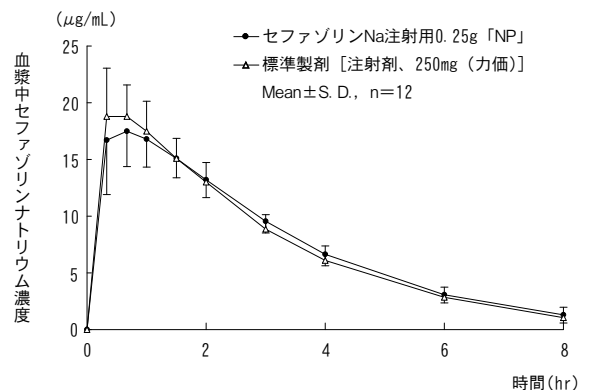
生物学的同等性試験

1.セファゾリンNa注射用0.25g「NP」

セファゾリンNa注射用0.25g「NP」と標準製剤のそれぞれ0.25g [セファゾリンナトリウムとして250mg（力価）]を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に筋肉内投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC_{0-8hr}、C_{max}）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）～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。²⁾

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0-8hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	C _{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
セファゾリンNa注射用0.25g「NP」	62.9±8.0	18.2±2.9	0.60±0.33	1.83±0.24
標準製剤 [注射剤、250mg（力価）]	61.9±8.0	19.8±3.6	0.53±0.23	1.80±0.26

(Mean±S. D., n=12)



血漿中濃度並びにAUC、C_{max}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。

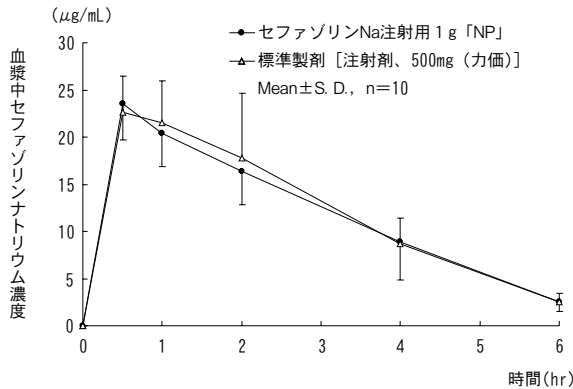
2.セファゾリンNa注射用1g「NP」

セファゾリンNa注射用1g「NP」と標準製剤のそれぞれ0.5g [セファゾリンナトリウムとして500mg（力価）]を、クロスオーバー法により健康成人男子に絶食時に筋肉内投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC_{0-6hr}、C_{max}）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）～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。³⁾



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→6hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
セファゾリンNa 注射用 1g 「NP」	71.98±15.18	23.69±3.54	0.55±0.16	1.29±0.25
標準製剤 [注射剤、500mg (力価)]	74.45±18.09	23.67±4.12	0.85±0.47	1.27±0.26

(Mean±S. D., n=10)



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。

【薬効薬理】

グラム陽性菌及び大腸菌、肺炎桿菌、プロテウス・ミラベリスなどのグラム陰性菌に強く作用する。作用機序は細菌細胞壁の合成阻害で、作用は殺菌的である。ペニシリンナーゼに対してはかなり安定であるが、グラム陰性桿菌の産生するセファロスポリナーゼによってセファロリジン、セファロチンと同様に不活化される。ペニシリン結合タンパク (PBP) に強い結合親和性を持つ。⁴⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：セファゾリンナトリウム (Cefazolin Sodium)

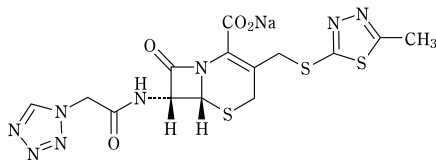
略号：CEZ

化学名：Monosodium (6R, 7R)-3-(5-methyl-1, 3, 4-thiadiazol-2-ylsulfanylmethyl)-8-oxo-7-[2-(1H-tetrazol-1-yl)acetylamino]-5-thia-1-azabicyclo[4. 2. 0]oct-2-ene-2-carboxylate

分子式：C₁₄H₁₃N₅NaO₄S₃

分子量：476.49

構造式：



性状：・白色～淡黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。
・水又はホルムアミドに溶けやすく、メタノールに溶けにくく、エタノール (95) にほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

1. セファゾリンNa点滴静注用 1gバッグ「NP」に関する注意

- 1) 製品の品質を保持するため、本品を包んでいる外袋は使用直前まで開封しないこと。また、開封後は速やかに使用すること。
- 2) 次の場合には使用しないこと。
(1) 外袋が破損しているときや内側に液滴が認められるとき

- (2) 隔壁の開通前に薬剤が溶解しているとき
 - (3) 薬剤が変色しているときや、薬剤溶解前に溶解液の着色又は混濁等の異常が認められるとき
 - (4) ゴム栓部のシールフィルムがはがれているとき
- 3) 輸液セットの針はゴム栓の穿孔位置にまっすぐに刺すこと。斜めに刺すと針がプラスチックバッグの首部を傷つけて液漏れを起こすことがある。
- 4) 容器の液目盛りは、およその目安として使用すること。

2. 安定性試験

1) セファゾリンNa注射用 0.25g 「NP」、セファゾリンNa注射用 0.5g 「NP」

最終包装製品を用いた長期保存試験 (25℃、相対湿度 60%、2年間) の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、セファゾリンNa注射用 0.25g 「NP」及びセファゾリンNa注射用 0.5g 「NP」は通常の市場流通下において2年間安定であることが確認された。⁵⁾

2) セファゾリンNa注射用 1g 「NP」、セファゾリンNa注射用 2g 「NP」

最終包装製品を用いた長期保存試験 [室温 (1~30℃)、2年間] の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、セファゾリンNa注射用 1g 「NP」及びセファゾリンNa注射用 2g 「NP」は通常の市場流通下において2年間安定であることが確認された。⁶⁾

3) セファゾリンNa点滴静注用 1gバッグ「NP」

最終包装製品を用いた長期保存試験 (25℃、2年間) の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、セファゾリンNa点滴静注用 1gバッグ「NP」は通常の市場流通下において2年間安定であることが確認された。⁷⁾

【包装】

- セファゾリンNa注射用 0.25g 「NP」：
0.25g (力価) × 10バイアル
- セファゾリンNa注射用 0.5g 「NP」：
0.5g (力価) × 10バイアル
- セファゾリンNa注射用 1g 「NP」：
1g (力価) × 10バイアル
- セファゾリンNa注射用 2g 「NP」：
2g (力価) × 10バイアル
- セファゾリンNa点滴静注用 1gバッグ「NP」：
1g (力価) キット × 10

【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) ニプロ (株)：社内資料 生物学的同等性試験 (0.25g)
- 3) ニプロ (株)：社内資料 生物学的同等性試験 (1g)
- 4) 第十七改正日本薬局方解説書
- 5) ニプロ (株)：社内資料 安定性試験 (0.25g, 0.5g)
- 6) ニプロ (株)：社内資料 安定性試験 (1g, 2g)
- 7) ニプロ (株)：社内資料 安定性試験 (1gバッグ)

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献欄に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

ニプロ株式会社 医薬品情報室

〒531-8510 大阪市北区本庄西3丁目9番3号

☎ 0120-226-898

FAX 06-6375-0177



製造販売 ニプロ株式会社
大阪市北区本庄西3丁目9番3号