

sitafloracin hydrate (JAN)

シタフロキサシン水和物

ニューキノロン系抗菌剤

624

【基本電子添文】 グレースビット細粒・錠2025年3月改訂

【製品】 規制等：[処方] 《グレースビット細粒10%・錠50mg 2008.01.25承認》
グレースビット Gracevit 細粒10% 錠50mg（第一三共）
シタフロキサシン 錠50mg（沢井）

【組成】 【細粒】：シタフロキサシンとして10%
【錠剤】：1錠中シタフロキサシンとして50mg
シタフロキサシン水和物53.3mgはシタフロキサシン50mgに相当

【効能・効果】 〈適応菌種〉本剤に感性のブドウ球菌属，レンサ球菌属，肺炎球菌，腸球菌属，モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス，大腸菌，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，インフルエンザ菌，緑膿菌，レジオネラ・ニューモフィラ，ペプトストレプトコッカス属，プレボテラ属，ポルフィロモナス属，フソバクテリウム属，トラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス），肺炎クラミジア（クラミジア・ニューモニエ），肺炎マイコプラズマ（マイコプラズマ・ニューモニエ） 〈適応症〉咽頭・喉頭炎，扁桃炎（扁桃周囲炎，扁桃周囲膿瘍を含む），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，尿道炎，子宮頸管炎，中耳炎，副鼻腔炎，歯周組織炎，歯冠周囲炎，顎炎

効能関連注意 ①効能共通：本剤は下痢，軟便が高頻度に認められているため，使用に際しては，リスクとベネフィットを考慮する（その他の副作用参照） ②咽頭・喉頭炎，扁桃炎（扁桃周囲炎，扁桃周囲膿瘍を含む），急性気管支炎，副鼻腔炎：「抗微生物薬適正使用の手引き」を参照し，抗菌薬投与の必要性を判断した上で，本剤が適切と判断される場合に投与する

【用法・用量】 シタフロキサシンとして，1回50mgを1日2回又は1回100mgを1日1回経口投与。なお，効果不十分と思われる症例には，1回100mgを1日2回経口投与できる

用法関連注意：腎機能が低下している患者では，本剤の血中濃度が上昇するため，投与量，投与間隔を調節する（特定背景関連注意②，薬物動態⑤a参照）

クレアチニンクリアランス (CLcr) 値 (mL/min)	用法・用量の目安 (体重60kgとした場合)
50≦CLcr	50mg1日2回又は100mg1日1回
30≦CLcr<50	50mg1日1回
10≦CLcr<30	1回50mgを48時間以上の間隔毎

【禁忌】 ①本剤の成分又は他のキノロン系抗菌薬に対し過敏症の既往歴のある患者 ②妊婦又は妊娠している可能性のある女性（特定背景関連注意③参照） ③小児等（特定背景関連注意⑤参照）

【重要な基本的注意】 ①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 ②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現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（特定背景関連注意①c，重大な副作用①参照） 【特定背景関連注意】 ①合併症・既往歴等のある患者 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 ⑥重症筋無力症の患者：類薬で症状を悪化させるとの報告がある 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，家族歴若しくはリスク因子（マルファン症候群/ロイス・ディーツ症候群等）を有する患者：必要に応じて画像検査の実施を考慮する。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②，重大な副作用①参照） ②腎機能障害患者：（用法関連注意，薬物動態⑤a参照） ③妊婦：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。動物実験（ラット）で器官形成期の投与において，胎児の体重減少及び骨化遅延，出生児（離乳後）の体重増加抑制が認められている。動物実験（ウサギ）で器官形成期の投与において，流産及び胎児の骨格変異の増加が認められている（禁忌②参照） ④授乳婦：授乳しないことが望ましい。動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている（薬物動態②c参照） ⑤小児等：投与しない。小児等を対象とした臨床試験は実施していない。動物実験（幼若犬）で関節部の軟骨障害が認められている（禁忌③参照） ⑥高齢者 ④腱障害が現れやすいとの報告がある（重大な副作用①参照） ⑥患者の状態を観察しながら慎重に投与する。一般に生理機能が低下していることが多い（薬物動態⑤⑥参照）

【相互作用】 併用注意

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アルミニウム又はマグネシウム含有の制酸薬等，カルシウム剤，鉄剤・乾燥水酸化アルミニウムゲル・酸化マグネシウム・乾燥硫酸鉄・沈降炭酸カルシウム等（薬物動態⑥参照）	本剤の効果が減弱されるおそれがある。これらの薬剤は本剤投与後2時間以上あけて投与する	これらの薬剤とキレートを形成し，本剤の吸収が低下すると考えられている
フェニル酢酸系又はプロピオン酸系非ステロイド性消炎鎮痛薬・ケトプロフェン等	痙攣を起こすことがある	中枢神経におけるGABA _A 受容体への結合阻害が増強されると考えられている
副腎皮質ホルモン剤（経口剤及び注射剤）・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	機序不明

【副作用】 次の副作用が現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中止するなど適切な処置を行う

①重大な副作用 ④ショック（頻度不明），アナフィラキシー（頻度不明）：血圧低下，呼吸困難，皮疹，血管性浮腫等の異常が認められた場合には中止し，適切な処置を行う ⑥中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）

(頻度不明)、**皮膚粘膜眼症候群 (Stevens-Johnson症候群)** (頻度不明)、**多形紅斑** (頻度不明) ③**急性腎障害** (頻度不明) ④**肝機能障害** (頻度不明)、**黄疸** (頻度不明) : AST上昇, ALT上昇等が現れることがある ⑤**汎血球減少症** (頻度不明)、**無顆粒球症** (頻度不明)、**溶血性貧血** (頻度不明)、**血小板減少** (頻度不明) ⑥**偽膜性大腸炎** (頻度不明) : 腹痛, 頻回の下痢等が認められた場合には中止し, 適切な処置を行う ⑦**低血糖** (頻度不明) : 低血糖性昏睡に至る例も報告されている。糖尿病患者, 腎機能障害患者, 高齢者で現れやすい ⑧**錯乱** (頻度不明)、**せん妄** (頻度不明)、**幻覚等の精神症状** (頻度不明) ⑨**大動脈瘤** (頻度不明)、**大動脈解離** (頻度不明) : (重要な基本的注意②, 特定背景関連注意①③参照) ⑩**アキレス腱炎, 腱断裂等の腱障害** (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中止し, 適切な処置を行う (特定背景関連注意⑥⑩参照) ⑪**痙攣** (頻度不明) ⑫**QT延長** (頻度不明)、**心室頻拍 (Torsade de pointesを含む)** (頻度不明) ⑬**間質性肺炎** (頻度不明) ⑭**横紋筋融解症** (頻度不明)

②その他の副作用

	1~10%未満	0.1~1%未満	頻度不明
過敏症	発疹	痒痒症, 蕁麻疹	光線過敏症
精神神経系	頭痛	めまい, 不眠症	
消化器	軟便※, 下痢※, 腹痛	腹部不快感, 悪心, 腹部膨満, 便秘, 消化不良, 口唇炎, 嘔吐, 口渇, 口内炎, 排便回数増加, 舌炎, 口の錯感覚	
肝臓	ALT上昇, AST上昇, γ -GTP上昇	Al-P上昇, LDH上昇	
血液	好酸球数増加	好中球数減少, 血小板数増加, 白血球数減少, 白血球数増加	
その他		CK上昇, 血糖減少, 血中カリウム増加, トリグリセリド増加, 尿蛋白陽性, 腔カンジダ症, 異常感, 血中カリウム減少, 背部痛, 悪寒, 倦怠感	浮腫

※ : (効能関連注意①参照)

【その他の注意】非臨床試験に基づく情報 : 培養細胞 (チャイニーズ・ハムスター由来) で, 光染色体異常誘発性が認められている (*in vitro*) 【取扱い上の注意】〔細粒〕プラスチックボトル開封後は遮光して保存する 【保存等】室温保存。有効期間 : 3年

【薬物動態】①血中濃度 : 健康成人男性に単回経口投与 (空腹時及び食後 ; 各6例) 時の血清中濃度推移は電子添文参照, 薬物動態パラメータは次のとおり

	50mg空腹時	100mg空腹時	100mg食後
C_{max} ($\mu\text{g/mL}$)	0.51 $\pm$ 0.14	1.00 $\pm$ 0.14	0.88 $\pm$ 0.31
T_{max} (hr)	1.2 $\pm$ 0.5	1.2 $\pm$ 0.5	2.0 $\pm$ 0.8
$t_{1/2}$ (hr)	6.2 $\pm$ 0.4	5.7 $\pm$ 0.7	5.5 $\pm$ 0.5

$AUC_{0-\infty}$ ($\mu\text{g} \cdot \text{hr/mL}$)	2.62 $\pm$ 0.52	5.55 $\pm$ 1.22	5.81 $\pm$ 1.31
Vd_z/F (L/kg)	2.8 $\pm$ 0.5	2.5 $\pm$ 0.7	2.3 $\pm$ 0.3

ノンコンパートメント解析

②分布 ③50mg又は100mgを単回経口投与時の各組織及び体液中濃度は次のとおりであり, 良好な組織移行性を確認

組織・体液	投与量	投与後時間 (hr)	組織・体液中濃度 ($\mu\text{g/g}$, $\mu\text{g/mL}$)	対血清中濃度比
中耳粘膜	100mg (9例)	2.7~3.1	0.82 $\pm$ 0.73	1.4 $\pm$ 0.7※
上顎洞粘膜	100mg (4例)	2.0~3.0	0.56 $\pm$ 0.31	1.1 $\pm$ 0.8
篩骨洞粘膜	100mg (6例)	2.3~4.0	0.96 $\pm$ 0.61	1.6 $\pm$ 0.5
口蓋扁桃	50mg (10例)	2.0~3.8	0.63 $\pm$ 0.20	1.8 $\pm$ 0.4
歯肉	50mg (10例)	2.7~3.7	0.57 $\pm$ 0.17	1.3 $\pm$ 0.4
拔牙創貯留液	50mg (10例)	2.7~3.7	0.32 $\pm$ 0.17	0.8 $\pm$ 0.5

※ : 血清中濃度が定量下限未満となった被験者以外の8例の値 ④血清蛋白結合率 : 健康成人に100mg単回経口投与後1時間, 4時間, 8時間での血清蛋白結合率は46~55% (限外ろ過法) であり, いずれの時点でもほぼ一定の値 ⑤ラット乳汁移行性 : 分娩後9日目の哺育中ラットに ^{14}C -標識シタフロキサシン水和物4.69mg/kgを非絶食下单回経口投与時, 投与後8時間までの乳汁中放射能濃度の血清中濃度に対する比は2.59~4.25 (特定背景関連注意④参照) ⑥代謝 : 本剤はほとんど代謝を受けず, 未変化体のまま尿中に排泄。一部, 血清, 尿, 糞中代謝物としてグルクロナイド, 7'-オキシ体, 7'S-水酸化体, 7'S-水酸化体グルクロナイド, N-アセチル抱合体が認められた (外国人データ)。ヒト生体試料を用いた*in vitro*試験では, チトクロームP450分子種CYP1A1及びCYP1A2に対し弱い阻害を示したが, CYP2C9, CYP2D6及びCYP3A4などに対しては, 阻害は認められなかった (*in vitro*) ⑦排泄 : 健康成人に50mg, 100mgを空腹時単回経口投与後48時間までに, それぞれ投与量の約70%が未変化体のまま尿中に排泄。また, ^{14}C -標識体100mg単回経口投与後72時間までに約80%が尿中へ, 約20%が糞中に排泄 (外国人データ) ⑧特定の背景を有する患者 ⑨腎機能障害患者 : CLcr値により3群に分け, 50mgを空腹時単回投与時, 腎機能低下に伴い, 血清中濃度の消失の遅延及び尿中排泄の遅延が認められた。薬物動態パラメータは次のとおり (用法関連注意, 特定背景関連注意②参照)

腎機能 (CLcr mL/min)	軽度障害 (6例) 60 $\leq$ CLcr<90	中等度障害 (3例) 30 $\leq$ CLcr<60	重度障害 (3例) 10 $\leq$ CLcr<30
C_{max} ($\mu\text{g/mL}$)	0.63 $\pm$ 0.35	0.75 $\pm$ 0.22	0.60 $\pm$ 0.06
T_{max} (hr)	1.7 $\pm$ 1.1	1.5 $\pm$ 1.3	1.8 $\pm$ 1.9
$t_{1/2}$ (hr)	7.5 $\pm$ 1.3	11.5 $\pm$ 2.2	16.3 $\pm$ 2.1
$AUC_{0-24\text{hr}}$ ($\mu\text{g} \cdot \text{hr/mL}$)	4.18 $\pm$ 0.91	6.29 $\pm$ 1.21	6.33 $\pm$ 0.67
累積尿中排泄率 (%) 0~24時間	43.4 $\pm$ 7.1	37.4 $\pm$ 4.2	14.5 $\pm$ 5.1
累積尿中排泄率 (%) 0~48時間	48.9 $\pm$ 7.4	44.7 $\pm$ 2.2	20.1 $\pm$ 5.8

ノンコンパートメント解析

《参考 : 腎機能低下患者の目安とされる用法・用量で投与時の母集団薬物動態解析から推定した薬物動態パラメータ (体重60kgとした場合)》

腎機能 CLcr (mL/min)	C_{max} ($\mu\text{g/mL}$)	$AUC_{0-24\text{hr}}$ ($\mu\text{g} \cdot \text{hr/mL}$)
50 $\leq$ CLcr	$C_{max} \leq 0.72$ ※1	$AUC_{0-24\text{hr}} \leq 12.92$ ※1

	$C_{max} \leq 1.01^{※2}$	$AUC_{0-24h} \leq 12.92^{※2}$
$30 \leq CL_{cr} < 50$	$0.51 < C_{max} \leq 0.67$	$6.46 < AUC_{0-24h} \leq 10.78$
$10 \leq CL_{cr} < 30$	$0.50 < C_{max} \leq 0.91$	$5.39 < AUC_{0-48h} \times 1/2 \leq 16.13$

※1：50mg1日2回。※2：100mg1日1回

⑥高齢者：高齢者5例（67～80歳）及び非高齢者6例（25～35歳）に100mgを空腹時単回投与時、非高齢者群に比べて高齢者群では、 $t_{1/2}$ の延長、 C_{max} の低下及び AUC_{0-24h} の増加がみられた。本剤の薬物動態は、加齢に伴う吸収・排泄機能低下により影響されることが示唆された。薬物動態パラメータは次のとおり（特定背景関連注意⑥⑥参照）

	C_{max} ($\mu\text{g/mL}$)	T_{max} (hr)	AUC_{0-24h} ($\mu\text{g} \cdot \text{hr/mL}$)	$t_{1/2}^{※}$ (hr)
高齢者	0.61 ± 0.23	3.80 ± 1.48	6.35 ± 1.51	6.05 ± 1.19
非高齢者	0.91 ± 0.38	0.92 ± 0.20	4.86 ± 0.82	3.30 ± 1.18

ノンコンパートメント解析。※：1-コンパートメントモデル解析で算出

⑥薬物相互作用 アルミニウム又はマグネシウム含有の制酸薬等、カルシウム剤、鉄剤：本剤100mgを単回経口投与時、乾燥水酸化アルミニウムゲル（1g）、酸化マグネシウム（500mg）、沈降炭酸カルシウム（1g）又は乾燥硫酸鉄（鉄として50mg）を併用経口投与した場合、本剤の AUC_{0-24h} はそれぞれ本剤単独投与時の25％、49％、68％及び44％に低下し、本剤の C_{max} はそれぞれ本剤単独投与時の18％、43％、63％及び33％に低下（相互作用参照） 【臨床成績】 ①有効性及び安全性に関する試験 ③咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、肺炎、慢性呼吸器病変の二次感染 国内第Ⅲ相試験：呼吸器感染症患者を対象とした臨床試験において、50mgを1日2回又は100mgを1日1～2回投与時の有効率（有効例数/評価対象例数）は呼吸器感染症全体で93.3％（489/524）。疾患別では、咽頭・喉頭炎100％（8/8）、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）91.7％（11/12）、急性気管支炎100％（14/14）、肺炎：全体93.8％（350/373）〔細菌性肺炎93.9％（323/344）、非定型肺炎（細菌との混合感染を含む）：全体93.1％（27/29）〔マイコプラズマ肺炎90.9％（20/22）、クラミジア肺炎100％（6/6）、レジオネラ肺炎－（1/1）〕〕、慢性呼吸器病変の二次感染90.6％（106/117） ⑥膀胱炎、腎盂腎炎 国内第Ⅲ相試験：尿路感染症患者を対象とした臨床試験において、50mg又は100mgを1日2回投与時の有効率（有効例数/評価対象例数）は尿路感染症全体で95.0％（302/318）。疾患別では、膀胱炎94.8％（239/252）、腎盂腎炎95.5％（63/66） ⑦尿道炎、子宮頸管炎：国内第Ⅲ相試験 ⑦非淋菌性性感染症患者を対象とした臨床試験において、50mgを1日2回投与時の有効率（有効例数/評価対象例数）は非淋菌性性感染症全体で93.3％（70/75）。疾患別では、尿道炎：全体88.6％（31/35）〔非淋菌性クラミジア性85.2％（23/27）、非淋菌性非クラミジア性100％（8/8）〕、子宮頸管炎97.5％（39/40） ④副作用発現頻度は25.3％（22/87）で、主な副作用は下痢11.5％（10/87） ④中耳炎、副鼻腔炎：国内第Ⅲ相試験 ⑦耳鼻咽喉科領域感染症患者を対象とした臨床試験において、50mg又は100mgを1日2回投与時の有効率（有効例数/評価対象例数）は耳鼻咽喉科領域感染症全体で

88.5％（85/96）。疾患別では、中耳炎87.8％（43/49）、副鼻腔炎89.4％（42/47） ④副作用発現頻度は37.3％（38/102）で、主な副作用は下痢19.6％（20/102） ③歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎：国内第Ⅲ相試験 ⑦歯科・口腔外科領域感染症患者を対象とした臨床試験において、50mg又は100mgを1日2回投与時の有効率（有効例数/評価対象例数）は歯科・口腔外科領域感染症全体で97.6％（41/42）。疾患別では、歯周組織炎100％（17/17）、歯冠周囲炎100％（7/7）、顎炎94.4％（17/18） ④副作用発現頻度は44.9％（22/49）で、主な副作用は下痢22.4％（11/49）、ALT増加10.2％（5/49）、AST増加6.1％（3/49） ④効能共通 国内第Ⅲ相試験：呼吸器感染症、尿路感染症、耳鼻咽喉科領域感染症、歯科・口腔外科領域感染症及び性感染症患者を対象とした臨床試験より収集した原因微生物の菌種別の菌消失率は次のとおり

菌種・菌属	菌消失率（％） （消失菌株/菌消失率評価菌株数）
ブドウ球菌属	95.6（108/113）
レンサ球菌属（肺炎球菌を除く）	100（61/61）
肺炎球菌	95.7（157/164）
ペニシリン耐性肺炎球菌※1	92.9（13/14）
ペニシリン中等度耐性肺炎球菌	96.2（50/52）
※2	
マクロライド耐性肺炎球菌※3	94.8（110/116）
多剤耐性肺炎球菌※4	95.3（81/85）
腸球菌属	99.1（111/112）
モラクセラ（ブランハメラ）・カタラリス	100（35/35）
大腸菌	92.5（123/133）
シトロバクター属	100（12/12）
クレブシエラ属	93.1（54/58）
エンテロバクター属	100（14/14）
セラチア属	77.8（7/9）
プロテウス属	87.5（7/8）
モルガネラ・モルガニー	－（4/4）
インフルエンザ菌	100（108/108）
BLNAR※5	100（31/31）
緑膿菌	70.2（33/47）
呼吸器感染症由来緑膿菌	18.2（2/11）
尿路感染症由来緑膿菌	90.9（30/33）
ベプトストレプトコッカス属	100（21/21）
ブレボテラ属	100（33/33）
ボルフィロモナス属	－（3/3）
フソバクテリウム属	－（2/2）
トラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス）	96.9（63/65）
肺炎クラミジア（クラミジア・ニューモニエ）	－（1/1）
肺炎マイコプラズマ（マイコプラズマ・ニューモニエ）	100（13/13）

※1：ペニシリンG；MIC $\geq 2\mu\text{g/mL}$ 〔経口ペニシリンVの基準（CLSI法）を使用〕。※2：ペニシリンG； $0.12\mu\text{g/mL} \leq \text{MIC} \leq 1\mu\text{g/mL}$ 〔経口ペニシリンVの基準（CLSI法）を使用〕。※3：クラリスロマイシン；MIC $\geq 1\mu\text{g/mL}$ 又はエリスロマイシン；MIC $\geq 1\mu\text{g/mL}$ 。※4：キノロン耐性〔レボフロキサシン；MIC $\geq 8\mu\text{g/mL}$ 又はモキシフロキサシン；MIC $\geq 4\mu\text{g/mL}$ 〕、ペニシリン耐性〔ペニシリンG；MIC $\geq 2\mu\text{g/mL}$ 〔経口ペニシリンVの基準（CLSI法）を使用〕〕、セフェム耐性〔セフロキシム；MIC $\geq 2\mu\text{g/mL}$ 〕、マクロライド耐性〔クラリスロマイシン；MIC $\geq 1\mu\text{g/mL}$ 又はエリス

ロマイシン；MIC≧1μg/mL〕，テリスロマイシン耐性〔テリスロマイシン；MIC≧4μg/mL〕，テトラサイクリン耐性〔テトラサイクリン；MIC≧8μg/mL〕，スルファメトキサゾール・トリメトプリム耐性〔スルファメトキサゾール・トリメトプリム；MIC≧76/4μg/mL〕，のうち2系統以上の耐性株。^{※5}：β-ラクタマーゼ非産生アンピシリン耐性インフルエンザ菌

②その他 ①a光毒性に対する影響：健康成人（白人6例）を対象とした臨床試験において，本剤を経口投与時の光毒性指数^{※1}（中央値）は次のとおりであり，紫外光照射により光毒性を示した（外国人データ）

投与群	波長335 ± 30nm	波長365 ± 30nm	波長400 ± 30nm
500mg 1日1回 ^{※2}	3.38	11.10	9.10
500mg 1日2回 ^{※2}	5.50	18.30	14.70

※1：投与前の最小発赤線量の中央値/投与後の最小発赤線量の中央値（<1.4：なし，1.4-3.0：軽度，>3.0-6.0：中等度，>6.0：重度）

②QTcF間隔に対する影響：健康成人を対象とした臨床試験において，本剤400，600又は800mgを1日2回静注^{※2}時のQTcF間隔延長に用量相関性が認められ，変動幅の平均は10msec以下（外国人データ）。^{※2}：承認1日最大用量は経口投与100mg（効果不十分と思われる症例には200mg）
【薬効薬理】 ①作用機序：本剤は細菌のDNAジャイレース及びトポイソメラーゼIVに対して阻害活性を示し，殺菌的に作用。両酵素に対する阻害活性は，対照とした他のニューキノロン系抗菌薬より強かった。更に，本剤はキノロン耐性菌由来酵素に対しても強い阻害活性を示した（*in vitro*） ②抗菌作用：本剤は好気性又は嫌気性のグラム陽性菌及びグラム陰性菌，非定型菌に対し，幅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，モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス，大腸菌，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，インフルエンザ菌，緑膿菌，レジオネラ・ニューモフィラ，ペプトストレプトコッカス属，プレボテラ属，ポルフィロモナス属，フソバクテリウム属，トラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス），肺炎クラミジア（クラミジア・ニューモニエ），肺炎マイコプラズマ（マイコプラズマ・ニューモニエ）などに対して強い抗菌力。特に肺炎球菌（ペニシリン耐性，マクロライド耐性及び多剤耐性肺炎球菌を含む）及び腸球菌属，緑膿菌及び大腸菌（キノロン耐性大腸菌を含む）に対して，他のニューキノロン系抗菌薬に比べ強い抗菌活性を示した ③実験的感染症に対する治療効果：グラム陽性菌及びグラム陰性菌によるマウス敗血症モデルで，本剤は*in vitro*での抗菌力を反映する感染防御効果を，また，肺炎球菌によるマウス呼吸器感染モデルで，対照とした他のニューキノロン系抗菌薬より優れた治療効果を示した ④呼吸器感染症でのPK/PD解析：成人の呼吸器感染症を対象とした臨床試験で実施したPK/PD解析結果から，AUC_{0-24hr}/MIC又はC_{max}/MICの上昇に伴い，原因菌の消失率が上昇することを確認。肺炎球菌22株を含む呼吸器感染症の主要原因菌の消失率は，AUC_{0-24hr}/MICが100を超えた場合に96.3%（78/81），C_{max}/MICが5を超えた場合に96.3%（79/82）。また，肺炎球菌性呼吸器感染症を対象とした臨床試験での肺炎球菌の消失率は，血清中シタフロキサシン濃度を非結合型濃度に換算したfAUC_{0-24hr}/MICが30を超えた場合に98.9%（89/90），fC_{peak}/MICが2を超えた場合に98.9%（89/90）

【性状】 シタフロキサシン水和物（STFX）は微黄白色～黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。リン酸試液にやや溶けにくく，0.1mol/L塩酸試液，アセトニトリル又はメタノールに溶けにくく，エタノール（99.5）に極めて溶けにくく，水にほとんど溶けない。光によって淡黄褐色となる（リン酸試液：リン酸50gを水950mLに溶かす）。融点：217～223℃