＊＊2009年6月改訂（第７版，指定医薬品の規制区分の廃止に伴う改訂）
＊2009年2月改訂

貯　　法：室温保存
使用期限：外箱等に表示（使用期間２年）

日本標準商品分類番号
876132

持続性経口用セフェム系抗生物質製剤
処方せん医薬品[注1)]＊＊

L-ケフレックス®顆粒 ①

セファレキシン複粒
L-Keflex®　〔規制区分から「指定医薬品」を削除〕

	①
承認番号	15300EMZ00796
薬価収載	1979年4月
販売開始	1979年4月
再評価結果	2004年9月
効能追加	1981年11月

シオノギ製薬

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】
本剤の成分によるショック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）】
本剤の成分又は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

販売名	L-ケフレックス顆粒
成分・含量〔1包（1g）中〕	セファレキシン 500mg（力価） 胃溶性粒：セファレキシン 150mg（力価） 腸溶性粒：セファレキシン 350mg（力価）
添加物	白糖，トウモロコシデンプン，低置換度ヒドロキシプロピルセルロース，ヒドロキシプロピルセルロース，D-マンニトール，メチルセルロース，タルク，ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートサクシネート，クエン酸トリエチル，サラシミツロウ，含水二酸化ケイ素，黄色５号

2.　性状

販売名	L-ケフレックス顆粒
性状・剤形	ごくうすいだいだい色の顆粒で，わずかに特異なにおいがあり，味はほとんどない。

【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，大腸菌，クレブシエラ属，プロテウス・ミラビリス
＜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
○ 咽頭・喉頭炎，扁桃炎（扁桃周囲炎を含む），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，前立腺炎（急性症，慢性症）
○ バルトリン腺炎
○ 涙嚢炎，麦粒腫
○ 外耳炎，中耳炎，副鼻腔炎
○ 歯周組織炎，歯冠周囲炎，顎炎，抜歯創・口腔手術創の二次感染

【用法・用量】

通常，成人及び体重 20kg 以上の小児にはセファレキシンとして１日 1g（力価）を２回に分割して，朝，夕食後に経口投与する。
重症の場合や分離菌の感受性が比較的低い症例にはセファレキシンとして１日 2g（力価）を２回に分割して，朝，夕食後に経口投与する。
なお，年齢，体重，症状により適宜増減する。

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞
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。

【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［血中濃度が持続するので，投与量を減らすか，投与間隔をあけて使用すること。］
(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［「高齢者への投与」の項参照］

2.　重要な基本的注意
ショックがあらわれるおそれがあるので，十分な問診を行うこと。

3.　副作用
本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していないため，発現頻度については文献，自発報告等を参考に集計した。

(1) 重大な副作用
1) ショック，アナフィラキシー様症状（0.1%未満）：ショック，アナフィラキシー様症状（呼吸困難，全身潮紅，浮腫等）を起こすことがあるので，観察を十分に行い，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。
2) 急性腎不全（0.1%未満）：急性腎不全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。
3) 溶血性貧血（0.1%未満）：溶血性貧血があらわれることがあるので，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) 偽膜性大腸炎（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。
5) 皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群），中毒性表皮壊死症（Lyell 症候群）（0.1%未満）：皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群），中毒性表皮壊死症（Lyell 症候群）があらわれることがあるので，観察を十分に行い，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。
6) 間質性肺炎，PIE 症候群（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，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。

注1）注意－医師等の処方せんにより使用すること

(2) その他の副作用

種類＼頻度	5%以上又は頻度不明	0.1～5%未満	0.1%未満
過敏症[注1]	**発疹，蕁麻疹，紅斑，そう痒，発熱，リンパ腺腫脹，関節痛等**		
血液[注1]			**顆粒球減少，好酸球増多，血小板減少**
肝臓[注2]			**黄疸，AST（GOT）上昇，ALT（GPT）上昇，Al-P上昇**
消化器		悪心，嘔吐，下痢，軟便，腹痛，食欲不振，胃不快感等	
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1：症状（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。
注2：症状（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。

4. 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。

5. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与

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。］

6. 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。

7. 適用上の注意

(1) **調剤時**：原則としてSP包装のまま調剤すること。SP包装を開封して調剤すると2種類の顆粒が偏析を起こし，混合比率が変化することがあるので注意すること。

(2) **調製方法**：牛乳，ジュース等に懸濁したまま放置しないように注意すること。

(3) **服用時**

1) かまずに服用するように注意すること。

2) 制酸剤を配合したり，同時に服用すると，本剤の腸溶性が損なわれるおそれがあるので避けることが望ましい。やむを得ず併用するときは十分に服用間隔をあけること。

【薬物動態】

1. 血中濃度

健康成人に，セファレキシン複粒500mg（力価）（*n*=5），1g（力価）（*n*=10）を食後単回経口投与したときの血中濃度及び薬物動態パラメータを図1・表1に示す。血中濃度は多少のばらつきがあるが二峰性を示す傾向がみられた[1)]

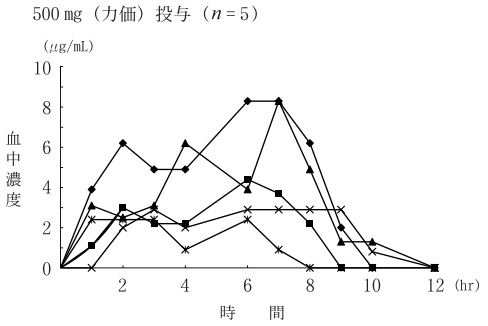


図1 経口投与時の血中濃度

表1 薬物動態パラメータ

投与量	*n*	Cmax (μg/mL)	AUC_{0-10} (μg・hr/mL)
500mg（力価）	5	5.3±2.9	29.8±15.6
1g（力価）	10	11.7±2.9	65.7±13.0

（測定法：bioassay）（mean±S.D.）

2. 代謝

（参考）

健康成人にセファレキシンカプセル経口投与後，生体内で代謝されず未変化のまま尿中に排泄された[2)]。

3. 排泄

健康成人にセファレキシン複粒500mg（力価）（*n*=5）及び1g（力価）（*n*=10）を食後単回経口投与したときの12時間までの平均尿中回収率（mean±S.E.）は，それぞれ56.3±8.0%，91.8±2.0%を示した[1)]。

4. その他

（参考）

血清蛋白結合率：限外ろ過法にて測定されたセファレキシンの血清蛋白結合率は約15%であった[3)]。（外国人によるデータ）

【臨床成績】

承認時における一般臨床試験での有効性評価対象例は1650例（顆粒，カプセル※，カプセル125※を含む）であり，有効率は85.4%（1409例）であった。（※ L-ケフレックスカプセル，カプセル125は販売中止）

表2 臨床成績

疾患	有効例数/有効性評価対象例数	有効率（%）
皮膚科領域感染症	143/155	92.3
外科領域感染症	25/27	92.6
呼吸器感染症	285/359	79.4
尿路感染症	604/684	88.3
産婦人科領域感染症	11/11	100
眼科領域感染症	81/84	96.4
耳鼻科領域感染症	45/69	65.2
歯科・口腔外科領域感染症	215/261	82.4

【薬効薬理】

1. 薬理作用

抗菌作用

セファレキシンは，試験管内でブドウ球菌属，レンサ球菌属，肺炎球菌，大腸菌，クレブシエラ属，プロテウス・ミラビリスに抗菌力を示す[4),5)]。

2. 作用機序

細菌の細胞壁合成を阻害することにより抗菌作用を発揮し，その作用は殺菌的である[6)]。

【有効成分に関する理化学的知見】

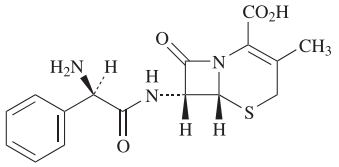
一般的名称：セファレキシン（JAN）［日局］
Cefalexin
略号　CEX

化学名：　(6*R*,7*R*)-7-[(2*R*)-2-Amino-2-phenylacetylamino]-3-methyl-8-oxo-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylic acid

分子式：　$C_{16}H_{17}N_3O_4S$

分子量：　347.39

化学構造式：



性状：　白色～淡黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。
水にやや溶けにくく，メタノールに溶けにくく，エタノール（95）又は*N*,*N*-ジメチルホルムアミドにほとんど溶けない。
吸湿性である。

融点：　約170℃（分解）

分配係数：　0.14［pH7.2，1-オクタノール/緩衝液］

【包装】

L-ケフレックス顆粒：SP100g（1g×100包），
SP500g（1g×500包）

【主要文献】

〔文献請求番号〕

1) 上田泰ほか：最新医学，1977,**32**(6),1189〔197700121〕
2) 西村治雄ほか：最新医学，1969,**24**(9),1983〔196900019〕
3) Kind,A.C.et al.:Antimicrob.Agents Chemother.,1968,361〔196800050〕
4) 西野武志ほか：Chemotherapy,1979,**27**(S-7),38〔197900102〕
5) 中沢昭三ほか：Jpn.J.Antibiot.,1969,**22**(4),269〔196900025〕
6) 上田泰ほか：化学療法ハンドブック，1975,pp.16-18，永井書店，東京

【文献請求先】

塩野義製薬株式会社 医薬情報センター
〒541-0045 大阪市中央区道修町3丁目1番8号
電話 0120-956-734
FAX 06-6202-1541
http://www.shionogi.co.jp/med/

製造販売元

塩野義製薬株式会社

〒 541-0045　大阪市中央区道修町 3 丁目 1 番 8 号

〔提携会社名削除〕*

®:登録商標*