

※2010年8月改訂（第9版、日局15第2追補の制定に基づく改訂）

※2009年6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）

経口用セフェム系抗生物質製剤

日本薬局方[※] セファレキシンカプセル

処方せん医薬品^{注1）}*

ケフレックス[®]カプセル250mg^①

 シオノギ製薬

Keflex[®]

日本標準商品分類番号
876132

	①
承認番号	21900AMX00246
薬価収載	2007年6月
販売開始	1970年5月
再評価結果	2004年9月
効能追加	2005年3月

【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	ケフレックスカプセル 250mg
成分・含量 (1カプセル中)	セファレキシン 250mg（力価）
添加物	トウモロコシデンプン、タルク、ステアリン酸マグネシウム、含水二酸化ケイ素 カプセル本体中：ラウリル硫酸ナトリウム、ゼラチン、酸化チタン、青色1号、黄色5号

2. 性状

販売名	ケフレックスカプセル 250mg
性状・剤形	ボディは白色、キャップは帯灰緑色の硬カプセル剤で、内容物はほとんど白色の粉末で、味はやや苦く、においはほとんどない。
外形	
大きさ	2号カプセル
重量	約0.36g
識別コード	 H69

【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、淋菌、大腸菌、クレブシエラ属、エンテロバクター属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、プロピデンシア属、インフルエンザ菌

＜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
- 骨髓炎、筋炎
- 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）
- 淋菌感染症、子宮頸管炎
- バルトリン腺炎、子宮内感染
- 涙嚢炎、麦粒腫、角膜炎（角膜潰瘍を含む）
- 外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、化膿性唾液腺炎
- 歯周組織炎、歯冠周囲炎、上顎洞炎、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回250mg（力価）を6時間ごとに経口投与する。

重症の場合や分離菌の感受性が比較的低い症例には1回500mg（力価）を6時間ごとに経口投与する。

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。（「薬物動態」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〔「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（Lyle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（Lyle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。

注1) 注意－医師等の処方せんにより使用すること

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。

(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, 掻痒, 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, AI-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

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。)

【薬物動態】

1. 血中濃度

(1) 健康成人

健康成人にセファレキシンカプセル 250mg (力価), 500mg (力価) 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¹⁾。

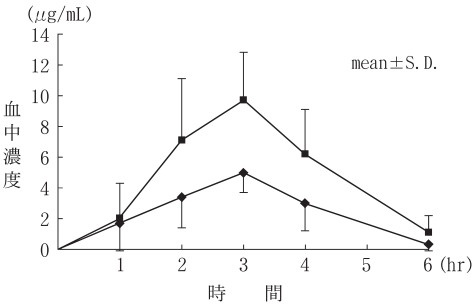


図 1 経口投与時の血中濃度

表 1 薬物動態パラメータ

記号	投与量 [mg (力価)]	n	Cmax (µg/mL)	Tmax (hr)	AUC ₀₋₆ (µg・hr/mL)	T _{1/2} (hr)
◆	250	7	5.5±0.8	2.9±0.4	14.94±3.69	1.24±0.74
■	500	8	10.3±2.9	2.9±0.6	29.11±8.53	1.05±0.34

(測定法: bioassay) (mean±S. D.)

(2) 腎機能障害患者

腎機能障害患者に 500mg (力価) を単回経口投与したとき, GFR (glomerular filtration rate; 糸球体ろ過値) の低下に伴い, Cmax, Tmax が高値を示す傾向がみられた²⁾。(外国人によるデータ)

表 2 薬物動態パラメータ

GFR (mL/min)	n	Cmax (µg/mL)	Tmax (hr)
<10	9	25.9	2.7
10~20	4	32.6	4
20~50	4	21.9	1.6
>50	1	19.0	1.0
腎機能正常者	18	12.7	1.0

(mean)

また, GFR が 30mL/min 以下では半減期が著明に延長した²⁾。(外国人によるデータ)

2. 代謝

健康成人に経口投与後, 生体内で代謝されず, 未変化のまま尿中に排泄された³⁾。

3. 排泄

健康成人に 250mg (力価) (n=8), 500mg (力価) (n=8) を食後経口投与したときの 6 時間までの平均尿中回収率は約 90% であった¹⁾。

4. その他

血清蛋白結合率: 限外ろ過法にて測定された血清蛋白結合率は約 15% であった⁴⁾。(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 1243 例 (カプセル, 錠*を含む) であり, 有効率は 85.9% (1068 例) であった。(※ケフレックス錠は販売中止)

表 3 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	188/212	88.7
外科領域感染症	30/38	78.9
整形外科領域感染症	6/6	—
呼吸器感染症	129/147	87.8
尿路感染症	427/510	83.7
性感染症	66/84	78.6
産婦人科領域感染症	16/19	84.2
眼科領域感染症	22/25	88.0
耳鼻科領域感染症	67/78	85.9
歯科・口腔外科領域感染症	117/124	94.4

【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、淋菌、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^{5), 6)}。

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⁷⁾。

【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

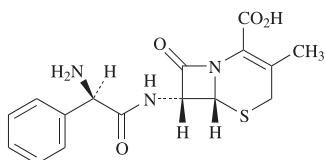
略号： CEX

化学名： (6*R*, 7*R*)-7-[(2*R*)-2-Amino-2-phenylacetyl-amino]-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】

ケフレックスカプセル 250mg：PTP100 カプセル (10 カプセル×10),
PTP500 カプセル (10 カプセル×50)

【主要文献】

[文献請求番号]

- 1) 前川秀幸ほか：Jpn. J. Antibiot., 1977, **30**(8), 631 [197700122]
- 2) Bailey, R. R. et al. : Postgrad. Med. J., 1970, **46**(S), 60 [197000142]
- 3) 西村治雄ほか：最新医学, 1969, **24**(9), 1983 [196900019]
- 4) Kind, A. C. et al. : Antimicrob. Agents Chemother., 1968, 361 [196800050]
- 5) 西野武志ほか：Chemotherapy, 1979, **27**(S-7), 38 [197900102]
- 6) 中沢昭三ほか：Jpn. J. Antibiot., 1969, **22**(4), 269 [196900025]
- 7) 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]*

