

▼ジェニナック錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】ガレノキサシン (GRNX) garenoxacin mesilate hydrate 【分類】キノロン系経口抗菌剤

【単位】▼200mg/錠

【常用量】400mg/日

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】400mg/日 (1) であるが消失遅延のため慎重投与 (5)

【その他の報告】HD 患者への投与試験は実施されているが、比較的若年で肥満傾向の患者でのデータであり、Cmax は20~50%低く、t1/2 は2~3 倍延長している (5) 200mg/日にて Cmax 3mg/L, 効果あり [n=6, 平均体重 48kg] (青山東五, 他:日腎会誌 43:258, 2012) NHCAP に対して、TAZ/PIPC と比較して非劣勢 (鈴木克典, 他:第 62 回日本化学療法学会抄録 p265, 2014) 高度腎障害患者で 400mg×1/日を推奨 (Yamagishi Y, et al: Jpn J Antibiot 68: 141-50, 2015)

【保存期 CKD 患者への投与方法】低体重 (40kg 未満) の患者でかつ透析等を受けていない高度の腎機能障害 (Ccr 30mL/min 未満) 患者へは 200mg/日 (1)

【その他の報告】AUC は透析を必要としない重度の腎機能障害患者で 51%増加し, HD 又は PD 患者で 1.2~21%増加 (1)

【特徴】経口キノロン剤で、トポイソメラーゼ II を阻害する。PK-PD 理論により AUC/MIC 比を高めるため 1 日 1 回投与が設定されている。光線過敏症, 中枢毒性が軽減されているという (1)

【主な副作用・毒性】ショック, アナフィラキシー, QT 延長, 心室頻拍, けいれん, 血糖障害, 低血圧, 低血糖, 偽膜性大腸炎, SJS, TEN, 間質性肺炎, 肝障害, 急性腎不全, 血球減少, アキレス腱炎, 幻覚, せん妄など。

【安全性に関する情報】低体重の症例で副作用発現率が高くなる傾向を認めている (1) 意識障害等があらわれることがあるので, 自動車の運転等, 危険を伴う機械の操作に従事する際には注意するよう患者に十分に説明すること (1)

【ka】4.80±0.54/hr (1)

【F】92% (1) 腎障害患者では経口吸収率が低下する可能性がある (Krishna G et al: Curr Med Res Opin 23:649-657,2007)

【tmax】約 2hr (1) 【Cmax】400mg 投与時 9.21±2.28 μg/mL (1) 透析を必要としない重度の腎機能障害患者で 20~50%減少 (1)

【代謝】硫酸抱合体及びグルクロン酸抱合体が主代謝物。CYP への関与は低い (1) 硫酸抱合体が主代謝物であるが, 未変化体に対する濃度比は 2.2~5.0%とわずか (1) 代謝物の活性は未変化体の 1/4~1/4096 (1)

【排泄】尿中回収率 (おそらく未変化体として) : 31.7±6.0% [24hr まで], 43.6±7.8% [72hr まで] (1) 25% (Krishna G et al: Curr Med Res Opin 23: 649-57, 2007)

【CL/F】67.8±11.2mL/min (1)

【t1/2】10~12hr (1) 【ke】0.0515~0.0577/hr (1) 【透析患者の t1/2】24~32hr (1)

【蛋白結合率】79~80% (1)

【Vd】71.1±9.5L/man (1)

【MW】540.53

【透析性】HD 除去率 11% (投与後 3hr から HD を実施した際の投与量に対する除去割合) (1) HD : 1.5~11.5% (Krishna G et al: Curr Med Res Opin 23: 649-57, 2007) PD 除去率 3% (1) 蛋白結合率が比較的高く, Vd もそれほど小さくないため HD によって効率的には除去されないと推測される (5)

【透析クリアランス】HD 55mL/min (E の平均は 14%なので少なくとも QB400mL/min) PD 1.6mL/min (Krishna G, et al: Curr Med Res Opin 23: 649-57, 2007)

【O/W 係数】6.78 [1-オクタノール/水系, pH7.7] (1)

【相互作用】Al, Mg 含有制酸剤: 同時投与で AUC 58%低下, 制酸剤投与後 2hr 後, 4hr 後でそれぞれ 22%, 16%低下. 制酸剤投与 2hr 前か 4hr 後に投与する必要がある (Krishna G, et al: Pharmacotherapy 27: 963-969, 2007) テオフィリンの Cmax, AUC を約 20%上昇させる (1)

【備考】他のキノロン系薬に比べ, 関節毒性が低い可能性 (Nagai A, et al: J Toxicol Sci 27:219-228,2002)

【更新日】20200125

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院ではいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。