

## ▼クラビット錠 100mg [内] &lt;販売中止&gt;

【重要度】★★ 【一般製剤名】レボフロキサシン (LVFX) (U) levofloxacin 【分類】広範囲経口抗菌製剤 (ニューキノロン系抗菌剤)

【単位】◎100mg/錠

【常用量】200~300mg (最高600mgまで) /日

【用法】分2~3

【透析患者への投与方法】4日までは1日1回100mg投与、それ以後は100mgを隔日投与 (透析会誌30:109,1997) 【その他の報告】25%に減量 (3) 1日1回100mg投与でも蓄積傾向有り (腎と透析24:133-136,1988) CLCr20ml/min以下の症例では100mgを48時間以上の間隔で投与 (Chemotherapy 40 (S3):188-195,1992) 【CAPD 腹膜炎への投与方法】100mg/日 (起因菌が緑膿菌の場合、追加投与を考慮する) (5) 【CAPD 出口部感染への投与方法】100mg/日 (起因菌がグラム陰性菌の場合に使用) (5)

【保存期腎不全患者への投与方法】CLCr>50mL/min: 海外の常用量に比し本邦の常用量は少ないため減量の必要なし、CLCr10~50mL/min: 1回100mgを12~24時間おき、CLCr<10mL/min: 1回100mgを24時間おき (5) 【その他の報告】CLCr50mL/min以上: 減量の必要なし、CLCr10~50mL/min: 初回500mg、維持量1回250mgを24~48時間おき、CLCr10mL/min以下: 初回500mg、維持量1回250mgを48時間おき (12) Ccr 50mL/min以上: 500mg1日1回、Ccr 20以上~50未満: 初回500mg、2日目以降250mg/日1日1回、Ccr 20mL/min未満: 初回500mg、3日目以降250mg隔日投与 (第57回日本化学療法学会)

【特徴】オフロキサシンの光学異性体 (L-体) で、従来のオフロキサシンのほぼ2倍の抗菌活性を有する。経口吸収性及び排泄性も同程度で安全性が高い

【主な副作用・毒性】偽膜性大腸炎、横紋筋融解症、アキレス腱炎、発疹、めまい、白血球減少、血小板減少、肝障害、腎障害、痙攣、低血糖など。低血糖はSU剤やインスリン等を使用しているDM患者、腎機能障害患者で出現しやすい (1)

【モニターすべき項目】下痢、中枢神経症状、血糖

【吸収】速やかに、ほぼ完全に吸収される。食事摂取と関係なく服用できる (U)

【F】約99% (13, U)

【tmax】1~2h、食事とともに摂取すると約1hr延長する (U) 0.9~2.4hr (1) 1.6hr (13) 【Cmax】500mg単回経口投与後のCmaxは4.5μg/mL (13)

【代謝】立体化学的に安定で、光学異性体D-オフロキサシンに変換されることはない。ほとんど代謝を受けない (U)

【排泄】腎排泄; 87%が未変化体として尿中排泄 (48hr)、腎クリアランスはGFRを越えるため、尿細管分泌もある。糞便中には72時間で4%が排泄 (U) 尿中未変化体排泄率61~87% (13) 67~87% (12) 【CL】2.52mL/min/kg、腎障害で低下 (13)

【t1/2】6~8hr (U) 7hr、腎障害で延長 (13) 4~8hr (12) 【透析患者のt1/2】非透析時約23hr、透析時4.2hr (PS膜) 4.8hr (セルロースアセテート膜) (Am J Kidney Dis 32: 642-645,1998) 非透析時34.9hr、透析時を含めて27.7hr (腎と透析24:133-136,1988) 透析時5.9hr、非透析時55.4hr (透析会誌30:109,1997) 30~39hr (Sowinski KM:Am J Kidney Dis 42:342,2003) 76hr (12)

【蛋白結合率】24~38% (13) 31~36% (平衡透析法) (1) 24~38% (12)

【Vd】1.19L/kg (1) 89~112L/man、広く分布し、水疱液や肺組織にも良好に移行する (U) 1.36L/kg (13) 1.1~1.5L/kg (12) 【分布】フルオロキノロン薬は腎、胆嚢、肝、肺、婦人科領域臓器、前立腺、食細胞、尿、痰、胆汁などの体液、臓器に高濃度で分布するが、脳脊髄液にも血清ピーク濃度の14~60%の濃度で分布 (髄膜の炎症がないとき) する (U) 【透析患者のVd】Vss: 1.0~1.6L/kg (Sowinski KM:AJKD, 42:342, 2003)

【MW】370.38

【透析性】HD・CAPDでは効率的には除去できない (U,13) 34.6% (透析会誌26: 473-477,1993) 【透析CL】オフロキサシンのポリスルホン膜による透析クリアランスは83.3mL/min/m<sup>2</sup>、セルロースアセテート膜による透析クリアランスは61.7mL/min/m<sup>2</sup> (Am J Kidney Dis 32: 642-645,1998) 50~88mL/min (腎と透析24:133-136,1988)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない 【O/W係数】0.553 (n-オクタノール水系/pH7) (1) 【pKa】5.5, 8.0 (1) 【薬物動態】動物では腎機能低下により胆汁排泄が増加する (Jpn J Antibiotics 39:2643,1986)

【併用注意】フェニル酢酸系またはプロピオン酸系NSAIDs (ロキソプロフェンなど) (痙攣を起こすことがある)。Al、Mg、Fe、Caなどの金属カチオンとの併用により吸収低下するため、金属カチオン製剤は食間投与すること。CaCO<sub>3</sub>との併用時も同時服用は避ける。

【備考】米国での報告によると、LVFXのMICが1μg/mL以下の場合に十分なCmax/MIC比を得るためのHD患者への投与方法は初回500mg、以後48hr毎に250mg (Sowinski KM:AJKD, 42:342,2003)

【更新日】20110829

※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・写真などの無断複製・転載を禁じます。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。