

広範囲経口抗菌製剤  
処方せん医薬品<sup>注)</sup> フロキン<sup>®</sup> 錠100mg  
オフロキサシン錠  
FLOKIN<sup>®</sup> Tab. 100mg

貯 法：室温保存

使用期限：3年（外箱に表示）

（注）注意-医師等の処方せんにより使用すること

承認番号	21700AMZ00786
薬価収載	2006年7月
※販売開始	2009年9月
効能追加	2007年2月

【禁忌】（次の患者には投与しないこと）

- (1)本剤の成分又はレボフロキサシン水和物に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2)妊娠又は妊娠している可能性のある婦人（「妊娠、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）
- (3)小児等（「小児等への投与」及び「その他の注意」の項参照）

【組成・性状】

販売名	フロキン錠100mg
成 分	日局オフロキサシン
含量(1錠中)	100mg
添 加 物	トウモロコシデンプン、セルロース、部分アルファーハイデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスボビドン、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、マクロゴール、酸化チタン、カルナウバロウ
性 状	白色～微黄白色のフィルムコート錠
外 形	
大 き さ	直径：8.1mm、厚み：3.8mm、質量：約204mg
識別コード	本体：IC535、PTP：IC-535

【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、らい菌、大腸菌、赤痢菌、チフス菌、パラチフス菌、シトロバクター属、肺炎桿菌、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、プロビデンシア属、インフルエンザ菌、綠膿菌、アシネトバクター属、カンピロバクター属、ペプストトレプトコッカス属、トロコーマクラミジア（クラミジア・トロコマティス）

〈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、肛門周囲膿瘍、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）、尿道炎、子宮頸管炎、胆囊炎、胆管炎、感染性腸炎、腸チフス、パラチフス、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、涙囊炎、麦粒腫、瞼板腺炎、角膜炎（角膜潰瘍を含む）、中耳炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、頸炎、ハンセン病

【用法・用量】

通常、成人に対して、オフロキサシンとして1日300～600mgを2～3回に分割して経口投与する。ハンセン病については、オフロキサシンとして1日400～600mgを2～3回に分割して経口投与する。なお、感染症の種類および症状により適宜増減する。

ハンセン病については、原則として他の抗ハンセン病剤と併用する。

腸チフス、パラチフスについては、オフロキサシンとして1回200mgを1日4回、14日間経口投与する。

〈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)高度の腎機能障害のある患者〔高い血中濃度の持続が認められている。〕
- (2)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。〕
- (3)キノロン系抗菌薬に対し過敏症の既往歴のある患者
- (4)重筋筋無力症の患者〔症状を悪化させることがある。〕
- (5)高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

2. 重要な基本的注意

- (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。

- (2)ハンセン病への使用にあたっては、「ハンセン病診断・治療指針」（厚生省・財藤楓協会発行）を参考に治療を行なうことが望ましい。

- (3)ハンセン病の治療にあたっては、本剤による治療についての科学的データの蓄積が少ないことを含め、患者に十分な説明を行い、インフォームド・コンセントを得ること。

3. 相互作用

併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
フェニル酢酸系又はプロピオノ酸系非ステロイド性消炎鎮痛薬 フルルビプロフェン等	痙攣を起こすおそれがある。	中枢神経におけるGABA <sub>A</sub> 受容体への結合阻害が増強されると考えられている。

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、鉄剤	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1～2時間後に投与する。	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。
クマリン系抗凝固薬 ワルファリン	ワルファリンの作用を増強し、プロトロンビン時間の延長が認められたとの報告がある。	ワルファリンの肝代謝を抑制、または蛋白結合部位での置換により遊離ワルファリンが増加する等と考えられている。

#### 4. 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。

##### (1)重大な副作用（頻度不明）

下記の重大な副作用があらわ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投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- 1) **ショック、アナフィラキシー**（初期症状：紅斑、悪寒、呼吸困難等）
- 2) **中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis : TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson症候群）**
- 3) **痙攣**
- 4) **QT延長、心室頻拍（Torsades de pointesを含む）**
- 5) **急性腎不全、間質性腎炎**
- 6) **劇症肝炎、肝機能障害、黄疸**（初期症状：嘔気・嘔吐、食欲不振、倦怠感、そう痒等）
- 7) **無顆粒球症**（初期症状：発熱、咽頭痛、倦怠感等）
- 8) **汎血球減少症**
- 9) **血小板減少**
- 10) **溶血性貧血**（症状：ヘモグロビン尿）
- 11) **間質性肺炎、好酸球性肺炎**（症状：発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常、好酸球增多等）  
(処置方法：副腎皮質ホルモン剤投与等)
- 12) **偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎**（症状：腹痛、頻回の下痢等）
- 13) **横紋筋融解症**（急激な腎機能悪化を伴うことがある）  
(症状：筋肉痛、脱力感、CK(CPK)上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等）
- 14) **低血糖**〔低血糖性昏睡に至る例も報告されているので、十分に注意すること。糖尿病患者（特にスルホニルウレア系薬剤やインスリン製剤等を投与している患者）、腎機能障害患者、高齢者であらわれやすい。〕
- 15) **アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害**（症状：腱周辺の痛み、浮腫）  
(60歳以上の患者、コルチコステロイド剤を併用している患者、臓器移植の既往のある患者であらわれやすい)
- 16) **錯乱、せん妄、抑うつ等の精神症状**
- 17) **過敏性血管炎**（症状：発熱、腹痛、関節痛、紫斑、斑状丘疹、皮膚生検で白血球破碎性血管炎等）
- 18) **重症筋無力症の悪化**（重症筋無力症の患者で症状の悪化があらわれることがある）

#### (2)その他の副作用

下記の副作用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必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症	発疹、浮腫、荨麻疹、熱感、そう痒、光線過敏症等
精神神経系	不眠、頭痛、振戦、しびれ感、めまい、眠気、幻覚、興奮、不安、意識障害、錐体外路障害
泌尿器	BUN上昇、クレアチニン上昇等、血尿、尿閉、無尿、頻尿
肝臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、AI-P上昇、γ-GTP上昇等
血液	白血球減少、好酸球增多、貧血等
消化器	悪心、嘔吐、下痢、食欲不振、腹痛、消化不良、腹部不快感、口内炎、舌炎、口渴、便秘、腹部膨満感
感覚器	耳鳴、味覚異常、視覚異常
その他	倦怠感、発熱、動悸、胸痛、関節痛、関節障害、筋肉痛、脱力感、発汗、高血糖

#### 5. 高齢者への投与

(1)本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため、高い血中濃度が持続するおそれがあるので用量に留意し、慎重に投与すること。

(2)ハンセン病の場合には投与が長期に及ぶことが多いので、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。

#### 6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1)妊娠又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。〔妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。〕

(2)授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。  
〔ヒト母乳中へ移行することがある。〕

#### 7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していないので、投与しないこと。（「その他の注意」の項参照）

#### 8. 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縫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。）

#### 9. その他の注意

動物実験（幼若犬、幼若ラット）で関節異常が認められている。

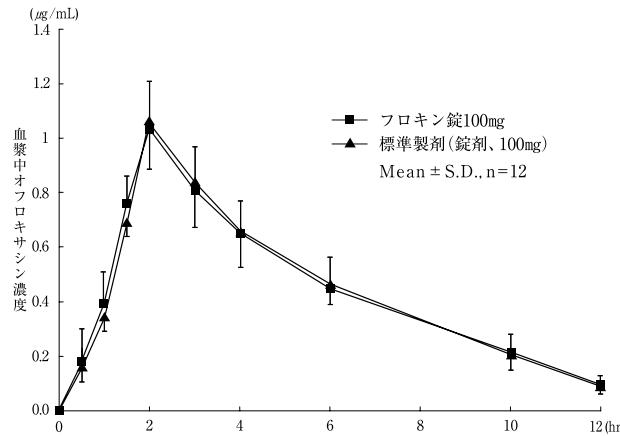
#### 【薬物動態】

##### 1. 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>

フロキシン錠100mgと標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ1錠（オフロキサシンとして100mg）を健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0~12</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )	C <sub>max</sub> ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	t <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
プロキン錠100mg	5.30±0.64	1.06±0.15	1.92±0.20	3.18±0.63
標準製剤 (錠剤、100mg)	5.31±0.55	1.06±0.16	2.00±0.00	2.89±0.33

(Mean±S.D., n=12)



血漿中濃度並びにAUC、C<sub>max</sub>等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

## 2. 溶出挙動<sup>2)</sup>

本剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたオフロキサシン錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

### 【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：オフロキサシン (Ofloxacin)

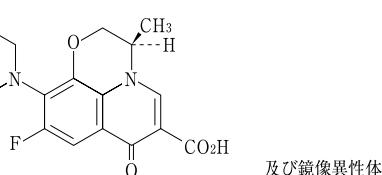
化学名：(3RS)-9-Fluoro-3-methyl-10-(4-methylpiperazin-1-yl)-7-oxo-2,

3-dihydro-7H-pyrido[1, 2, 3-de]-[1, 4]benzoxazine-6-carboxylic acid

分子式：C<sub>18</sub>H<sub>20</sub>F N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>

分子量：361.37

構造式：



及び鏡像異性体

性状：帯微黃白色～淡黃白色の結晶又は結晶性の粉末である。酢酸(100)に溶けやすく、水に溶けにくく、アセトニトリル又はエタノール(99.5)に極めて溶けにくい。

水酸化ナトリウム試液溶液(1→20)は旋光性を示さない。

光によって変色する。

融点：約265°C (分解)

### 【取扱い上の注意】

#### 安定性試験<sup>3)</sup>

最終包装製品を用いた加速試験(40°C、相対湿度75%、6カ月)の結果、本剤は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

### 【包 装】

プロキン錠100mg：PTP100錠(10錠×10)

PTP500錠(10錠×50)

### 【主 要 文 献】

1)株式会社イセイ：社内資料(生物学的同等性試験)

2)株式会社イセイ：社内資料(溶出試験)

3)株式会社イセイ：社内資料(安定性試験)

### 【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

株式会社イセイ 学術課

〒990-2495 山形市若葉町13番45号

TEL 023(622)7755

FAX 023(624)4717