

経口用セフェム系抗生物質製剤

日本薬局方

セファクロルカプセル

| | |
|------------|------------------|
| 日本標準商品分類番号 | |
| 876132 | |
| 承認番号 | 22000AMX01976000 |
| 薬価収載 | 2008年12月 |
| 販売開始 | 2008年12月 |

貯法：しゃ光・
気密容器
室温保存

処方箋医薬品^注

トキクロル[®]カプセル250mg

使用期限：2年
(ラベル及び
外箱に表示)

TOKICLOR Capsules 250mg

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

※【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

本剤の成分に対し過敏症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)】

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】

トキクロルカプセル250mgは、1カプセル中にセファクロル250mg(力価)を含有する。添加物としてトウモロコシデンプン、カルボキシメチルスターチナトリウム及びステアリン酸マグネシウムを含有する。また、カプセル本体に、青色1号、酸化チタン、ラウリル硫酸ナトリウム、ゼラチンを含有する。

| 販売名 | 剤形 | 色調 | 外観・性状 | 識別コード |
|----------------|------------|---------------------------------|--|---------------|
| トキクロルカプセル250mg | 硬カプセル剤(2号) | キャップ： 青色不透明 ボディ： 白色不透明 |  | IC-613 TCR |

※【効能又は効果】

<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、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、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、麦粒腫、中耳炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、猩紅熱

<効能又は効果に関連する使用上の注意>

咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、中耳炎への使用にあたっては、「抗微生物薬適正使用の手引き」¹⁾を参照し、抗菌薬投与の必要性を判断した上で、本剤の投与が適切と判断される場合に投与すること。

【用法及び用量】

通常、成人及び体重20kg以上の小児に対しては、セファクロルとして1日750mg(力価)を3回に分割して経口投与する。

重症の場合や分離菌の感受性が比較的低い症例に対しては、1日1500mg(力価)を3回に分割して経口投与する。

なお、年齢、体重、症状等に応じ適宜増減する。

<用法及び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。

(1) 重大な副作用(頻度不明)

1) ショック、アナフィラキシー：ショック、アナフィラキシー(呼吸困難、喘鳴、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) 急性腎障害：急性腎障害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) 汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少：汎血球減少、無顆粒球症、血小板減少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：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) 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)：中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼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：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。

7) 肝機能障害、黄疸：AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-Pの著しい上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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。

(2) 重大な副作用(類薬)

溶血性貧血：他のセフェム系抗生物質で溶血性貧血があらわれることが報告されているので、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。

(3) その他の副作用

| | 頻度不明 |
|--------------------|------------------------------|
| 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、貧血、(赤血球減少、ヘモグロビン減少、ヘマトクリット減少)、血小板減少、好酸球増多等 |
| 肝臓 ^{注2} | AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇、黄疸 |
| 腎臓 | BUN 上昇、血清クレアチニン上昇 |
| 消化器 | 悪心、下痢、腹痛、嘔吐、胃不快感、胸やけ、食欲不振等 |
| 菌交代症 | 口内炎、カンジタ症 |
| 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、めまい等 |

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

- (1)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。]
- (2)授乳中の婦人には投与を避けることが望ましい。やむを得ず投与する場合は授乳を中止させること。[ヒト母乳中へ移行することが報告されている。]

6. 臨床検査結果に及ぼす影響

- (1)テストペー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。)

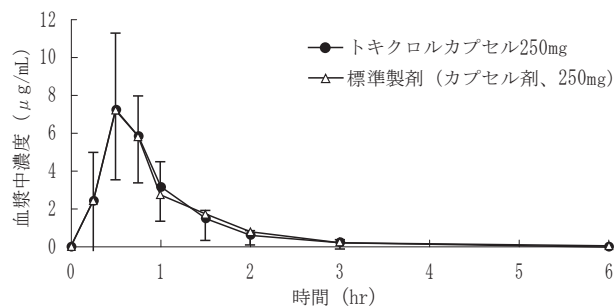
【薬物動態】

〈生物学的同等性試験〉

トキコロカプセル250mgと標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1カプセル(セファクロルとして250mg)健康成人12名に絶食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、C_{max})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。²⁾

| | AUC _{0-6hr} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$) | C _{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$) | T _{max} (hr) | t _{1/2} (hr) |
|-----------------------|---|---|--------------------------|--------------------------|
| トキコロカプセル250mg | 6.65±1.53 | 8.50±2.95 | 0.58±0.12 | 0.41±0.17 |
| 標準製剤 (カプセル剤、250mg) | 6.92±1.30 | 8.53±2.47 | 0.69±0.40 | 0.45±0.30 |

(Mean±S.D.、n=12)



血漿中濃度並びにAUC、C_{max}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。

〈溶出挙動〉

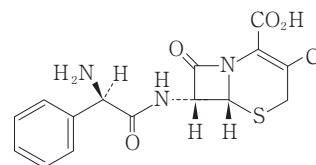
トキコロカプセル250mgは、日本薬局方医薬品各条に定められたセファクロルカプセルの溶出規格に適合していることが確認されている。³⁾

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：セファクロル (Cefaclor) 略号：CCL

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

化学構造式：



分子式：C₁₅H₁₄ClN₃O₄S

分子量：367.81

性状：本品は白色～黄白色の結晶性の粉末である。

水又はメタノールに溶けにくく、N,N-ジメチルホルムアミド又はエタノール(99.5)にほとんど溶けない。

【取扱い上の注意】

〈安定性試験〉

最終包装製品を用いた長期保存試験[室温保存(1~30℃)]の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、トキコロカプセル250mgは通常の市場流通下において2年間安定であることが確認されている。⁴⁾

【包装】

トキコロカプセル250mg：100カプセル (PTP)
500カプセル (PTP)

【主要文献】

- 1)厚生労働省健康局結核感染症課編：抗微生物薬適正使用の手引き
- 2)コーアイセイ株式会社：社内資料(生物学的同等性試験)
- 3)コーアイセイ株式会社：社内資料(溶出試験)
- 4)コーアイセイ株式会社：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。

コーアイセイ株式会社 くすり相談窓口
 ☎990-2495 山形市若葉町13番45号
 TEL 023(666)5797
 FAX 023(624)4717



製造販売元
コーアイセイ株式会社
 山形市若葉町13番45号