

貯 法：遮光気密容器、室温保存
開封後は湿気を避けて保存すること
使用期限：外箱に表示
規制区分：処方箋医薬品（注意-医師等の処方箋に
より使用すること）

広範囲経口抗菌剤

バステーン[®]錠 100mg

バステーン[®]錠 200mg

BASTEEN TABLETS 100mg・TABLETS 200mg

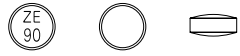

ノルフロキサシン錠

| | 錠100mg | 錠200mg |
|-------|---------------|---------------|
| 承認番号 | 22300AMX00223 | 21900AMX01030 |
| 薬価収載 | 2011年 6月 | 2007年 12月 |
| 販売開始 | 2011年 6月 | 2007年 12月 |
| 再評価結果 | 2004年 9月 | |

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2. 次の薬剤を投与中の患者（「相互作用」の項参照）
フェンブフェン、フルルビプロフェンアキセチル、フルル
ビプロフェン
3. 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人
ただし、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人に対して
は、炭疽及び野兔病に限り、治療上の有益性を考慮して投
与すること（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）。

【組成・性状】

| 販売名 | 成分・分量 (1錠中) | 剤形 | 色調 | 外形・サイズ(識別コード) |
|-----------------|-----------------------|--------------|------------|---|
| バステーン錠 100mg | ノルフロキ サシン 100mg | フィルム コート錠 | 白色～ 微黄色 |  直径：7.6mm 厚み：4.3mm 重量：170mg (ZE90) |
| バステーン錠 200mg | ノルフロキ サシン 200mg | フィルム コート錠 | 白色～ 微黄色 |  直径：9.1mm 厚み：5.0mm 重量：260mg (ZE91) |

添加物として、バステーン錠100mgは乳糖水和物、トウモロ
コシデンブ、結晶セルロース、クロスカルメロースナトリウ
ム、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウ
ム、軽質無水ケイ酸、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸
化チタン、タルク、カルナウバロウを、バステーン錠200mg
は結晶セルロース、クロスカルメロースナトリウム、エチルセ
ルロース、クロスポビドン、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マ
グネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール6000、酸化チタン
を含有する。

【効能・効果】

<適応菌種>

本剤に感性的ブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌
属、淋菌、炭疽菌、大腸菌、赤痢菌、サルモネラ属、チフス菌、
パラチフス菌、シトロバクター属、クレブシエラ属、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
ニー、プロビデンシア・レットゲリ、コレラ菌、腸炎ビブリオ、
インフルエンザ菌、緑膿菌、野兔病菌、カンピロバクター属

<適応症>

表在性皮膚感染症、深在性皮膚感染症、慢性膿皮症、咽頭・喉
頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、膀胱炎、腎盂腎炎、前立腺炎
(急性症、慢性症)、尿道炎、胆嚢炎、胆管炎、感染性腸炎、腸
チフス、パラチフス、コレラ、中耳炎、副鼻腔炎、炭疽、野兔
病

※<効能・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、感染性腸炎、副鼻腔
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・用量】

ノルフロキサシンとして、通常成人1回100～200mgを1日3～4
回経口投与する。

なお、症状により適宜増減する。

ただし、腸チフス、パラチフスの場合は、ノルフロキサシンと
して1回400mgを1日3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>

1. 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。
なお、長期投与が必要となる場合には、経過観察を十分
行うこと。
2. 腸チフス、パラチフスにおける用量では、他の感染症に
対する用量と比較して国内投与経験が少ないため、頻回
に臨床検査を行う等患者の状態を十分に観察すること。
3. 炭疽の発症及び進展抑制には、類薬であるシプロフロキ
サシンについて米国疾病管理センター（CDC）が、60日間
の投与を推奨している。

【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) 高度の腎障害のある患者[高い血中濃度が持続するので、
投与量を減するか、投与間隔をあけて投与すること。]
- (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
[痙攣をおこすことがある。]
- (3) 重症筋無力症の患者[症状を悪化させることがある。]
- (4) 高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

- ※※ (5) 大動脈瘤又は大動脈解離を合併している患者、大動脈瘤
又は大動脈解離の既往、家族歴若しくはリスク因子（マル
ファン症候群等）を有する患者[海外の疫学研究において、
ニューキノロン系抗菌剤投与後に大動脈瘤及び大動脈解
離の発生リスクが増加したとの報告がある（「重要な基本
的注意」、「重大な副作用」の項参照）。]

※※ 2. 重要な基本的注意

大動脈瘤、大動脈解離を引き起こすことがあるので、観察
を十分に行うとともに、腹部、胸部又は背部に痛み等の症
状があらわれた場合には直ちに医師の診察を受けるよう患
者に指導すること。大動脈瘤又は大動脈解離を合併してい
る患者、大動脈瘤又は大動脈解離の既往、家族歴若しくは
リスク因子を有する患者では、必要に応じて画像検査の実
施も考慮すること（「慎重投与」、「重大な副作用」の項参照）。

3. 相互作用

(1) 併用禁忌(併用しないこと)

| 薬剤名等 | 臨床症状・措置方法 | 機序・危険因子 |
|---|--|--|
| フェンブフェン フルルビプロフェン アキセチル (ロピオン) | 痙攣をおこすことがある。 痙攣が発現した場合は、気道確保、抗痙攣薬の使用等適切な処置を行い、投与を中止する。 | ニューキノロン系抗菌剤によるGABA受容体結合阻害作用が、非ステロイド性消炎鎮痛剤により増強されると考えられている。 |
| フルルビプロフェン (フロベン等) | フルルビプロフェンの類似化合物(フルルビプロフェンアキセチル)との併用で痙攣をおこすことがあるとの報告がある。 痙攣が発現した場合は、気道確保、抗痙攣薬の使用等適切な処置を行い、投与を中止する。 | |

(2) 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 |
|--|--|--|
| フェニル酢酸系非ステロイド性消炎鎮痛剤(ただし、フェンブフェンは併用禁忌) ジクロフェナク、アンフェナク等 プロピオン酸系非ステロイド性消炎鎮痛剤(ただし、フルルビプロフェンアキセチル及びフルルビプロフェンは併用禁忌) ケトプロフェン、ロキソプロフェン、プラノプロフェン、ザルトプロフェン等 | 痙攣をおこすおそれがある。 痙攣が発現した場合は、気道確保、抗痙攣薬の使用等適切な処置を行い、投与を中止する。 | ニューキノロン系抗菌剤によるGABA受容体結合阻害作用が、非ステロイド性消炎鎮痛剤により増強されると考えられている。 |
| テオフィリン アミノフィリン 水和物 | テオフィリンの作用が増強するので、テオフィリンを減量するなど慎重に投与する。 | 肝薬物代謝酵素の競合により、テオフィリンクリアランスが低下し、テオフィリンの血中濃度を上昇させることが報告されている。(参考：成人でのクリアランスで14.9%程度の低下がみられたとの報告がある。) |
| シクロスポリン | シクロスポリンの血中濃度を上昇させることが報告されているので、シクロスポリンを減量するなど慎重に投与する。 | シクロスポリンの肝薬物代謝酵素活性を抑制すると考えられている。(参考：シクロスポリンの代謝に関与するヒト肝ミクロソーム酵素を、 <i>in vitro</i> で64%抑制したとの報告がある。) |
| ワルファリン | ワルファリンの作用を増強し、出血、プロトロンビン時間の延長等があらわれるので、ワルファリンを減量するなど慎重に投与する。 | |

| | | |
|---|--|--|
| アルミニウム又はマグネシウムを含有する製剤(制酸剤等) ケイ酸アルミニウム、水酸化アルミニウムゲル・水酸化マグネシウム、スクラルファート水和物等 鉄剤 カルシウムを含有する製剤 | 本剤の効果が減弱するおそれがある。 本剤を服用後、2時間以上間隔をあけて制酸剤等を服用する等注意する。 | 金属イオンとキレートを形成し、吸収が阻害される。 |
| チザニジン塩酸塩 | チザニジン塩酸塩の血中濃度が上昇し、チザニジン塩酸塩の副作用が増強されるおそれがある。 | チザニジン塩酸塩の主代謝酵素であるCYP1A2を阻害し、チザニジン塩酸塩の血中濃度を上昇させる可能性がある。 |

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)

- ※※ 1) ショック、アナフィラキシー(呼吸困難、胸内苦悶等)
- ※※ 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)、剥脱性皮膚炎
- ※※ 3) 急性腎障害
- 4) 痙攣、錯乱、ギラン・バレー症候群、重症筋無力症の増悪
- 5) アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害
- 6) 血管炎、溶血性貧血
上記1)～6)の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。
- 7) 偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎：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。
- 8) 横紋筋融解症：筋肉痛、脱力感、CK(CPK)上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とし、急激な腎機能悪化を伴う横紋筋融解症があらわれることがあるので、このような副作用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。
- 9) 間質性肺炎：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。
- 10) 肝機能障害、黄疸：AST(GOT)、ALT(GPT)、AI-P、LDHの上昇等を伴う肝機能障害や黄疸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。
- ※※ 11) 大動脈瘤、大動脈解離：大動脈瘤、大動脈解離を引き起こすことがあるので、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと(「慎重投与」、「重要な基本的注意」の項参照)。

(2) 重大な副作用(類薬)

- 低血糖(頻度不明)
他のニューキノロン系抗菌剤で、重篤な低血糖があらわれる(高齢者、特に腎障害患者であらわれやすい)との報告があるので、慎重に投与すること。

(3) その他の副作用

| 種類 | 頻度 | 頻度不明 |
|-------------------|----|---|
| 過敏症 ^{注)} | | 発疹、浮腫、発赤、痒痒感、発熱、光線過敏症等 |
| 腎臓 | | BUN上昇、クレアチニン上昇等 |
| 消化器 | | 嘔気、嘔吐、食欲不振、腹痛、下痢、消化不良、腹部膨満感、便秘、口内炎、口唇炎、口角炎等 |
| 血液 ^{注)} | | 白血球減少、好酸球増多、血小板減少、赤血球減少、ヘモグロビン減少 |
| 精神神経系 | | めまい、頭痛、不眠、眠気、しびれ感、意識障害 |
| その他 | | 全身倦怠感、冷感、熱感、心悸亢進、胸痛 |

注) 観察を十分にを行い、異常が認められた場合には投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

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、用量に留意して慎重に投与すること。

6. 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投与しないこと。ただし、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人に対しては、炭疽及び野兔病に限り、治療上の有益性を考慮して投与すること。[妊婦又は妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]

(2) 授乳中の婦人に投与することは避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合には授乳を避けさせること。[授乳中の投与に関する安全性は確立していない。]

7. 小児等への投与

小児等に対する安全性は確立していない。

8. 臨床検査結果に及ぼす影響

チモール混濁反応を用いる検査値に影響を及ぼすことがある(見かけ上の低値)。

9. 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、さらには穿孔をお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。]

10. その他の注意

- (1) 動物実験(幼若犬)で関節異常が認められている。
- (2) 動物実験(イヌ、ラット)で大量投与により、イヌの精巣及び精巣上体の萎縮、ラットの精細管の萎縮が認められている。

【薬物動態】

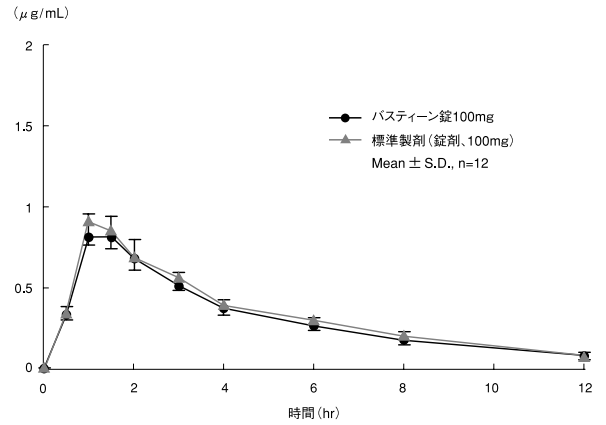
1. 生物学的同等性試験^{2, 3)}

バステイーン錠100mgと標準製剤をそれぞれ2錠(ノルフロキサシンとして200mg)あるいはバステイーン錠200mgと標準製剤をそれぞれ1錠(ノルフロキサシンとして200mg)を、クロスオーバー法により健康成人男子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、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。

バステイーン錠100mg

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|--------------------|--|-------------------------------------|--------------|--------------------------|
| | AUC _(0→12) ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$) | Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$) | Tmax (hr) | t _{1/2} (hr) |
| バステイーン錠100mg | 3.78 ± 0.52 | 0.88 ± 0.13 | 1.2 ± 0.3 | 3.7 ± 1.2 |
| 標準製剤 (錠剤、100mg) | 4.05 ± 0.54 | 0.95 ± 0.12 | 1.1 ± 0.2 | 4.1 ± 1.3 |

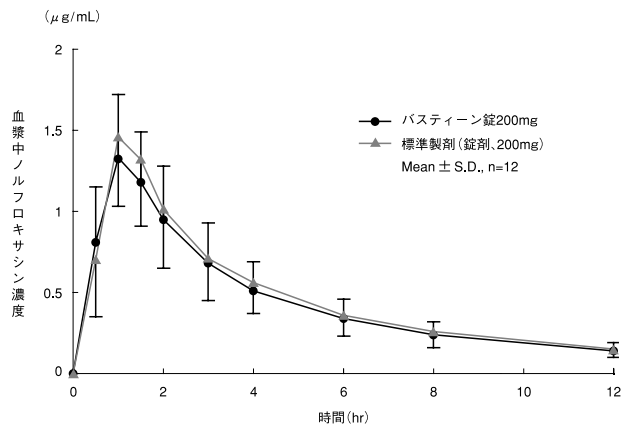
(Mean ± S.D., n=12)



バステイーン錠200mg

| | 判定パラメータ | | 参考パラメータ | |
|--------------------|--|-------------------------------------|--------------|--------------------------|
| | AUC _(0→12) ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$) | Cmax ($\mu\text{g}/\text{mL}$) | Tmax (hr) | t _{1/2} (hr) |
| バステイーン錠200mg | 5.49 ± 1.66 | 1.42 ± 0.35 | 1.0 ± 0.3 | 4.8 ± 1.1 |
| 標準製剤 (錠剤、200mg) | 5.84 ± 1.79 | 1.53 ± 0.40 | 1.1 ± 0.2 | 5.0 ± 1.0 |

(Mean ± S.D., n=12)



血漿中濃度並びにAUC、Cmax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^{4, 5)}

バステイーン錠100mg及び同錠200mgは、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたノル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。

【薬効薬理】

1. 抗菌作用⁶⁾

黄色ブドウ球菌、肺炎球菌、腸球菌、緑膿菌、セラチア、大腸菌、シトロバクター属、サルモネラ属、赤痢菌、クレブシエラ属、エンテロバクター属、プロテウス属に対し強い抗菌活性を示した(in vitro)。

2. 作用機序⁷⁾

DNAジャイレース(細菌の高次ラセン構造型DNAと弛緩型DNAの変換に関与する酵素)の作用を阻害することによりDNAの複製を遮断し殺菌的に作用する。

【有効成分に関する理化学的知見】

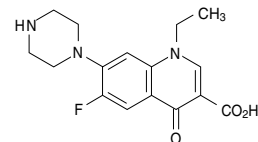
一般名：ノルフロキサシン(Norfloxacin)(JAN)

化学名：1-Ethyl-6-fluoro-4-oxo-7-(piperazin-1-yl)-1,4-dihydroquinoline-3-carboxylic acid

分子式：C₁₆H₁₈FN₃O₃

分子量：319.33

構造式：



性状：ノルフロキサシンは白色～微黄色の結晶性の粉末である。酢酸(100)に溶けやすく、エタノール(99.5)又はアセトンに溶けにくく、メタノールに極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。希塩酸又は水酸化ナトリウム試液に溶ける。吸湿性である。光によって徐々に着色する。

分配係数：

| 有機溶媒相 | 水相 | 分配係数 |
|----------|-----------------------|------|
| 1-オクタノール | 水 | 0.46 |
| クロロホルム | pH7.0の0.1mol/Lリン酸塩緩衝液 | 1.94 |
| 1-オクタノール | pH7.0の0.1mol/Lリン酸塩緩衝液 | 0.43 |

(25℃)

【取扱い上の注意】

○安定性試験

- ・バステイン錠100mg⁸⁾
最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6箇月)の結果、バステイン錠100mg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。
- ・バステイン錠200mg⁹⁾
PTP包装したものを用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6箇月)の結果、バステイン錠200mg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】

バステイン錠100mg PTP：100錠

バステイン錠200mg PTP：100錠、500錠、1,000錠

※【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) 全星薬品工業(株)：生物学的同等性試験に関する資料1(社内資料)
- 3) 全星薬品工業(株)：生物学的同等性試験に関する資料2(社内資料)
- 4) 全星薬品工業(株)：溶出試験に関する資料1(社内資料)
- 5) 全星薬品工業(株)：溶出試験に関する資料2(社内資料)
- 6) Qadri, S. M. H. et al. : Drugs Exptl. Clin. Res., **15**, 349 (1989)
- 7) Crumplin, G. C. et al. : J. Antimicrob. Chemother., **13** (Suppl. B), 9 (1984)
- 8) 全星薬品工業(株)：安定性試験に関する資料1(社内資料)
- 9) 全星薬品工業(株)：安定性試験に関する資料2(社内資料)

【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。

全星薬品工業株式会社 医薬情報部
〒545-0051 大阪市阿倍野区旭町1-2-7
☎ 0120-189-228
TEL 06-6630-8820
FAX 06-6630-8990

発売元



全星薬品株式会社
堺市堺区向陵中町2-4-12

製造販売元



全星薬品工業株式会社
大阪市阿倍野区旭町1-2-7