**2024年5月改訂（第3版）
*2023年1月改訂

日本標準商品分類番号
876241

貯　　法：室温保存
有効期間：3年

ニューキノロン系経口抗菌剤

処方箋医薬品注)

ノルフロキサシン錠

小児用バクシダール®錠50mg
BACCIDAL® Tablets for Children 50mg

承認番号	20300AMZ00257000
販売開始	1991年6月

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）
〈効能共通〉
2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
* 2.2 次の薬剤を投与中の患者
フェニル酢酸系（フェンブフェン等）又はプロピオン酸系（フルルビプロフェンアキセチル、フルルビプロフェン、エスフルルビプロフェン・ハッカ油等）の非ステロイド性消炎鎮痛剤［10.1参照］
2.3 乳児等［9.7.1参照］
〈炭疽、野兎病以外〉
2.4 妊婦又は妊娠している可能性のある女性［9.5.1参照］

3. 組成・性状
3.1 組成

有効成分	1錠中 日局　ノルフロキサシン50mg
添加剤	結晶セルロース、カルメロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース

3.2 製剤の性状

剤形	フィルムコーティング錠		
色調	白色～微黄色		
外形	 直径：5.6mm	厚さ：2.8mm	 質量：約70mg
識別コード	KP-111		

4. 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、腸球菌属、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、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、インフルエンザ菌、緑膿菌、野兎病菌、カンピロバクター属
〈適応症〉
表在性皮膚感染症、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、感染性腸炎、腸チフス、パラチフス、炭疽、野兎病

5. 効能又は効果に関連する注意
〈咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、感染性腸炎〉
「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。

6. 用法及び用量
本剤は他の抗菌剤が無効と判断される症例に対してのみ投与する。
ノルフロキサシンとして、通常1日体重1kg当たり6～12mgを3回に分けて経口投与する。
なお、症状により適宜増減する。
また、投与期間はできるだけ短期間（原則として7日以内）にとどめること。
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日体重1kg当たり15～18mgを3回に分けて、14日間経口投与する。

7. 用法及び用量に関連する注意
〈腸チフス、パラチフス〉
7.1 本剤が50mg錠であることから、下記の表を目安とすること。

体重	投与量
15～22kg	1回2錠
23～31kg	1回3錠
32～40kg	1回4錠
41～49kg	1回5錠

〈炭疽〉
7.2 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。

8. 重要な基本的注意
8.1 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。
8.2 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。［9.1.3、11.1.11参照］

9. 特定の背景を有する患者に関する注意
9.1 合併症・既往歴等のある患者
9.1.1 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。［11.1.4参照］
9.1.2 重症筋無力症の患者
症状を悪化させることがある。［11.1.4参照］
9.1.3 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/ロイス・ディーツ症候群等）を有する患者
必要に応じて画像検査の実施を考慮すること。海外の疫学研究において、フルオロ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。［8.2、11.1.11参照］
9.2 腎機能障害患者
9.2.1 高度の腎障害のある患者
高い血中濃度が持続するので、投与量を減ずるか、投与間隔をあけて投与すること。［11.1.12参照］
9.5 妊婦
〈炭疽、野兎病以外〉
9.5.1 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。［2.4参照］
〈炭疽、野兎病〉
9.5.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。
9.6 授乳婦
治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。
9.7 小児等
9.7.1 乳児等
投与しないこと。乳児等を対象とした臨床試験は実施していない。［2.3参照］
9.7.2 幼児
5歳未満の幼児には錠剤が服用可能なことを確認して、慎重に投与すること。

9.8 高齢者

9.8.1 腱障害があらわれやすいとの報告がある。[11.1.5参照]

9.8.2 用量に留意して慎重に投与すること。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。[11.1.12参照]

10. 相互作用

＊10.1 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
＊ フェニル酢酸系非ステロイド性消炎鎮痛剤 フェンブフェン等 プロピオン酸系非ステロイド性消炎鎮痛剤 フルルビプロフェンアキセチル（ロピオン） フルルビプロフェン（フロベン） エスフルルビプロフェン・ハッカ油（ロコア） 等 [2.2参照]	痙攣を起こすことがある。 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。

10.2 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
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、*in vitro* 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。	機序不明。
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。
副腎皮質ホルモン剤（経口剤及び注射剤） プレドニゾロン ヒドロコルチゾン等	腱障害のリスクが増大するとの報告がある。これらの薬剤との併用は、治療上の有益性が危険性を上回る場合のみとすること。	機序不明。

11. 副作用

次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するなど適切な処置を行うこと。

11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック、アナフィラキシー（呼吸困難、胸内苦悶等）（いずれも頻度不明）

11.1.2 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（いずれも頻度不明）

11.1.3 急性腎障害（頻度不明）

11.1.4 痙攣、錯乱、ギラン・バレー症候群、重症筋無力症の増悪（いずれも頻度不明）
[9.1.1、9.1.2参照]

11.1.5 アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害（頻度不明）
腱周辺の痛み、浮腫、発赤等の症状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。[9.8.1参照]

11.1.6 血管炎、溶血性貧血（いずれも頻度不明）

11.1.7 偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎（頻度不明）
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。

11.1.8 横紋筋融解症（頻度不明）
筋肉痛、脱力感、CK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。

11.1.9 間質性肺炎（頻度不明）
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。

11.1.10 肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）
AST、ALT、Al-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。

11.1.11 大動脈瘤、大動脈解離（いずれも頻度不明）
[8.2、9.1.3参照]

11.1.12 低血糖（頻度不明）
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。[9.2.1、9.8.2参照]

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	発疹	浮腫、発赤、そう痒感、発熱　等	光線過敏症
腎臓	BUN、クレアチニンの上昇　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	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

12. 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）。

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 海外において類薬で高用量を投与した場合、一過性の重症関節炎、精神錯乱がみられたとの報告がある。

15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 動物実験（幼若犬）で関節異常が認められている[2]。

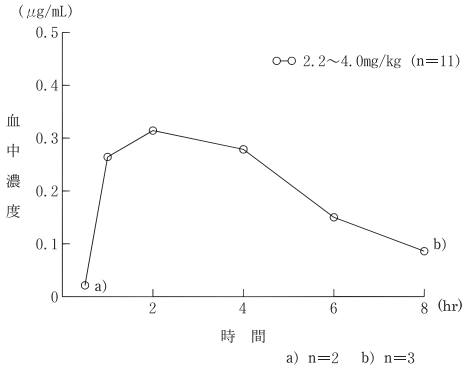
15.2.2 動物実験（イヌ、ラット）で大量投与により、イヌの精巣及び精巣上体の萎縮、ラットの精細管の萎縮が認められている[3)～5)]。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

小児患者にノルフロキサシン2.2～4.0mg/kgを単回経口投与した時の、血中濃度及び薬物速度論的パラメータは次のとおりである[6]。

図　血中濃度（小児患者）



a) n=2　b) n=3

薬物速度論的パラメータ

投与量 (mg/kg)	T_{max} (hr)	C_{max} (μg/mL)	$t_{1/2}$ (hr)	AUC (μg・hr/mL)
2.2～4.0	2.3	0.42	2.3 (n=10)	2.09 (n=10)

16.3 分布

成人患者にノルフロキサシン200mgを単回経口投与した時の、組織等における濃度は下表のとおりである。

	症例数	投与後時間	濃度
喀痰[7]	2	約4時間	0.77μg/mL
扁桃[8]	6	2時間	1.87μg/g
上顎洞粘膜[9]	4	2時間	0.72～2.03μg/g
耳漏[9]	1	2時間	1.93μg/mL
胆嚢[10]	9	1～4.5時間	1.39μg/g
胆汁[10]	6	1～4.5時間	10.4μg/mL
前立腺液[11]	6	1時間	0.16μg/mL
尿道分泌物[12]	5	1時間	0.51μg/mL

16.4 代謝

小児患者にノルフロキサシン2.2～4.0mg/kgを単回経口投与した結果、尿中排泄物の85.4%は未変化体であり、その他に4種の代謝物が認められた[6]。

16.5 排泄

小児患者にノルフロキサシン2.2～4.0mg/kgを単回経口投与した結果、尿中濃度は2～4時間尿に平均101μg/mLのピークを示し、6時間までの尿中回収率は21.6%であった[6]。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

小児対象臨床試験の総投与症例406例のうち327例における有効率は95.7%（313/327例）であった。疾患別の臨床効果の概要は表1のとおりであった。

表1　疾患別臨床効果

群別	疾患名	有効率
浅在性化膿性疾患	表在性皮膚感染症（伝染性膿痂疹）、慢性膿皮症（皮下膿瘍）	71.4%(5/7例)
呼吸器感染症	咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎	81.0%(34/42例)
尿路感染症	膀胱炎、腎盂腎炎	98.3%(113/115例)
腸管感染症	感染性腸炎 細菌性赤痢 カンピロバクター腸炎 サルモネラ腸炎 その他の急性腸炎	 95.8%(23/24例) 98.6%(70/71例) 100.0%(24/24例) 100.0%(44/44例)

炭疽及び野兎病に対する臨床試験は実施していない。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

細菌のDNAの高次構造を変換するDNA gyraseに作用し、DNA複製を阻害することにより、殺菌的に作用する[13]。

18.2 抗菌作用

18.2.1 ナリジクス酸やピペミド酸では抗菌力を示さなかったブドウ球菌属及びレンサ球菌属等のグラム陽性菌にも強い抗菌力を示した[14)～16)]（*in vitro*）。

18.2.2 大腸菌、緑膿菌、赤痢菌及びサルモネラ属等のグラム陰性菌に対しては、ナリジクス酸及びピペミド酸に比べ、一段と強い抗菌力を示した[15)～18)]（*in vitro*）。

18.2.3 ナリジクス酸耐性グラム陰性菌、ゲンタマイシン耐性緑膿菌、アンピシリン耐性黄色ブドウ球菌、メチシリン耐性黄色ブドウ球菌及びβ－ラクタマーゼ産生淋菌に対しても強い抗菌力を示した[12)、15)、19)、20)]（*in vitro*）。

18.2.4 マウス感染防御実験においてナリジクス酸及びピペミド酸よりも優れた治療効果を示した[15)、21)]。

18.3 耐性獲得

18.3.1 Rプラスミド上からは本剤の耐性遺伝子はみつかっていない。

18.3.2 継代培養による耐性獲得実験においてナリジクス酸及びピペミド酸に比べ耐性が獲得されにくい[21]（*in vitro*）。

19. 有効成分に関する理化学的知見

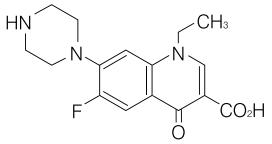
一般名：ノルフロキサシン（Norfloxacin）［JAN］
略号　：NFLX
化学名：1-Ethyl-6-fluoro-4-oxo-7-(piperazin-1-yl)-1,4-dihydroquinoline-3-carboxylic acid
分子式：$C_{16}H_{18}FN_3O_3$
分子量：319.33
性状　：本品は白色～微黄色の結晶性の粉末である。
本品は酢酸（100）に溶けやすく、エタノール（99.5）又はアセトンに溶けにくく、メタノールに極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。
本品は希塩酸又は水酸化ナトリウム試液に溶ける。
本品は吸湿性である。
本品は光によって徐々に着色する。

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（0.1mol/Lリン酸塩緩衝液）	1.94
1-オクタノール	pH7.0（0.1mol/Lリン酸塩緩衝液）	0.43

(25℃)

化学構造式：



22. 包装

100錠［10錠（PTP）×10］

23. 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）社内資料 ：ノルフロキサシンの幼若犬における関節障害の病理像
3）杉本勉, 他. ：Chemotherapy. 1981 ；29(S-4) ：785-811
4）入倉勉, 他. ：Chemotherapy. 1981 ；29(S-4) ：829-848
5）入倉勉, 他. ：Chemotherapy. 1981 ；29(S-4) ：849-885
6）社内資料 ：ノルフロキサシンの小児における体内動態.
7）重野芳輝, 他. ：Chemotherapy. 1981 ；29(S-4) ：359-369
8）米井潔, 他. ：耳鼻臨床. 1986 ；79(7) ：1175-1181
9）新川敦, 他. ：耳鼻と臨床. 1986 ；32(補2) ：966-972
10）平山隆, 他. ：基礎と臨床. 1982 ；16 ：6039-6043
11）鈴木恵三, 他. ：Chemotherapy. 1986 ；34(7) ：597-608
12）酒井茂, 他. ：泌尿紀要. 1986 ；32(11) ：1747-1761
13）平井敬二, 他. ：Chemotherapy. 1990 ；38(S-2) ：1-10
14）藤井良知, 他. ：Jpn. J. Antibiotics. 1990 ；43 ：181-215
15）伊藤明, 他. ：Chemotherapy. 1981 ；29(S-4) ：1-11
16）西野武志, 他. ：Chemotherapy. 1981 ；29(S-4) ：27-44
17）青木隆一, 他. ：感染症学雑誌. 1986 ；60(5) ：495-509
18）西村忠史, 他. ：Jpn. J. Antibiotics. 1990 ；43 ：860-871
19）大泉耕太郎, 他. ：Chemotherapy. 1981 ；29(S-4) ：172-175
20）岩田敏, 他. ：Jpn. J. Antibiotics. 1990 ；43 ：228-232
21）伊藤明, 他. ：Chemotherapy. 1981 ；29(S-4) ：66-82

**24. 文献請求先及び問い合わせ先

杏林製薬株式会社　くすり情報センター
〒160-0017　東京都新宿区左門町20番地
電話　0120-409-341
受付時間　9:00～17:30（土・日・祝日・会社休日を除く）

26. 製造販売業者等

**26.1 製造販売元

杏林製薬株式会社
東京都千代田区大手町一丁目3番7号