

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018（2019年更新版）に準拠して作成

広範囲経口抗菌製剤

日本薬局方 トスフロキサシントシル酸塩錠
トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」
トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」
TOSUFLOXACIN TOSILATE Tablets 「TCK」

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意—医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	錠 75mg:1錠中にトスフロキサシントシル酸塩水和物（日局）75mg（トスフロキサシンとして 51mg）含有する。 錠 150mg:1錠中にトスフロキサシントシル酸塩水和物（日局）150mg（トスフロキサシンとして 102mg）含有する。
一般名	和名：トスフロキサシントシル酸塩水和物（JAN） 洋名：Tosufloxacin Tosilate Hydrate（JAN）
製造販売承認年月日	製造販売承認年月日：2009年7月13日
薬価基準収載 ・販売開始年月日	薬価基準収載年月日：2009年11月13日 販売開始年月日：2009年11月13日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元 辰巳化学株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	辰巳化学株式会社 薬事・学術課 TEL:076-247-2132 FAX:076-247-5740 医療関係者向け情報 https://www.tatsumi-kagaku.com/public/info_medical/list.php

本IFは2024年2月改訂（第1版）の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要－日本病院薬剤師会－

(2020年4月改訂)

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がI Fの位置付け、I F記載様式、I F記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がI F記載要領の改訂を行ってきた。I F記載要領2008以降、I FはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したI Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI Fは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のI Fの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のI Fが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、I F記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. I Fとは

I Fは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・

判断・提供すべき事項等は I F の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された I F は、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

I F の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I F の利用にあたって

電子媒体の I F は、PMD A の医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って I F を作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、I F の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、I F が改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMD A の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I F を日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。I F は日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR 等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らが I F の内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I F を活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I.	概要に関する項目	1	8.	トランスポーターに関する情報	23
1.	開発の経緯	1	9.	透析等による除去率	23
2.	製品の治療学的特性	1	10.	特定の背景を有する患者	23
3.	製品の製剤学的特性	1	11.	その他	23
4.	適正使用に関して周知すべき特性	1	VIII.	安全性（使用上の注意等）に関する項目	24
5.	承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	1.	警告内容とその理由	24
6.	RMP の概要	2	2.	禁忌内容とその理由	24
II.	名称に関する項目	3	3.	効能又は効果に関連する注意とその理由	24
1.	販売名	3	4.	用法及び用量に関連する注意とその理由	24
2.	一般名	3	5.	重要な基本的注意とその理由	24
3.	構造式又は示性式	3	6.	特定の背景を有する患者に関する注意	25
4.	分子式及び分子量	3	7.	相互作用	26
5.	化学名（命名法）又は本質	3	8.	副作用	28
6.	慣用名、別名、略号、記号番号	3	9.	臨床検査結果に及ぼす影響	29
III.	有効成分に関する項目	4	10.	過量投与	29
1.	物理化学的性質	4	11.	適用上の注意	30
2.	有効成分の各種条件下における安定性	4	12.	その他の注意	30
3.	有効成分の確認試験法、定量法	4	IX.	非臨床試験に関する項目	31
IV.	製剤に関する項目	5	1.	薬理試験	31
1.	剤形	5	2.	毒性試験	31
2.	製剤の組成	6	X.	管理的事項に関する項目	32
3.	添付溶解液の組成及び容量	6	1.	規制区分	32
4.	力価	6	2.	有効期間	32
5.	混入する可能性のある夾雑物	6	3.	包装状態での貯法	32
6.	製剤の各種条件下における安定性	6	4.	取扱い上の注意	32
7.	調製法及び溶解後の安定性	9	5.	患者向け資材	32
8.	他剤との配合変化（物理化学的変化）	9	6.	同一成分・同効薬	32
9.	溶出性	10	7.	国際誕生年月日	32
10.	容器・包装	15	8.	製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準取載年月日、販売開始年月日	32
11.	別途提供される資材類	15	9.	効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	33
12.	その他	15	10.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	33
V.	治療に関する項目	16	11.	再審査期間	33
1.	効能又は効果	16	12.	投薬期間制限に関する情報	33
2.	効能又は効果に関連する注意	16	13.	各種コード	33
3.	用法及び用量	17	14.	保険給付上の注意	33
4.	用法及び用量に関連する注意	17	XI.	文献	34
5.	臨床成績	17	1.	引用文献	34
VI.	薬効薬理に関する項目	19	2.	その他の参考文献	34
1.	薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	19	XII.	参考資料	35
2.	薬理作用	19	1.	主な外国での発売状況	35
VII.	薬物動態に関する項目	20	2.	海外における臨床支援情報	35
1.	血中濃度の推移	20	XIII.	備考	36
2.	薬物速度論的パラメータ	21	1.	調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	36
3.	母集団（ポピュレーション）解析	21	2.	その他の関連資料	37
4.	吸収	22			
5.	分布	22			
6.	代謝	23			
7.	排泄	23			

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg「TCK」／錠 150mg「TCK」は、辰巳化学株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（2005 年 3 月 31 日）に基づき、承認申請し、2009 年 7 月に承認を得て、2009 年 11 月発売に至った。

また、2010 年 3 月に「肺炎球菌」から「肺炎球菌（ペニシリン耐性肺炎球菌を含む）」への効能又は効果の変更が承認された。

2. 製品の治療学的特性

本剤は、トスフロキサシントシル酸塩水和物（日局）を有効成分とする広範囲経口抗菌製剤である。

主な副作用として発疹、胃・腹部不快感、悪心、下痢・軟便、胃・腹痛がある。重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー（呼吸困難、浮腫、発赤等）、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）、痙攣、意識障害（意識喪失等）、急性腎障害、間質性腎炎、腎性尿崩症、肝機能障害、黄疸、無顆粒球症、血小板減少、偽膜性大腸炎等の血便を伴う重篤な大腸炎、間質性肺炎、好酸球性肺炎、横紋筋融解症、低血糖、大動脈瘤、大動脈解離、末梢神経障害、アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害、精神症状、重症筋無力症の悪化があらわれることがある。（「VIII. 8. 副作用」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

特になし

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、 最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として 作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMP の概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

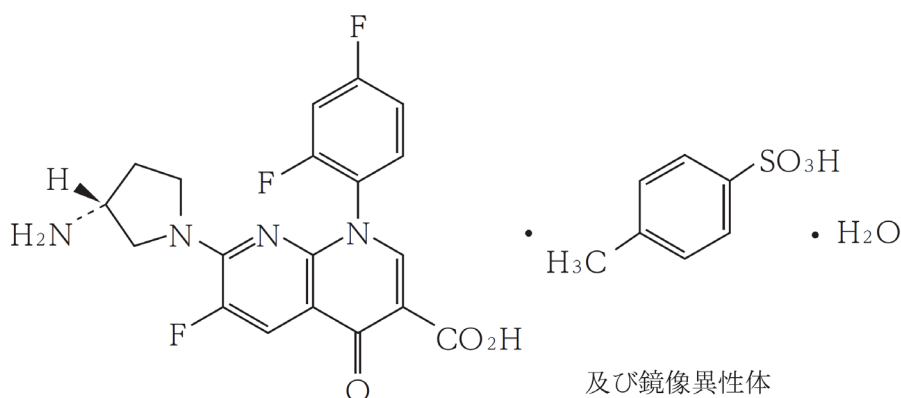
- (1) 和名：トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」
トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」
- (2) 洋名：TOSUFLOXACIN TOSILATE Tablets 75mg 「TCK」
TOSUFLOXACIN TOSILATE Tablets 150mg 「TCK」
- (3) 名称の由来
含有する有効成分名＋剤形＋含量＋屋号

2. 一般名

- (1) 和名：トスフロキサシントシル酸塩水和物 (JAN)
- (2) 洋名：Tosufloxacin Tosilate Hydrate (JAN)
- (3) ステム：ナリジクス酸系の抗菌剤：-oxacin

3. 構造式又は示性式

構造式：



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₉H₁₅F₃N₄O₃・C₇H₈O₃S・H₂O

分子量：594.56

5. 化学名（命名法）又は本質

7-[(3*RS*)-3-Aminopyrrolidin-1-yl]-1-(2,4-difluorophenyl)-6-fluoro-4-oxo-1,4-dihydro-1,8-naphthyridine-3-carboxylic acid mono 4-toluenesulfonate monohydrate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

一般名：トスフロキサシントシル酸塩水和物 略号：TFLX

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～微黄白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

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

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

融点：約 254°C (分解)

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

メタノール溶液 (1→100) は旋光性を示さない。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

日本薬局方による

定量法

日本薬局方による



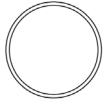


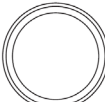
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

錠剤（フィルムコーティング錠）

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	外形			色調 剤形
	直径(mm)	厚さ(mm)	重量(mg)	
トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」	 7.1	 3.4	 150	白色 フィルム コーティング錠
トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」	 8.6	 4.7	 300	白色 フィルム コーティング錠

(3) 識別コード

販売名	本体	包装材料
トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」	TU 703	TU 703
トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」	TU 704	TU 704

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	有効成分（1錠中）	添加剤
トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg「TCK」	トスフロキサシントシル酸塩水和物（日局） 75mg （トスフロキサシンとして 51mg）	結晶セルロース、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、L-アスパラギン酸、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール、酸化チタン、カルナウバロウ
トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg「TCK」	トスフロキサシントシル酸塩水和物（日局） 150mg （トスフロキサシンとして 102mg）	

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

試験項目及び規格

試験項目	規格
性状	白色のフィルムコーティング錠
確認試験	蛍光反応 規格：淡青白色の蛍光を発する 呈色反応 規格：青紫色を呈する 紫外可視吸収スペクトル 規格：波長 260～264nm、341～345nm 及び 356～360nm に吸収の極大を示す

試験項目	規 格
製剤均一性 (含量均一性)	判定値は 15.0%を超えない
溶出性	75mg：90 分間の溶出率は 70%以上（溶出試験法第 2 法、水、50rpm） 150mg：90 分間の溶出率は 65%以上（溶出試験法第 2 法、水、50rpm）
定量	表示量の 95.0～105.0%を含む

<加速試験>

●トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」¹⁾

保管条件：40±1°C、75±5%RH

包装形態：PTP 包装

試験結果：

	開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状	白色のフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
確認試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性	適合	/		適合
溶出性	適合	適合	適合	適合
定量 (%)	100.6	100.3	100.1	100.5
	100.1	99.8	99.9	100.1
	100.5	100.4	100.4	100.4

1 ロット n=3 3 ロット

●トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」²⁾

保管条件：40±1°C、75±5%RH

包装形態：PTP 包装

試験結果：

	開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状	白色のフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
確認試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性	適合	/		適合
溶出性	適合	適合	適合	適合
定量 (%)	100.4	100.5	100.6	100.5
	100.6	101.1	100.8	100.6
	100.3	101.3	100.8	100.4

1 ロット n=3 3 ロット

<無包装下の安定性>

平成 11 年 8 月 20 日付「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）」
（日本病院薬剤師会）を参考に、無包装状態の試験を行った。

●トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」

保存条件		試験項目	規格	結果			
				開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
温度	40±2℃ 遮光 気密容器	性状	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	10.1	10.2	9.3	9.6
		溶出性*2 (%)	90 分間、70%以上 (最小値～最大値)	82～105	93～99	91～95	96～103
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	101.6	102.2	98.3	98.9
湿度	25±1℃ 75±5%RH 遮光 開放	性状	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	10.1	8.3	6.4	6.4
		溶出性*2 (%)	90 分間、70%以上 (最小値～最大値)	82～105	95～99	95～96	97～99
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	101.6	101.8	98.3	99.3

保存条件		試験項目	規格	結果	
				開始時	60 万 lx・hr
光	温度 なりゆき 1000lx/hr 気密容器	性状	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	10.1	9.1
		溶出性*2 (%)	90 分間、70%以上 (最小値～最大値)	82～105	95～98
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	101.6	100.0

*1 n=10 の平均値

*2 n=6

*3 n=3 の平均値

●トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」

保存条件		試験項目	規格	結果			
				開始時	1 箇月	2 箇月	3 箇月
温度	40±2℃ 遮光 気密容器	性状	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	13.1	13.2	13.0	12.7
		溶出性*2 (%)	90 分間、65%以上 (最小値～最大値)	83～97	93～96	94～98	93～103
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	99.3	101.3	99.4	101.6
湿度	25±1℃ 75±5%RH 遮光 開放	性状	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	13.1	11.4	8.1	8.2
		溶出性*2 (%)	90 分間、65%以上 (最小値～最大値)	83～97	89～97	97～99	93～101
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	99.3	102.2	100.6	101.6

保存条件		試験項目	規格	結果	
				開始時	60 万 lx・hr
光	温度 なりゆき 1000lx/hr 気密容器	性状	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	13.1	11.8
		溶出性*2 (%)	90 分間、65%以上 (最小値～最大値)	83～97	96～98
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	99.3	101.3

*1 n=10 の平均値

*2 n=6

*3 n=3 の平均値

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性

< 溶出挙動における同等性及び類似性 >

●トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」³⁾

トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」(試験製剤)は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン(薬食審査発第 1124004 号、2006 年 11 月 24 日)」に基づき、トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」を標準製剤としたとき、溶出挙動に基づき生物学的に同等とみなされた。

結果

平均溶出率

○pH 1.2 (毎分 50 回転)

標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点 (10 分及び 30 分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあった。

○pH 4.0 (毎分 50 回転)、水 (毎分 50 回転)

標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる適当な 2 時点 (5 分及び 45 分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率 $\pm 10\%$ の範囲にあった。

○pH 6.8 (毎分 50 回転)

すべての測定時間において試験製剤の平均溶出率は、標準製剤の平均溶出率 $\pm 6\%$ の範囲にあった。

○pH 4.0 (毎分 100 回転)

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率は 15 分以内に 85%以上であった。

個々の溶出率

○pH 1.2 (毎分 50 回転)、pH 4.0 (毎分 50 回転、毎分 100 回転)、水 (毎分 50 回転)

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

○pH 6.8 (毎分 50 回転)

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、試験製剤の平均溶出率 $\pm 9\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものがなかった。

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較

溶出試験条件		判定時間 (分)	平均溶出率 (%)		結果
			トスフロキサシント シル酸塩錠 150mg 「TCK」	トスフロキサシント シル酸塩錠 75mg 「TCK」×2 錠	
pH 1.2	50 回転/分	10	63.6	58.8	範囲内
		30	86.7	83.3	範囲内
pH 4.0	50 回転/分	5	40.2	41.7	範囲内
		45	86.9	90.8	範囲内
pH 6.8※	50 回転/分	5	3.1	4.0	範囲内
		360	4.9	5.7	範囲内
水	50 回転/分	5	39.3	40.6	範囲内
		45	82.4	87.7	範囲内
pH 4.0	100 回転/分	15	95.4	92.3	範囲内

(n=12)

※全ての測定時点において試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±6%の範囲にある。

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率

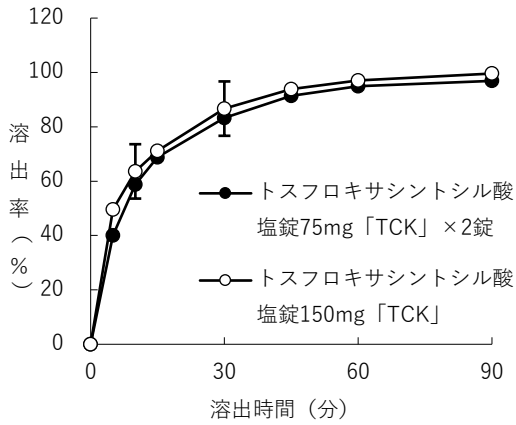
溶出試験条件		最終比較時点 (分)	平均溶出率 (%)	個々の溶出率			結果
				最小～最大 (%)	±15%を 超える 個数	±25%を 超える 個数	
pH 1.2	50 回転/分	30	83.3	78.4～85.5	0	0	適合
pH 4.0	50 回転/分	45	90.8	87.5～93.6	0	0	適合
水	50 回転/分	45	87.7	83.2～92.2	0	0	適合
pH 4.0	100 回転/分	15	92.3	90.4～94.0	0	0	適合

(n=12)

溶出試験条件		最終比較時点 (分)	平均溶出率 (%)	個々の溶出率			結果
				最小～最大 (%)	±9%を 超える 個数	±15%を 超える 個数	
pH 6.8	50 回転/分	360	5.7	5.3～6.3	0	0	適合

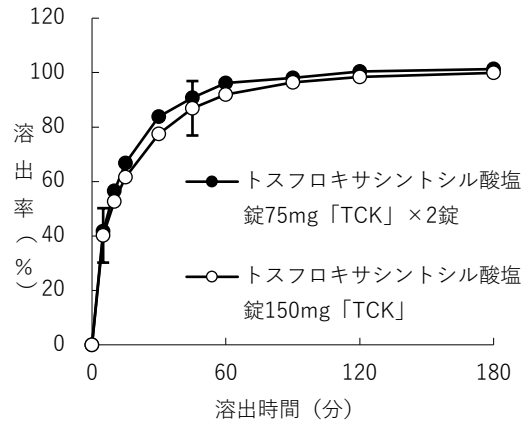
(n=12)

pH 1.2 (毎分 50 回転)



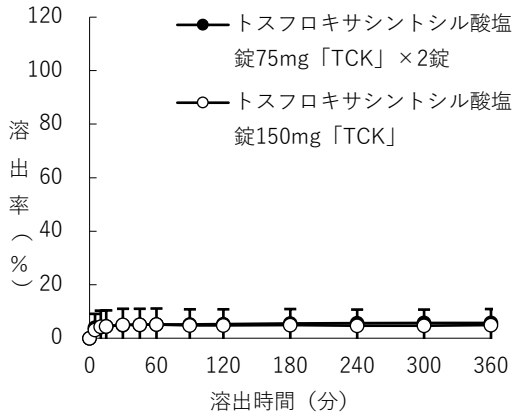
(n=12)

pH 4.0 (毎分 50 回転)



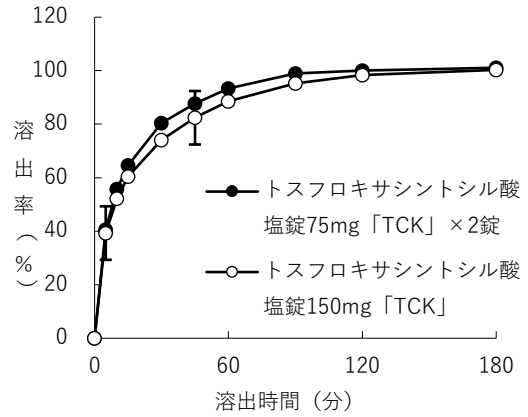
(n=12)

pH 6.8 (毎分 50 回転)



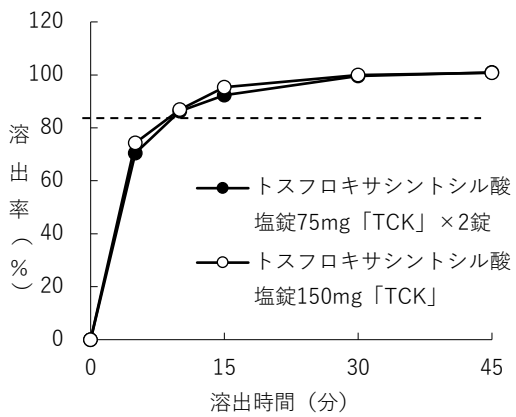
(n=12)

水 (毎分 50 回転)



(n=12)

pH 4.0 (毎分 100 回転)



(n=12)

--- 溶出率 85%
 ○ 判定基準の
 適合範囲

●トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg「TCK」⁴⁾

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（薬食審査発第 1124004 号、2006 年 11 月 24 日）に従いトスフロキサシントシル酸塩錠 150mg「TCK」（試験製剤）とオゼックス錠 150（標準製剤）との溶出挙動の比較を行った結果、全ての溶出試験条件において同等性試験ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。

結果

○pH 1.2（毎分 50 回転）

標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる適当な 2 時点（5 分及び 30 分）において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

○pH 4.0（毎分 50 回転）

標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる適当な 2 時点（5 分及び 45 分）において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

○pH 6.8（毎分 50 回転）

すべての測定時間において試験製剤の平均溶出率は、標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

○水（毎分 50 回転）

標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる適当な 2 時点（10 分及び 60 分）において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

○pH 4.0（毎分 100 回転）

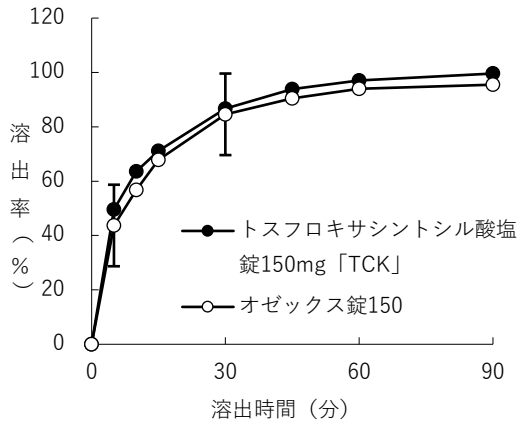
試験製剤及び標準製剤の平均溶出率は 15 分以内に 85%以上であった。

溶出試験条件		判定時間 (分)	平均溶出率 (%)		平均溶出率の 差 (%)
			オゼックス錠 150	トスフロキサシント シル酸塩錠 150mg 「TCK」	
pH 1.2	50 回転/分	5	43.7	49.6	範囲内
		30	84.6	86.7	範囲内
pH 4.0	50 回転/分	5	36.0	40.2	範囲内
		45	86.2	86.9	範囲内
pH 6.8*	50 回転/分	5	4.1	3.1	範囲内
		360	3.8	4.9	範囲内
水	50 回転/分	10	42.4	52.2	範囲内
		60	85.2	88.6	範囲内
pH 4.0	100 回転/分	15	90.7	95.4	範囲内

(n=12)

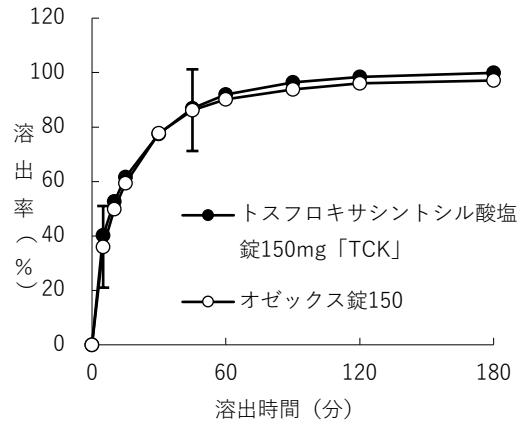
※全ての測定時点において試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にある。

pH 1.2 (毎分 50 回転)



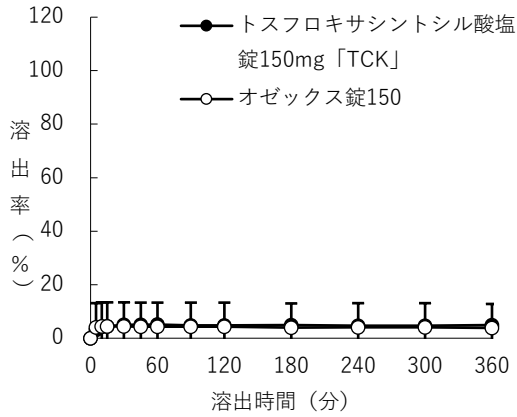
(n=12)

pH 4.0 (毎分 50 回転)



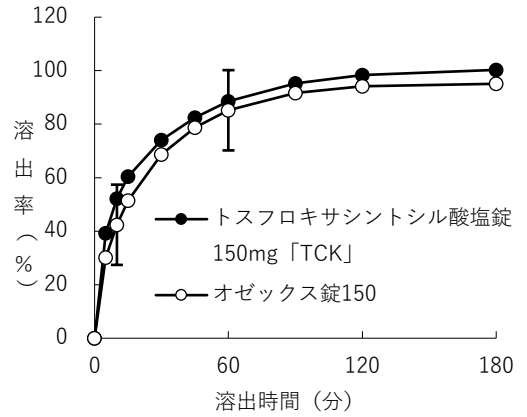
(n=12)

pH 6.8 (毎分 50 回転)



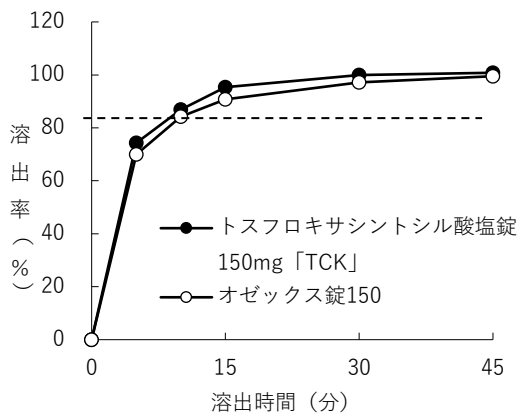
(n=12)

水 (毎分 50 回転)



(n=12)

pH 4.0 (毎分 100 回転)



(n=12)

--- 溶出率 85%
 ○ 判定基準の
 適合範囲

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当資料なし

(2) 包装

<トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」>

100 錠(10 錠 (PTP) ×10)

<トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」>

100 錠 (10 錠 (PTP) ×10)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

包装形態	材質
PTP 包装	ポリ塩化ビニルフィルム アルミニウム箔

11. 別途提供される資材類

無し

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

〈適応菌種〉

トスフロキサシンに感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌（ペニシリン耐性肺炎球菌を含む）、腸球菌属、淋菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、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、プロビデンシア属、コレラ菌、インフルエンザ菌、緑膿菌、バークホルデリア・セパシア、ステノトロホモナス（ザントモナス）・マルトフィリア、アシネトバクター属、ペプトストレプトコッカス属、バクテロイデス属、プレボテラ属、アクネ菌、トラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス）

〈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、ざ瘡（化膿性炎症を伴うもの）、外傷・熱傷及び手術創等の二次感染、乳腺炎、肛門周囲膿瘍、骨髓炎、関節炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲膿瘍を含む）、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、胆嚢炎、胆管炎、感染性腸炎、腸チフス、パラチフス、コレラ、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、涙嚢炎、麦粒腫、瞼板腺炎、外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、化膿性唾液腺炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎、炭疽

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能又は効果に関連する注意

〈咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、感染性腸炎、中耳炎、副鼻腔炎〉

「抗微生物薬適正使用の手引き」⁵⁾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。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

〈骨髄炎、関節炎、腸チフス、パラチフス以外〉

通常、成人に対して、トスフロキサシントシル酸塩水和物として1日300～450mg（トスフロキサシンとして204～306mg）を2～3回に分割して経口投与する。

〈骨髄炎、関節炎〉

通常、成人に対して、トスフロキサシントシル酸塩水和物として1日450mg（トスフロキサシンとして306mg）を3回に分割して経口投与する。

〈腸チフス、パラチフス〉

通常、成人に対して、トスフロキサシントシル酸塩水和物として1日600mg（トスフロキサシンとして408mg）を4回に分割して14日間経口投与する。

なお、腸チフス、パラチフスを除く症例においては、感染症の種類及び症状により適宜増減するが、重症又は効果不十分と思われる症例にはトスフロキサシントシル酸塩水和物として1日600mg（トスフロキサシンとして408mg）を経口投与する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

設定されていない

4. 用法及び用量に関連する注意

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 除菌を確実にするため14日間投与する。なお、投与中は、臨床検査値の異常変動等の発現に注意すること。

〈炭疽〉

7.2 炭疽の発症及び進展抑制には、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。[8.4 参照]

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後ベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ニューキノロン系抗菌薬

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

細菌の DNA ジャイレース及びトポイソメラーゼIVを阻害し、殺菌的に作用する⁶⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

- 1) 健康成人に 150mg 又は 300mg を食後単回経口投与したときのトスフロキサシンの血中濃度は以下のとおりである⁷⁾。

投与量	例数	C _{max} (µg/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC (µg·hr/mL)
150mg	34	0.54	2.00	4.85	4.95
300mg	5	1.06	2.16	4.44	8.97

2) 生物学的同等性試験

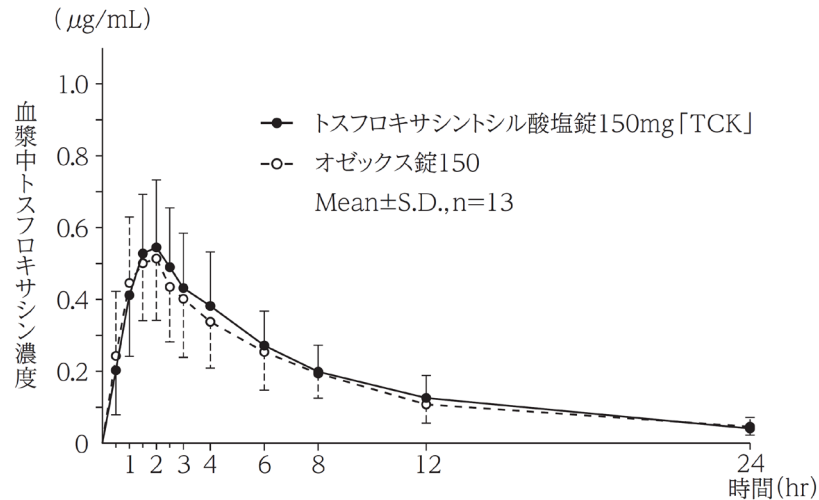
●トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」

生物学的同等性試験ガイドライン（薬食審査発第 1124004 号 2006 年 11 月 24 日）

トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」とオゼックス錠 150 を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（トスフロキサシントシル酸塩水和物 150mg）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、C_{max}）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.80）～log（1.25）の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された⁸⁾。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0→24hr} (µg·hr/mL)	C _{max} (µg/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」	4.39 ±1.51	0.62 ±0.16	1.65 ±0.66	7.35 ±1.34
オゼックス錠 150	4.11 ±1.49	0.60 ±0.16	1.62 ±0.58	8.05 ±1.16

(Mean ± S.D., n=13)



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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ. 7. 相互作用」の項を参照すること。

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

その他

女性性器組織⁹⁾、胆汁、胆嚢組織¹⁰⁾、耳漏¹¹⁾、唾液¹²⁾、涙液¹³⁾、抜歯創¹²⁾、関節液¹⁴⁾等に良好な移行が認められている。また、乳汁中へも移行する¹⁵⁾。[9.6 参照]

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

扁桃組織

口蓋扁桃摘出術施行患者 3 例に 150～300mg を空腹時単回経口投与したとき、組織内濃度は 130～195 分で 0.66～1.08 $\mu\text{g/g}$ を示した¹¹⁾。

喀痰

慢性気管支炎及び肺気腫の感染合併患者 2 例に 150mg を食後単回経口投与したとき、最高喀痰中濃度は 2～3 時間後に 0.31 $\mu\text{g/mL}$ 及び 0.34 $\mu\text{g/mL}$ の値が得られ、6～8 時間後にも 0.20 $\mu\text{g/mL}$ 前後であった¹⁶⁾。

前立腺組織

前立腺肥大症手術患者 5 例に 150mg を空腹時単回経口投与したとき、組織内濃度は 2 時間で 0.120 $\mu\text{g/g}$ 、4 時間で 0.245 $\mu\text{g/g}$ を示した¹⁷⁾。

皮膚組織

皮膚疾患患者 2 例に 450mg(150mg \times 3/日)を 7 日又は 10 日連続で食後経口投与したとき、皮膚組織内濃度は最終投与後 135 分で 2.5 $\mu\text{g/g}$ 、225 分で 1.43 $\mu\text{g/g}$ を示した¹⁸⁾。

なお、「VII. 5. (3) 乳汁への移行性」の項も参照すること。

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

健康成人 6 例に 150mg を食後単回経口投与したとき、大部分が未変化体として尿中に排泄されたが、未変化体以外に 2 種の代謝物及びこれらの抱合体が尿中に確認された¹⁹⁾。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

該当資料なし

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

健康成人 6 例に 150mg を食後単回経口投与したとき、24 時間までの未変化体の尿中排泄率は 45.8%であった²⁰⁾。また、代謝物も含めた 24 時間までの尿中総回収率は 50.7%であった¹⁹⁾。[9.8.2 参照]

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

透析患者の血中濃度

血液透析患者 2 例に 150mg を食後単回経口投与したとき、それぞれ投与 1.5 時間後に 1.65µg/mL、3 時間後に 1.6µg/mL の血中濃度ピーク値を示し、5 時間の透析で透析液中に 7.31% 及び 8.33%が回収された²¹⁾。

10. 特定の背景を有する患者

腎機能障害者の血中濃度

腎機能障害者に 150mg を食後単回経口投与したとき、次表のとおり、腎機能の低下に伴い血中半減期 ($T_{1/2}$) の延長が認められた²¹⁾。[9.2.1, 9.8.2 参照]

腎機能障害の程度 (Ccr : mL/min)	例数	$T_{1/2}$ (hr)
正常者 (Ccr \geq 80)	5	3.9
軽度 (80 > Ccr \geq 50)	3	4.0
中等度 (50 > Ccr \geq 20)	2	9.8
高度 (20 > Ccr)	4	10.5

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

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

〈炭疽、コレラ以外〉

2.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性 [9.5.1,9.5.2 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

〈効能共通〉

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。

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]

8.3 急性腎障害、間質性腎炎、腎性尿崩症等の重篤な腎障害、肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、定期的に検査を行うこと。[11.1.4,11.1.5 参照]

〈炭疽〉

8.4 長期投与中は、副作用及び臨床検査値の異常変動等の発現に特に注意すること。[7.2 参照]

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

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。[11.1.3 参照]

9.1.2 重症筋無力症の患者

フルオロキノロン系抗菌薬で症状を悪化させるとの報告²²⁾がある。[11.1.15 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薬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]

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 高度の腎障害のある患者

投与量・投与間隔の適切な調節をするなど慎重に投与すること。高い血中濃度が持続することがある。[16.6.1 参照]

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

〈炭疽、コレラ以外〉

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。[2.2 参照]

〈炭疽、コレラ〉

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。[2.2 参照]

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。母乳中への移行が報告されている。[16.3.1 参照]

(7) 小児等

9.7 小児等

低出生体重児、新生児及び乳児を対象とした臨床試験は実施していない。[15.2 参照]

(8) 高齢者

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。[11.1.13 参照]

9.8.2 用量並びに投与間隔に留意し、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。[16.5,16.6.1 参照]

7. 相互作用

10. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

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	健康成人にテオフィリン 1 日 400mg と本剤 1 日 450mg を併用したところ、テオフィリンの最高血中濃度は、併用 3 日目で 1.13 倍、5 日目では 1.23 倍の上昇を示したとの報告がある。 テオフィリンの中毒症状（消化器障害、頭痛、不整脈、痙攣等）があらわれるおそれがあるため、観察を十分に行い、血中濃度モニタリングを行うなど注意すること。	機序：テオフィリンの肝での代謝を抑制し、血中濃度を上昇させることが報告されている。 危険因子：高齢者、高度の腎障害患者

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、プロピオン酸系非ステロイド性消炎鎮痛剤 ジクロフェナク ナトリウム ロキソプロフェンナトリウム水和物 等	痙攣があらわれることがある。 観察を十分に行い、症状があらわれた場合には両剤の投与を中止し、気道確保と抗痙攣薬の使用など痙攣に対する治療を実施すること。	機序：中枢神経におけるGABA _A 受容体への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ことが主な機序と考えられている。 危険因子：高齢者、てんかん等痙攣性疾患又はこれらの既往歴のある患者、高度の腎障害患者
アルミニウム又はマグネシウム含有の制酸剤、鉄剤、カルシウム含有製剤 乾燥水酸化アルミニウムゲル 酸化マグネシウム クエン酸第一鉄ナトリウム 沈降炭酸カルシウム 等	本剤の効果が減弱されるおそれがある。 同時投与を避けるなど注意すること。	機序：金属カチオンと難溶性の錯塩を形成し、本剤の消化管からの吸収が低下することが報告されている。
副腎皮質ホルモン剤（経口剤、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

8. 副作用

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。

(1) 重大な副作用と初期症状

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、浮腫、発赤等）（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）（いずれも頻度不明）

11.1.3 痙攣、意識障害（意識喪失等）（いずれも頻度不明）

[9.1.1 参照]

11.1.4 急性腎障害、間質性腎炎、腎性尿崩症（いずれも頻度不明）

急性腎障害、間質性腎炎、腎性尿崩症等の重篤な腎障害があらわれることがある。

[8.3 参照]

11.1.5 肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

[8.3 参照]

11.1.6 無顆粒球症、血小板減少（いずれも頻度不明）

発熱、咽頭痛、皮下・粘膜出血等があらわれた場合には血液検査を行い、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。

11.1.7 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 間質性肺炎、好酸球性肺炎（いずれも頻度不明）

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、好酸球性肺炎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。

11.1.9 横紋筋融解症（頻度不明）

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。筋肉痛、脱力感、CK 上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇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。

11.1.10 低血糖（頻度不明）

高齢者、腎障害患者、糖尿病患者であらわれやすい。

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 末梢神経障害（頻度不明）

しびれ、筋力低下、痛み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。

<p>11.1.13 アキレス腱炎、腱断裂等の腱障害（頻度不明）</p> <p>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]</p> <p>11.1.14 精神症状（頻度不明）</p> <p>幻覚、せん妄等の精神症状があらわれることがある。</p> <p>11.1.15 重症筋無力症の悪化（頻度不明）</p> <p>[9.1.2 参照]</p>

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
種類	0.1～1%未満 ^{注)}	0.1%未満 ^{注)}	頻度不明
過敏症	発疹	そう痒感、蕁麻疹、発熱	光線過敏症
腎臓	—	BUN 上昇、血尿	クレアチニン上昇
肝臓	—	AST 上昇、ALT 上昇、Al-P 上昇、LDH 上昇、 γ -GTP 上昇、ビリルビン上昇	—
消化器	胃・腹部不快感、悪心、下痢・軟便、胃・腹痛	嘔吐、腹部膨満感、食欲不振、便秘、口内炎、口渇、舌炎	—
血液	—	—	白血球減少、好酸球増多、血小板減少、貧血
精神神経系	—	頭痛、めまい、しびれ、不眠、振戦	幻覚
その他	—	倦怠感	関節痛、味覚異常

注) 臨床試験と承認後の使用成績調査を合算した発現頻度

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

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。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

動物実験（幼若犬）で 50mg/kg、500mg/kg を 14 日間経口投与した結果、関節異常（上腕骨近位端軟骨に微小水疱あるいはびらん）が認められたとの報告がある²³⁾、²⁴⁾。[9.7 参照]

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験（「VI. 薬効薬理に関する項目」参照）

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

「VIII. 12. (2) 非臨床試験に基づく情報」の項を参照すること。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製剤：トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」

トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」

処方箋医薬品（注意—医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：トスフロキサシントシル酸塩水和物 処方箋医薬品

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有り

くすりのしおり：有り

その他の患者用資料：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：オゼックス錠 75/錠 150/細粒小児用 15%/錠小児用 60mg

同効薬：レボフロキサシン水和物、モキシフロキサシン塩酸塩、スパルフロキサシン
など

7. 国際誕生年月日

該当資料なし

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
トスフロキサシントシル酸 塩錠 75mg 「TCK」	2009年7月13日	22100AMX02089000	2009年11月13日	2009年11月13日
トスフロキサシントシル酸 塩錠 150mg 「TCK」	2009年7月13日	22100AMX02090000	2009年11月13日	2009年11月13日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

2010年3月30日

「肺炎球菌」から「肺炎球菌（ペニシリン耐性肺炎球菌を含む）」へ効能又は効果を変更。

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号 (9桁)	レセプト電算処理 システム用コード
トスフロキサシントシル酸 塩錠 75mg「TCK」	6241010F1012	6241010F1055	119311401	621931101
トスフロキサシントシル酸 塩錠 150mg「TCK」	6241010F2019	6241010F2051	119312101	621931201

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 社内資料：安定性試験（錠 75mg）
- 2) 社内資料：安定性試験（錠 150mg）
- 3) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 75mg）
- 4) 社内資料：溶出試験（錠 150mg）
- 5) 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
- 6) 神山 朋子ほか：あたらしい眼科. 2006；23（別巻）：3-11
- 7) 橋本 茂一：化学療法の領域. 1990；6（8）：1694-1705
- 8) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 150mg）
- 9) 張 南薫ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：1214-1228
- 10) 谷村 弘ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：814-841
- 11) 河村 正三ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：1341-1353
- 12) 佐々木次郎ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：1488-1507
- 13) 矢田 浩二ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：1426-1429
- 14) 鳴嶋 真人ほか：基礎と臨床. 1992；26（8）：2731-2734
- 15) 中村 孝ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：710-726
- 16) 那須 勝ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：699-709
- 17) 津川 昌也ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：1074-1090
- 18) 高橋 久ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：1288-1327
- 19) 田井 賢ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：208-215
- 20) 中島 光好ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：158-180
- 21) 前田 浩志ほか：Chemotherapy. 1988；36（S-9）：187-194
- 22) Sieb,J.P.：Neurology. 1998；50：804-807
- 23) 関節に対する影響（オゼックス細粒小児用 15% / オゼックス錠小児用 60mg：2009 年 10 月 16 日承認、申請資料概要 2.6.6.9.2.1）
- 24) 古坊 真一ほか：日本化学療法学会雑誌. 2010；58（S-2）：12-23

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

(1) 粉碎

粉碎時の安定性試験結果

●トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」

保存条件	試験項目	規格	結果		
			開始時	2 週間	4 週間
室内散乱光 シャーレ開放	定量 (%)	95.0%~105.0%	101.6	102.3	99.2

●トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」

保存条件	試験項目	規格	結果		
			開始時	2 週間	4 週間
室内散乱光 シャーレ開放	定量 (%)	95.0%~105.0%	99.3	102.0	98.0

(2) 崩壊・懸濁性および経管投与チューブの通過性

「内服薬 経管投与ハンドブック 第二版(監修：藤島一郎、執筆：倉田なおみ)、じほう」を参考に、製剤の崩壊・懸濁性および経管投与チューブの通過性の試験を行った。

試験方法

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、ディスペンサー内に製剤をそのまま1個入れてピストンを戻し、ディスペンサーに55°Cの温湯20mLを吸い取り、筒先に蓋をして5分間自然放置する。5分後にディスペンサーを手で90度15往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察する。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行う。それでも崩壊懸濁しない場合は、この方法を中止する。中止した製品は、破壊(乳棒で数回叩く)後、上述と同様の操作を行う。

得られた懸濁液を経管チューブの注入端より、約2~3mL/secの速度で注入し、通過性を観察する。体内挿入端から3分の2を水平にし、他端(注入端)を30cmの高さにセットする。注入後に適量の水を注入して経管チューブ内を洗うとき、経管チューブ内に残存物がみられなければ、通過性に問題なしとする。

判定方法

水（約 55°C）

製剤を 55°C の温湯 20mL に入れ、5 分または 10 分放置後に攪拌したときの通過性
破壊→水

製剤を破壊した後に、55°C の温湯 20mL に入れ、5 分または 10 分放置後に攪拌したときの通過性

○：経管チューブを通過

△：時間をかければ崩壊しそうな状況、または経管チューブを閉塞する危険性がある

×：通過困難

結果

●トスフロキサシントシル酸塩錠 75mg 「TCK」

経管チューブサイズ	水（約 55°C）		破壊→水	
	5 分	10 分	5 分	10 分
8Fr.	○			

●トスフロキサシントシル酸塩錠 150mg 「TCK」

経管チューブサイズ	水（約 55°C）		破壊→水	
	5 分	10 分	5 分	10 分
8Fr.	○			

2. その他の関連資料

該当資料なし