

(新聞発表用)

製造

| | | |
|---|-----------|---|
| 1 | 販 売 名 | オゼックス点眼液 0.3% トスフロ点眼液 0.3% |
| 2 | 一 般 名 | トシル酸トスフロキサシン |
| 3 | 申 請 者 名 | 富山化学工業株式会社: オゼックス点眼液 0.3% 株式会社ニデック: トスフロ点眼液 0.3% |
| 4 | 成 分 ・ 分 量 | 1mL 中トシル酸トスフロキサシン 3mg 含有 |
| 5 | 用 法 ・ 用 量 | 通常、成人及び小児に対して1回1滴、1日3回点眼する。なお、疾患、症状により適宜増量する。 |
| 6 | 効 能 ・ 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、腸球菌属、マイクロコッカス属、モラクセラ属、コリネバクテリウム属、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、インフルエンザ菌、ヘモフィルス・エジプチウス (コッホ・ウィークス菌)、シュードモナス属、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、アクネ菌 <適応症> 眼瞼炎、涙嚢炎、麦粒腫、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎 (角膜潰瘍を含む)、眼科周術期の無菌化療法 |
| 7 | 備 考 | 添付文書 (案) を別紙として添付。 本剤はニューキノロン系抗菌点眼液である。 |

広範囲抗菌点眼剤

日本標準商品分類番号

871319

指定医薬品・処方せん医薬品

注意一医師等の処方せんにより使用すること

貯 法：室温保存

使用期限：外箱及びラベルに表示の

期限内に使用すること

オゼックス点眼液 0.3%

トシル酸トスフロキサシン点眼液

OZEX ophthalmic solution

| | |
|------|---------|
| 承認番号 | () |
| 薬価収載 | 薬価基準未収載 |
| 販売開始 | 年 月 |

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

本剤の成分及びキノロン系抗菌剤に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

| | |
|--------------|------------------------------------|
| 販売名 | オゼックス®点眼液 0.3% |
| 成分 | トシル酸トスフロキサシン |
| 含量 (1mL中) | 3mg (トスフロキサシンとして 2.04mg) |
| 添加物 | 硫酸アルミニウムカリウム、ホウ砂、塩化ナトリウム、 pH調整剤 |
| 色・剤形 | 無色澄明、無菌水性点眼剤 |
| pH | 4.9~5.5 |
| 浸透圧比 | 0.9~1.1 (生理食塩液に対する比) |

【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、腸球菌属、マイクロコッカス属、モラクセラ属、コリネバクテリウム属、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、インフルエンザ菌、ヘモフィルス・エジプチウス(コッホ・ウィークス菌)、シュードモナス属、緑膿菌、パークホルデリア・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、アクネ菌

〈適応症〉

眼瞼炎、涙嚢炎、麦粒腫、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎(角膜潰瘍を含む)、眼科周術期の無菌化療法

【用法及び用量】

通常、成人及び小児に対して1回1滴、1日3回点眼する。なお、疾患、症状により適宜増量する。

〈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。
- ・小児においては、成人に比べて短時間で治療効果が認められることがあることから、経過を十分観察し、漫然と使用しないよう注意すること。
- ・小児における増量投与については、その安全性は確立されていない。

【使用上の注意】

1. 副作用

承認時までの臨床試験で、総症例数 620 例〔成人 539 例、小児 81 例(乳幼児 62 例、新生児 11 例を含む)〕のうち、副作用は成人 15 例(2.42%)に認められ、発現件数は 16 件であった。主な副作用は、眼刺激 6 件(0.97%)、点状角膜炎等の角膜障害 4 件(0.65%)であった。

(1) 重大な副作用(類薬)

ショック、アナフィラキシー様症状:他の点眼用ニューキノロン系抗菌剤で、ショック、アナフィラキシー様症状が報告されているので、観察を十分にを行い、紅斑、発疹、呼吸困難、血圧低下、眼瞼浮腫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。

(2) その他の副作用

次のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

| 種類/頻度 | 0.5~1%未満 | 0.1~0.5%未満 |
|-------|-----------------|----------------------------|
| 眼 | 眼刺激、点状角膜炎等の角膜障害 | 眼痛、眼瞼皮膚炎、霧視、眼の充血、眼そう痒症、霰粒腫 |

2. 適用上の注意

- (1) 点眼用のみ使用すること。
- (2) 薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意するよう指導すること。
- (3) 原則として配合変化が認められる点眼液との併用は避けること(「取扱い上の注意」の項参照)。

【薬物動態】

1. 血中濃度及び結膜嚢内濃度¹⁾

健康成人眼に本剤を1回1滴、1日3回14日間点眼したとき、最終点眼1.5時間後の血清中トスフロキサシン濃度は定量限界(<0.0347 µg/mL)以下であった。また、健康成人眼に本剤を1回1滴、1日8回14日間点眼したとき、点眼14日目の初回点眼24時間後の血清中トスフロキサシン濃度は定量限界(<0.0347 µg/mL)以下で、結膜嚢内濃度は2.0 µg/mLであった。

2. 動物における眼組織内移行

(参考:ウサギ、イヌ)

(1) 結膜嚢内濃度²⁾

本剤を有色ウサギに1回40 µL点眼したときの結膜嚢内トスフロキサシン濃度は、点眼5分後で168 µg/mL、4時間後では3.31 µg/mLであり、6時間後では0.670 µg/mLであった。

(2) 眼組織内濃度

1) ¹⁴C 標識トシル酸トスフロキサシン点眼液 0.3%を有色ウサギに1回40 µL点眼したとき、点眼1時間後には硝子体を除く各眼組織に広く分布し、放射能濃度は、眼瞼結膜で436 ng eq./g、眼球結膜で128 ng eq./g、前房水で89.3 ng eq./mL及び角膜で1800 ng eq./gを示した。また、メラニン含有組織である虹彩・毛様体及び脈絡膜・網膜は1時間後でそれぞれ421 ng eq./g及び249 ng eq./g、24時間後ではそれぞれ3250 ng eq./g及び759 ng eq./gを示した²⁾。

2) ¹⁴C 標識トシル酸トスフロキサシンをビーグル犬に20 mg/kgの投与量で1日1回14日間反復経口投与したとき、脈絡膜・色素上皮及び虹彩・毛様体の放射能濃度は、投与終了12時間後に322 µg eq./g及び425 µg eq./gを示し、投与終了360日後まで徐々に消失した²⁾。

3) 幼若ウサギを用いた13週間反復点眼による眼毒性試験において、本剤投与群の眼瞼結膜、角膜、脈絡膜・色素上皮及び虹彩・毛様体内トスフロキサシン濃度は、成熟ウサギに本剤を39週間反復点眼した場合と比較して平均値で1.4~2.3倍とやや高値を示した。一方、眼球結膜及び前房水の薬剤濃度は幼若ウサギと成熟ウサギでほぼ同様な値を示した³⁾。

【臨床成績】

1. 疾患別臨床効果⁴⁾⁵⁾⁶⁾

外眼部感染症の患者 304 例を対象に実施した本剤の第

III 相比較試験、一般臨床試験の各疾患別臨床効果は下表のとおりであった。

| 疾患名 | 有効率（有効以上） | |
|--------------|-----------------------|---------------|
| | 臨床試験全体 （小児臨床試験を含む） | 小児臨床試験 |
| 眼瞼炎 | 90.0% (9/10) | — |
| 涙嚢炎 | 93.8% (15/16) | 100% (5/5) |
| 麦粒腫 | 97.8% (45/46) | 100% (6/6) |
| 結膜炎 | 94.4% (187/198) | 97.6% (40/41) |
| 瞼板腺炎 | 87.0% (20/23) | 100% (1/1) |
| 角膜炎（角膜潰瘍を含む） | 100% (11/11)*1 | — |

*1 角膜潰瘍 4 例を含む

2. 適応菌種別臨床効果⁴⁾⁵⁾⁶⁾

上記症例より分離された適応菌種別臨床効果は下表のとおりであった。

| 菌種 | 有効率*2（有効以上） |
|------------------------------|-----------------|
| ブドウ球菌属 | 94.1% (128/136) |
| レンサ球菌属 | 100% (16/16) |
| 肺炎球菌 | 100% (10/10) |
| モラクセラ属（モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス） | 100% (4/4) |
| コリネバクテリウム属 | 98.7% (77/78) |
| エンテロバクター属 | 100% (1/1) |
| セラチア属 | 100% (4/4) |
| インフルエンザ菌 | 100% (35/35) |
| シュードモナス属 | 100% (3/3) |
| 緑膿菌 | 100% (3/3) |
| ステノトロホモナス（ザントモナス）・マルトフィリア | 66.7% (2/3) |
| アシネトバクター属 | 100% (2/2) |
| アクネ菌 | 86.8% (79/91) |

*2 複数の菌種が検出された場合は、各々の菌種に 1 例として算入

3. 眼科手術期の無菌化療法に対する効果⁷⁾

眼手術予定患者を対象に実施された術前無菌法における抗菌効果は、評価対象例数 64 例中無菌化例数は 47 例（無菌化率 73.4%）であった。なお、1 日点眼量及び点眼期間は、1 回 1 滴、1 日 5 回、2 日間であった。

【薬効薬理】

1. 抗菌作用⁸⁾⁹⁾¹⁰⁾

本剤の活性本体であるトスフロキサシンの抗菌スペクトルは広範囲に及び、*in vitro* でブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、マイクロコッカス属、コリネバクテリウム属等のグラム陽性菌、モラクセラ属、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、インフルエンザ菌、ヘモフィルス・エジプチウス（コッホ・ウィークス菌）、シュードモナス属、緑膿菌、バークホルデルリア・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等のグラム陰性菌並びに嫌気性菌であるアクネ菌等の眼感染症の起原菌に対して強い抗菌力を示す。

2. 作用機序¹¹⁾

細菌の DNA の高次構造を変換する DNA gyrase 及び topoisomerase IV 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。

3. 実験的感染症に対する治療効果¹²⁾

ウサギの角膜実質に緑膿菌あるいは表皮ブドウ球菌の臨床分離株を接種して作成した眼感染症モデルに対して、本剤は治療効果を示した。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：トシル酸トスフロキサシン

(Tosufloxacin Tosilate)

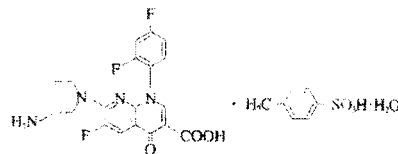
略号：TFLX（トスフロキサシン）

化学名：

(±)-7-(3-amino-1-pyrrolidinyl)-6-fluoro-1-(2,4-difluorophenyl)-1,4-dihydro-4-oxo-1,8-naphthyridine-3-carboxylic acid

p-toluenesulfonate hydrate

構造式：



分子式：C₁₉H₁₅F₃N₄O₃ · C₇H₈O₃S · H₂O

分子量：594.56

性状：微黄白色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。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、エタノール（95）、アセトン、酢酸エチル、ジエチルエーテル又はクロロホルムにほとんど溶けない。

融点：約 254°C（分解）

分配係数：n-オクタノール/水、37°C

| 溶液 | 分配係数 |
|-------------------------|------|
| 0.1N 塩酸 | 0.72 |
| pH 4 (McIlvaine buffer) | 0.79 |
| pH 7 (McIlvaine buffer) | 0.08 |
| pH 10 (Sørensen buffer) | 0.02 |

【取扱い上の注意】

●主な点眼液との配合変化*3

本剤 1mL と配合薬剤 1mL をガラス管に入れ、ミキサーで 10 秒間混合し、外観変化を観察¹³⁾¹⁴⁾

| | |
|----------|--|
| 配合変化あり*4 | リンデロン液、ニフラン点眼液、ジクロード点眼液、プロナック点眼液、点眼・点鼻用リンデロンA液、エコリシン点眼液、リザベン点眼液、インターール点眼液、タチオン点眼液、ミドリM、キサラタン点眼液、チモプトール0.25%、チモプトールXE0.5%、トルソプト点眼液1%、ミケラン点眼液2%、リズモンTG点眼液0.5%、フラビタン点眼液 |
| 配合変化なし | トブラシン点眼液、サンテマイシン点眼液、ザジテン点眼液、ムコゾーム点眼液、カタリン点眼液、ミドリP、レスキュラ点眼液、サンコバ点眼液 |

*3 表中以外の薬剤については検討されていない

*4 混合直後または室温で 1 時間放置後に外観変化が認められたもの

【包装】

オゼックス点眼液 0.3% : 5mL×5 本、5mL×10 本

【主要文献】

- 1) 北野周作ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 2) 福島容子ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 3) 木澤和夫ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 4) 北野周作ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 5) 北野周作ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 6) 北野周作ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 7) 北野周作ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 8) 富山化学 社内資料
- 9) 五島瑛智子ほか：CHEMOTHERAPY，36(S-9)，36-58，1988
- 10) 富山化学 社内資料
- 11) 神山朋子ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 12) 水永真吾ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 13) 富山化学 社内資料
- 14) 富山化学 社内資料

【文献請求先】

大塚製薬株式会社

信頼性保証本部 医薬情報センター

〒101-8535 東京都千代田区神田司町 2-2

大塚製薬神田第2ビル

電話 050-316-12345

FAX 03-3257-6566

製造販売元
富山化学工業株式会社
東京都新宿区西新宿 3-2-5

販売
大塚製薬株式会社
東京都千代田区神田司町 2-9

®登録商標

〇-〇〇

広範囲抗菌点眼剤

| |
|------------|
| 日本標準商品分類番号 |
| 871319 |

指定医薬品・処方せん医薬品

注意—医術等の処方せんにより使用すること

貯法：室温保存

使用期限：外箱及びラベルに表示の
期限内に使用すること

トスフロ®点眼液 0.3%
トシル酸トスフロキサシン点眼液

TOSUFLO® ophthalmic solution

| | |
|------|---------|
| 承認番号 | () |
| 薬価収載 | 薬価基準未収載 |
| 販売開始 | 年 月 |

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

本剤の成分及びキノロン系抗菌剤に対し過敏症の既往歴のある患者

【組成・性状】

| | |
|----------------|-------------------------------------|
| 販売名 | トスフロ®点眼液 0.3% |
| 成分 | トシル酸トスフロキサシン |
| 含量 (1 mL 中) | 3mg (トスフロキサシンとして 2.04mg) |
| 添加物 | 硫酸アルミニウムカリウム、ホウ砂、塩化ナトリウム、 pH 調整剤 |
| 色・剤形 | 無色透明、無菌水性点眼剤 |
| pH | 4.9~5.5 |
| 浸透圧比 | 0.9~1.1 (生理食塩液に対する比) |

【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、腸球菌属、ミクロコッカス属、モラクセラ属、コリネバクテリウム属、クレブシエラ属、エンテロバクテリウム属、セラチア属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、プロピデンシア属、インフルエンザ菌、ヘモフィルス・エジプテウス(コッホ・ウィークス菌)、シュードモナス属、緑膿菌、パークホルデルリア・セバシア、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、アクネ菌

〈適応症〉

眼瞼炎、涙嚢炎、麦粒腫、結膜炎、瞼板腺炎、角膜炎(角膜潰瘍を含む)、眼科周術期の無菌化療法

【用法及び用量】

通常、成人及び小児に対して1回1滴、1日3回点眼する。なお、疾患、症状により適宜増量する。

〈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。
- ・小児においては、成人に比べて短時間で治療効果が認められる場合があることから、経過を十分観察し、漫然と使用しないよう注意すること。
- ・小児における増量投与については、その安全性は確立されていない。

【使用上の注意】

1. 副作用

承認時までの臨床試験で、総症例数 620 例〔成人 539 例、小児 81 例(乳幼児 62 例、新生児 11 例を含む)〕のうち、副作用は成人 15 例(2.42%)に認められ、発現件数は 16 件であった。主な副作用は、眼刺激 6 件(0.97%)、点状角膜炎等の角膜障害 4 件(0.65%)であった。

(1) 重大な副作用(類薬)

ショック、アナフィラキシー様症状：他の点眼用ニューキノロン系抗菌剤で、ショック、アナフィラキシー様症状が報告されているので、観察を十分に行い、紅斑、発疹、呼吸困難、血圧低下、眼瞼浮腫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。

(2) その他の副作用

次のような副作用があらわれた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

| 種類/頻度 | 0.5~1%未満 | 0.1~0.5%未満 |
|-------|-----------------|----------------------------|
| 眼 | 眼刺激、点状角膜炎等の角膜障害 | 眼痛、眼瞼皮膚炎、霧視、眼の充血、眼そう痒症、霰粒腫 |

2. 適用上の注意

- (1) 点眼用のみ使用すること。
- (2) 薬液汚染防止のため、点眼のとき、容器の先端が直接目に触れないように注意するよう指導すること。
- (3) 原則として配合変化が認められる点眼液との併用は避けること(「取扱い上の注意」の項参照)。

【薬物動態】

1. 血中濃度及び結膜嚢内濃度¹⁾

健康成人眼に本剤を1回1滴、1日3回14日間点眼したとき、最終点眼1.5時間後の血清中トスフロキサシン濃度は定量限界(<0.0347 µg/mL)以下であった。また、健康成人眼に本剤を1回1滴、1日8回14日間点眼したとき、点眼14日目の初回点眼24時間後の血清中トスフロキサシン濃度は定量限界(<0.0347 µg/mL)以下で、結膜嚢内濃度は2.0 µg/mLであった。

2. 動物における眼組織内移行

(参考：ウサギ、イヌ)

(1) 結膜嚢内濃度²⁾

本剤を有色ウサギに1回40 µL点眼したときの結膜嚢内トスフロキサシン濃度は、点眼5分後で168 µg/mL、4時間後では3.31 µg/mLであり、6時間後では0.670 µg/mLであった。

(2) 眼組織内濃度

- 1) ¹⁴C 標識トシル酸トスフロキサシン点眼液 0.3%を有色ウサギに1回40 µL点眼したとき、点眼1時間後には硝子体を除く各眼組織に広く分布し、放射能濃度は、眼瞼結膜で436 ng eq./g、眼球結膜で128 ng eq./g、前房水で89.3 ng eq./mL及び角膜で1800 ng eq./gを示した。また、メラニン含有組織である虹彩・毛様体及び脈絡膜・網膜は1時間後でそれぞれ421 ng eq./g及び249 ng eq./g、24時間後ではそれぞれ3250 ng eq./g及び759 ng eq./gを示した²⁾。
- 2) ¹⁴C 標識トシル酸トスフロキサシンをビーグル犬に20 mg/kgの投与量で1日1回14日間反復経口投与したとき、脈絡膜・色素上皮及び虹彩・毛様体の放射能濃度は、投与終了12時間後に322 µg eq./g及び425 µg eq./gを示し、投与終了360日後まで緩徐に消失した²⁾。

3) 幼若ウサギを用いた13週間反復点眼による眼毒性試験において、本剤投与群の眼瞼結膜、角膜、脈絡膜・色素上皮及び虹彩・毛様体内トスフロキサシン濃度は、成熟ウサギに本剤を39週間反復点眼した場合と比較して平均値で1.4~2.3倍とやや高値を示した。一方、眼球結膜及び前房水の薬剤濃度は幼若ウサギと成熟ウサギではほぼ同様な値を示した²⁾。

【臨床成績】

1. 疾患別臨床効果⁴⁾⁵⁾⁶⁾

外眼部感染症の患者 304 例を対象に実施した本剤の第111 相比較試験、一般臨床試験の各疾患別臨床効果は下表

のとおりであった。

| 疾患名 | 有効率 (有効以上) | |
|-------------------|----------------------------|---------------|
| | 臨床試験全体 (小児臨床試験を 含む) | 小児臨床試験 |
| 眼瞼炎 | 90.0% (9/10) | — |
| 涙囊炎 | 93.8% (15/16) | 100% (5/5) |
| 麦粒腫 | 97.8% (45/46) | 100% (6/6) |
| 結膜炎 | 94.4% (187/198) | 97.6% (40/41) |
| 瞼板腺炎 | 87.0% (20/23) | 100% (1/1) |
| 角膜炎 (角膜潰瘍を 含む) | 100% (11/11) ^{※1} | — |

※1 角膜潰瘍 4 例を含む

2. 適応菌種別臨床効果⁽⁴⁾⁽⁵⁾⁽⁶⁾

上記症例より分離された適応菌種別臨床効果は下表のとおりであった。

| 菌種 | 有効率 ^{※2} (有効以上) |
|------------------------------------|--------------------------|
| ブドウ球菌属 | 94.1% (128/136) |
| レンサ球菌属 | 100% (16/16) |
| 肺炎球菌 | 100% (10/10) |
| モラクセラ属 (モラクセラ (ブランハ メラ)・カタラーリス) | 100% (4/4) |
| コリネバクテリウム属 | 98.7% (77/78) |
| エンテロバクター属 | 100% (1/1) |
| セラチア属 | 100% (4/4) |
| インフルエンザ菌 | 100% (35/35) |
| シュードモナス属 | 100% (3/3) |
| 緑膿菌 | 100% (3/3) |
| ステノトロホモナス (ザントモナ ス)・マルトフィリア | 66.7% (2/3) |
| アシネトバクター属 | 100% (2/2) |
| アクネ菌 | 86.8% (79/91) |

※2 複数の菌種が検出された場合は、各々の菌種に 1 例として算入

3. 眼科周術期の無菌化療法に対する効果⁽⁷⁾

眼手術予定患者を対象に実施された術前無菌法における抗菌効果は、評価対象例数 64 例中無菌化例数は 47 例 (無菌化率 73.4%) であった。なお、1 日点眼量及び点眼期間は、1 回 1 滴、1 日 5 回、2 日間であった。

【薬効薬理】

1. 抗菌作用⁽⁸⁾⁽⁹⁾⁽¹⁰⁾

本剤の活性本体であるトスフロキサシンの抗菌スペクトルは広範囲に及び、*in vitro* でブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、腸球菌属、マイクロコッカス属、コリネバクテリウム属等のグラム陽性菌、モラクセラ属、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、プロピデンシア属、インフルエンザ菌、ヘモフィルス・エジプチウス (コッホ・ウィークス菌)、シュードモナス属、緑膿菌、パークホルデリア・セバシア、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等のグラム陰性菌並びに嫌気性菌であるアクネ菌等の眼感染症の起原菌に対して強い抗菌力を示す。

2. 作用機序⁽¹¹⁾

細菌の DNA の高次構造を変換する DNA gyrase 及び topoisomerase IV 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。

3. 実験的感染症に対する治療効果⁽¹²⁾

ウサギの角膜実質に緑膿菌あるいは表皮ブドウ球菌の臨床分離株を接種して作成した眼感染症モデルに対して、本剤は治療効果を示した。

【有効成分に関する理化学的知見】

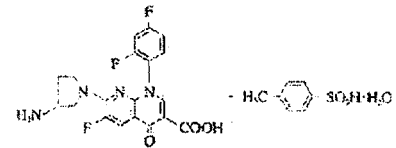
一般名：トシル酸トスフロキサシン
(Tosufloxacin Tosilate)

略号：TFLX (トスフロキサシン)

化学名：

(±)-7-(3-amino-1-pyrrolidinyl)-6-fluoro-1-(2,4-difluorophenyl)-1,4-dihydro-4-oxo-1,8-naphthyridine-3-carboxylic acid
p-toluenesulfonate hydrate

構造式：



分子式：C₁₉H₁₅F₃N₄O₃ · C₇H₉O₃S · H₂O

分子量：594.56

性状：微黄白色の結晶性の粉末で、におい及び味はない。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、エタノール(95)、アセトン、酢酸エチル、ジエチルエーテル又はクロロホルムにほとんど溶けない。

融点：約 254°C (分解)

分配係数：n-オクタノール/水、37°C

| 溶 液 | 分配係数 |
|-------------------------|------|
| 0.1N 塩酸 | 0.72 |
| pH 4 (McIlvaine buffer) | 0.79 |
| pH 7 (McIlvaine buffer) | 0.08 |
| pH 10 (Sorensen buffer) | 0.02 |

【取扱い上の注意】

●主な点眼液との配合変化^{※3}

本剤 1mL と配合薬液 1mL をガラス管に入れ、ミキサーで 10 秒間混合し、外観変化を観察⁽¹³⁾⁽¹⁴⁾

| | |
|----------------------|--|
| 配合変化あり ^{※4} | リンデロン液、ニフラン点眼液、ジクロード点眼液、プロナック点眼液、点眼・点鼻用リンデロンA液、エコリシン点眼液、リザベン点眼液、インタール点眼液、タチオン点眼液、ミドリM、キサラタン点眼液、チモプトール 0.25%、チモプトールXE 0.5%、トルソプト点眼液 1%、ミケラン点眼液 2%、リズモンTG点眼液 0.5%、フラビタン点眼液 |
| 配合変化なし | トブラシン点眼液、サンテマイシン点眼液、ザジテン点眼液、ムコゾーム点眼液、カタリン点眼液、ミドリP、レスキュラ点眼液、サンコバ点眼液 |

※3 表中以外の薬液については検討されていない

※4 混合直後または室温で 1 時間放置後に外観変化が認められたもの

【包 装】

トスフロ点眼液 0.3% : 5mL × 1 本、5mL × 5 本
5mL × 10 本、5mL × 50 本

【主要文献】

- 1) 北野周作ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 2) 福島容子ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 3) 木澤和夫ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 4) 北野周作ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 5) 北野周作ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 6) 北野周作ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 7) 北野周作ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 8) 富山化学 社内資料
- 9) 五島瑛智子ほか：CHEMOTHERAPY，36(S-9)，36-58，1988
- 10) 富山化学 社内資料
- 11) 神山朋子ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 12) 水永真吾ほか：あたらしい眼科，23 別巻，2006 投稿中
- 13) 富山化学 社内資料
- 14) 富山化学 社内資料

【文献請求先】

株式会社 ニデック 医薬部

〒443-0038 愛知県蒲郡市拾石町前浜 34 番地 14

電 話 0533-67-7249

製造販売元
株式会社 ニデック
愛知県蒲郡市拾石町前浜 34 番地 14

®登録商標

〇-〇〇