

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のI F記載要領(1998年9月)に準拠して作成

日本薬局方

注射用セファゾリンナトリウム

セファロスポリン系抗生物質製剤

指定医薬品、処方せん医薬品

タイセゾリン[®]注射用1g
タイセゾリン[®]注射用2g

TAICEZOLIN

剤形	注射剤(凍結乾燥品)
規格・含量	タイセゾリン注射用1g 1バイアル中:セファゾリンナトリウム……1g(力価) タイセゾリン注射用2g 1バイアル中:セファゾリンナトリウム……2g(力価)
一般名	和名:セファゾリンナトリウム 洋名:Cefazolin sodium
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 発売年月日	製造販売承認年月日:2006年8月4日 薬価基準収載年月日:2006年12月8日 発売年月日:1984年10月
開発・製造・輸入・発売・提携・販売会社名	製造販売元:大洋薬品工業株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	

本I Fは2008年4月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

ＩＦ利用の手引きの概要

－ 日本病院薬剤師会 －

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者(以下、MRと略す)等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和63年日本病院薬剤師会(以下、日病薬と略す)学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、IFと略す)として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成10年日病薬学術第3小委員会によって新たな位置付けとIF記載要領が策定された。

2. IFとは

IFは「医療用医薬品添付文書等の情報を補完し、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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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薬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。

しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。

3. IFの様式・作成・発行

規格はA4判、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IFは日病薬が策定した「IF記載要領」に従って記載するが、本IF記載要領は、平成11年1月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価(臨床試験実施による)がなされた時点ならびに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合にはIFが改訂・発行される。

4. IFの利用にあたって

IF策定の原点を踏まえ、MRへのインタビュー、自己調査のデータを加えてIFの内容を充実させ、IFの利用性を高めておく必要がある。

MRへのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床成績等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update(医薬品安全対策情報)等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段にIF作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお適正使用や安全確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

目 次

1 . 概要に関する項目	1	8 . 安全性（使用上の注意等）に関する項目	15
1 - 1 . 開発の経緯	1	8 - 1 . 警告内容とその理由	15
1 - 2 . 製品の特徴及び有用性	1	8 - 2 . 禁忌内容とその理由	15
2 . 名称に関する項目	2	8 - 3 . 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由	15
2 - 1 . 販売名	2	8 - 4 . 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由	15
2 - 2 . 一般名	2	8 - 5 . 慎重投与内容とその理由	15
2 - 3 . 構造式又は示性式	2	8 - 6 . 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	15
2 - 4 . 分子式及び分子量	2	8 - 7 . 相互作用	16
2 - 5 . 化学名（命名法）	2	8 - 8 . 副作用	16
2 - 6 . 慣用名、別名、略号、記号番号	2	8 - 9 . 高齢者への投与	17
2 - 7 . CAS 登録番号	2	8 - 10 . 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	17
3 . 有効成分に関する項目	3	8 - 11 . 小児等への投与	17
3 - 1 . 有効成分の規制区分	3	8 - 12 . 臨床検査結果に及ぼす影響	17
3 - 2 . 物理化学的性質	3	8 - 13 . 過量投与	18
3 - 3 . 有効成分の各種条件下における安定性	3	8 - 14 . 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）	18
3 - 4 . 有効成分の確認試験法	3	8 - 15 . その他の注意	18
3 - 5 . 有効成分の定量法	3	8 - 16 . その他	18
4 . 製剤に関する項目	4	9 . 非臨床試験に関する項目	19
4 - 1 . 剤形	4	9 - 1 . 一般薬理	19
4 - 2 . 製剤の組成	4	9 - 2 . 毒性	19
4 - 3 . 注射剤の調製法	4	10 . 取扱い上の注意等に関する項目	20
4 - 4 . 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	10 - 1 . 有効期間又は使用期限	20
4 - 5 . 製剤の各種条件下における安定性	5	10 - 2 . 貯法・保存条件	20
4 - 6 . 溶解後の安定性 ²⁾	5	10 - 3 . 薬剤取扱い上の注意点	20
4 - 7 . 他剤との配合変化（物理化学的変化）	7	10 - 4 . 承認条件	20
4 - 8 . 電解質の濃度	9	10 - 5 . 包装	20
4 - 9 . 混入する可能性のある夾雑物	9	10 - 6 . 同一成分・同効薬	20
4 - 10 . 生物学的試験法	9	10 - 7 . 国際誕生年月日	20
4 - 11 . 製剤中の有効成分の確認試験法	9	10 - 8 . 製造販売承認年月日及び承認番号	20
4 - 12 . 製剤中の有効成分の定量法	9	10 - 9 . 薬価基準収載年月日	20
4 - 13 . 力価	9	10 - 10 . 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容	20
4 - 14 . 容器の材質	9	10 - 11 . 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	21
4 - 15 . その他	9	10 - 12 . 再審査期間	21
5 . 治療に関する項目	10	10 - 13 . 長期投与の可否	21
5 - 1 . 効能又は効果	10	10 - 14 . 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	21
5 - 2 . 用法及び用量	10	10 - 15 . 保険給付上の注意	21
5 - 3 . 臨床成績	11	11 . 文献	22
6 . 薬効薬理に関する項目	12	11 - 1 . 引用文献	22
6 - 1 . 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	12	11 - 2 . その他の参考文献	22
6 - 2 . 薬理作用	12	12 . 参考資料	23
7 . 薬物動態に関する項目	13	12 - 1 . 主な外国での発売状況	23
7 - 1 . 血中濃度の推移・測定法	13	13 . 備考	24
7 - 2 . 薬物速度論的パラメータ	13	13 - 1 . その他の関連資料	24
7 - 3 . 吸収	13		
7 - 4 . 分布	13		
7 - 5 . 代謝	14		
7 - 6 . 排泄	14		
7 - 7 . 透析等による除去率	14		

1 . 概要に関する項目

1 - 1 . 開発の経緯

特になし

1 - 2 . 製品の特徴及び有用性

1. セファゾリンナトリウムは、グラム陽性菌及び大腸菌、肺炎桿菌、プロテウス・ミラビリスなどのグラム陰性菌に強く作用する。作用機序は細菌細胞壁の合成阻害で、作用は殺菌的である。ペニシリナーゼに対してはかなり安定であるが、グラム陰性桿菌の産生するセファロスポリナーゼによってセファロリジン、セファロチンと同様に不活化される。ペニシリン結合たん白（PBP）に強い結合親和性を持つ。
2. 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー様症状、血液障害、肝障害、腎障害、大腸炎、皮膚障害、間質性肺炎、PIE 症候群、痙攣を起こすことがある。

2 . 名称に関する項目

2 - 1 . 販売名

和名

タイセゾリン注射用 1g

タイセゾリン注射用 2g

洋名

TAICEZOLIN

名称の由来

特になし

2 - 2 . 一般名

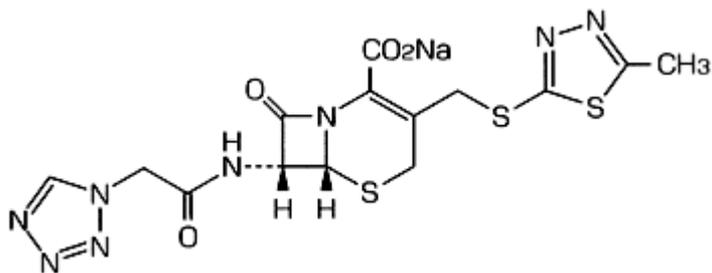
和名（命名法）

セファゾリンナトリウム

洋名（命名法）

Cefazolin sodium

2 - 3 . 構造式又は示性式



2 - 4 . 分子式及び分子量

分子式：C₁₄H₁₃N₈NaO₄S₃

分子量：476.49

2 - 5 . 化学名（命名法）

monosodium (6*R*,7*R*)-3-(5-methyl-1,3,4-thiadiazol-2-ylsulfanylmethyl)-8-oxo-7-[2-(1*H*-tetrazol-1-yl)acetylamino]-5-thia-1-azabicyclo[4.2.0]oct-2-ene-2-carboxylate

2 - 6 . 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：CEZ

2 - 7 . CAS 登録番号

27164-46-1

3 . 有効成分に関する項目

3 - 1 . 有効成分の規制区分

指定医薬品

3 - 2 . 物理化学的性質

外観・性状

白色～淡黄白色の結晶又は結晶性の粉末

溶解性

溶 媒	溶解性(1 g を溶かすに要する溶媒量)
水	1mL以上 10mL未満
ホルムアミド	1mL以上 10mL未満
メタノール	100mL以上 1000mL未満
エタノール(95)	10000mL以上

吸湿性

該当資料なし

融点(分解点)、沸点、凝固点

該当資料なし

酸塩基解離定数

該当資料なし

分配係数

該当資料なし

その他の主な示性値

旋光度〔 〕_D²⁰ : -19 ~ -23 ° (脱水物に換算したもの 2.5g, 水, 25mL, 100mm)

pH : 本品 1.0g を水 10mL に溶かした液の pH は 4.8 ~ 6.3 である。

3 - 3 . 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3 - 4 . 有効成分の確認試験法

- (1)紫外可視吸光度測定法
- (2)赤外吸収スペクトル測定法
- (3)核磁気共鳴スペクトル測定法(¹H)
- (4)ナトリウム塩の定性反応(1)

3 - 5 . 有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

4 . 製剤に関する項目

4 - 1 . 剤形

剤形の区別、規格及び性状

販 売 名	剤形の区別	規 格	性 状
タイセゾリン 注射用1g	凍結乾燥 注射剤	1バイアル中 セファゾリン ナトリウムを 1g(力価)含有	白色～淡黄白色の 凍結乾燥品
タイセゾリン 注射用2g		1バイアル中 セファゾリン ナトリウムを 2g(力価)含有	

溶液及び溶解時の pH、浸透圧比、粘度、比重、安定な pH 域等

溶解液	濃 度	pH	浸透圧比 (日局生理食塩液に対する比)
注 射 用 水	1g(力価)/10mL	4.5～6.5	約 1
生 理 食 塩 液	1g(力価)/10mL	4.5～6.5	約 2
生 理 食 塩 液	2g(力価)/100mL	4.5～6.5	約 1
5w/v% ブドウ糖注射液	1g(力価)/10mL	4.5～6.5	約 2
0.5w/v% 塩酸リドカイン注射液	0.25g(力価)/2mL	4.5～6.5	約 1
0.5w/v% 塩酸リドカイン注射液	0.5g(力価)/2mL	4.5～6.5	約 2

酸価、ヨウ素価等

該当資料なし

注射剤の容器中の特殊な気体の有無及び種類
窒素

4 - 2 . 製剤の組成

有効成分（活性成分）の含量

タイセゾリン注射用 1g

1バイアル中 セファゾリンナトリウムを 1g(力価)含有

タイセゾリン注射用 2g

1バイアル中 セファゾリンナトリウムを 2g(力価)含有

添加物

なし

添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4 - 3 . 注射剤の調製法

静脈内注射

本品を注射用水、生理食塩液又はブドウ糖注射液に溶解する。

筋肉内注射

本品を塩酸リドカイン注射液（0.5w/v%）約 2～3mL に溶解する。

4 - 4 . 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当資料なし

4 - 5 . 製剤の各種条件下における安定性¹⁾

加速試験

タイセゾリン注射用 1g と 2g 製剤において、相対比較試験を行なった結果から、両製剤は同等と判断し、タイセゾリン注射用 2g につき加速試験を行った。

保存条件	包装形態	保存期間	測定項目	結果
40 ± 1	ガラスアンプル (無色透明)	0, 2, 4, 6 箇月	性状 浸透圧比 pH 溶状 定量	いずれの試験項目においても試験開始時と比較して6箇月後までほとんど変化を認めなかった。

4 - 6 . 溶解後の安定性²⁾

1) タイセゾリン注射用 1g/バイアルの溶解液中での安定性試験 (保存条件: 25)

溶解液	測定項目	溶解後の時間 (hr)			
		0	3	6	24
注射用水 [1g(力価)/20mL]	外 観	無色澄明	淡黄色澄明	淡黄色澄明	淡黄色澄明
	pH	4.95	4.80	5.19	5.60
	浸透圧比	0.60	0.61	0.62	0.62
5%ブドウ糖注射液 [1g(力価)/20mL]	外 観	無色澄明	淡黄色澄明	淡黄色澄明	淡黄色澄明
	pH	4.90	4.59	5.11	5.75
	浸透圧比	1.67	1.67	1.68	1.68
0.5%リドカイン 注射液 [1g(力価)/4mL]	外 観	淡黄色澄明	淡黄色澄明	淡黄色澄明	淡黄色澄明
	pH	5.32	5.53	5.60	5.87
	浸透圧比	3.27	3.22	-	3.28
	定量 ^{注1)} (%)	100	101.5	101.2	102.3

注 1) : 0 時間の定量値を 100 とした。

2) タイセゾリン注射用 1g の輸液中での安定性試験結果

溶解液	保存条件	測定項目	溶解後の時間 (hr)			
			0	3	6	24
1g(力価)/500mL 生理食塩液	5 遮光	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	5.24	5.39	5.38	5.41
		定量 ^{注2)} (%)	100	98.0	100.7	101.8
	25 室内 散乱光	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	5.23	5.46	5.57	5.71
		定量 ^{注2)} (%)	100	99.2	97.5	99.5
1g(力価)/500mL 注射用水	5 遮光	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	5.31	5.45	5.42	5.59
		定量 ^{注2)} (%)	100	86.3	99.0	101.1
	25 室内 散乱光	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	5.77	5.71	5.70	5.93
		定量 ^{注2)} (%)	100	99.9	99.5	97.5
1g(力価)/500mL 5%ブドウ糖注射液	5 遮光	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	5.02	5.27	5.19	5.10
		定量 ^{注2)} (%)	100	102.5	103.1	103.7
	25 室内 散乱光	外 観	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
		pH	5.04	5.19	5.47	5.57
		定量 ^{注2)} (%)	100	101.3	100.2	100.9

注 2) : 0 時間の定量値を 100 とした。

4 - 7 .他剤との配合変化 (物理化学的变化) ^{3) - 5)}

1) pH変動試験

試験材料 (含量)	規格 pH	試料 pH	(A)0.1N HCl (B)0.1N NaOH (mL)	最終pH または 変化点pH	移動 指数	変化 所見
タイセゾリン 注射用1g [1g(力価)/10mL]	4.5 ~ 6.5	5.16	(A) 0.37	4.43	0.73	白濁
			(B) 10	11.25	6.09	淡黄色澄明

2) タイセゾリン注射用 1g の各輸液中での配合変化 (保存条件: 室温、1000 lux 室内散乱光)

配合輸液			薬剤 使用量	外観 / pH / 含量 (%) ^{注 3)}			
販売名	成分名	容量		配合後の時間			
			配合直後	3 時間	6 時間	24 時間	
大塚 蒸留水	注射用水	500mL	1 g(力価) /1V	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				5.77	5.71	5.70	5.93
				100	99.9	99.5	97.5
大塚 生食注	生理食塩液	500mL	1 g(力価) /1V	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				5.23	5.46	5.57	5.71
				100	99.2	97.5	99.5
大塚 糖液 5%	5 %ブドウ 糖注射液	500mL	1 g(力価) /1V	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				5.04	5.19	5.47	5.57
				100	101.3	100.2	100.9
ソリタ - T 3号	維持液	500mL	1 g(力価) /1V	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				5.12	5.13	5.13	5.17
				100	99.5	99.9	100.6
ラクテッ ク注	乳酸 リンゲル液	500mL	1 g(力価) /1V	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				6.16	6.23	6.16	6.21
				100	100.3	100.1	101.4
ハイカリッ ク液 - 1号	高カロリー 輸液用 基本液	700mL	1 g(力価) /1V	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				4.45	4.46	4.48	4.47
				100	101.1	98.8	98.8
3%ES ポリタミン 注射液	高カロリー 輸液用 総合アミノ 酸製剤	500mL	1 g(力価) /1V	無色澄明	無色澄明	無色澄明	無色澄明
				5.70	5.69	5.70	5.71
				100	100.4	99.6	105.4

注 3) 配合直後の含量を 100 とした。

3) タイセゾリン注射用 1g の配合試験結果

配合製品	配合量	配合直後		結果	備考
		外観	pH		
インデラル注射液 2mg	2mL	淡黄色澄明	5.1		
シチコリン注射液 「タイヨー」25%	2mL	淡黄色澄明	6.2		
メクロフェノキサート 塩酸塩注射用 250mg 「タイヨー」	1V/10mL	微黄色澄明	4.9		8 時間後結晶析出 混濁
アリナミン F100 注	20mL	微黄色澄明	4.3		
ピタメジン静注用	1V/20mL 注射用剤	淡赤色澄明	4.6		4 時間後退色 (淡赤色 微赤色)
トラネキサム酸注射液 1000mg「タイヨー」	10mL	淡黄色澄明	6.3		
ピシバニール注射液 0.2KE	1A/2mL 添付溶解液	微黄色微濁	5.2		
5-FU 注 250 協和	5mL	淡黄色澄明	8.5		配合直後 pH8.5 24 時間後増色、 (微黄色 淡黄色) 残存力価低下
ジアゼパム注射液 10mg 「タイヨー」	2mL	淡黄色微濁		×	配合直後混濁
アデラビン 9 号	1mL	橙黄色澄明	5.5		
カシワドール静注	20mL	微黄色澄明	5.2		
ソル・コーテフ	2mL	淡黄色澄明	6.5		
グルタチオン注射用 200mg「タイヨー」	1A/3mL 注射用剤	微黄色澄明	5.2		
ノイロトロピン注射液 1.2 単位	1mL	淡黄色澄明	5.4		
ペラプリン注 10mg	2mL	微黄色澄明	5.0		

：室内散光下・室温 24 時間の観察で、外観、pH 及び残存力価に変化を認められなかった。
(4.0 < pH < 7.0、残存力価 90% のものを安定とした)。

：室内散光下・室温 24 時間の観察で、外観又は pH 変化 (pH7.0 以上となる) を認めた。

：室内散光下・室温 24 時間の観察で、配合直後 pH7.0 以上、外観変化及び残存力価の低下を認めた。

×：配合直後、外観にはなはだしい変化を認めた。

：用時調製

- 4 - 8 . 電解質の濃度
該当資料なし
- 4 - 9 . 混入する可能性のある夾雑物
該当資料なし
- 4 - 10 . 生物学的試験法
該当資料なし
- 4 - 11 . 製剤中の有効成分の確認試験法
(1)紫外可視吸光度測定法
(2)ナトリウム塩の定性反応(1)
- 4 - 12 . 製剤中の有効成分の定量法
液体クロマトグラフィー
- 4 - 13 . 力価
セファゾリン ($C_{14}H_{14}N_8O_4S_3$: 454.51) としての量を質量(力価)で示す。
- 4 - 14 . 容器の材質
本体 : 無色透明のガラスバイアル
キャップ : ブチルゴム、ポリプロピレン、アルミ
- 4 - 15 . その他
特になし

5 . 治療に関する項目

5 - 1 . 効能又は効果

< 適応菌種 >

セファゾリンに感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、大腸菌、肺炎桿菌、プロテウス・ミラビリス、プロビデンシア属

< 適応症 >

敗血症、感染性心内膜炎、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、びらん・潰瘍の二次感染、乳腺炎、骨髄炎、関節炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、膿胸、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎盂腎炎、腹膜炎、胆嚢炎、胆管炎、バルトリン腺炎、子宮内感染、子宮付属器炎、子宮旁結合織炎、眼内炎（全眼球炎を含む）、中耳炎、副鼻腔炎、化膿性唾液腺炎

5 - 2 . 用法及び用量

セファゾリンとして、通常、1日量成人には1g（力価）、小児には体重kg当り20～40mg（力価）を2回に分けて緩徐に静脈内へ注射するが、筋肉内へ注射することもできる。

症状及び感染菌の感受性から効果不十分と判断される場合には、1日量成人1.5～3g（力価）を、小児には体重kg当り50mg（力価）を3回に分割投与する。

症状が特に重篤な場合には、1日量成人5g（力価）、小児には体重kg当り100mg（力価）までを分割投与することができる。

また、輸液に加え、静脈内に点滴注入することもできる。

注射液の調製法

静脈内注射

本品を注射用水、生理食塩液又はブドウ糖注射液に溶解する。

筋肉内注射

本品を塩酸リドカイン注射液（0.5w/v%）約2～3mLに溶解する。

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。
- 2) 高度の腎障害のある患者では、血中濃度が持続するので、腎障害の程度に応じて投与量を減量し、投与の間隔をあけて使用すること。

5 - 3 . 臨床成績

臨床効果

該当資料なし

臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

検証的試験

1)無作為化平行用量反応試験

該当資料なし

2)比較試験

該当資料なし

3)安全性試験

該当資料なし

4)患者・病態別試験

該当資料なし

治療的使用

1)使用成績調査・特定使用成績調査・製造販売後臨床試験

該当しない

2)承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

該当しない

6 . 薬効薬理に関する項目

6 - 1 . 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 セフェム系（第一世代）抗生物質

6 - 2 . 薬理作用

作用部位・作用機序⁶⁾

セファゾリンナトリウムは、グラム陽性菌及び大腸菌、肺炎桿菌、プロテウス・ミラピリスなどのグラム陰性菌に強く作用する。作用機序は細菌細胞壁の合成阻害で、作用は殺菌的である。ペニシリナーゼに対してはかなり安定であるが、グラム陰性桿菌の産生するセファロスポリナーゼによってセファロリジン、セファロチンと同様に不活化される。ペニシリン結合たん白（PBP）に強い結合親和性を持つ。

薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

7 . 薬物動態に関する項目

7 - 1 . 血中濃度の推移・測定法

治療上有効な血中濃度

該当資料なし

最高血中濃度到達時間⁷⁾

血中濃度(参考)

タイセゾリン注射用 1g [セファゾリンナトリウムとして 1g(力価)] をセファゾリンナトリウムとして 50mg(力価)/kg イヌに筋肉内投与したとき、投与後約 0.5 時間で最高血中濃度に達し、消失半減期は約 1.95 時間であった。

通常用量での血中濃度

該当資料なし

中毒症状を発現する血中濃度

該当資料なし

7 - 2 . 薬物速度論的パラメータ

吸収速度定数

該当資料なし

バイオアベイラビリティ

該当資料なし

消失速度定数

該当資料なし

クリアランス

該当資料なし

分布容積

該当資料なし

血漿蛋白結合率

該当資料なし

7 - 3 . 吸収

該当資料なし

7 - 4 . 分布

血液 - 脳関門通過性

該当資料なし

胎児への移行性

該当資料なし

乳汁中への移行性

該当資料なし

髄液への移行性

該当資料なし

その他の組織への移行性

該当資料なし

7 - 5 . 代謝

代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種

該当資料なし

初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

7 - 6 . 排泄

排泄部位

該当資料なし

排泄率

該当資料なし

排泄速度

該当資料なし

7 - 7 . 透析等による除去率

腹膜透析

該当資料なし

血液透析

該当資料なし

直接血液灌流

該当資料なし

8 . 安全性（使用上の注意等）に関する項目

8 - 1 . 警告内容とその理由

該当記載事項なし

8 - 2 . 禁忌内容とその理由

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】
本剤の成分によるショック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）】
本剤の成分又はセフェム系抗生物質に対し、過敏症の既往歴のある患者

8 - 3 . 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

該当記載事項なし

8 - 4 . 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

「5 . 治療に関する項目」を参照すること

8 - 5 . 慎重投与内容とその理由

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しやすいつ体制を有する患者
(3)高度の腎障害のある患者(<用法・用量に関連する使用上の注意>の項参照)
(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）

8 - 6 . 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

本剤によるショック、アナフィラキシー様症状の発生を確実に予知できる方法がないので、次の措置をとること。
(1)事前に既往歴等について十分な問診を行うこと。なお、抗生物質等によるアレルギー歴は必ず確認すること。
(2)投与に際しては、必ずショック等に対する救急処置のとれる準備をしておくこと。
(3)投与開始から投与終了後まで、患者を安静の状態に保たせ、十分な観察を行うこと。特に、投与開始直後は注意深く観察すること。

8 - 7 . 相互作用

併用禁忌とその理由

該当記載事項なし

併用注意とその理由（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
ワルファリンカリウム	ワルファリンカリウムの作用が増強されるおそれがある。ただし、本剤に関する症例報告はない。	腸内細菌によるビタミンKの産生を抑制することがある。
利尿剤 フロセミド等	腎障害が増強されるおそれがある。	機序は明らかではないが、ラット、ウサギにおいて、腎障害が増強されるとの報告がある。

8 - 8 . 副作用

副作用の概要

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）と初期症状

- (1) ショック ショックを起こすことがあるので、観察を十分に行い、不快感、口内異常感、喘鳴、眩暈、便意、耳鳴、発汗等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) アナフィラキシー様症状 アナフィラキシー様症状（呼吸困難、全身潮紅、血管浮腫、蕁麻疹等）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。
- (3) 血液障害 汎血球減少、無顆粒球症（初期症状：発熱、咽頭痛、頭痛、倦怠感等）、溶血性貧血（初期症状：発熱、ヘモグロビン尿、貧血症状等）、血小板減少（初期症状：点状出血、紫斑等）があらわれることがあるので、定期的な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。
- (4) 肝障害 黄疸、AST（GOT）、ALT（GPT）、AI-Pの上昇等があらわれることがあるので、定期的な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。
- (5) 腎障害 急性腎不全等の重篤な腎障害があらわれることがあるので、定期的な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。
- (6) 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し、適切な処置を行うこと。
- (7) 皮膚障害 皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）、中毒性表皮壊死症（Lyell 症候群）があらわれることがあるので、観察を十分に行い、発熱、頭痛、関節痛、皮膚や粘膜の紅斑・水疱、皮膚の緊張感・灼熱感・疼痛等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。
- (8) 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。
- (9) 痙攣 腎不全の患者に大量投与すると、痙攣等の神経症状を起こすことがある。

2)その他の副作用

	頻 度 不 明
過敏症 ^{注)}	発疹、蕁麻疹、紅斑、痒痒、発熱、浮腫
血液	顆粒球減少、好酸球増多
腎臓	BUN上昇、血清クレアチニン上昇
消化器	悪心、嘔吐、食欲不振、下痢
菌交代症	口内炎、カンジダ症
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、全身倦怠感

注)発現した場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

薬物アレルギーに対する注意及び試験法

8 - 2【禁忌】、【原則禁忌】、8 - 5(1)(2)、8 - 6、8 - 8 1)(1)(2)及び 2)「過敏症」の項参照

8 - 9 . 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。

8 - 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1)妊婦等：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)授乳婦：授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。[母乳中へ移行することが報告されている]

8 - 11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。なお、低出生体重児、新生児では乳児、幼児等に比べて血清中濃度半減期が延長するとの報告がある。

8 - 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

- (1)テストテープ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。

8 - 13. 過量投与
該当記載事項なし

8 - 14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

- (1) 静脈内投与時：静脈内大量投与により、血管痛、血栓性静脈炎を起こすことがあるので、これを予防するために注射液の調製、注射部位、注射方法等について十分注意し、その注射速度はできるだけ遅くすること。
- (2) 筋肉内投与時（静脈内注射が困難な場合にのみ使用すること）：筋肉内注射にあたっては、下記の点に注意すること。
- 1) 筋肉内投与はやむを得ない場合にのみ、必要最小限に行うこと。同一部位への反復注射は行わないこと。特に低出生体重児、新生児、乳児、小児には注意すること。
 - 2) 神経走行部位を避けること。
 - 3) 注射針を刺入したとき、激痛を訴えたり、血液の逆流をみた場合は直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。
 - 4) 筋注用に溶解した溶液は静脈内への注射は絶対に避けること。
 - 5) 注射部位に疼痛、硬結をみることがある。
- (3) 調製方法：温度による溶解度の差（下表）により、澄明に溶解しない場合があるが、この場合は液量を増やすか温湯であたため澄明な溶液としてから使用すること。また、溶解後はしゃ光して室温又は冷蔵庫保存で 48 時間以内に使用すること。

本品 1g（力価）の溶解に必要な溶解液量

（単位：mL）

溶解液 \ 温度	10°C	15°C	20°C	25°C
注射用水	4.0	3.5	3.0	2.5
生理食塩液	5.0	4.0	3.5	3.0
0.5w/v%リドカイン注射液	—	—	3.0	2.5

- (4) 調製時：メシル酸ガベキサート、メシル酸ナファモスタット、シメチジン、ファモチジン、アミノ糖系抗生物質と混合すると混濁することがある。

8 - 15. その他の注意
該当記載事項なし

8 - 16. その他
該当記載事項なし

9 . 非臨床試験に関する項目

9 - 1 . 一般薬理

該当資料なし

9 - 2 . 毒性

単回投与毒性試験

該当資料なし

反復投与毒性試験

該当資料なし

生殖発生毒性試験

該当資料なし

その他の特殊毒性

該当資料なし

10. 取扱い上の注意等に関する項目

10-1. 有効期間又は使用期限

有効期間：2年

10-2. 貯法・保存条件

室温保存

本剤は光によって徐々に着色することがあるので、開封後の保存には注意すること。

10-3. 薬剤取扱い上の注意点

規制区分：指定医薬品、処方せん医薬品

(注意 - 医師等の処方せんにより使用すること)

取扱い上の注意：

安定性試験結果の概要¹⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、6ヵ月)の結果、タイセゾリン注射用1g及びタイセゾリン注射用2gは通常の市場流通下において安定であることが推測された。

10-4. 承認条件

該当しない

10-5. 包装

タイセゾリン注射用1g [1バイアル中1g(力価)]

10バイアル

タイセゾリン注射用2g [1バイアル中2g(力価)]

10バイアル

タイセゾリン皮内反応用 [1アンプル中300µg(力価)、溶解液・対照液付]

10セット

10-6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：セファメジン 注射用(アステラス)

同効薬：セファロsporin系抗生物質

10-7. 国際誕生年月日

該当しない

10-8. 製造販売承認年月日及び承認番号

	タイセゾリン注射用1g	タイセゾリン注射用2g
製造販売承認年月日	2006年8月4日	
承認番号	21800AMX10701000	21800AMX10702000

10-9. 薬価基準収載年月日

2006年12月8日

10-10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

- 10 - 11. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容
薬効再評価結果公示日 2004年9月30日
- 10 - 12. 再審査期間
該当しない
- 10 - 13. 長期投与の可否
該当しない
- 10 - 14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード
タイセゾリン注射用 1g 6132401D3153
タイセゾリン注射用 2g 6132401D4150
- 10 - 15. 保険給付上の注意
特になし

11. 文献

11 - 1. 引用文献

- 1) 大洋薬品工業（株）社内資料（安定性試験）
- 2) 大洋薬品工業（株）社内資料（安定性試験）
- 3) 大洋薬品工業（株）社内資料（pH変動試験）
- 4) 大洋薬品工業（株）社内資料（配合変化試験）
- 5) 大洋薬品工業（株）社内資料（配合変化試験）
- 6) 第十五改正日本薬局方解説書
- 7) 大洋薬品工業（株）社内資料（薬物動態試験）

11 - 2. その他の参考文献

特になし

12. 参考資料

- 12 - 1. 主な外国での発売状況
該当しない

13. 備考

- 13 - 1. その他の関連資料
特になし

<文献請求先>

大洋薬品工業株式会社 タイヨーDIセンター
〒453 0801 名古屋市中村区太閤一丁目24番11号
TEL 0120 080 601 FAX (052) 459 2853