

- (5) クラミジア・トラコマティスによる尿道炎, 子宮頸管炎に対する本剤 1,000 mg (力価) 1 回投与の有効率 (PCR 法による陰性化率) は主判定時期である投与開始 15 日目では 86.7% (98/113) であった。また, 副判定時期である投与開始 29 日目では 90.7% (98/108 ※) であった³³⁾。
 ※: 29 日目の解析から除外した 5 症例は, 投与開始 15 日目以降に併発疾患を発現した 1 例, 抗菌薬を併用した 1 例及び投与開始 15 日目で観察を終了した 3 例であった。

アジスロマイシン注射剤から経口剤への切り替え(スイッチ療法)した場合の成績

無作為化比較試験(呼吸器感染症(肺炎))を含む国内臨床試験³⁴⁾73 例及び外国臨床試験³⁵⁾137 例の成績は以下のとおりである。なお, 臨床試験では, アジスロマイシン注射剤 500 mg を 1 日 1 回, 2~5 日間点滴静注した後, アジスロマイシン 250 mg 錠又はカプセルを 500 mg (力価) 1 日 1 回経口投与した。注射剤と経口剤の総投与期間は合計 7~10 日間とした。注射剤から経口剤への切り替えは, 被験者の状態で医師が判断した。国内臨床試験: 呼吸器感染症(肺炎)に対する非対照試験において, 投与開始 15 日目の有効率は 84.5% (60/71) であった。本試験で原因菌として分離同定された肺炎球菌はすべてアジスロマイシンに対する感受性は低かったが (MIC ≥ 2 µg/mL), 11 例のうち 10 例が有効例であった。
肺炎球菌のアジスロマイシン感受性別, MIC 別の臨床効果 (投与開始 15 日目)

	n/N ^{a)} 有効率 (%)
感受性別:	
耐性 (MIC ≥ 2 µg/mL)	10/11 (90.9)
MIC 不明	2/3 (66.7)
MIC 別:	
MIC = 4 µg/mL	1/1 (100)
MIC = 8 µg/mL	0/1 (0)
MIC = 16 µg/mL	3/3 (100)
MIC > 64 µg/mL	6/6 (100)

a) n=有効の例数, N=評価例数から判定不能を除いた例数
 有効率は n/N × 100 から算出した。

外国臨床試験: 呼吸器感染症(肺炎)に対する無作為化比較試験において, 投与終了 10~14 日目における有効率は 77.4% (106/137) であった。

【薬効薬理】

1. 抗菌作用

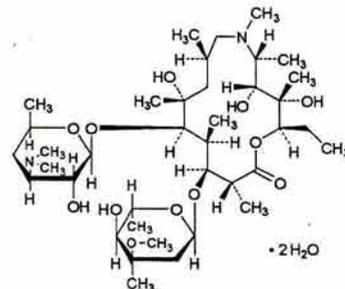
- (1) *In vitro* において, ブドウ球菌属, レンサ球菌属等のグラム陽性菌, モラクセラ(プランハメラ)・カタラリス, インフルエンザ菌等の一部グラム陰性菌, レジオネラ・ニューモフィラ, ペプトストレプトコッカス属, マイコプラズマ属, クラミジア属に抗菌作用を示し, その作用は他のマクロライド系抗生物質と同程度であった^{36~40, 44)}。
- (2) 黄色ブドウ球菌, 肺炎球菌, インフルエンザ菌等の各種細菌を用いた感染症モデルにおいて, 本剤の良好な組織移行性を反映し, 従来のマクロライド系抗生物質よりも強い防御効果及び治療効果を示した^{39~43)}。
- (3) 黄色ブドウ球菌及びインフルエンザ菌に対して, 1MIC 以上の薬剤濃度で殺菌的な作用を示した³⁶⁾。

2. 作用機序

細菌の 70S リボソームの 50S サブユニットと結合し, 蛋白合成を阻害する⁴⁵⁾。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名: アジスロマイシン水和物 (Azithromycin Hydrate)
 化学名: (2R,3S,4S,5R,6R,8R,11R,12R,13S,14R)-5-(3,4,6-
 Trideoxy-3-dimethylamino-β-D-xylo-hexopyranosyloxy)-
 3-(2,6-dideoxy-3-C-methyl-3-O-methyl-α-L-ribo-
 hexopyranosyloxy)-10-aza-6,12,13-trihydroxy-
 2,4,6,8,10,11,13-heptamethylhexadecan-14-olide dihydrate
 略号: AZM
 分子式: C₃₈H₇₂N₂O₁₂ · 2H₂O
 分子量: 785.02
 構造式:



力価: アジスロマイシン水和物の力価は, アジスロマイシン (C₃₈H₇₂N₂O₁₂: 748.98) としての量を質量 (力価) で示す。
 性状: アジスロマイシン水和物は, 白色の結晶性の粉末である。メタノール又はエタノール (99.5) に溶けやすく, 水にほとんど溶けない。

【包装】

250mg 錠: 60 錠, 300 錠 (PTP)
 60 錠, 300 錠 (患者さん用パッケージ入り PTP)

【主要文献】

- 1) Foulds, G. et al. : J Clin Pharmacol 31(2) : 164, 1991 [L19981029016]
- 2) Woldtvedt, B. R. et al. : Ann Pharmacother 32(2) : 269, 1998 [L19980924044]
- 3) Lane, G. : Ann Pharmacother 30(7/8) : 884, 1996 [L19980925042]
- 4) 社内資料: シクロスポリンとの薬物相互作用 [L20000216021]
- 5) Amsden, G. W. et al. : J Clin Pharmacol 40(12-2) : 1522, 2000 [L20001215065]
- 6) Gomes, T. et al. : Clin Pharmacol Ther 86(4) : 383, 2009 [L20090928014]
- 7) 武藤 秀弥ほか: 日本化学療法学会雑誌 43(Suppl. 6) : 110, 1995 [L19990308111]
- 8) 社内資料: ラット受胎能及び一般生殖能試験 [L20000216038]
- 9) 社内資料: ラット経口 1 カ月毒性試験 [L20000216030]
- 10) 社内資料: イヌ経口 1 カ月毒性試験 [L20000216031]
- 11) 社内資料: ラット経口 6 カ月毒性試験 [L20000216034]
- 12) 社内資料: イヌ経口 6 カ月毒性試験 [L20000216035]
- 13) 社内資料: イヌ経口 6 カ月毒性試験及び回復性試験 [L20000216036]
- 14) 社内資料: イヌ経口 6 カ月毒性試験 (間欠投与) 及び回復性試験 [L20000216037]
- 15) Foulds, G. et al. : J Antimicrob Chemother 25(Suppl. A) : 73, 1990 [L19981006040]
- 16) Luke, D. R. et al. : Antimicrob Agents Chemother 40(11) : 2577, 1996 [L19970513016]
- 17) Gladue, R. P. et al. : Antimicrob Agents Chemother 33(3) : 277, 1989 [L19980911010]
- 18) 横山 秀一ほか: 日本化学療法学会雑誌 43(Suppl. 6) : 122, 1995 [L19990308147]

- 19) 丁 宗鉄ほか：日本化学療法学会雑誌 43(Suppl. 6) : 139, 1995 [L19981023009]
- 20) 丁 宗鉄ほか：日本化学療法学会雑誌 43(Suppl. 6) : 177, 1995 [L19990308145]
- 21) 社内資料：ヒトにおける尿および胆汁中代謝物の検討 [L20000216018]
- 22) Mazzei, T. et al. : J Antimicrob Chemother 31(Suppl. E) : 57, 1993 [L19980922044]
- 23) 柴 孝也ほか：日本化学療法学会雑誌 43(Suppl. 6) : 186, 1995 [L19990308144]
- 24) Hoffer, D. et al. : Infection 23(6) : 356, 1995 [L19981012081]
- 25) 社内資料：皮膚科領域感染症に対する用量設定試験 [L20000216002]
- 26) 社内資料：皮膚科領域感染症に対する二重盲検比較試験 [L20000216005]
- 27) 社内資料：レンサ球菌性咽頭炎を対象とした二重盲検比較試験 [L20000216007]
- 28) 社内資料：後期第Ⅱ相試験 肺炎に対する用量設定試験 [L20000216001]
- 29) 社内資料：肺炎に対する二重盲検比較試験 [L20000216003]
- 30) 社内資料：慢性気道感染症に対する二重盲検比較試験 [L20000216004]
- 31) 社内資料：急性副鼻腔炎を対象としたオープン比較試験 [L20000216008]
- 32) 社内資料：菌科・口腔外科領域感染症に対する二重盲検比較試験 [L20000216006]
- 33) 社内資料：クラミジア・トラコマティスによる性感染症に対する国内第Ⅲ相二重盲検比較試験 [L20040423003]
- 34) 社内資料：市中肺炎に対する注射剤から経口剤への切り替え療法の非対照試験
- 35) 社内資料：市中肺炎に対する注射剤から経口剤への切り替え療法の比較試験
- 36) 松永 敏幸ほか：日本化学療法学会雑誌 43(Suppl. 6) : 95, 1995 [L19990308148]
- 37) 栗原 京子ほか：日本化学療法学会雑誌 43(Suppl. 6) : 24, 1995 [L19990308154]
- 38) 加藤 直樹ほか：日本化学療法学会雑誌 43(Suppl. 6) : 31, 1995 [L19990308153]
- 39) Ishida, K. et al. : Antimicrob Agents Chemother 38(4) : 790, 1994 [L19981019036]
- 40) Niki, Y. et al. : Antimicrob Agents Chemother 38(10) : 2296, 1994 [L19980916012]
- 41) 松永 敏幸ほか：日本化学療法学会雑誌 43(Suppl. 6) : 68, 1995 [L19990122001]
- 42) 西野 武志ほか：日本化学療法学会雑誌 43(Suppl. 6) : 40, 1995 [L19990308152]
- 43) 長島 正人ほか：日本化学療法学会雑誌 43(Suppl. 6) : 8, 1995 [L19981005042]
- 44) Choi, GE et al. : Korean J Lab Med 30:28, 2010
- 45) Retsema, J. et al. : Antimicrob Agents Chemother 31(12) : 1939, 1987 [L19981005010]

ファイザー株式会社
東京都渋谷区代々木 3-22-7

【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

「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。
ファイザー株式会社 製品情報センター
〒151-8589 東京都渋谷区代々木 3-22-7
学術情報ダイヤル 0120-664-467
FAX 03-3379-3053

【製造販売】

PFIZER CONFIDENTIAL