

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

15員環マクロライド系抗生物質製剤

アジスロマイシン錠
アジスロマイシン錠 250mg「トワ」
アジスロマイシン錠 500mg「トワ」
AZITHROMYCIN TABLETS 250mg “TOWA” / TABLETS 500mg
“TOWA”

アジスロマイシン水和物散
アジスロマイシン細粒小児用 10%「トワ」
AZITHROMYCIN FINE GRANULES FOR PEDIATRIC 10% “TOWA”

販売名	アジスロマイシン錠 250mg 「トワ」	アジスロマイシン錠 500mg 「トワ」	アジスロマイシン細粒 小児用 10%「トワ」
剤形	フィルムコーティング錠		細粒剤
製剤の規制区分	処方箋医薬品 ^注 注) 注意－医師等の処方箋により使用すること		
規格・含量	1錠中 日局 アジスロマイ シン水和物 262.0mg 含有 (アジスロマイシンとして 250mg(力価))	1錠中 日局 アジスロマイ シン水和物 524.0mg 含有 (アジスロマイシンとして 500mg(力価))	1g 中 日局 アジスロマイ シン水和物 104.8mg 含有 (アジスロマイシンとして 100mg(力価))
一般名	和名：アジスロマイシン水和物 (JAN) 洋名：Azithromycin Hydrate (JAN)		
製造販売承認年月日	2013年8月15日		2015年2月16日
薬価基準収載年月日	2013年12月13日		2015年6月19日
販売開始年月日	2013年12月13日		2015年6月19日
製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：東和薬品株式会社		
医薬情報担当者の 連絡先			
問い合わせ窓口	東和薬品株式会社 学術部 DIセンター TEL 0120-108-932 FAX 06-7177-7379 https://med.towayakuhin.co.jp/medical/		

本IFは2024年9月改訂の電子添文の記載に基づき作成した。

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。

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、IF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IFの位置付け、IF記載様式、IF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IF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IF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IFが速やかに提供されることとなった。最新版のIF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IF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IF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、IF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. IFとは

IF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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF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IF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IF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。

IF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. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDA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IFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF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、IF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、IF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、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDA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

IF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。IF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IF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、IF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。

(2020年4月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	9. 透析等による除去率	28
1. 開発の経緯	1	10. 特定の背景を有する患者	28
2. 製品の治療学的特性	1	11. その他	28
3. 製品の製剤学的特性	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	29
4. 適正使用に関して周知すべき特性	2	1. 警告内容とその理由	29
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	2. 禁忌内容とその理由	29
6. RMP の概要	2	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	29
II. 名称に関する項目	3	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	29
1. 販売名	3	5. 重要な基本的注意とその理由	29
2. 一般名	3	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	30
3. 構造式又は示性式	3	7. 相互作用	31
4. 分子式及び分子量	3	8. 副作用	31
5. 化学名（命名法）又は本質	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	34
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	10. 過量投与	35
III. 有効成分に関する項目	4	11. 適用上の注意	35
1. 物理化学的性質	4	12. その他の注意	35
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	IX. 非臨床試験に関する項目	36
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	1. 薬理試験	36
IV. 製剤に関する項目	5	2. 毒性試験	36
1. 剤形	5	X. 管理的事項に関する項目	37
2. 製剤の組成	6	1. 規制区分	37
3. 添付溶解液の組成及び容量	6	2. 有効期間	37
4. 力価	6	3. 包装状態での貯法	37
5. 混入する可能性のある夾雑物	6	4. 取扱い上の注意	37
6. 製剤の各種条件下における安定性	7	5. 患者向け資材	37
7. 調製法及び溶解後の安定性	9	6. 同一成分・同効薬	37
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	10	7. 国際誕生年月日	37
9. 溶出性	10	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	37
10. 容器・包装	16	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	37
11. 別途提供される資材類	16	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	37
12. その他	16	11. 再審査期間	38
V. 治療に関する項目	17	12. 投薬期間制限に関する情報	38
1. 効能又は効果	17	13. 各種コード	38
2. 効能又は効果に関連する注意	17	14. 保険給付上の注意	38
3. 用法及び用量	18	XI. 文献	39
4. 用法及び用量に関連する注意	18	1. 引用文献	39
5. 臨床成績	19	2. その他の参考文献	41
VI. 薬効薬理に関する項目	22	XII. 参考資料	41
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	22	1. 主な外国での発売状況	41
2. 薬理作用	22	2. 海外における臨床支援情報	41
VII. 薬物動態に関する項目	23	XIII. 備考	42
1. 血中濃度の推移	23	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	42
2. 薬物速度論的パラメータ	26	2. その他の関連資料	43
3. 母集団（ポピュレーション）解析	26		
4. 吸収	26		
5. 分布	26		
6. 代謝	27		
7. 排泄	27		
8. トランスポーターに関する情報	27		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

アジスロマイシン水和物は 15 員環マクロライド系抗生物質であり、本邦では 2000 年から製造販売されている。

東和薬品株式会社が後発医薬品として、アジスロマイシン錠 250mg/500mg「トーワ」の開発を企画し、薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2013 年 8 月に承認を取得、2013 年 12 月に発売した。

また、アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」の開発を企画し、薬食発第 0331015 号(平成 17 年 3 月 31 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2015 年 2 月に承認を取得、2015 年 6 月に発売した。

2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤 は、アジスロマイシン水和物を有効成分とする 15 員環マクロライド系抗生物質製剤であり、1 日 1 回 3 日間投与*でアジスロマイシン感性菌による各種感染症に対する効能又は効果を有する。（「V. 1. 効能又は効果」及び「V. 3. 用法及び用量」の項参照）
- (2) 重大な副作用としてショック、アナフィラキシー、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）、急性汎発性発疹性膿疱症、薬剤性過敏症候群、肝炎、肝機能障害、黄疸、肝不全、急性腎障害、偽膜性大腸炎、出血性大腸炎、間質性肺炎、好酸球性肺炎、QT 延長、心室性頻脈（Torsade de pointes を含む）、白血球減少、顆粒球減少、血小板減少、横紋筋融解症が報告されている。（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

*本剤の投与期間は 3 日間とする。また、4 日目以降においても臨床症状が不変もしくは悪化の場合には医師の判断で適切な他の薬剤に変更する。成人の場合、尿道炎、子宮頸管炎に対しては 1 回投与とし、投与後 2~4 週間は経過を観察し、効果が認められない場合には医師の判断で適切な他の薬剤に変更する。（「V. 4. 用法及び用量に関連する注意」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

アジスロマイシン錠 250mg/500mg「トーワ」

- ・500mg 錠を規格追加
- ・患者さん用パッケージ（PTP シート）には、3 日間の服用方法の説明や服用開始日の記入欄を表示

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」

- ・有効成分を胃溶性ポリマーでコーティングし、苦みをマスキングしたストロベリー風味の細粒（「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照）

共通

- ・ PTP シート又は分包に薬効 [抗生物質] を表示
- ・ PTP シート (裏面) 又は分包に GS1 コードを表示。専用アプリ「添文ナビ」で読み取ること
で、最新の電子添文等を参照可能

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

アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」
アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」
アジスロマイシン細粒小児用 10% 「トーワ」

(2) 洋 名

AZITHROMYCIN TABLETS 250mg “TOWA”
AZITHROMYCIN TABLETS 500mg “TOWA”
AZITHROMYCIN FINE GRANULES FOR PEDIATRIC 10% “TOWA”

(3) 名称の由来

一般名＋剤形＋規格（含量）＋「屋号」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」（平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号）に基づく〕

2. 一般名

(1) 和 名（命名法）

アジスロマイシン水和物（JAN）

(2) 洋 名（命名法）

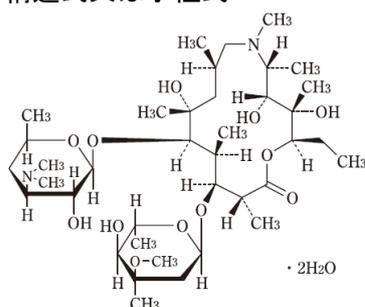
Azithromycin Hydrate（JAN）

Azithromycin（INN）

(3) ステム

Streptomyces 属の微生物が産生する抗生物質：-mycin

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₃₈H₇₂N₂O₁₂ · 2H₂O

分子量：785.02

5. 化学名（命名法）又は本質

(2*R*,3*S*,4*S*,5*R*,6*R*,8*R*,11*R*,12*R*,13*S*,14*R*)-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 (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：AZM

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

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。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(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

該当資料なし

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

日局「アジスロマイシン水和物」の確認試験による

定量法

日局「アジスロマイシン水和物」の定量法による

IV. 製剤に関する項目

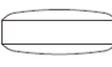
1. 剤形

(1) 剤形の区別

アジスロマイシン錠 250mg/500mg 「トーワ」：フィルムコーティング錠

アジスロマイシン細粒小児用 10% 「トーワ」：細粒剤

(2) 製剤の外観及び性状

販売名		アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」	アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」
性状・剤形		白色のフィルムコーティング錠	
外形	表		
	裏		
	側面		
直径 (mm)		12.6/6.4 (長径/短径)	15.7/7.9 (長径/短径)
厚さ (mm)		4.9	6.4
質量 (mg)		298	592

販売名	アジスロマイシン細粒小児用 10% 「トーワ」
性状・剤形	白色～淡いだいだい色の細粒である。また、1包 1g の分包品もある。

ストロベリー風味の製剤である。

(3) 識別コード

販売名	アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」	アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」
識別コード	Tw718	Tw719
記載場所	錠剤、PTP シート、個装箱	

(4) 製剤の物性

販売名	アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」	アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」
硬度	176N	254N

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

販売名	アジスロマイシン錠 250mg「トーワ」	アジスロマイシン錠 500mg「トーワ」
1錠中の有効成分	日局 アジスロマイシン水和物 ……………262.0mg (アジスロマイシンとして 250mg(力価))	日局 アジスロマイシン水和物 ……………524.0mg (アジスロマイシンとして 500mg(力価))
添加剤	結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク	

販売名	アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」	
1g 中の有効成分	日局 アジスロマイシン水和物…104.8mg (アジスロマイシンとして 100mg(力価))	
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、沈降炭酸カルシウム、白糖、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、アミノアルキルメタクリレートコポリマーE、タルク、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、酸化チタン、軽質無水ケイ酸、サッカリンナトリウム水和物、アスパルテーム (L-フェニルアラニン化合物)、香料	

(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

アジスロマイシン水和物の力価は、アジスロマイシン(C₃₈H₇₂N₂O₁₂)としての量を質量(力価)で示す。

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

アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」

(1) 加速試験⁶⁸⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	白色のフィルム コーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	99.4~102.7	98.1~105.4
含量(%)	98.0~99.4	97.4~100.2

(2) 長期保存試験⁶⁹⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：25℃、60%RH、3ロット*(n=1)

試験項目	開始時	5 年 6 箇月
性状	白色のフィルム コーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
溶出率(%)	99~102	97~102
含量(%)	98~99	97~101

*：確認試験（開始時）のみ 2 ロットで実施

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」は通常の市場流通下において 5 年間安定であることが確認された。

(3) 無包装状態における安定性⁷⁰⁾

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (60 万 lx・hr)
外観	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
含量	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
硬度	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出性	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし

注) 「(社)日本病院薬剤師会：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)、平成 11 年 8 月 20 日」に準じて試験を実施した。

アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」

(1) 加速試験⁷¹⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3*)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	白色のフィルム コーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	98.2~102.1	99.8~102.9
含量(%)	98.6~100.2	98.4~101.0

*：純度試験のみ n=1 で実施

(2) 長期保存試験⁷²⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：25℃、60%RH、3 ロット*(n=1)

試験項目	開始時	5 年 6 箇月
性状	白色のフィルム コーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
溶出率(%)	93~102	96~101
含量(%)	98~100	96~100

*：確認試験（開始時）のみ 2 ロットで実施

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」は通常の市場流通下において 5 年間安定であることが確認された。

(3) 無包装状態における安定性⁷³⁾

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (60 万 lx・hr)
外観	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
含量	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
硬度	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出性	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし

注)「(社)日本病院薬剤師会：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)、平成 11 年 8 月 20 日」に準じて試験を実施した。

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」

(1) 加速試験⁷⁴⁾

包装形態：アルミ分包した製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	淡いだいたい色の細粒であった。(ごくわずかに白色の粒を認めた。)また、分包品であった。	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	83.8~101.8	88.0~100.6
粒度	規格内	同左
含量(%)	99.8~104.1	101.1~103.5

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品(乾燥剤入り)

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	淡いだいたい色の細粒であった。(ごくわずかに白色の粒を認めた。)	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
溶出率(%)	83.8~101.8	85.8~98.6
粒度	規格内	同左
含量(%)	99.8~104.1	97.2~100.7

最終包装製品を用いた加速試験の結果、アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

(2) 無包装状態における安定性⁷⁵⁾

試験項目	開始時	温度 (40℃、3 箇月)	湿度 (25℃、75%RH、3 箇月)	光 (60 万 lx・hr)
外観	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
含量	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出性	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし

注)「(社)日本病院薬剤師会：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)、平成 11 年 8 月 20 日」に準じて試験を実施した。

7. 調製法及び溶解後の安定性

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」

「Ⅷ. 11. 適用上の注意」の項参照

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

服薬補助ゼリーとの配合変化⁷⁶⁾

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」

■方法

(1)配合方法

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」(2000mg) と服薬補助ゼリー（大さじ 1（およそ 15mL））を配合した。

(2)保存条件

条件：成り行き温湿度、室内散光下

保存形態：無色ガラス瓶（密栓）

■結果

服薬補助ゼリー (メーカー名)	測定項目	配合前	配合直後	3 時間後
らくらく服薬 ゼリー (龍角散)	外観	試験製剤： 淡いだいだい色の細粒であ った	淡いだいだい色のゼリーに 淡いだいだい色の粉剤が混 在していた	同左
	におい	試験製剤： 甘い芳香があった	レモン様のおいに甘い芳 香が混ざっていた	同左
	pH	—	7.16	7.54
	含量 (%)	試験製剤：101.1	101.0	99.9
おくすり 飲めたね いちご味 (龍角散)	外観	試験製剤： 淡いだいだい色の細粒であ った	赤白色のゼリーと赤色のゼ リーに淡いだいだい色の粉 剤が混在していた	薄い黄緑色のゼリーとごく 淡いだいだい色の粉剤が混 在していた
	におい	試験製剤： 甘い芳香があった	イチゴ様のおいであつた	同左
	pH	—	7.68	7.87
	含量 (%)	試験製剤：101.1	100.7	100.3
おくすり 飲めたね チョコ風味 (龍角散)	外観	試験製剤： 淡いだいだい色の細粒であ った	濃褐色のゼリーに淡い だいだい色の粉剤が混在して いた	同左
	におい	試験製剤： 甘い芳香があった	チョコレート様のおい であつた	同左
	pH	—	8.05	8.17
	含量 (%)	試験製剤：101.1	98.6	97.8

薬剤・飲食物との配合変化試験成績は「X III. 2. その他の関連資料」の項を参照

9. 溶出性

(1) 規格及び試験方法

アジスロマイシン錠 250mg/500mg「トーワ」

アジスロマイシン錠 250mg/500mg「トーワ」は、日本薬局方外医薬品規格第 4 部に定められたアジスロマイシン水和物錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法(パドル法)

試験液：pH6.5 のリン酸塩緩衝液 900mL

回転数：75rpm

測定法：液体クロマトグラフィー

規 格：30 分間の溶出率が 85%以上のときは適合とする。

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」は、設定された溶出規格に適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法(パドル法)

試験液：pH4.0 の 0.05mol/L 酢酸・酢酸ナトリウム緩衝液 900mL

回転数：50rpm

測定法：液体クロマトグラフィー

規格：30 分間の溶出率が 80%以上のときは適合とする。

(2) 生物学的同等性試験

16.8 その他

〈アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」〉

アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」は、アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が同等と判断され、生物学的に同等とみなされた。²⁰⁾

アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」について、「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」(平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号) (以下、ガイドライン) に従い、ヒトでの生物学的同等性が確認されたアジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」を標準製剤として溶出試験を行い、生物学的同等性試験とした。なお、試験製剤の処方変更水準は、ガイドラインにより B 水準に該当した。

〈測定条件〉

試験液 : pH1.2、pH3.0、pH6.8、水

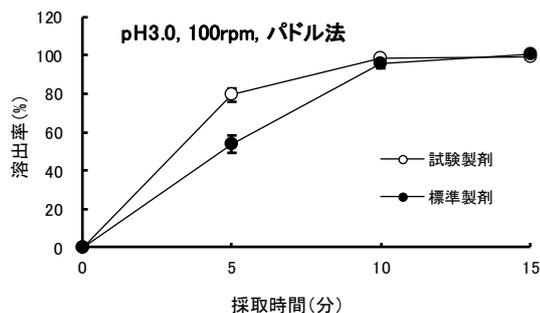
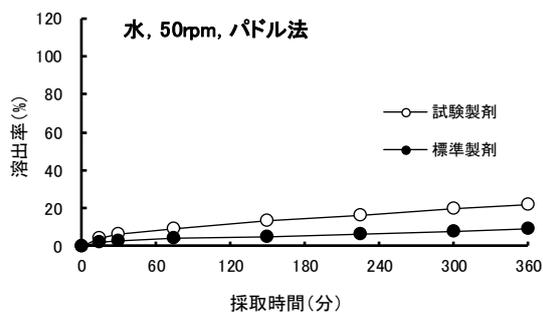
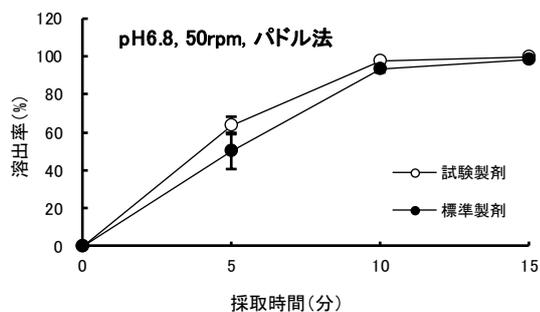
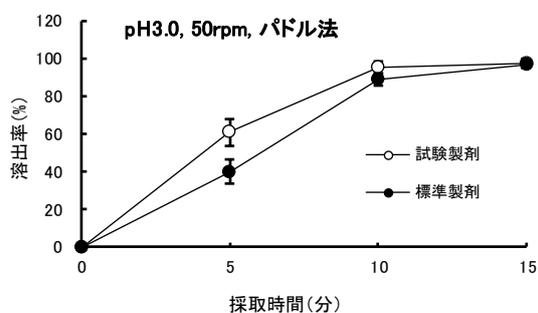
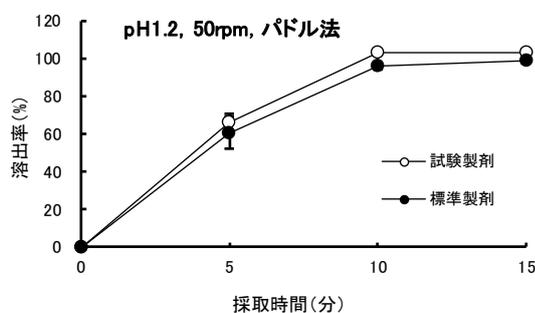
回転数 : 50rpm、100rpm

試験製剤 : アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」

検体数 : n=12

試験法 : パドル法

標準製剤 : アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」



平均溶出率(%) \pm S.D.

①同等性の判定基準及び判定結果（平均溶出率）

試験条件		判定時間 (分)	平均溶出率(%)		溶出率 の差(%)	同等性の判定基準	判定
			試験製剤	標準製剤			
パドル法 50rpm	pH1.2	15	103.3	98.9	/	15分以内に平均85%以上 溶出	適
	pH3.0	15	97.6	96.6			適
	pH6.8	15	100.0	98.0			適
	水	75	4.5	3.9	0.6	標準製剤の平均溶出率の ±6%以内	適
		360	10.9	9.1	1.8		
パドル法 100 rpm	pH3.0	15	99.3	100.3	/	15分以内に平均85%以上 溶出	適

②同等性の判定基準及び判定結果（試験製剤の個々の溶出率）

試験条件		判定時間 (分)	(a) 最小値～ 最大値(%)	(b) 平均溶出率 ±15%の範囲(%)	(a)が (b)を 超えた数	同等性の判定基準	判定
パドル法 50rpm	pH1.2	15	100.4～105.2	88.3～118.3	0	最終比較時点における 個々の溶出率について、 試験製剤の平均溶出率 ±15%の範囲を超えるも のが12個中1個以下 で、±25%の範囲を超え るものがない	適
	pH3.0	15	93.8～99.8	82.6～112.6	0		適
	pH6.8	15	97.9～102.0	85.0～115.0	0		適
パドル法 100rpm	pH3.0	15	97.8～100.6	84.3～114.3	0		適

試験条件		判定時間 (分)	(a) 最小値～ 最大値(%)	(b) 平均溶出率 ±9%の範囲(%)	(a)が (b)を 超えた数	同等性の判定基準	判定
パドル法 50rpm	水	360	10.6～11.2	1.9～19.9	0	最終比較時点における 個々の溶出率について、 試験製剤の平均溶出率 ±9%の範囲を超えるも のが12個中1個以下 で、±15%の範囲を超え るものがない	適

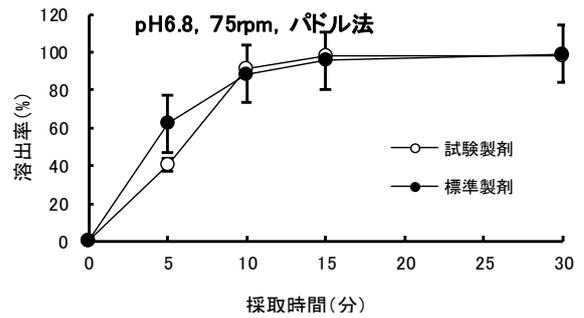
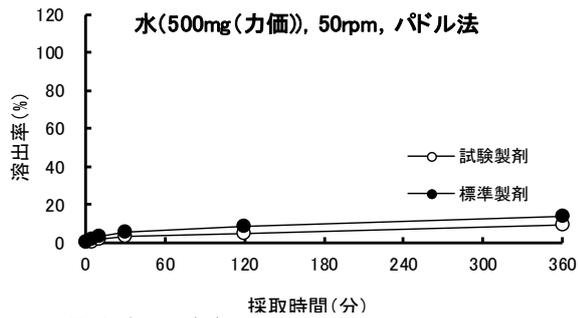
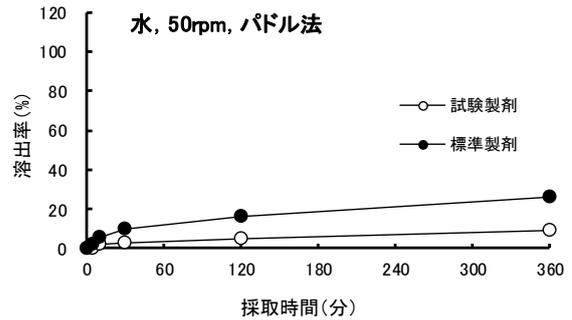
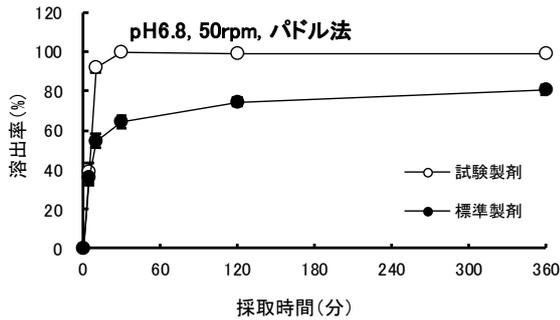
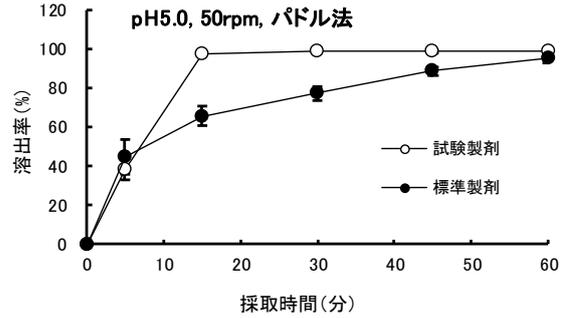
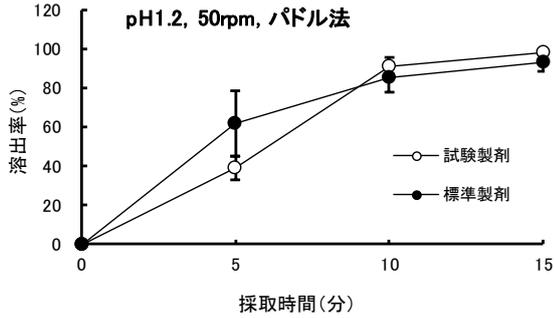
①②の結果より、すべての試験条件で判定基準を満たし、溶出挙動が同等と判定された。従って、アジスロマイシン錠 250mg「トーワ」と標準製剤（アジスロマイシン錠 500mg「トーワ」）は、生物学的に同等とみなされた。

アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」⁷⁾

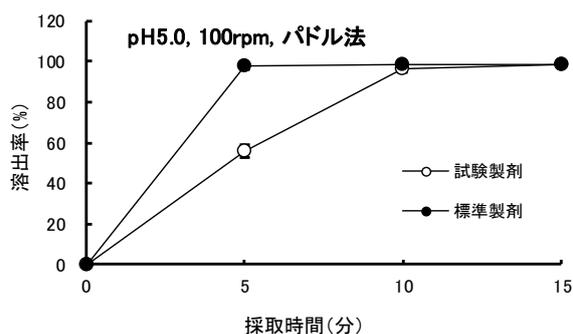
アジスロマイシン錠500mg 「トーワ」について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号)(以下、ガイドライン)に従い溶出試験を行った。

<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH5.0、pH6.8、水、水(500mg(力価)) 検体数 : n=12
 回転数 : 50rpm、75rpm、100rpm 試験法 : パドル法
 試験製剤 : アジスロマイシン錠500mg 「トーワ」 標準製剤 : ジスロマック錠250mg



平均溶出率(%)±S.D.



平均溶出率(%)±S.D.

類似性の判定基準及び判定結果

試験条件		判定時間(分)	平均溶出率(%)		溶出率の差(%)	類似性の判定基準	判定
			試験製剤	標準製剤			
パドル法 50rpm	pH1.2	15	98.0	93.4	/	15分以内に平均85%以上溶出	適
	pH5.0	5	38.6	44.6	-6.0	標準製剤の平均溶出率の±15%以内	適
		45	98.7	88.6	10.1		
	pH6.8	5	38.6	35.8	2.8	標準製剤の平均溶出率の±12%以内	不適
		360	98.7	80.5	18.2		
	水	30	2.8	10.0	-7.2	標準製剤の平均溶出率の±9%以内	不適
360		9.0	25.8	-16.8			
水 (500mg (力価))*1	30	2.8	5.5	-2.7	適		
	360	9.0	13.4	-4.4			
パドル法 75rpm*2	pH6.8	15	98.1	89.3	/	15分以内に平均85%以上溶出	適
パドル法 100rpm	pH5.0	15	98.7	98.7	/	適	

*1: 試験液に対する有効成分の溶解度が他の試験液に比べて非常に低く、有効成分量の相違が溶出率の差に大きく影響していると考えられた。その為、1ベッセルあたりの有効成分量が同じ500mg(力価)となるよう、試験製剤は1錠、標準製剤は2錠を用いて溶出試験を行った。

*2: 標準製剤は錠剤崩壊後に拡散せずベッセル底部に堆積し、溶出率は80%程度であった。一方、試験製剤はほぼ100%溶出し、添加剤による差が生じたと考えられた。その為、より堆積を起こしにくいパドル回転数75rpmの条件で溶出試験を行った。

上記の結果より、pH6.8(50rpm)及び水(50rpm)の試験条件において、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準を満たしておらず、試験製剤及び標準製剤の溶出挙動は類似していなかったが、水(1ベッセル中500mg(力価))(50rpm)と、pH6.8(75rpm)の試験条件では、ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準をみたしたことから、試験製剤の溶出挙動は標準製剤の溶出挙動と本質的には類似していると判断した。

従って、ヒトにおける生物学的同等性試験を行い、アジスロマイシン錠500mg「トーワ」は標準製剤との生物学的同等性が確認された。

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」⁷⁸⁾

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号) (以下、ガイドライン) に従い溶出試験を行った。

<測定条件>

試験液 : pH1.2、pH5.0、pH6.8、水

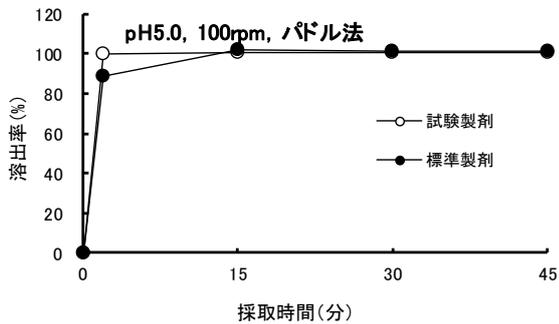
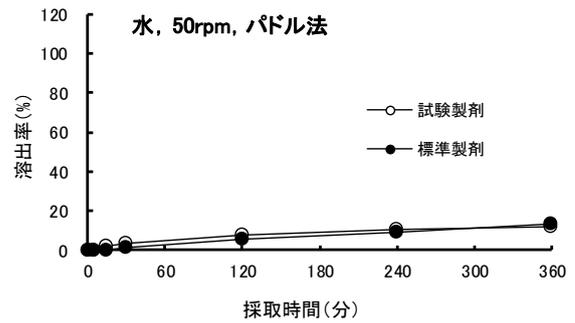
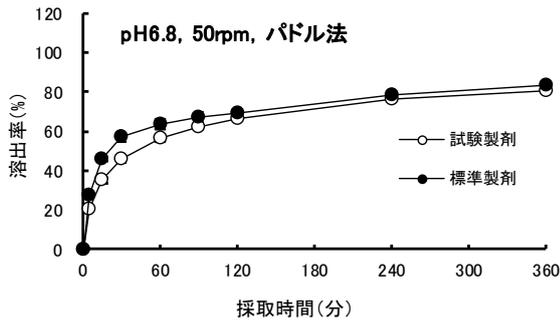
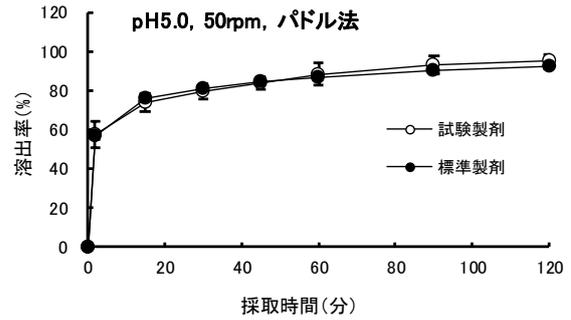
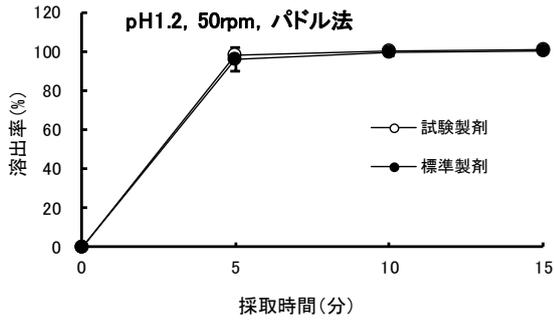
回転数 : 50rpm、100rpm

試験製剤 : アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」

検体数 : n=12

試験法 : パドル法

標準製剤 : ジスロマック細粒小児用 10%



平均溶出率(%)±S.D.

類似性の判定基準及び判定結果

試験条件		判定時間(分)	平均溶出率(%)		溶出率の差(%)	類似性の判定基準	判定
			試験製剤	標準製剤			
パドル法 50rpm	pH1.2	15	100.8	100.4		15分以内に平均85%以上溶出	適
	pH5.0	2	57.7	56.5	1.2	標準製剤の平均溶出率の±15%以内	適
		45	83.9	84.4	-0.5		
	pH6.8	15	35.1	46.1	-11.0	標準製剤の平均溶出率の±12%以内	適
		360	80.9	83.5	-2.6		
	水	120	7.8	5.8	2.0	標準製剤の平均溶出率の±9%以内	適
360		12.0	13.3	-1.3			
パドル法 100rpm	pH5.0	15	100.7	101.7		15分以内に平均85%以上溶出	適

上記の結果より、すべての試験条件でガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合し、アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。従って、ヒトにおける生物学的同等性試験を行い、アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」は標準製剤との生物学的同等性が確認された。

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
該当しない

(2) 包装

- 〈アジスロマイシン錠 250mg「トーワ」〉
 - 60錠 [6錠×10 : PTP]
 - 60錠 [6錠×10 : PTP (患者さん用パッケージ)]
- 〈アジスロマイシン錠 500mg「トーワ」〉
 - 30錠 [3錠×10 : PTP]
 - 30錠 [3錠×10 : PTP (患者さん用パッケージ)]
- 〈アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」〉
 - 1g×30包 [分包]
 - 100g [バラ、乾燥剤入り]

(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	PTP : ポリ塩化ビニル、アルミ箔
分包包装	分包 : セロファン・ポリエチレン・アルミニウムラミネート
バラ包装	瓶、蓋 : ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

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

アジスロマイシン錠 250mg/500mg 「トーワ」

4. 効能又は効果

〈アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」〉

[適応菌種]

アジスロマイシンに感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、淋菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、インフルエンザ菌、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、プレボテラ属、クラミジア属、マイコプラズマ属

[適応症]

深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、慢性呼吸器病変の二次感染、尿道炎、子宮頸管炎、骨盤内炎症性疾患、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

〈アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」〉

[適応菌種]

アジスロマイシンに感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、インフルエンザ菌、ペプトストレプトコッカス属、レジオネラ・ニューモフィラ、クラミジア属、マイコプラズマ属

[適応症]

深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、慢性呼吸器病変の二次感染、尿道炎、子宮頸管炎、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎

アジスロマイシン細粒小児用 10% 「トーワ」

4. 効能又は効果

〈適応菌種〉

アジスロマイシンに感性のブドウ球菌属、レンサ球菌属、肺炎球菌、モラクセラ（ブランハメラ）・カタラーリス、インフルエンザ菌、肺炎クラミジア（クラミジア・ニューモニエ）、マイコプラズマ属

〈適応症〉

咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、肺炎、肺膿瘍、中耳炎

2. 効能又は効果に関連する注意

アジスロマイシン錠 250mg/500mg 「トーワ」

5. 効能又は効果に関連する注意

〈骨盤内炎症性疾患〉

5.1 淋菌を適応菌種とするのは、骨盤内炎症性疾患の適応症に限る。

〈咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、副鼻腔炎〉

5.2 「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。

〈肺炎〉

5.3 症状に応じてアジスロマイシン注射剤から治療を開始する必要性を判断すること。[7.6、7.7 参照]

アジスロマイシン細粒小児用 10% 「トーワ」

5. 効能又は効果に関連する注意

〈咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、中耳炎〉

「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。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

アジスロマイシン錠 250mg/500mg「トーワ」

6. 用法及び用量

<アジスロマイシン錠 250mg「トーワ」>

[深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、肺膿瘍、慢性呼吸器病変の二次感染、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎]

成人にはアジスロマイシンとして、500mg（力価）を1日1回、3日間合計1.5g（力価）を経口投与する。

[尿道炎、子宮頸管炎]

成人にはアジスロマイシンとして、1000mg（力価）を1回経口投与する。

[骨盤内炎症性疾患]

成人にはアジスロマイシン注射剤による治療を行った後、アジスロマイシンとして250mg（力価）を1日1回経口投与する。

<アジスロマイシン錠 500mg「トーワ」>

成人にはアジスロマイシンとして、500mg（力価）を1日1回、3日間合計1.5g（力価）を経口投与する。

尿道炎、子宮頸管炎に対しては、成人にはアジスロマイシンとして、1000mg（力価）を1回経口投与する。

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」

6. 用法及び用量

小児には、体重1kgあたり10mg（力価）を1日1回、3日間経口投与する。
ただし、1日量は成人の最大投与量500mg（力価）を超えないものとする。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

アジスロマイシン錠 250mg/500mg「トーワ」

7. 用法及び用量に関連する注意

<深在性皮膚感染症、リンパ管・リンパ節炎、咽頭・喉頭炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍を含む）、急性気管支炎、肺膿瘍、慢性呼吸器病変の二次感染、副鼻腔炎、歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎>

7.1 本剤で治療を開始し、4日目以降においても臨床症状が不変もしくは悪化の場合には、医師の判断で適切な他の薬剤に変更すること。[16.7.2 参照]

7.2 外国の臨床における体内動態試験の成績から、本剤500mg（力価）を1日1回3日間経口投与することにより、感受性菌に対して有効な組織内濃度が約7日間持続することが予測されているので、治療に必要な投与期間は3日間とする。

<尿道炎、子宮頸管炎>

7.3 本剤投与開始後2～4週間は経過を観察し、効果を判定すること。細菌学的検査結果又は臨床症状から効果が認められない場合には医師の判断で適切な他の薬剤に変更すること。[16.7.2 参照]

7.4 本剤1000mg（力価）を1回経口投与することにより、アジスロマイシン感性のトラコーマクラミジア（クラミジア・トラコマティス）に対して有効な組織内濃度が約10日間持続することが予測されているので、治療に必要な投与回数は1回とする。

<肺炎>

7.5 本剤で治療を開始し、4日目以降においても臨床症状が不変もしくは悪化の場合には、医師の判断で適切な他の薬剤に変更すること。[16.7.2 参照]

- 7.6 アジスロマイシン注射剤から本剤に切り替える場合は、症状に応じて投与期間を変更することができる。[5.3、17.1.7、17.1.8 参照]
- 7.7 アジスロマイシン注射剤から本剤へ切り替え、総投与期間が 10 日を超える場合は、経過観察を十分に行うこと。アジスロマイシン注射剤からアジスロマイシン錠へ切り替えた臨床試験は、医師が経口投与可能と判断した時点で、アジスロマイシン注射剤からアジスロマイシン錠 500mg (力価) を 1 日 1 回投与に切り替え、アジスロマイシン注射剤の投与期間は 2～5 日間、総投与期間は合計 7～10 日間で実施され、総投与期間として 10 日間を超える投与経験は少ない。[5.3、17.1.7、17.1.8 参照]
- 7.8 レジオネラ・ニューモフィラに対して、アジスロマイシン注射剤による治療を実施せずに本剤のみで治療した場合の有効性及び安全性は確立していない (投与経験が少ない)。
<骨盤内炎症性疾患>
- 7.9 アジスロマイシン注射剤から本剤へ切り替え、総投与期間が 10 日を超える場合は、経過観察を十分に行うこと。アジスロマイシン注射剤からアジスロマイシン錠へ切り替えた臨床試験は、医師が経口投与可能と判断した時点で、アジスロマイシン注射剤からアジスロマイシン錠 250mg (力価) を 1 日 1 回投与に切り替え、アジスロマイシン注射剤の投与期間は 1～2 日間、総投与期間は合計 7 日間で実施され、総投与期間として 7 日間を超える投与経験はない。[17.1.9 参照]
- 7.10 アジスロマイシン注射剤による治療を実施せずに本剤のみで治療した場合の有効性及び安全性は確立していない (投与経験はない)。

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」

7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 分包製品の場合：体重換算による服用量の概算は、次表のとおりである。

体重	15～25kg	26～35kg	36～45kg	46kg～
1 日あたりの 服用量 (包数)	200mg(力価) (2 包)	300mg(力価) (3 包)	400mg(力価) (4 包)	500mg(力価) (5 包)

7.2 外国の臨床における体内動態試験の成績から、本剤 500mg (力価) を 1 日 1 回 3 日間経口投与することにより、感受性菌に対して有効な組織内濃度が約 7 日間持続することが予測されているので、治療に必要な投与期間は 3 日間とする。

7.3 4 日目以降においても臨床症状が不変もしくは悪化の場合には、医師の判断で適切な他の薬剤に変更すること。[16.7.2 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）、製造販売後データベース調査、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

アジスロマイシン錠 250mg/500mg「トーワ」

17.1 有効性及び安全性に関する試験

アジスロマイシン経口剤投与のみの成績

〈皮膚科感染症〉

17.1.1 国内第Ⅱ相/第Ⅲ相試験

浅在性化膿性疾患（せつ、せつ腫症、よう、丹毒、蜂巣炎、リンパ管（節）炎、ひょう疽、化膿性爪囲炎）に対する有効率は 91.8%（67/73）であった。^{34)~36)}

17.1.2 国内第Ⅲ相試験

二重盲検比較試験で浅在性化膿性疾患に対するアジスロマイシン錠の有効性が確認された。³⁵⁾

〈呼吸器感染症〉

17.1.3 国内第Ⅱ相/第Ⅲ相及び海外二重盲検比較試験

呼吸器感染症（咽喉頭炎、急性気管支炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍）、慢性気管支炎、気管支拡張症（感染時）、慢性呼吸器疾患の二次感染、肺炎、肺化膿症、マイコプラズマ肺炎）に対する有効率は 97.6%（373/382）であった。また、二重盲検比較試験で肺炎、慢性気道感染症に対するアジスロマイシン錠の有効性が確認された。^{36)~40)}

〈耳鼻科領域感染症（副鼻腔炎）〉

17.1.4 海外オープン比較試験

耳鼻科領域感染症（副鼻腔炎）に対する有効率は 100%（36/36）であった。⁴¹⁾

〈歯科・口腔外科領域感染症（歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎）〉

17.1.5 国内第Ⅲ相試験

歯科・口腔外科領域感染症（歯周組織炎、歯冠周囲炎、顎炎）に対する有効率は 85.9%（73/85）であった。また、二重盲検比較試験で歯科・口腔外科領域感染症に対するアジスロマイシン錠の有効性が確認された。⁴²⁾

〈クラミジア・トラコマティスによる性感染症（尿道炎、子宮頸管炎）〉

17.1.6 国内第Ⅲ相試験

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アジスロマイシン錠 1,000mg（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。⁴³⁾

アジスロマイシン注射剤からアジスロマイシン経口剤へ切り替えた（スイッチ療法）場合の成績

〈呼吸器感染症（肺炎）〉

17.1.7 国内第Ⅲ相試験

呼吸器感染症（肺炎）に対する非対照試験において、アジスロマイシン注射剤 500mg を 1日 1回、2~5日間点滴静注した後、アジスロマイシン錠 500mg（力価）を 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。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 \geq 2 μ g/mL）、11例のうち 10例が有効例であった。

表 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 \geq 2 μ g/mL)	10/11 (90.9)
MIC 不明	2/3 (66.7)
MIC 別：	
MIC=4 μ g/mL	1/1 (100)
MIC=8 μ g/mL	0/1 (0)
MIC=16 μ g/mL	3/3 (100)
MIC>64 μ g/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 $n/N \times 100$ から算出した。

本試験で報告された主な副作用は下痢 14.7% (15/102)、注射部位疼痛 5.9% (6/102) であった。⁴⁴⁾ [7.6、7.7 参照]

17.1.8 海外第Ⅲ相試験

呼吸器感染症（肺炎）に対する無作為化比較試験において、アジスロマイシン注射剤 500mg を 1 日 1 回、2～5 日間点滴静注した後、アジスロマイシンカプセル[®]500mg（力価）を 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。

投与終了 10～14 日目における有効率は 77.4% (106/137) であった。

本試験で報告された主な副作用は注射部位疼痛及び下痢 各 5.4% (各 11/202)、注射部位感染/炎症 3.5% (7/202) であった。⁴⁵⁾ [7.6、7.7 参照]

注) 国内で承認されている成人用製剤は錠剤及び注射剤である。

〈骨盤内炎症性疾患〉

17.1.9 国内第Ⅲ相試験

骨盤内炎症性疾患を対象とした臨床試験（詳細診断名：肝周囲炎、骨盤腹膜炎、ダグラス窩膿瘍、子宮内感染、子宮付属器炎）では、アジスロマイシン注射剤 500mg を 1 日 1 回、1～2 日間点滴静注した後、アジスロマイシン錠を 250mg（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 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。

投与開始 15 日目の有効率は 94.1% (48/51) であった。主な原因菌であるクラミジア・トラコマティス及び淋菌に対する臨床効果（有効率）及び細菌学的効果（菌消失率）は、それぞれ、100%(12/12、6/6 及び 11/11、6/6) であった。

本試験で報告された主な副作用は下痢 11.8% (9/76)、注射部位疼痛及び悪心 各 5.3% (4/76) であった。⁴⁶⁾ [7.9 参照]

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーフ」

〈呼吸器感染症〉

17.1.1 海外オープン比較試験及び二重盲検比較試験

呼吸器感染症（咽喉頭炎、急性気管支炎、扁桃炎（扁桃周囲炎、扁桃周囲膿瘍）、肺炎、肺化膿症等）に対する有効率は 95.1% (310/326) であった。なお、成人を対象とした二重盲検比較試験で肺炎、慢性気道感染症に対するアジスロマイシン錠の有効性が確認された。^{36),39),40),63),64)}

〈耳鼻科領域感染症（中耳炎）〉

17.1.2 海外オープン比較試験

耳鼻科領域感染症（中耳炎（含、乳様突起炎、錐体尖体炎））に対する有効率は 94.2% (97/103) であった。^{36),65)}

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

14 員環マクロライド系抗生物質：

エリスロマイシン、クラリスロマイシン、ロキシスロマイシン等

16 員環マクロライド系抗生物質：

ジョサマイシン、ミデカマイシン、ロキタマイシン、キタサマイシン、スピラマイシン酢酸エステル等

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 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。⁴⁷⁾

(2) 薬効を裏付ける試験成績

アジスロマイシン錠 250mg/500mg 「トーワ」

18.2.1 *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（ブランハメラ）・カタラーリス、インフルエンザ菌、淋菌、プレボテラ属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。^{48)~60)}

アジスロマイシン細粒小児用 10% 「トーワ」

18.2.1 *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（ブランハメラ）・カタラーリス、インフルエンザ菌等の一部グラム陰性菌、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。^{48)~53)}

共通

18.2.2 *In vitro* 及び *in vivo*（マウス、ハムスター）において、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で、アジスロマイシン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。^{49),52),53),61),62)}

18.2.3 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。^{48),49)}

(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

アジスロマイシン錠 250mg/500mg 「トーワ」

16.1.1 単回投与

健康成人男子 6 名にアジスロマイシン錠 250、500 及び 1000mg (力価) を単回経口投与したときの薬物動態パラメータを表に示す。¹⁹⁾

表 単回経口投与後の薬物動態パラメータ
(平均値±標準偏差、N=6/群)

投与量 (mg)	t _{max} (h)	C _{max} (μg/mL)	t _{1/2} ^{a)} (h)	AUC ₀₋₄₈ (μg・h/mL)	AUC ₀₋₁₆₈ (μg・h/mL)
250	2.7±0.8	0.24±0.12	NA	1.73±0.39	NA
500	2.5±0.8	0.58±0.11	61.9±9.4	3.32±0.46	4.41±0.48
1000	2.3±0.8	0.74±0.14	68.1±12.4	7.29±1.16	10.51±1.72

NA：算出せず

a)投与後 48～168h の t_{1/2}

16.1.2 反復投与

健康成人男子 6 名にアジスロマイシン錠 250 及び 500mg (力価) を 1 日 1 回 3 日間反復経口投与した場合、初回投与及び最終投与後の血清中濃度に差はみられず、蓄積は認められなかった。¹⁹⁾

16.1.3 生物学的同等性試験

〈アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」〉

アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」 1 錠とジスロマック錠 250mg2 錠 (アジスロマイシンとして 500mg) をクロスオーバー法により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。²⁰⁾

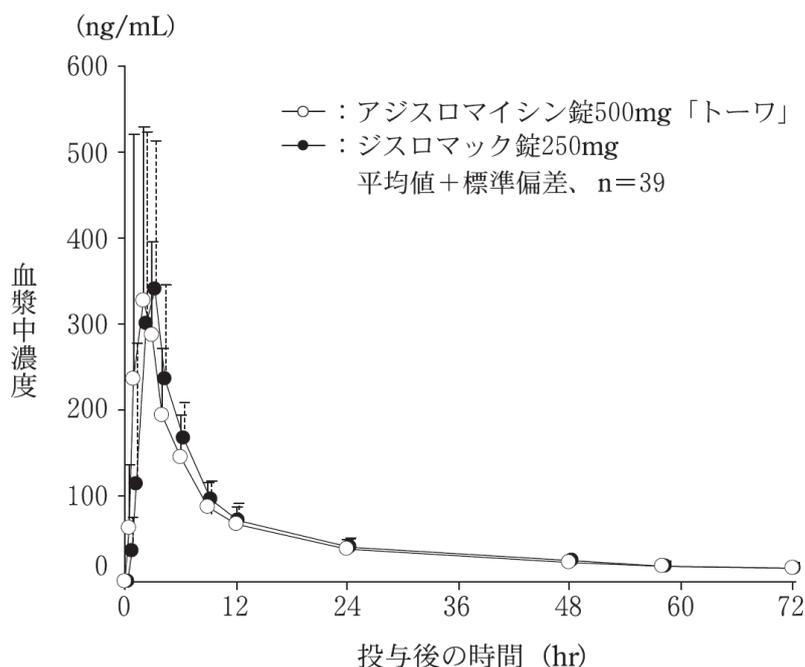


表 薬物動態パラメータ

(平均値±標準偏差、n=39)

	製剤投与量 (アジスロマイシン として)	判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	t _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
アジスロマイシン錠 500mg「トーワ」	1錠 (500mg)	3606±983	472.7±222.7	2.13±0.83	36.15±11.09
ジスロマック錠 250mg	2錠 (500mg)	3805±910	467.8±169.0	2.49±0.97	37.64±16.86

血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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。

両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び90%信頼区間

パラメータ	AUC ₀₋₇₂	C _{max}
平均値の差	log(0.9367)	log(0.9803)
平均値の差の90%信頼区間	log(0.8588)~log(1.0216)	log(0.8479)~log(1.1334)

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」

16.1.1 小児患者

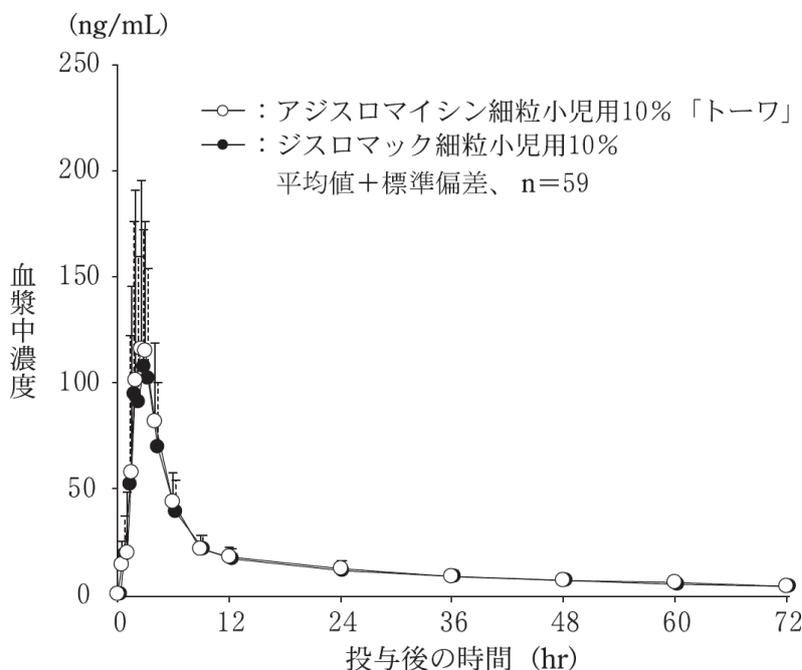
小児患者 16 例(1~9 歳)にアジスロマイシン懸濁剤^{注1)}10mg/kg を 3 日間反復経口投与したとき、最終投与後の最高血清中濃度(C_{max})は 2~4 歳の患者で 0.42 μg/mL、5~9 歳の患者で 0.25 μg/mL であり、血清中濃度・時間曲線下面積(AUC_{0~24})はそれぞれ 2.90 及び 2.08 μg・hr/mL であった。⁶⁶⁾

投与量 (mg/kg)	年齢 (歳)	n	C _{max} (μg/mL)	AUC _{0~24} (μg・hr/mL)
10	1	1	0.11	0.74
	2~4	7	0.42±0.34	2.90±2.64
	5~9	8	0.25±0.14	2.08±1.00

注 1) 国内で承認されている小児用製剤は細粒剤及びカプセル剤である。

16.1.3 生物学的同等性試験

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」とジスロマック細粒小児用 10%を、クロスオーバー法によりそれぞれ 2g（アジスロマイシンとして 200mg(力価)）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中アジスロマイシン濃度を測定し、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、 $\log(0.80)\sim\log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。⁶⁷⁾



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0~72} (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	t_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」	1097±313	183.9±78.6	2.53±0.77	34.35±6.87
ジスロマック細粒小児用 10%	1071±293	175.2±72.0	2.25±0.95	36.86±8.35

(平均値±標準偏差、n=59)

血漿中濃度並びに AUC、 C_{max} 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。

両剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び 90%信頼区間

パラメータ	AUC _{0~72}	C_{max}
平均値の差	$\log(1.0216)$	$\log(1.0410)$
平均値の差の 90%信頼区間	$\log(0.9637)\sim\log(1.0830)$	$\log(0.9331)\sim\log(1.1614)$

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

16.2.1 食事の影響

健康成人男子 8 名にアジスロマイシン錠 500mg（力価）をクロスオーバー法により、空腹時又は食後に単回経口投与した場合の体内動態パラメータには有意差は認められず、アジスロマイシンの吸収に及ぼす食事の影響はないものと考えられる。²¹⁾

16.7 薬物相互作用

16.7.1 他のマクロライド系薬剤において、下記薬剤による相互作用が報告されている。²⁷⁾

(1) テオフィリン、ミダゾラム、トリアゾラム、カルバマゼピン、フェニトイン

これらの薬剤の血中濃度が上昇し、作用が増強されるおそれがある。

(2) エルゴタミン含有製剤

四肢の虚血を起こすことがある。

16.7.2 他の抗菌剤との相互作用

アジスロマイシンと他の抗菌剤との相互作用に関しては、これまでの国内又は外国における臨床試験成績から、マクロライド系、ペニシリン系、キノロン系、テトラサイクリン系、セフェム系及びカルバペネム系抗菌剤との間で相互作用によると考えられる有害事象の報告はない。³³⁾ [7.1、7.3、7.5 参照]

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

アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」²⁰⁾

kel : 0.02073 ± 0.00556hr⁻¹ (健康成人男子、絶食単回経口投与)

アジスロマイシン細粒小児用 10% 「トーワ」⁶⁷⁾

kel : 0.02087 ± 0.00363hr⁻¹ (健康成人男子、絶食単回経口投与)

(4) クリアランス

「VII. 5. (5) その他の組織への移行性」の項参照

(5) 分布容積

「VII. 5. (5) その他の組織への移行性」の項参照

(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

「Ⅷ. 6. (6) 授乳婦」の項参照

(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

16.3.1 組織内濃度

手術予定患者にアジスロマイシン経口剤 500mg (力価) を経口投与した際の投与後 12 時間～8 日目の各種組織内濃度の検討では、いずれの組織においても、血清中濃度が消失後も数日にわたって高い組織内濃度が維持された (外国人データ)。²²⁾

なお、アジスロマイシンのヒトにおける全身クリアランス及び分布容積はそれぞれ 10mL/min/kg 及び 33.3L/kg と報告されており、分布容積が大きく、組織へ移行しやすいことが示されている。²³⁾

16.3.2 アジスロマイシンはヒト多形核白血球及びマウスマクロファージ等の食細胞への良好な移行が認められた。²⁴⁾

アジスロマイシンが移行した食細胞が感染組織に遊走することにより、感染組織では非感染組織に比べて高い薬剤濃度が得られることが動物 (マウス) 試験で認められている。²⁵⁾

(6) 血漿蛋白結合率

16.3.3 血清蛋白結合率

アジスロマイシンのヒト血清蛋白との結合率は 12.2～20.3% (*in vivo*、超遠心法) であった。²⁶⁾

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

16.4 代謝

アジスロマイシンのチトクローム P450 による代謝は確認されていない。²⁷⁾

(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

16.5.1 健常成人男子 6 名にアジスロマイシン錠 500mg (力価) を単回経口投与したとき、投与後 168 時間までの尿中に未変化体として投与量の 9% が排泄された。¹⁹⁾

健常成人男子の尿及び患者の胆汁中代謝物について検討した結果、いずれもほとんどは未変化体で、代謝物として脱メチル体、脱クラジノース体が確認された。アジスロマイシンは胆汁、消化管分泌を介して、未変化体としてほとんど糞中に排泄される。^{28), 29)}

<参考>ラット

16.5.2 ラットに ¹⁴C-標識アジスロマイシン 20mg/kg を単回経口投与したとき、投与後 168 時間までに投与量の 80.3% が糞中に、13.3% が尿中に排泄され、また投与後 72 時間までに投与量の 3.1% が呼気中に排泄された。²⁹⁾

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

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

16. 6. 1 肝機能障害患者

軽度及び中等度の肝機能障害患者（成人）16例にアジスロマイシンカプセル^注500mg（力価）を単回経口投与したとき、健常成人に比べて、 C_{max} が増加し、 $t_{1/2}$ が延長する傾向が認められたが、有意差は認められなかった。また尿中排泄率においても有意差は認められなかった（外国人データ）。³⁰⁾

注) 国内で承認されている成人用製剤は錠剤及び注射剤である。

16. 6. 2 腎機能障害患者

腎機能障害患者（成人）17例にアジスロマイシン錠 500mg（力価）を単回経口投与したとき、アジスロマイシンの体内動態は健常成人と有意差は認められなかった。^{31),32)}

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）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「Ⅴ. 2. 効能又は効果に関連する注意」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. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

アジスロマイシン錠 250mg/500mg 「トーワ」

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すること。
- 8.2 アナフィラキシー・ショックがあらわれるおそれがあるので、アレルギー既往歴、薬物過敏症等について十分な問診を行うこと。[11.1.1 参照]
- 8.3 本剤の使用にあたっては、事前に患者に対して、次の点を指導すること。[11.1.2 参照]
 - ・中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群が疑われる症状〔発疹に加え、粘膜（口唇、眼、外陰部）のびらんあるいは水ぶくれ等の症状〕があらわれた場合には、服用を中止し、ただちに医師に連絡すること。
 - ・服用終了後においても上記症状があらわれることがあるので、症状があらわれた場合にはただちに医師に連絡すること。
- 8.4 意識障害等があらわれることがあるので、自動車の運転等、危険を伴う機械の操作に従事する際には注意するよう患者に十分に説明すること。
- 8.5 アジスロマイシンは組織内半減期が長いことから、投与終了数日後においても副作用が発現する可能性があるため、観察を十分に行うなど注意すること。

アジスロマイシン細粒小児用 10% 「トーワ」

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すること。
- 8.2 アナフィラキシー・ショックがあらわれるおそれがあるので、アレルギー既往歴、薬物過敏症等について十分な問診を行うこと。[11.1.1 参照]
- 8.3 本剤の使用にあたっては、事前に患者に対して、次の点を指導すること。[11.1.2 参照]
 - ・中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群が疑われる症状〔発疹に加え、粘膜（口唇、眼、外陰部）のびらんあるいは水ぶくれ等の症状〕があらわれた場合には、服用を中止し、ただちに医師に連絡すること。
 - ・服用終了後においても上記症状があらわれることがあるので、症状があらわれた場合にはただちに医師に連絡すること。
- 8.4 アジスロマイシンは組織内半減期が長いことから、投与終了数日後においても副作用が発現する可能性があるため、観察を十分に行うなど注意すること。

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 他のマクロライド系又はケトライド系薬剤に対し過敏症の既往歴のある患者

9.1.2 心疾患のある患者

QT 延長、心室性頻脈（Torsade de pointes を含む）を起こすことがある。[11.1.8 参照]

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 高度な肝機能障害のある患者

投与量並びに投与間隔に留意するなど慎重に投与すること。肝機能を悪化させるおそれがある。

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

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。

(6) 授乳婦

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。ヒト母乳中に移行することが報告されている^{2)~4)}。

(7) 小児等

9.7 小児等

9.7.1 低出生体重児、新生児を対象とした臨床試験は実施していない。

9.7.2 白血球数減少が認められることがあるので、顆粒球数（好中球数）減少も合わせて十分観察を行い、異常が認められた場合には投与を中止し、必要があれば、他の抗菌薬に切り替えた上、症状に応じて対症療法等の適切な処置を行うこと。承認時に、小児で白血球数減少が認められたのは442例中33例で、このうち9例において好中球数が1000/mm³以下に減少した。白血球数減少が認められた症例の多くは、投与開始7日後あるいは8日後の検査日において回復がみられた。[11.1.9、11.2 参照]

9.7.3 下痢が認められた場合には症状に応じて投与中止あるいは対症療法等の適切な処置を行うこと。承認時の小児における下痢の発現頻度は、2歳未満（124例中8例）では2歳以上（602例中6例）と比べて高い。[11.2 参照]

9.7.4 市販後の自発報告において、小児における興奮の報告が成人に比べて多い傾向が認められている。[11.2 参照]

(8) 高齢者

9.8 高齢者

患者の一般状態に注意して投与すること。アジスロマイシン経口剤の一般感染症の臨床試験成績から、高齢者において認められた副作用の種類及び副作用発現率は、非高齢者と同様であったが、一般に高齢者では、生理機能が低下しており、血中・組織内濃度が高くなる可能性がある。

7. 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
制酸剤（水酸化マグネシウム、水酸化アルミニウム）	アジスロマイシンの最高血中濃度低下の報告がある ⁵⁾ 。	機序不明
ワルファリン	国際標準化プロトロンビン比上昇の報告がある ^{6),7)} 。	マクロライド系薬剤はワルファリンの肝臓における主たる代謝酵素であるチトクローム P450 を阻害するので、ワルファリンの作用が増強することがあるが、アジスロマイシンでの機序の詳細は明らかではない。
シクロスポリン	シクロスポリンの最高血中濃度の上昇及び血中濃度半減期の延長の報告がある ⁸⁾ 。	マクロライド系薬剤はシクロスポリンの主たる代謝酵素であるチトクローム P450 を阻害するので、シクロスポリンの血中濃度が上昇することがあるが、アジスロマイシンでの機序の詳細は明らかではない。
ネルフィナビル	アジスロマイシン錠の 1200mg 投与で、アジスロマイシンの濃度・時間曲線下面積（AUC）及び平均最高血中濃度の上昇の報告がある ⁹⁾ 。	機序不明
ジゴキシン	アジスロマイシンとの併用により、ジゴキシン中毒の発現リスク上昇の報告がある ¹⁰⁾ 。	P-糖蛋白質を介したジゴキシンの輸送が阻害されることにより、ジゴキシンの血中濃度が上昇することを示唆した報告があるが、アジスロマイシンでの機序の詳細は明らかではない。
ベネトクラクス	ベネトクラクスの効果が減弱するおそれがあるので、併用を避けることが望ましい。	機序は不明であるが、ベネトクラクスの血中濃度が低下する可能性がある。

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（頻度不明）、アナフィラキシー（頻度不明）

呼吸困難、喘鳴、血管浮腫等を起こすことがある。また、アジスロマイシンは組織内半減期が長いことから、これらの副作用の治療中止後に再発する可能性があるので注意すること。[8.2 参照]

11.1.2 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）（頻度不明）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）（頻度不明）、急性汎発性発疹性膿疱症（頻度不明）

異常が認めら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。これらの副作用はアジスロマイシンの投与中又は投与終了後 1 週間以内に発現しているため、投与終了後も注意すること。また、アジスロマイシンは組織内半減期が長いことから、これらの副作用の治療中止後に再発する可能性があるため注意すること。[8.3 参照]

11.1.3 薬剤性過敏症症候群（頻度不明）

初期症状として発疹、発熱がみられ、更に肝機能障害、リンパ節腫脹、白血球増加、好酸球増多、異型リンパ球出現等を伴う遅発性の重篤な過敏症状があらわれることがある。なお、ヒトヘルペスウイルス 6 (HHV-6) 等のウイルスの再活性化を伴うことが多く、投与中止後も発疹、発熱、肝機能障害等の症状が再燃あるいは遷延化することがあるので注意すること¹⁾。

11.1.4 肝炎（頻度不明）、肝機能障害（頻度不明）、黄疸（頻度不明）、肝不全（頻度不明）

11.1.5 急性腎障害（頻度不明）

乏尿等の症状や血中クレアチニン値上昇等の腎機能低下所見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。

11.1.6 偽膜性大腸炎（頻度不明）、出血性大腸炎（頻度不明）

偽膜性大腸炎、出血性大腸炎等の重篤な大腸炎があらわれることがあるので、腹痛、頻回の下痢、血便等があらわれた場合にはただちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.1.7 間質性肺炎（頻度不明）、好酸球性肺炎（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、好酸球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。

11.1.8 QT 延長（頻度不明）、心室性頻脈（Torsade de pointes を含む）（頻度不明）

QT 延長等の心疾患のある患者には特に注意すること。[9.1.2 参照]

11.1.9 白血球減少（頻度不明）、顆粒球減少（頻度不明）、血小板減少（頻度不明）

[9.7.2 参照]

11.1.10 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。また、横紋筋融解症による急性腎障害の発症に注意すること。

(2) その他の副作用

アジスロマイシン錠 250mg/500mg 「トーワ」

11.2 その他の副作用

	1%以上 ^{a)}	0.1～1%未満 ^{a)}	0.1%未満 ^{a)}	頻度不明
皮膚		発疹、蕁麻疹、そう痒症	アトピー性皮膚炎増悪	光線過敏性反応、紅斑、水疱、皮膚剥離、多形紅斑、寝汗、多汗症、皮膚乾燥、皮膚変色、脱毛
血液	好酸球数増加	白血球数減少 ^{b)}	血小板数増加、好塩基球数増加、顆粒球数減少 ^{b)} 、プロトロンビン時間延長、血小板数減少	貧血、リンパ球数減少、ヘモグロビン減少、白血球数増加
血管障害		血栓性静脈炎		潮紅
循環器				血圧低下、動悸、血圧上昇
肝臓	ALT 増加	AST 増加、ALP 増加、 γ -GTP 増加、LDH 増加、肝機能検査異常	血中ビリルビン増加	
腎臓			BUN 増加、尿中蛋白陽性	クレアチニン増加、腎臓痛、排尿困難、尿潜血陽性、頻尿

消化器	下痢 ^{c)}	腹痛、悪心、嘔吐、腹部不快感、腹部膨満	便秘、口内炎、消化不良、食欲不振、鼓腸放屁、口唇のあれ、黒毛舌、舌炎、舌苔、腹鳴	舌変色、口・舌のしびれ感、おくび、胃炎、口内乾燥、唾液増加、腭炎、アフタ性口内炎、口腔内不快感、消化管障害、口唇炎
精神・神経系			頭痛、めまい、灼熱感、傾眠、味覚異常、感覚鈍麻、不眠症	失神、痙攣、振戦、激越 ^{d)} 、嗅覚異常、無嗅覚、神経過敏、不安、錯感覚、攻撃性
感染症		カンジダ症	胃腸炎	真菌感染、咽頭炎、皮膚感染、肺炎、β溶血性レンサ球菌感染、膣炎
眼				結膜炎、眼瞼浮腫、霧視、ぶどう膜炎、眼痛、視力障害
筋骨格系				筋肉痛、関節痛、頸部痛、背部痛、四肢痛、関節腫脹
呼吸器			咳嗽、呼吸困難、嘔声	鼻出血、アレルギー性鼻炎、くしゃみ、ラ音、気管障害、低音性連続性ラ音、鼻部障害、鼻閉、鼻漏、羊鳴性気管支音、痰貯留
耳				耳痛、難聴、耳鳴、聴力低下、耳の障害
生殖器			卵巣嚢腫	精巣痛、不正子宮出血
代謝			血中カリウム減少、血中カリウム増加	脱水、血中重炭酸塩減少、低カリウム血症
注入部位		疼痛	血管外漏出、紅斑	
その他			発熱、口渇、気分不良、倦怠感、浮遊感	胸痛、無力症、浮腫、低体温、不整脈、咽喉頭異物感、局所腫脹、粘膜異常感覚、疼痛、疲労

a) 250mg錠、カプセル、細粒の承認時の臨床試験と市販後の使用成績調査及び注射剤の承認時の臨床試験を合わせた発現頻度。

b) [9.7.2 参照]

c) [9.7.3 参照]

d) [9.7.4 参照]

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」

11.2 その他の副作用				
	1%以上 ^{a)}	0.1~1%未満 ^{a)}	0.1%未満 ^{a)}	頻度不明
皮膚		発疹	蕁麻疹、そう痒症、アトピー性皮膚炎増悪	光線過敏性反応、紅斑、水疱、皮膚剥離、多形紅斑、寝汗、多汗症、皮膚乾燥、皮膚変色、脱毛
血液	好酸球数増加	白血球数減少 ^{b)}	血小板数増加、好塩基球数増加、顆粒球数減少 ^{b)} 、血小板数減少	貧血、リンパ球数減少、ヘモグロビン減少、白血球数増加、プロトロンビン時間延長

血管障害				潮紅、血栓性静脈炎
循環器				血圧低下、動悸、血圧上昇
肝臓	ALT 増加	AST 増加、ALP 増加、 γ -GTP 増加、LDH 増加	血中ビリルビン増加	肝機能検査異常
腎臓			BUN 増加、尿中蛋白陽性	クレアチニン増加、腎臓痛、排尿困難、尿潜血陽性、頻尿
消化器	下痢 ^{c)}	腹痛、悪心、嘔吐、腹部不快感、腹部膨満	便秘、口内炎、消化不良、食欲不振、口唇のあれ、黒毛舌、舌炎、舌苔、腹鳴	舌変色、口・舌のしびれ感、おくび、胃炎、口内乾燥、唾液増加、腭炎、鼓腸放屁、アフタ性口内炎、口腔内不快感、消化管障害、口唇炎
精神・神経系			頭痛、めまい、傾眠、感覚鈍麻、不眠症	失神、痙攣、振戦、激越 ^{d)} 、嗅覚異常、無嗅覚、神経過敏、不安、錯感覚、攻撃性、灼熱感、味覚異常
感染症			カンジダ症	真菌感染、胃腸炎、咽頭炎、皮膚感染、肺炎、 β 溶血性レンサ球菌感染、膿炎
眼				結膜炎、眼瞼浮腫、霧視、ぶどう膜炎、眼痛、視力障害
筋骨格系				筋肉痛、関節痛、頸部痛、背部痛、四肢痛、関節腫脹
呼吸器			咳嗽、呼吸困難	鼻出血、アレルギー性鼻炎、くしゃみ、ラ音、気管障害、低音性連続性ラ音、鼻部障害、鼻閉、鼻漏、羊鳴性気管支音、痰貯留、嘎声
耳				耳痛、難聴、耳鳴、聴力低下、耳の障害
生殖器				精巣痛、不正子宮出血、卵巣嚢腫
代謝			血中カリウム増加、血中カリウム減少	脱水、血中重炭酸塩減少、低カリウム血症
その他			発熱、口渇、気分不良、倦怠感、浮遊感	胸痛、無力症、浮腫、低体温、不整脈、咽喉頭異物感、局所腫脹、粘膜異常感覚、疼痛、疲労

a) 250mg 錠、カプセル、細粒の承認時の臨床試験と市販後の使用成績調査を合わせた発現頻度。
b) [9.7.2 参照]
c) [9.7.3 参照]
d) [9.7.4 参照]

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

13. 過量投与

13.1 症状

本剤の過量投与により聴力障害を起こす可能性がある。

11. 適用上の注意

アジスロマイシン錠 250mg/500mg 「トーワ」

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。

アジスロマイシン細粒小児用 10% 「トーワ」

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

調剤時につぶした場合には、苦味が発現することがあるので、避けることが望ましい。

14.2 薬剤交付時の注意

本剤は小児が確実に服用できるように主薬の苦味を防ぐためのコーティングが施してあるので、水又は牛乳等の中性飲料で速やかに服用すること。

なお、酸性飲料（オレンジジュース、乳酸菌飲料及びスポーツ飲料等）で服用したり、嚙んで服用した場合には、苦味が発現することがあるので、避けることが望ましい。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

アジスロマイシンとの因果関係は不明だが、心悸亢進、間質性腎炎、肝壊死、運動亢進があらわれたとの報告がある。

(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

15.2.1 ラットの受胎能及び一般生殖能試験（雄2ヵ月以上、雌2週間以上投与）で、20mg/kg投与の雄雌に受胎率の低下が認められた¹²⁾。

15.2.2 動物（ラット、イヌ）に20～100mg/kgを1～6ヵ月間反復投与した場合に様々な組織（眼球網膜、肝臓、肺臓、胆嚢、腎臓、脾臓、脈絡叢、末梢神経等）にリン脂質空胞形成がみられたが、投薬中止後消失することが確認されている^{13)～18)}。なお、リン脂質空胞はアジスロマイシン-リン脂質複合体を形成することによる組織像と解釈され、その毒性学的意義は低い。

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」の項参照

(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

「VIII. 12. (2) 非臨床試験に基づく情報」の項参照

(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

「VIII. 12. (2) 非臨床試験に基づく情報」の項参照

(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」の項参照

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製剤：処方箋医薬品^{注)}

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：該当しない

2. 有効期間

5年（錠 250mg・錠 500mg）

3年（細粒小児用 10%）

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

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：

- ・アジスロマイシン錠「トーワ」を服用される患者さんへ（3日間用）
- ・アジスロマイシン錠「トーワ」を服用される患者さんへ（1回服用）
- ・アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」の飲ませ方
（「XⅢ. 2. その他の関連資料」の項参照）

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ジスロマック錠 250mg/600mg・カプセル小児用 100mg・細粒小児用 10%・点滴静注用 500mg

7. 国際誕生年月日

1991年4月4日（英国）

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
アジスロマイシン錠 250mg「トーワ」	2013年8月15日	22500AMX01586000	2013年12月13日	2013年12月13日
アジスロマイシン錠 500mg「トーワ」	2013年8月15日	22500AMX01587000	2013年12月13日	2013年12月13日
アジスロマイシン細粒 小児用 10%「トーワ」	2015年2月16日	22700AMX00304000	2015年6月19日	2015年6月19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

アジスロマイシン錠 250mg「トーワ」

項目	内容	変更追加年月日
効能又は効果 用法及び用量	適応菌種に「淋菌、プレボテラ属」、適応症に「骨盤内炎症性疾患」を追加	2016年9月28日

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 (9桁) 番号	レセプト電算 処理システム用 コード
アジスロマイシン錠 250mg「トーワ」	6149004F1168	6149004F1168	122815101	622281501
アジスロマイシン錠 500mg「トーワ」	6149004F4027	6149004F4027	122816801	622281601
アジスロマイシン細粒 小児用 10%「トーワ」	6149004C1102	6149004C1102	124115001	622411501

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。

X I . 文 献

1. 引用文献

電子添文の主要文献

- 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) Kelsey,J.et al. : Am J Obstet Gynecol. 1994 ; 170(5-1) : 1375-1376
- 3) Salman,S.et al. : Antimicrob Agents Chemother. 2015 ; 60(3) : 1592-1599
- 4) Sutton,AL.et al. : Am J Obstet Gynecol. 2015 ; 212(6) : 812,e1-e6
- 5) Foulds,G.et al. : J Clin Pharmacol. 1991 ; 31(2) : 164-167
- 6) Woldtvedt,B.R.et al. : Ann Pharmacother. 1998 ; 32(2) : 269-270
- 7) Lane,G. : Ann Pharmacother. 1996 ; 30(7/8) : 884-885
- 8) シクロスポリンとの薬物相互作用（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要へ.3.1.4）
- 9) Amsden,G.W.et al. : J Clin Pharmacol. 2000 ; 40(12-2) : 1522-1527
- 10) Gomes,T.et al. : Clin Pharmacol Ther. 2009 ; 86(4) : 383-386
- 11) 厚生労働省：重篤副作用疾患別対応マニュアル 薬剤性過敏症症候群
- 12) ラット受胎能及び一般生殖能試験（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要ニ.3.1）
- 13) ラット経口1ヵ月毒性試験（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要ニ.2.1）
- 14) イヌ経口1ヵ月毒性試験（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要ニ.2.2）
- 15) ラット経口6ヵ月毒性試験（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要ニ.2.3）
- 16) イヌ経口6ヵ月毒性試験（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要ニ.2.4.1）
- 17) イヌ経口6ヵ月毒性試験及び回復性試験（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要ニ.2.4.2）
- 18) イヌ経口6ヵ月毒性試験(間欠投与)及び回復性試験（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要ニ.2.4.3）
- 19) 丁 宗鉄ほか：日本化学療法学会雑誌. 1995 ; 43(Suppl.6) : 139-163
- 20) 陶 易王ほか：医学と薬学. 2013 ; 70(3) : 583-594
- 21) 丁 宗鉄ほか：日本化学療法学会雑誌. 1995 ; 43(Suppl.6) : 177-185
- 22) Foulds,G.et al. : J Antimicrob Chemother. 1990 ; 25(Suppl.A) : 73-82
- 23) Luke,D.R.et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1996 ; 40(11) : 2577-2581
- 24) Gladue,R.P.et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1989 ; 33(3) : 277-282
- 25) 横山 秀一ほか：日本化学療法学会雑誌. 1995 ; 43(Suppl.6) : 122-126
- 26) 血清蛋白との結合（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要へ.2.(4).2))
- 27) 使用上の注意(案)及びその設定根拠（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要ト.3.(3)）
- 28) 代謝（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要へ.3.(1).3)）
- 29) 排泄（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要へ.2.(7)）
- 30) Mazzei,T.et al. : J Antimicrob Chemother. 1993 ; 31(Suppl.E) : 57-63
- 31) 柴 孝也ほか：日本化学療法学会雑誌. 1995 ; 43(Suppl.6) : 186-192
- 32) Höffler,D.et al. : Infection. 1995 ; 23(6) : 356-361
- 33) 薬物相互作用（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000年3月10日承認、申請資料概要へ.3.(1).4)）
- 34) 皮膚科領域感染症に対する用量設定試験（ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用：2000

- 年 3 月 10 日承認、申請資料概要ト.1.(3).2))
- 35) 皮膚科領域感染症に対する二重盲検比較試験 (ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用 : 2000 年 3 月 10 日承認、申請資料概要ト.1.(4).3))
 - 36) 効能・効果及びその設定根拠 (ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用 : 2000 年 3 月 10 日承認、申請資料概要ト.3.(1-1).2))
 - 37) レンサ球菌性咽頭炎を対象とした二重盲検比較試験 (ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用 : 2000 年 3 月 10 日承認、申請資料概要ト.1.(7).1))
 - 38) 後期第Ⅱ相試験肺炎に対する用量設定試験 (ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用 : 2000 年 3 月 10 日承認、申請資料概要ト.1.(3).1))
 - 39) 肺炎に対する二重盲検比較試験 (ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用 : 2000 年 3 月 10 日承認、申請資料概要ト.1.(4).1))
 - 40) 慢性気道感染症に対する二重盲検比較試験 (ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用 : 2000 年 3 月 10 日承認、申請資料概要ト.1.(4).2))
 - 41) 急性副鼻腔炎を対象としたオープン比較試験 (ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用 : 2000 年 3 月 10 日承認、申請資料概要ト.1.(7).2))
 - 42) 歯科・口腔外科領域感染症に対する二重盲検比較試験 (ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用 : 2000 年 3 月 10 日承認、申請資料概要ト.1.(4).4))
 - 43) 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 (ジスロマック錠 : 2004 年 5 月 21 日承認、審査報告書)
 - 44) 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(A0661191 試験) (ジスロマック点滴静注用/錠 : 2011 年 7 月 1 日承認、申請資料概要 2.7.3.1、2.7.6)
 - 45) 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(93-CE33-0618 試験) (ジスロマック点滴静注用/錠 : 2011 年 7 月 1 日承認、申請資料概要 2.7.3.1、2.7.6)
 - 46) 骨盤内炎症性疾患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(A0661192 試験) (ジスロマック点滴静注用/錠 : 2012 年 6 月 22 日承認、申請資料概要 2.7.3.3、2.7.6)
 - 47) Retsema,J.et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1987 ; 31(12) : 1939-1947
 - 48) 松永 敏幸ほか : 日本化学療法学会雑誌. 1995 ; 43(Suppl.6) : 95-99
 - 49) 松永 敏幸ほか : 日本化学療法学会雑誌. 1995 ; 43(Suppl.6) : 68-83
 - 50) 栗原 京子ほか : 日本化学療法学会雑誌. 1995 ; 43(Suppl.6) : 24-30
 - 51) 加藤 直樹ほか : 日本化学療法学会雑誌. 1995 ; 43(Suppl.6) : 31-39
 - 52) Ishida,K.et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1994 ; 38(4) : 790-798
 - 53) Niki,Y.et al. : Antimicrob Agents Chemother. 1994 ; 38(10) : 2296-2299
 - 54) Choi,GE.et al. : Korean J Lab Med. 2010 ; 30(1) : 28-33
 - 55) 小川 美保ほか : Pharma Medica. 2006 ; 24(3) : 109-119
 - 56) Mikamo,H.et al. : Chemotherapy. 2003 ; 49(1-2) : 62-65
 - 57) Kuriyama,T.et al. : Oral Microbiol Immunol. 2007 ; 22(4) : 285-288
 - 58) 金子 明寛 : 日本口腔外科学会雑誌. 2010 ; 56(10) : 546-552
 - 59) Waites,KB.et al. : Antimicrob Agents Chemother. 2009 ; 53(5) : 2139-2141
 - 60) Hamasuna,R.et al. : Antimicrob Agents Chemother. 2009 ; 53(11) : 4938-4939
 - 61) 西野 武志ほか : 日本化学療法学会雑誌. 1995 ; 43(Suppl.6) : 40-54
 - 62) 長島 正人ほか : 日本化学療法学会雑誌. 1995 ; 43(Suppl.6) : 8-23
 - 63) Hamill,J. : J Antimicrob Chemother. 1993 ; 31(Suppl.E) : 89-94
 - 64) Harris,J.S. : Pediatr Infect Dis J. 1998 ; 17(10) : 865-871
 - 65) Daniel,R.R. : J Antimicrob Chemother. 1993 ; 31(Suppl.E) : 65-71
 - 66) 小児における反復経口投与時の体内動態の検討 (ジスロマック錠/カプセル小児用/細粒小児用 : 2000 年 3 月 10 日承認、申請資料概要へ.3.(2).2))
 - 67) 社内資料 : 生物学的同等性試験 (細粒小児用 10%)

その他の引用文献

- 68) 社内資料 : 加速試験 (錠 250mg)
- 69) 社内資料 : 長期保存試験 (錠 250mg)
- 70) 社内資料 : 無包装状態における安定性試験 (錠 250mg)

-
- 71) 社内資料：加速試験（錠 500mg）
 - 72) 社内資料：長期保存試験（錠 500mg）
 - 73) 社内資料：無包装状態における安定性試験（錠 500mg）
 - 74) 社内資料：加速試験（細粒小児用 10%）
 - 75) 社内資料：無包装状態における安定性試験（細粒小児用 10%）
 - 76) 社内資料：配合変化試験（服薬補助ゼリーとの配合変化）（細粒小児用 10%）
 - 77) 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験（錠 500mg）
 - 78) 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験（細粒小児用 10%）
 - 79) 社内資料：粉碎後の安定性試験（錠 500mg）
 - 80) 社内資料：崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性試験
 - 81) 社内資料：配合変化試験（細粒小児用 10%）

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II . 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

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。

掲載根拠：「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する Q&A について(その 3)」
(令和元年 9 月 6 日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡)

(1) 粉砕⁷⁹⁾

アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」

素錠部の有効成分及び添加剤の組成比が同一であるアジスロマイシン錠 500mg「トーワ」の結果を参照。

アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」

■ 保存条件

粉砕した検体を以下の条件で保存した。

・室内散光

条件：成り行き温湿度、照度は約 600lx 付近に調整
(累積照度は 3 箇月時点で 120 万 lx・hr 以上)

保存形態：シャーレ (ラップで覆う)

・防湿

条件：成り行き温湿度、照度は約 600lx 付近に調整
(累積照度は 3 箇月時点で 120 万 lx・hr 以上)

保存形態：ガラス瓶 (密栓)

■ 結果

保存条件	試験項目	粉砕直後	1 箇月後	3 箇月後
室内散光	外観	白色の粉末	同左	同左*
	含量(%)	100.0	99.6	98.5
防湿	外観	白色の粉末	同左	同左
	含量(%)	100.0	100.2	98.4

*：少しだまが生じた

保存期間：2013 年 8 月 2 日～2013 年 11 月 5 日

温度：21.9～26.1℃

湿度：28～65%RH

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性⁸⁰⁾

■ 方法

アジスロマイシン錠 250mg/500mg 「トーワ」

- ① シリンジのプランジャーを抜き取り、シリンジ内に製剤 1 個を入れてプランジャーを戻し、お湯（55℃）を 20mL 吸い取る。
- ② 5 分間放置後、シリンジを手で 90 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察する。崩壊不良の場合は再度 5 分間放置し、同様の操作を行う。
- ③ 崩壊しない場合は、錠剤に亀裂を入れたものについて①～②の作業を行う。
- ④ チューブに取り付け、流速約 2～3mL/秒で懸濁液を全て押し込んだ後、さらに水 20mL をシリンジで注入し洗いこみ後の残留物の有無を確認する。

アジスロマイシン細粒小児用 10% 「トーワ」

- ① シリンジのプランジャーを抜き取り、シリンジ内に用法・用量に記載されている 1 回最大量の製剤を入れてプランジャーを戻し、お湯（55℃）あるいは室温水を 20mL 吸い取る。
- ② 5 分間放置後、シリンジを手で 90 度 15 往復横転し、溶解・懸濁の状況を観察する。溶解・懸濁不良の場合は再度 5 分間放置し、同様の操作を行う。
- ③ チューブに取り付け、流速約 2～3mL/秒で懸濁液を全て押し込んだ後、さらに水 20mL をシリンジで注入し洗いこみ後の残留物の有無を確認する。

■ 試験器具・機器

チューブ：ニューエンテラルフィーディングチューブ（長さ：120cm）

シリンジ：Exacta-Med オーラルディスペンサー（透明）60mL サイズ

■ 結果

販売名	試験項目	水(55℃)
アジスロマイシン錠 250mg 「トーワ」	崩壊性	5 分で崩壊した
	通過性	8Fr チューブ：抵抗なくチューブを通過した (全量を押し出せた)
	残存	ほとんどなかった
	懸濁液 pH	pH9.87
アジスロマイシン錠 500mg 「トーワ」	崩壊性	5 分で崩壊した
	通過性	8Fr チューブ：抵抗なくチューブを通過した (全量を押し出せた)
	残存	ほとんどなかった
	懸濁液 pH	pH9.73

販売名	試験項目	水(55℃)*	室温水*
アジスロマイシン細粒 小児用 10% 「トーワ」	溶解・懸濁性	溶解またはすぐに懸濁した	懸濁しにくかった
	通過性	8Fr チューブ：通過抵抗を感じた (全量を押し出せた)	
	残存	シリンジにのみわずかに認められた (目視で残留物が確認できるが微量であった)	シリンジ及びチューブにわずかに認められた (目視で残留物が確認できるが微量であった)
	懸濁液 pH	pH 8.0	pH 8.1

*：採取量 5g

2. その他の関連資料

東和薬品株式会社 医療関係者向けサイト

<https://med.towayakuhin.co.jp/medical/>

配合変化試験⁸¹⁾

アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」

■方法

(1) 配合方法

本剤 1g に薬剤または飲食物を表中の配合量に示す比率で加えて混合する。

(2) 保存条件

1) 薬剤との配合

室温 (成り行き温湿度)、密栓

2) 飲食物との配合

室温 (成り行き温湿度)、室内散光

■結果

(1) 固体製剤との配合

試験実施：2015年4月

分類	配合薬剤	配合薬量	試験項目	配合前* (配合薬)	配合直後	1日後	3日後	7日後
中枢神経系 用薬	アセトアミノフェン 細粒 20%「トーワ」	0.75g	外観	淡橙色の細粒	淡いだいだい色の細粒	同左	同左	同左
			流動性	—	変化なし	同左	同左	同左
			残存率 (%)	—	100.0	102.1	98.6	101.3
呼吸器官用薬	カルボシステイン DS50%「トーワ」	0.2g	外観	白色の微粒状の ドライシロップ	淡いだいだい色の細粒に白色の粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	変化なし	同左	同左	同左
			残存率 (%)	—	100.0	104.3	96.6	97.4
	小児用ムコソルバン DS1.5%	0.2g	外観	白色～微黄色の粒状または粉末	淡いだいだい色の細粒に白色の粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	変化なし	同左	同左	同左
			残存率 (%)	—	100.0	102.2	100.7	101.7
	アスピリン散 10%	0.065g	外観	だいだい色の微粒状	淡いだいだい色の細粒	同左	同左	同左
			流動性	—	変化なし	同左	同左	同左
			残存率 (%)	—	100.0	100.0	100.5	98.5
消化器官 用薬	ビオフェルミン R 散	0.2 g	外観	白色～わずかに淡黄褐色の粉末状	淡いだいだい色の細粒	同左	同左	同左
			流動性	—	変化なし	同左	同左	同左
			残存率 (%)	—	100.0	96.2	95.7	98.0
アレルギー用薬	ペリアクチン散 1%	0.08 g	外観	白色の粉末	淡いだいだい色の細粒	同左	同左	同左
			流動性	—	変化なし	同左	同左	同左
			残存率 (%)	—	100.0	102.6	97.4	101.8
	アレロック顆粒 0.5%	0.5 g	外観	淡黄褐色の顆粒	淡いだいだい色の細粒に淡黄褐色の顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	変化なし	同左	同左	同左
			残存率 (%)	—	100.0	99.9	98.8	99.9
	ブランルカスト DS10% 「トーワ」	0.35g	外観	白色～微黄色の顆粒	淡いだいだい色の細粒に白色の顆粒の混合物	同左	同左	同左
			流動性	—	変化なし	同左	同左	同左
			残存率 (%)	—	100.0	97.3	96.2	97.9

*：製品の電子添文情報より記載

(2)液体製剤との配合

試験実施：2015年4月

分類	配合薬剤	配合薬量	試験項目	配合前*1 (配合薬)	配合直後	1日後	3日後	7日後
呼吸器官用薬	カルボステインシロップ 小児用5%「トーワ」	2.0 mL	外観	褐色の液	淡い黄赤褐色の懸濁液	上層：淡い黄赤色の懸濁液 中間層：褐色澄明の液 下層：淡い黄赤色の沈殿物	同左	同左
			再分散性*3 (回数)	—	—	良 (1)	良 (3)	良 (6)
			残存率 (%)	—	100.0	97.8	98.5	101.0
	アスベリンシロップ0.5%	1.35mL	外観	白色～淡黄灰 白色の懸濁液	淡い黄赤色の懸濁液	同左	同左	同左
			再分散性*3 (回数)	—	—	良 (1)	良 (2)	良 (1)
			残存率 (%)	—	100.0	95.9	97.6	98.6
	プロカテロール塩酸塩 シロップ5 μ g/mL 「トーワ」*2	2.5 mL	外観	無色澄明の やや粘稠な 液	淡い黄赤色の懸濁液	淡い黄赤色の半澄明 の液+淡い黄赤色の沈 殿物	同左	同左
			再分散性*3 (回数)	—	—	良 (2)	良 (2)	良 (5)
			残存率 (%)	—	100.0	98.6	97.3	97.3
アレルギー用薬	ペリアクチンシロップ 0.04%	2.0 mL	外観	無色～微黄色 澄明の液	淡い黄赤色の懸濁液	上層：淡い黄赤色の懸濁液 中間層：無色澄明の液 下層：淡い黄赤色の沈殿物	同左	同左
			再分散性*3 (回数)	—	—	良 (1)	良 (1)	良 (1)
			残存率 (%)	—	100.0	97.9	98.4	100.2

*1：製品の電子添文情報より記載

*2：販売中止品

*3：配合検体を5秒間倒立し、次いで5秒間正立する操作を1回として懸濁液が均質に分散するまでの回数を測定し、測定回数が9回までを良、10回以上を不良とした。

(3) 飲食物との配合

試験実施：2014年4月

分類	配合飲食物	配合量	試験項目	配合直後	1時間後	24時間後
飲料	Suntory 天然水	3mL	外観	淡赤白色の懸濁液	淡赤白色の懸濁液に淡赤白色の沈殿物を認めた	無色澄明な液に白色浮遊物があり淡赤白色の沈殿物を認めた
			含量 (%)	100.0	103.6	100.1
	サントリーウーロン茶		外観	帯黄白褐色の懸濁液	帯黄白褐色の懸濁液に白褐色の沈殿物を認めた	帯黄褐色の懸濁液に白褐色の沈殿物を認めた
			含量 (%)	100.0	98.8	103.0
	明治 おいしい牛乳		外観	微赤白色の懸濁液	微赤白色の懸濁液に微赤白色の沈殿物を認めた	微赤白色の懸濁液に淡赤白色の沈殿物を認めた
			含量 (%)	100.0	100.4	99.4
	バンホーテンココア		外観	帯赤白褐色の懸濁液	帯赤白褐色の懸濁液に白褐色の沈殿物を認めた	上層に白褐色澄明の液と中間層に帯白褐色の懸濁液、下層に帯白褐色の沈殿物の下に白褐色の沈殿物を認めた
			含量 (%)	100.0	102.0	105.3
	なっちゃん オレンジ		外観	帯黄淡赤白色の懸濁液	帯黄淡赤白色の懸濁液と淡赤白色の沈殿物を認めた	帯黄色の懸濁液と淡赤白色の沈殿物を認めた
			含量 (%)	100.0	106.8	103.7
	なっちゃん りんご		外観	淡赤白色の懸濁液	淡赤白色の半透明な液と淡赤白色の沈殿物を認めた	微黄色澄明な液と淡赤白色の沈殿物を認めた
			含量 (%)	100.0	100.0	102.6
	アクエリアス		外観	淡赤白色の懸濁液	微赤白色の懸濁液と淡赤白色の沈殿物を認めた	無色澄明の液に白色の浮遊物があり淡赤白色の沈殿物を認めた
			含量 (%)	100.0	99.7	100.3
食品	プッチンプリン	外観	帯黄白褐色の半固形物	同左	同左	
		含量 (%)	100.0	105.2	100.3	
	ハーゲンダッツ バニラ	外観	帯赤白褐色の粘ちような懸濁液	上層：白褐色の粘ちような懸濁液 中下層：帯赤白褐色の粘ちような懸濁液	同左	
		含量 (%)	100.0	102.1	99.4	
	十勝ヨーグルト	外観	微赤白色の半固形物	同左	帯黄色澄明な液と微赤白色の半固形物を認めた	
含量 (%)		100.0	100.0	104.2		

この配合変化試験は、限られた条件下で試験を実施し、アジスロマイシン細粒小児用 10%「トーワ」の安定性を確認したものであり、配合した他剤の安定性は確認していません。

また、配合後の有効性、安全性の評価も行っていないため、配合した他剤との併用を推奨するものではありません。

他剤と配合する際には、各製品の電子添文をご参照ください。

製造販売元

東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号