

△ジスロマック錠 [内], ▼ジスロマック点滴静注用 [注]

【重要度】 【一般製剤名】 アジスロマイシン水和物 (AZM) (U) Azithromycin Hydrate 【分類】 マクロライド系抗生物質 [15 員環]

【単位】 △250mg・▼600mg/錠, ▼500mg/V

【常用量】

▼経口 250mg 錠

深在性皮膚感染症, リンパ管・リンパ節炎, 呼吸器・耳鼻咽喉・歯科系: 1日1回500mg, 3日間

尿道炎, 子宮頸管炎: 1回1000mg 単回

骨盤内炎症性疾患: 注射剤による治療を行った後, 250mg1日1回 [原則7日まで]

▼経口 600mg 錠

マイコバクテリウム・アビウムコンプレックス (MAC): 600mg/日 [EB 併用]

▼点滴静注

1日1回500mg 点滴 [原則5日まで]

【用法】

■錠剤: 3日間投与で有効な組織内濃度が約7日間持続する

■点滴静注: 1日1回, 2hr以上かけて点滴静注 [注射用水で溶解し, 薬物濃度を1mg/mL以下に希釈 (注射部位疼痛を抑制するため)]

末梢血管より2mg/mLの濃度に希釈して投与可能と思われるが, 輸液量を減らす必要のある症例に限定し, 血管炎の観察が必要 (内田裕之, 他: 日化療会誌 61: 256S, 2013)

【透析患者への投与方法】 減量の必要なし (1, サンフォード感染症治療ガイド)

【その他の報告】 データなし (3)

■減量の必要はないが, 点滴静注製剤は1mg/mL以下の濃度に調製する必要があるため輸液負荷が多くなる問題点がある (5)

HD患者のピロリ除菌にCAMの代替として使用しても除菌成功率は変わらなかった (Jalalzadeh M, et al: Nephrourol Mon 2012 PMID: 23573488, Vafaieimaneh J, et al: Saudi J Kidney Dis Transpl 2014 PMID: 24434382)

【保存期 CKD患者への投与方法】 減量の必要なし (1, 3, 12, サンフォード感染症治療ガイド, Ma TKW, et al: Clin Kidney J 7: 507-12, 2014)

【特徴】 15員環マクロライド系抗生物質. 組織移行性が高く半減期が長いため, 3日経口投与で7日間有効濃度を維持する.

【主な副作用・毒性】 ショック, アナフィラキシー, SJS, TEN, DIHS, 偽膜性大腸炎, 出血性大腸炎, 肝障害, 間質性肺炎, 血球減少, 横紋筋融解症, 腎不全, 消化器症状, 感覚器異常など. 過量投与で聴力障害のおそれ.

【吸収】 吸収に及ぼす食事の影響はない (1) 初回通過効果はごくわずか (11) SR-DSは食後2hr以上の空腹時に服用し, 服用後2hrは食事摂取を避ける (1) 消化管系の有害事象の発現率は食後投与に比べ空腹時投与で軽減 (1)

【F】 37% (1, U, 11)

【tmax】 2.1~3.2hr (U) 高齢者で3.8~4.4hr (U) 2.5hr [DS] (1)

【代謝】 尿及び患者の胆汁中代謝物に含まれるのは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 (1) 3'-N脱メチル化にはCYP3A4が関与する可能性 (1) 未変化体の活性と比較した代謝物の活性は, 3'-N脱メチル化体10%, 6-N脱メチル化体50% (1) 35%が主に脱メチル化により代謝 (U)

【排泄】 尿中未変化体排泄率9% [po, 168hrまで] (1) 4.5% [72hrまで] (U) 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 (1) 胆汁中に未変化体として50%排泄 (U) 尿中に, 3'-N脱メチル化体として0.06%, 6-N脱メチル化体として0.03%, 脱クラジノース体として0.67%回収される (1)

【CL】 10mL/min/kg (1)

【t1/2】 61.9~68.1hr (1) 血清で11~14hr, 白血球中で34~57hr, 組織中で2~4日 (U) 40~60hr (11) 66hr [SR] (1)

【蛋白結合率】 12.2~20.3% (1) 12~50% (11) 8~50% (12) 濃度によって変化し, 1μg/mLで7%, 0.02~0.05μg/mLで50% (U)

【Vd】 33.3L/kg (1, U) 18L/kg (12) 31L/kg (11)

【MW】 785.03

【透析性】 Vdが大きいため効率的に除去できないと思われる (5) 資料なし (1)

【TDMのポイント】 TDMの対象にならない. 治療効果と関連するPK/PDパラメータはAUC/MICおよびCmax/MIC (1)

【O/W係数】 0.39 [1-オクタノール/水系, pH7.0] (1)

【相互作用】 SR: ワルファリン [PT-INR上昇], シクロスポリン [濃度上昇], ネルフィナビル [アジスロマイシンの濃度上昇] と併用注意 (1) 酸化Mg [アジスロマイシンの血中濃度低下] (1) ジゴキシンの血中濃度が上昇する可能性 [P-gpを介したジゴキシンの輸送阻害と考えられている] (1) ベネトクラクスの効果が減弱するおそれ (1)

【備考】 一般に注射薬と経口剤の総投与期間は10日以内 (1)

【更新日】 20220310

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。