

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

モノバクタム系抗生物質製剤

日本薬局方 注射用アズトレオナム

アザクタム[®]注射用0.5g

アザクタム[®]注射用1g

Azactam[®] Injection

剤 形	注射剤（凍結乾燥品）
製 剂 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	0.5g : 1バイアル中アズトレオナム0.5g（力価） 1g : 1バイアル中アズトレオナム1g（力価）
一 般 名	和名：アズトレオナム（JAN） 洋名：Aztreonam（JAN）
製 造 販 売 承 認 年 月 日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日： 2026年2月16日（承継による） 薬価基準収載年月日： 1987年3月12日 販 売 開 始 年 月 日： 1987年3月12日
製 造 販 売（輸 入）・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	製造販売元： Meiji Seika ファルマ株式会社
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	
問 い 合 わ せ 窓 口	Meiji Seika ファルマ株式会社 くすり相談室 TEL (0120) 093-396、(03) 3273-3539 FAX (03) 3272-2438 受付時間：9時～17時 (土、日、祝日、その他当社の休業日を除く) 医療関係者向けホームページ https://www.meiji-seika-pharma.co.jp/medical/

本IFは2026年2月改訂（第3版）の電子添文の記載に基づき改訂した。

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。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 ー日本病院薬剤師会ー

(2020年4月改訂)

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。

目次

I. 概要に関する項目	1	6. 製剤の各種条件下における安定性	8
1. 開発の経緯	1	7. 調製法及び溶解後の安定性	8
2. 製品の治療学的特性	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	8
3. 製品の製剤学的特性	1	9. 溶出性	9
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	10. 容器・包装	9
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	(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	9
(1) 承認条件	2	(2) 包装	9
(2) 流通・使用上の制限事項	2	(3) 予備容量	9
6. RMP の概要	2	(4) 容器の材質	9
II. 名称に関する項目	3	11. 別途提供される資材類	9
1. 販売名	3	12. その他	9
(1) 和名	3	V. 治療に関する項目	10
(2) 洋名	3	1. 効能又は効果	10
(3) 名称の由来	3	2. 効能又は効果に関連する注意	10
2. 一般名	3	3. 用法及び用量	10
(1) 和名（命名法）	3	(1) 用法及び用量の解説	10
(2) 洋名（命名法）	3	(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠	10
(3) ステム（stem）	3	4. 用法及び用量に関連する注意	10
3. 構造式又は示性式	3	5. 臨床成績	10
4. 分子式及び分子量	3	(1) 臨床データパッケージ	10
5. 化学名（命名法）又は本質	3	(2) 臨床薬理試験	10
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	(3) 用量反応探索試験	10
III. 有効成分に関する項目	5	(4) 検証の試験	11
1. 物理化学的性質	5	(5) 患者・病態別試験	11
(1) 外観・性状	5	(6) 治療的使用	11
(2) 溶解性	5	(7) その他	12
(3) 吸湿性	5	VII. 薬物動態に関する項目	15
(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点	5	1. 血中濃度の推移	15
(5) 酸塩基解離定数	5	(1) 治療上有効な血中濃度	15
(6) 分配係数	5	(2) 臨床試験で確認された血中濃度	15
(7) その他の主な示性値	5	(3) 中毒域	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性	6	(4) 食事・併用薬の影響	16
3. 有効成分の確認試験法、定量法	6	2. 薬物速度論的パラメータ	17
IV. 製剤に関する項目	7	(1) 解析方法	17
1. 剤形	7	(2) 吸収速度定数	17
(1) 剤形の区别	7	(3) 消失速度定数	17
(2) 製剤の外観及び性状	7	(4) クリアランス	17
(3) 識別コード	7	(5) 分布容積	17
(4) 製剤の物性	7	(6) その他	17
(5) その他	7	3. 母集団（ポピュレーション）解析	17
2. 製剤の組成	7	(1) 解析方法	17
(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添 加剤	7	(2) パラメータ変動要因	17
(2) 電解質等の濃度	7		
(3) 熱量	7		
3. 添付溶解液の組成及び容量	7		
4. 力価	7		
5. 混入する可能性のある夾雑物	7		

4. 吸収	17	2. 毒性試験.....	32
5. 分布	17	(1) 単回投与毒性試験.....	32
(1) 血液-脳関門通過性	17	(2) 反復投与毒性試験.....	32
(2) 血液-胎盤関門通過性	18	(3) 遺伝毒性試験.....	32
(3) 乳汁への移行性	18	(4) がん原性試験.....	32
(4) 髄液への移行性	18	(5) 生殖発生毒性試験.....	32
(5) その他の組織への移行性.....	18	(6) 局所刺激性試験.....	32
(6) 血漿蛋白結合率	19	(7) その他の特殊毒性.....	33
6. 代謝	19	X. 管理的事項に関する項目.....	34
(1) 代謝部位及び代謝経路	19	1. 規制区分.....	34
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分 子種、寄与率	19	2. 有効期間.....	34
(3) 初回通過効果の有無及びその割合.....	19	3. 包装状態での貯法.....	34
(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存 在比率	19	4. 取扱い上の注意.....	34
7. 排泄	20	5. 患者向け資材.....	34
8. トランスポーターに関する情報.....	21	6. 同一成分・同効薬.....	34
9. 透析等による除去率	21	7. 国際誕生年月日.....	34
10. 特定の背景を有する患者.....	22	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	35
11. その他	22	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.....	35
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目.....	23	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びそ の内容.....	35
1. 警告内容とその理由	23	11. 再審査期間.....	35
2. 禁忌内容とその理由	23	12. 投薬期間制限に関する情報.....	35
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由..	23	13. 各種コード.....	35
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由..	23	14. 保険給付上の注意.....	35
5. 重要な基本的注意とその理由.....	23	XI. 文献.....	36
6. 特定の背景を有する患者に関する注意....	24	1. 引用文献.....	36
(1) 合併症・既往歴等のある患者.....	24	2. その他の参考文献.....	37
(2) 腎機能障害患者	24	XII. 参考資料.....	38
(3) 肝機能障害患者	24	1. 主な外国での発売状況.....	38
(4) 生殖能を有する者	24	2. 海外における臨床支援情報.....	38
(5) 妊婦	24	XIII. 備考	40
(6) 授乳婦	24	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.....	40
(7) 小児等	25	(1) 粉砕.....	40
(8) 高齢者	25	(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ の通過性.....	40
7. 相互作用	25	2. その他の関連資料.....	40
(1) 併用禁忌とその理由	25		
(2) 併用注意とその理由	25		
8. 副作用	26		
(1) 重大な副作用と初期症状.....	26		
(2) その他の副作用	26		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	30		
10. 過量投与	31		
11. 適用上の注意	31		
12. その他の注意	31		
(1) 臨床使用に基づく情報	31		
(2) 非臨床試験に基づく情報.....	31		
IX. 非臨床試験に関する項目	32		
1. 薬理試験	32		
(1) 薬効薬理試験	32		
(2) 安全性薬理試験	32		
(3) その他の薬理試験	32		

略語表

略語	略語内容
A1-P	アルカリフォスファターゼ
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
AUC	血漿中濃度一時間曲線下面積
BUN	血液尿素窒素
γ -GTP	ガンマーグルタミルトランスフェラーゼ
kel	消失速度定数
LAP	ロイシンアミノペプチダーゼ
LDH	乳酸脱水素酵素
$t_{1/2}$	消失半減期
Vd	分布容積

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

1928年、英国のフレミングがペニシリンを発見して以来、数多くのペニシリン系、セフェム系抗生素が開発されてきた。

しかし、今なお β -ラクタマーゼに対する安定性、グラム陰性菌、特に緑膿菌、セラチア等に対する抗菌力、難治性感染症に対する治療効果など多くの未解決の問題が残されている。

これらの細菌感染症をめぐる今日的課題に対し、世界的規模で研究開発が進められてきた。

米国、スクイブ医学研究所は、抗生物質產生微生物として細菌に注目し、100万種以上の細菌産生物をスクリーニングした結果、グラム陰性菌に抗菌力を示し、 β -ラクタマーゼに安定な β -ラクタム単環分子を確認した。従来の二環系のペニシリン系やセフェム系とは異なり、細菌由来の単環系 β -ラクタム抗生物質であることから、モノバクタム（モノサイクリック構造を有するバクテリア起源の β -ラクタム）と総称した。さらに、天然モノバクタムの基本骨格を化学的に修飾し、緑膿菌を含む広範囲のグラム陰性菌に強い抗菌力を示し、 β -ラクタマーゼに極めて安定なアズトレオナム（AZT）を発見した。また、1980年には全化学合成にも成功した。

AZTはグラム陰性菌、特に、大腸菌、ショロバクター属、クレブシェラ属、プロテウス属、モルガネラ・モルガニー、プロビデンシア属、セラチア属、エンテロバクター属、緑膿菌、インフルエンザ菌に対して強い抗菌力を示し、殺菌的に作用することが確認された。また、並行して実施した非臨床試験において安全性が確認され、1981年、第12回国際化學療法学会にて発表された。

その後、米国をはじめ各国で有効性、安全性の確認が行われ、日本でも1982年より研究を開始し、同様な有効性と安全性を確認し、発売に至ったものである。

なお、本剤は1996年3月7日に再審査が終了し、その結果により「未熟児、新生児の用法・用量」を追加した。

2026年2月、Meiji Seika ファルマ株式会社がエーザイ株式会社より製造販売承認を承継した。

2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は大腸菌から緑膿菌まで、グラム陰性菌に幅広い抗菌スペクトルを有し、その作用は殺菌的である。本剤は各種細菌の產生する β -ラクタマーゼに対して安定であり、また、 β -ラクタマーゼ產生誘導能もほとんど認められていない。（「VI. 2. 藥理作用」の項参照）
- (2) 本剤は高い血中濃度を示し、半減期は健康成人の場合約1.85時間である。生体内ではほとんど代謝されることなく、主として尿中に排泄される。また、胆汁、喀痰、子宮・子宮付属器、髄液等各種の体液、組織への移行性も確認されている。（「VII. 1. (1) 治療上有効な血中濃度」、「VII. 5. 分布」、「VII. 6. (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照）
- (3) 臨床的には、グラム陰性菌による敗血症、呼吸器感染症、尿路感染症、胆道感染症、腹腔内感染症、産婦人科領域感染症、化膿性髄膜炎、耳鼻科領域感染症等に有用性が認められている。（「V. 5. 臨床成績」の項参照）
- (4) 重大な副作用：ショック、急性腎不全、大腸炎、中毒性表皮壊死融解症、溶血性貧血があらわれることがある。（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

該当しない

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

（2026年2月現在）

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

アザクタム[®]注射用 0.5g

アザクタム[®]注射用 1g

(2) 洋名

Azactam[®]Injection 0.5g

Azactam[®]Injection 1g

以下、販売名の「[®]」は省略する。

(3) 名称の由来

Azetidine (β -ラクタム環の別称) と monobactam の合成語

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

アズトレオナム (JAN)

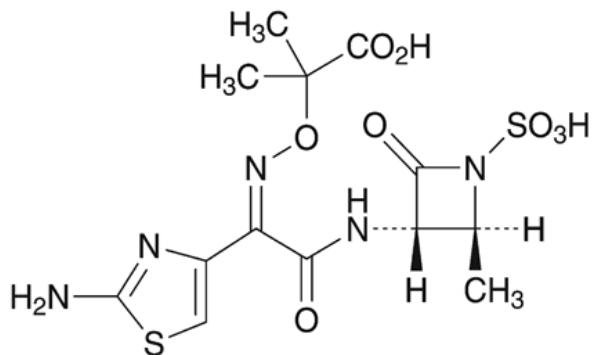
(2) 洋名 (命名法)

Aztreonam (JAN)

(3) ステム (stem)

-monam : monobactam antibiotics¹⁾

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : C₁₃H₁₇N₅O₈S₂

分子量 : 435.43

5. 化学名 (命名法) 又は本質

2-{(Z)-[(2-Aminothiazol-4-yl)-[(2S,3S)-2-methyl-4-oxo-1-sulfoazetidin-3-ylcarbamoyl]methyleneaminoxy]-2-methyl-1-propanoic acid}

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号 : AZT

治験番号 : SQ26, 776、E-0734

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

本品は白色～帯黄白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

本品はジメチルスルホキシドに溶けやすく、水又はメタノールに溶けにくく、エタノール(95)に極めて溶けにくい。

表III-1 溶解性

溶媒	本品 1g を溶かすのに必要な溶媒量 (mL)
水	120
メタノール	600
エタノール (95)	6000

(3) 吸湿性

25°Cで 11～93%相対湿度に 7 日間放置したときの重量変化は -0.6～+0.8%であり、93%相対湿度の高湿度下でも +0.8% のわずかな増加であった。

(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点

温度を上げていくと 210°C付近から褐色を帯びはじめ、220°Cに至っても黒変するのみで融解せず、また明確な分解点も示さない。

(5) 酸塩基解離定数

pKa₁=-0.1 (スルホン酸)

pKa₂=2.7 (カルボン酸)

pKa₃=3.3 (アミン)

(溶解度法で測定した。)

(6) 分配係数

n-ブタノール/水系での分配係数は全般的に小さく、酸性側でわずかに大きくなる。クロロホルム/水系及びイソオクタン/水系では全く有機層へ分配されなかった。

(7) その他の主な示性値

1) 旋光度 $[\alpha]_D^{20} : -26^\circ \sim -32^\circ$ (脱水物に換算したもの 0.25g、水、50mL、100mm)

2) pH : 本品 0.05g を水 10mL に溶かした液の pH は 2.2～2.8 である。

2. 有効成分の各種条件下における安定性

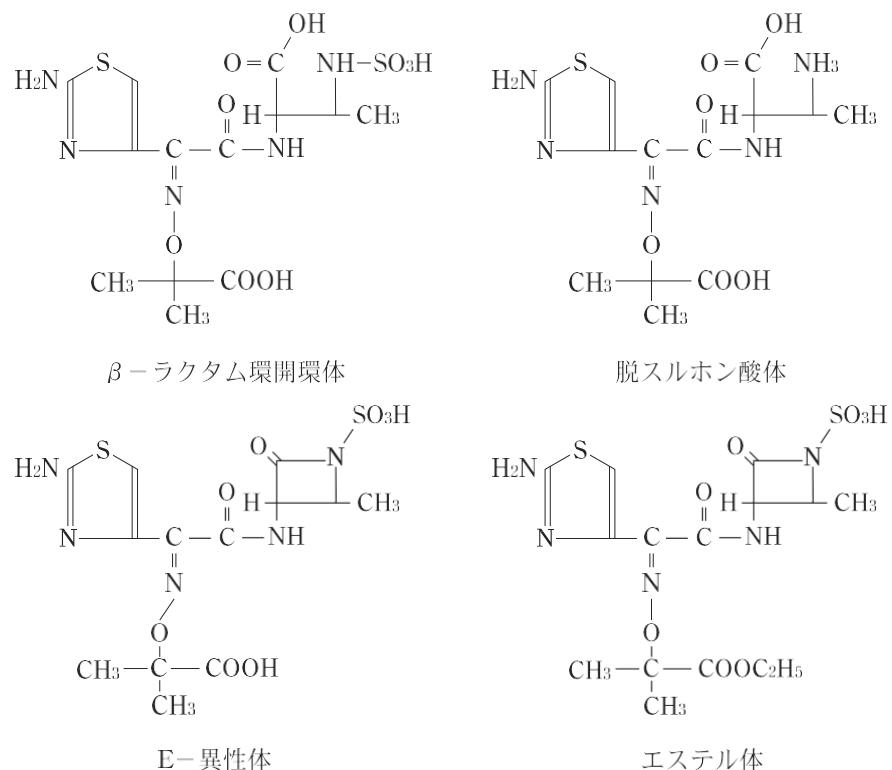
(1) 安定性

表III-2 安定性

試験方法	保存条件	保存期間	保存形態	測定項目	結果
苛 酷 試 驗	温度	60°C	3カ月	無色ガラスバイアル瓶 遮光	1カ月後、黄色味を帯び、淡黄白色を呈した。 変化は認められなかった。 変化は認められなかった。 変化は認められなかった。
		40°C	6カ月		
	湿度	40°C 80%RH	28日	開放ガラスビーカー 遮光	
	光	1,000lx	75日	無色ガラスバイアル瓶	
	長期保存試験	室温	39カ月	褐色ガラス瓶密封	

(2) 苛酷試験による主な反応生成物

アズトレオナムの固体状態及び溶液状態における熱、pH 及び光による分解物又は異性化物は次の 4種類である。



3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法：

(日局アズトレオナムの確認試験法による)

紫外可視吸光度測定法

核磁気共鳴スペクトル測定法

定量法：

(日局アズトレオナムの定量法による)

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

本剤は用時溶解して用いる注射剤（凍結乾燥品）である。

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	性状	色
アザクタム注射用 0.5g	塊又は粉末（凍結乾燥品）	
アザクタム注射用 1g	用時溶解して用いる注射剤	白色～黄白色

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

本剤を日本薬局方注射用水に溶解したときの pH 及び浸透圧比は次のとおりである。

pH : 4.5～7.0 [1g（力価）/10mL 日本薬局方注射用水]

浸透圧比：（生理食塩液に対する比）：約 1.6 [1g（力価）/10mL 日本薬局方注射用水]

安定な pH 域：pH2～8（25°C、72 時間まで）

(5) その他

バイアル内は窒素置換されており、ほぼ常圧（微陰圧）である。

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	有効成分（1 バイアル中）	添加剤（1 バイアル中）
アザクタム注射用 0.5g	日局アズトレオナム 0.5g（力価）	L-アルギニン 0.405g
アザクタム注射用 1g	日局アズトレオナム 1g（力価）	L-アルギニン 0.81g

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

本剤の力価は、アズトレオナム ($C_{13}H_{17}N_5O_8S_2$) としての重量（力価）で示す。

標準アズトレオナム 1mg は、1mg（力価）に対応する。

5. 混入する可能性のある夾雑物

「III. 2. (2) 苛酷試験による主な反応生成物」の項参照

6. 製剤の各種条件下における安定性

表IV-1 アザクタム注射用 0.5g の各種条件下における安定性

試験方法		保存条件	保存形態	保存期間	測定項目	結果
長期保存		25°C /60%RH	ガラスバイアル+UVカットフィルム+紙箱	36 カ月	性状 pH 溶状 水分 力価	いずれの測定項目においても規格内であった。
加速		40°C /75%RH	ガラスバイアル+UVカットフィルム+紙箱	6 カ月	性状 pH 溶状 水分 力価	いずれの測定項目においても規格内であった。
苛酷	温度	60°C	ガラスバイアル	3 カ月	性状 pH 水分 力価	いずれの測定項目においても規格内であった。
開封後	光	2 万 lx	ガラスバイアル	60 時間※		60 万 lx·hr で光照射面がわずかに褐変し、溶状も黄変した。その他の測定項目においては規格内であった。

※ : キセノンランプを 60 時間 (120 万 lx·hr、総近紫外放射エネルギー 200W·h/m²) 照射

表IV-2 アザクタム注射用 1g の各種条件下における安定性

試験方法		保存条件	保存形態	保存期間	測定項目	結果
長期保存		室温	ガラスバイアル+UVカットフィルム+紙箱	36 カ月	性状 pH 水分 力価	いずれの測定項目においても規格内であった。
加速		40°C /75%RH	ガラスバイアル+UVカットフィルム	6 カ月	性状 pH 溶状 水分 力価	いずれの測定項目においても規格内であった。
苛酷	温度	60°C	ガラスバイアル	3 カ月	性状 pH 水分 力価	いずれの測定項目においても規格内であった。
開封後	光	2 万 lx	ガラスバイアル	60 時間※		60 万 lx·hr で光照射面がわずかに褐変し、溶状も黄変した。その他の測定項目においては規格内であった。

※ : キセノンランプを 60 時間 (120 万 lx·hr、総近紫外放射エネルギー 200W·h/m²) 照射

7. 調製法及び溶解後の安定性

「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）

L-システインを含む総合アミノ酸補液と配合して使用する場合は、継時的に含量（力価）が低下するので、用時調製し、溶解後は速やかに使用すること^{2)~4)}。

表IV-3 pH 変動試験

全量(力値) 容量	規格 pH	試料 pH	1/10mol/L塩酸 mL(A) 1/10mol/L水酸化ナトリウム mL(B)	最終pH又は 変化点pH	移動指數	変化所見
※ 4.5~7.5	1g(力値) 20mL	5.04	(A) 10.00	4.11	0.93	変化なし
			(B) 10.00	8.60	3.56	"
	1g(力値) 10mL	5.00	(A) 10.00	4.06	0.94	"
			(B) 10.00	8.69	3.69	"
	0.5g(力値) 10mL	5.10	(A) 10.00	3.61	1.49	"
			(B) 10.00	9.15	4.05	"
	0.5g(力値) 5mL	5.14	(A) 10.00	4.10	1.04	"
			(B) 10.00	8.70	3.56	"

※100mg(力値)/mL溶液

9. 溶出性

該当しない

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

アザクタム注射用 0.5g : 10 バイアル

アザクタム注射用 1g : 10 バイアル

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

容器 : 無色ガラスバイアル

UVカットシュリンクフィルム : ポリ塩化ビニル

ゴム栓 : 塩素化ブチルゴム

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

〈適応菌種〉

本剤に感性の淋菌、髄膜炎菌、大腸菌、シトロバクター属、クレブシエラ属、エンテロバクタ一属、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、綠膿菌

〈適応症〉

敗血症、肺炎、肺膿瘍、慢性呼吸器病変の二次感染、膀胱炎、腎孟腎炎、前立腺炎（急性症、慢性症）、尿道炎、子宮頸管炎、腹膜炎、腹腔内膿瘍、胆囊炎、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、化膿性髄膜炎、角膜炎（角膜潰瘍を含む）、中耳炎、副鼻腔炎

2. 効能又は効果に関する注意

5. 効能・効果に関する注意

〈中耳炎、副鼻腔炎〉

「抗微生物薬適正使用の手引き」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⁵⁾。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

通常、成人には、1日 1～2g（力価）を2回に分けて静脈内注射、点滴静注又は筋肉内注射する。ただし、通常、淋菌感染症及び子宮頸管炎には、1日 1回 1～2g（力価）を筋肉内注射又は静脈内注射する。

通常、小児には、1日 40～80mg（力価）／kg を2～4回に分けて静脈内注射又は点滴静注する。なお、年齢、症状に応じて適宜増減するが、難治性又は重症感染症には、成人では1日量 4g（力価）まで增量し 2～4回に分けて投与し、小児では1日量 150mg（力価）／kg まで增量し 3～4回に分けて投与する。

通常、未熟児、新生児には、1回 20mg（力価）／kg を生後 3 日までは1日 2回、4日以降は1日 2～3回静脈内注射又は点滴静注する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

健康成人男子において、本剤を単回静脈内投与、連続静脈内投与及び単回筋肉内投与した際の、生理機能検査、自覚症状及び臨床検査所見を確認したところ、本剤の忍容性が認められた⁶⁾。

(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

比較臨床試験

グラム陰性菌による呼吸器感染症及び複雑性尿路感染症を対象とした比較臨床試験により本剤の有用性が認められている^{7), 8)}。

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

該当しない^{注)}

注) 「新医薬品等の再審査の申請のために行う使用の成績等に関する調査の実施方法に関するガイドライン」（平成 5 年 6 月 28 日薬安第 54 号）、「医療用医薬品の使用成績調査等の実施方法に関するガイドライン」（平成 9 年 3 月 27 日薬安第 34 号）又は「医療用医薬品の市販直後調査等の実施方法に関するガイドラインについて」（平成 12 年 12 月 27 日医薬安第 166 号、医薬審第 1810 号）に基づいて実施していないため、本項目には記載しない。ただし、使用成績調査による副作用発現頻度については「VIII. 8. 副作用」を参照のこと。

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

一般臨床試験

2,459例についての一般臨床試験の成績概要は次表のとおりである^{9)～18)}。

表V-1 一般臨床試験

疾患名		効果判定 症例数	有効率(%)
敗血症		16/26	61.5
呼吸器感染症	肺炎	187/257	72.2
	肺膿瘍	8/15	53.3
	慢性呼吸器病変の二次感染	148/223	66.4
尿路感染症	膀胱炎	224/363	61.7
	腎盂腎炎	169/240	70.4
	前立腺炎(急性症、慢性症)	13/18	72.2
	尿道炎	294/319	92.2
腹腔内感染症	腹膜炎	90/109	82.6
	腹腔内膿瘍	2/2	100
胆道感染症	胆囊炎	71/79	89.9
	胆管炎	28/45	62.2
産婦人科領域 感染症	バルトリン腺炎	21/23	91.3
	子宮頸管炎	41/41	100
	子宮内感染	66/76	86.8
	子宮付属器炎	39/45	86.7
	子宮旁結合織炎	23/28	82.1
化膿性髄膜炎 ^{注)}		12/12	100
眼科領域感染症	角膜炎(角膜潰瘍を含む)	4/4	100
耳鼻科領域感染症	中耳炎	37/57	64.9
	副鼻腔炎	18/35	51.4

注) 化膿性髄膜炎の治験12例(生後2ヵ月から8年11ヵ月までの患者)の1日投与量は134～400mg(力価)/kgであった¹⁸⁾。本剤の小児に対する承認最大1日投与量は150mg(力価)/kgである。

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

β-ラクタム系抗生物質

注意：関連のある化合物の效能・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

感受性細菌のペニシリン結合蛋白（PBP）のうち、特に PBP3 に高い結合親和性を有し、細胞壁合成阻害により強い殺菌作用を示す。

また、グラム陰性菌の外膜に対する透過性も良好である^{19)～21)}。

1) 好気性グラム陰性菌に対する抗菌スペクトル¹⁹⁾

菌株	接種菌量 10 ⁶ cells/mL			
	AZT	LMOX	CMX	CPZ
<i>Neisseria gonorrhoeae</i> ^{注 1)}	0.012	0.012*	≤0.006*	≤0.006*
<i>Neisseria meningitidis</i> ^{注 1)}	0.025	≤0.006*	0.012*	0.025*
<i>Haemophilus influenzae</i> N-36	0.025	0.025	0.012	0.025
<i>Escherichia coli</i> NIH JC-2	0.20	0.20	0.10	0.20
<i>Escherichia coli</i> K-12	0.025	0.10	0.012	0.012
<i>Citrobacter freundii</i> NIH 10018-68	0.78	0.39	0.39	1.56
<i>Klebsiella pneumoniae</i> KC-1	0.025	0.10	0.025	0.20
<i>Klebsiella pneumoniae</i> NCTC 9632	0.012	0.10	0.025	0.05
<i>Enterobacter cloacae</i> NCTC 9394	0.10	0.20	0.20	0.78
<i>Enterobacter aerogenes</i>	0.025	0.10	0.025	0.20
<i>Enterobacter aerogenes</i> NCTC 10006	0.10	0.39	0.20	0.39
<i>Serratia marcescens</i> IFO 3736	0.05	0.20	0.05	0.39
<i>Proteus vulgaris</i> OX-19	≤0.006	0.20	≤0.006	0.012
<i>Proteus mirabilis</i> 1287	≤0.006	0.10	≤0.006	0.10
<i>Proteus morganii</i> KONO	0.012	0.10	0.025	3.13
<i>Proteus rettgeri</i> NIH 96	≤0.006	0.012	≤0.006	≤0.006
<i>Proteus constans</i> NIH 118	≤0.006	0.10	0.012	0.39***
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> No. 12	3.13	25**	25**	6.25
<i>Pseudomonas aeruginosa</i> NC-5	0.20	1.56**	1.56**	0.20

培地：Heart Infusion Agar (Nissui) を用い、MIC を測定。

MIC (μg/mL)

注 1) *Neisseria* spp. には GC 培地を用いローソク培養法により MIC を測定。

LMOX : ラタモキセフ、CMX : セフメノキシム、CPZ : セフオペラゾン

*LMOX、CMX 及び CPZ の承認外菌種

**LMOX、CMX の承認外菌種 (ただし、CMX 外用・点眼では承認菌種)

***CPZ の承認外菌種

2) MBC

本剤の MIC 及び MBC の比較を臨床分離 *E. coli* 5 株、*P. aeruginosa* 4 株を用いて検討した結果、本剤の MIC と MBC は全て一致した²²⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) 緑膿菌を含むグラム陰性菌に対する抗菌作用

大腸菌、シトロバクター属、クレブシエラ属、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、淋菌、髄膜炎菌に対して強い抗菌力を示し、さらに、多くの β-ラクタム系抗生物質に抵抗を示す緑膿菌、セラチア属、エンテロバクター属にもすぐれた抗菌力を有する^{19)、20)、22)～24)}。

2) β -ラクタマーゼに対する安定性及びその產生誘導能

各種細菌の產生する β -ラクタマーゼに対して安定であり、 β -ラクタマーゼ產生グラム陰性菌にも強い抗菌作用を示す。また、 β -ラクタマーゼ產生誘導能もほとんど認められていない^{20), 22)~24)}。

(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

感染部位、起炎菌の感受性により異なる。

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

1) 静脈内注射

健康成人 5 名に本剤 1g (力価) を単回静脈内注射した場合、投与 5 分後の平均血清中濃度は 130.6 $\mu\text{g}/\text{mL}$ と高値を示し、半減期は 1.85 時間であった。また、健康成人 3~5 名に本剤 0.5、2g (力価) を単回静脈内注射した場合、投与 5 分後の平均血清中濃度はそれぞれ 70.7、256.0 $\mu\text{g}/\text{mL}$ を示し、投与量にはほぼ比例していた⁶⁾。

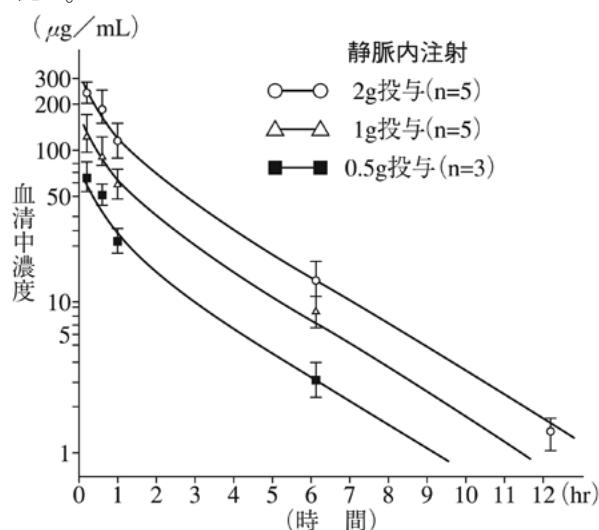


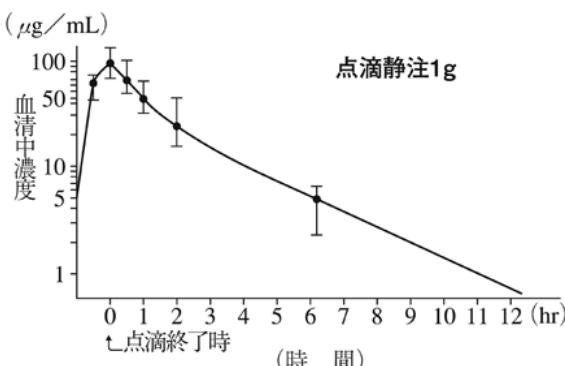
図 1 本剤 0.5~2g 単回静脈内投与後の平均血清中濃度

表VII-1 本剤 0.5~2g 単回静脈内投与後の薬物動態パラメータ

投与量 定数	0.5g (n=3)	1g (n=5)	2g (n=5)
$t_{1/2}$ (h)	1.76	1.85	1.63
AUC ($\mu\text{g} \cdot \text{h}/\text{mL}$)	99.0	222	389
Vd (L)	15.9	13.1	13.6

2) 点滴静注

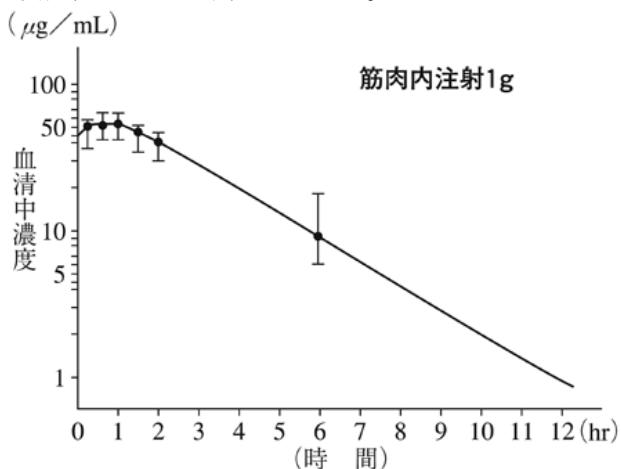
健康成人 5 名に本剤 1g (力価) を 1 時間で点滴静注した場合、平均血清中濃度は点滴終了直後に最高値 93.4 $\mu\text{g}/\text{mL}$ であった。以後の血清中濃度の推移は静脈内注射と同様であった⁶⁾。



図VII-2 本剤 1g 単回点滴静注後の平均血清中濃度

3) 筋肉内注射

健康成人 5 名に本剤 1g (力価) を単回筋肉内注射した場合、平均血清中濃度は投与 40 分後に最高値 $66.3 \mu\text{g/mL}$ を示し、半減期は 2.01 時間であった⁶⁾。



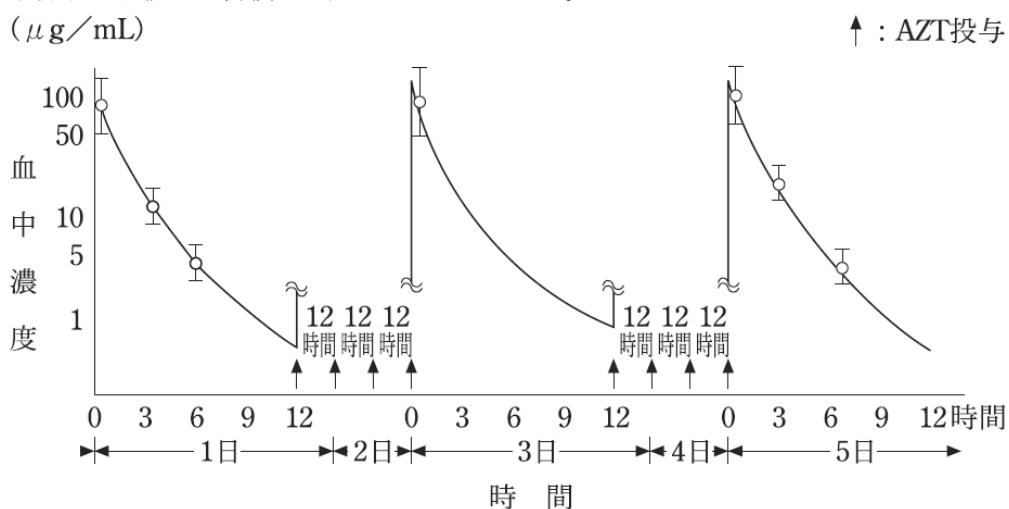
図VII-3 本剤 1g 単回筋肉内注射後の平均血清中濃度

表VII-2 本剤 1g 単回筋肉内注射後の薬物動態パラメータ

$k_{el} (\text{hr}^{-1})$	$t_{1/2} (\text{hr})$	$AUC (\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL})$	$C_{max} (\mu\text{g}/\text{mL})$	$t_{max} (\text{hr})$
0.344	2.01	229.71	66.3	0.333~1

4) 反復投与

健康成人 6 名に本剤 1g (力価) を 12 時間毎、連続 9 回 (5 日間) 静脈内注射しても、血清中濃度及び尿中排泄の推移から蓄積性は認められていない⁶⁾。



図VII-4 反復投与後の血清中濃度

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

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

静注 0.716hr^{-1} (健康成人男子 5 名に AZT 1g を単回静注)⁶⁾

筋注 0.344hr^{-1} (健康成人男子 5 名に AZT 1g を単回静注)⁶⁾

(4) クリアランス

[外国のデータ]

静注 $1.53\text{mL}/\text{min}/\text{kg}$ (健康成人男子 4 名に AZT 0.5g を単回静注)²⁵⁾

筋注 $1.46\text{mL}/\text{min}/\text{kg}$ (健康成人男子 4 名に AZT 0.5g を単回筋注)²⁵⁾

(5) 分布容積

静注 13.1L (健康成人男子 5 名に AZT 1g を単回静注)⁶⁾

(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

バイオアベイラビリティ

[外国のデータ]

筋注 101% (健康成人男子 4 名に AZT 0.5g を単回静注又は筋注した際の AUC 比より算出)²⁵⁾

吸収部位：注射部位より吸収される。

（参考）

各種動物に AZT 20mg/kg を静脈内投与したときの血清中濃度推移はイヌで最も高く、次いでサル、ウサギ、ラットの順で、大型動物になるほど持続性を示した。

その生物学的半減期はラットで 14.2 分、ウサギで 28.5 分、サルで 55.6 分、またイヌでは 60.5 分であった。これらの動物種での半減期は、いずれもヒトにおける半減期約 100 分に比べて短く、動物種によって血中動態に差がみられた²⁶⁾。

5. 分布

(1) 血液一脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液-胎盤関門通過性

分娩前の妊婦 32 名に本剤 1g を単回静脈内投与し、分娩時の母体血清、臍帯血、羊水中及び新生児血中濃度を検討した。臍帯血では投与後 35 分に $47 \mu\text{g/mL}$ のピーク値を示したが、母体血清のピーク値 $94 \mu\text{g/mL}$ よりも低値であり、投与後 2 時間以降は母体血清と同様の推移を示した。羊水中では投与後 2 時間以降にピークがみられ、約 8 時間後に $18 \mu\text{g/mL}$ とピークを示した。新生児残存血中濃度は、出生後 3 時間で $0.34\sim0.72 \mu\text{g/mL}$ を示し、以降緩やかに低下した²⁷⁾。

(3) 乳汁への移行性

本剤 1g 単回静脈内投与後の乳汁中濃度は投与 3 時間後にピークに達し、平均 $0.56 \mu\text{g/mL}$ を示した(5 例)。以降緩やかに低下し、投与 6 時間後では平均 $0.25 \mu\text{g/mL}$ であった²⁷⁾。

(4) 髄液への移行性

化膿性髄膜炎の小児(1 歳 11 カ月)に本剤 50mg/kg 静脈内投与した際、投与 1 時間後の髄液中濃度は $9.0 \mu\text{g/mL}$ (11 病日) を示した。また、経時的に髄液中濃度を検討した小児 2 例(42mg/kg 及び 100mg/kg 投与例)のピーク値は約 $7.0 \mu\text{g/mL}$ (それぞれ 4 及び 7 病日目) であった²⁸⁾。

(5) その他の組織への移行性

患者の喀痰、胆汁、腹腔内浸出液、髄液、骨盤死腔浸出液、眼房水等の体液中への移行性及び胆囊組織、前立腺組織、子宮・子宮付属器各組織、中耳粘膜等への移行性は良好である^{16), 28)~31)}。

1) 喀痰中移行

本剤を 1 時間点滴静脈内投与したとき、喀痰中濃度のピーク到達時間は症例により差がみられたが、1g 投与時のピーク値は $0.63\sim5.20 \mu\text{g/mL}$ 、移行率は 1.12~4.73%、2g 投与時ではそれぞれ $10.4 \mu\text{g/mL}$ 、7.6% であった^{10), 32)}。

2) 腹腔内浸出液移行

胃癌手術後の症例 4 例に本剤 1 回 1g を 1 日 2 回点滴静脈内投与し、24 時間毎に 3 日間腹腔内浸出液中の濃度を測定した結果、1、2、3 日目の平均濃度はそれぞれ 7.77 、 7.00 、 $5.03 \mu\text{g/mL}$ であった³⁰⁾。

3) 骨盤死腔浸出液中移行

子宮全摘術 53 例に本剤 1g 単回静脈内投与又は 1 時間点滴静脈内投与し、骨盤死腔浸出液中濃度を検討した。

静脈内投与では投与後 1.48 時間で $21.1 \mu\text{g/mL}$ のピーク値を示した。点滴静脈内投与は点滴終了 0.17 時間後にピーク値 $20.9 \mu\text{g/mL}$ に達した¹⁴⁾。

4) 胆囊組織内濃度

本剤 1g 単回静脈内投与後 15~90 分における胆囊組織内濃度は $0.6\sim16.4 \mu\text{g/g}$ 、平均 $8.3 \mu\text{g/g}$ (12 例) であった。また、投与後 2 時間では $0.68\sim96.9 \mu\text{g/g}$ 、平均 $13.4 \mu\text{g/g}$ (19 例) であった^{11), 33)}。

5) 前立腺組織内濃度

前立腺肥大症の切除術施行予定患者 16 例に本剤 1g を単回静脈内投与した。投与 35~200 分後の前立腺組織内濃度は $5.84\sim40.65 \mu\text{g/g}$ 、平均 $19.57 \mu\text{g/g}$ であり、血中濃度からみた移行率は 28.2% (16 例) であった³¹⁾。

6) 子宮・子宮付属器組織内濃度

本剤 1g を単回静脈内又は 1 時間点滴静脈内投与後の子宮各組織内濃度を検討した。

静脈内投与では子宮各組織内濃度は投与後 6~20 分でピークとなり、その濃度は子宮内膜 ($25.0 \mu\text{g/g}$)、筋層 ($23.1 \mu\text{g/g}$)、頸部 ($31.8 \mu\text{g/g}$)、腔部 ($39.4 \mu\text{g/g}$)、卵管 ($29.0 \mu\text{g/g}$) 及び卵巣 ($20.5 \mu\text{g/g}$) であった。以後血中濃度とともに減少し、7~8 時間後にはいずれの部位の濃度も $1\sim2 \mu\text{g/g}$ であった。

点滴静脈内投与では卵巣以外は投与終了直後にピークに達し、その濃度は子宮内膜 ($15.1 \mu\text{g/g}$)、筋層 ($19.7 \mu\text{g/g}$)、頸部 ($22.3 \mu\text{g/g}$)、腔部 ($28.1 \mu\text{g/g}$) 及び卵管 ($22.0 \mu\text{g/g}$) であった。卵巣では投与終了後 15 分に $17.0 \mu\text{g/g}$ のピーク値を示したが、いずれも 5 時間以降は $1\sim2 \mu\text{g/g}$ に減少した¹⁴⁾。

7) 中耳粘膜移行濃度

慢性化膿性中耳炎患者に、本剤 1g を単回静脈内投与した。1 時間後の中耳粘膜移行濃度は 5.21~8.82 μg/g、平均 7.52 μg/g (2 例 3 耳) であった¹⁶⁾。

(参考)³⁴⁾

表VII-3 雄ラットに ¹⁴C-AZT 20mg/kg/日を 7 日間連続静脈内投与した際の臓器内 AZT 濃度

臓器	濃度 (μg eq. of AZT/g or mL)			
	単回投与	3 回投与	7 回投与	
	投与後 24 時間	投与後 24 時間	投与後 24 時間	投与後 72 時間
血漿	0.11±0.00	0.24±0.01	0.31±0.02	0.17±0.02
脳	N.D.	N.D.	N.D.	N.D.
心臓	N.D.	0.08±0.04	0.18±0.01	N.D.
肺	0.15±0.01	0.40±0.04	0.74±0.02	0.32±0.01
肝臓	0.70±0.07	1.72±0.22	1.54±0.05	0.65±0.02
脾臓	0.06±0.03	0.20±0.02	0.29±0.01	0.21±0.02
膵臓	0.12±0.02	0.20±0.02	0.27±0.03	0.13±0.02
腎臓	4.22±0.19	9.27±0.30	12.95±1.09	7.90±0.83
骨髓	N.D.	0.08±0.04	0.11±0.06	N.D.
膀胱	0.39±0.11	0.47±0.12	0.72±0.04	0.75±0.24
脊髄	N.D.	N.D.	0.04±0.02	N.D.
気管	N.D.	0.25±0.03	0.51±0.03	0.25±0.03

N. D. ; 検出不能、3~4 例の平均値±S.E.

(Mean±S.E.)

(6) 血漿蛋白結合率

表VII-4 血清蛋白結合率³⁵⁾

薬剤濃度 (μg/mL)	血清蛋白結合率 (%)
100	55.7
10	52.6

n=3

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

生体内ではほとんど代謝されず、主に尿中に排泄される。しかし、ごく一部が代謝され水解物を生じる²⁵⁾。

(2) 代謝に関する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

該当資料なし

(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

代謝物は、抗菌活性を示さない。

7. 排泄

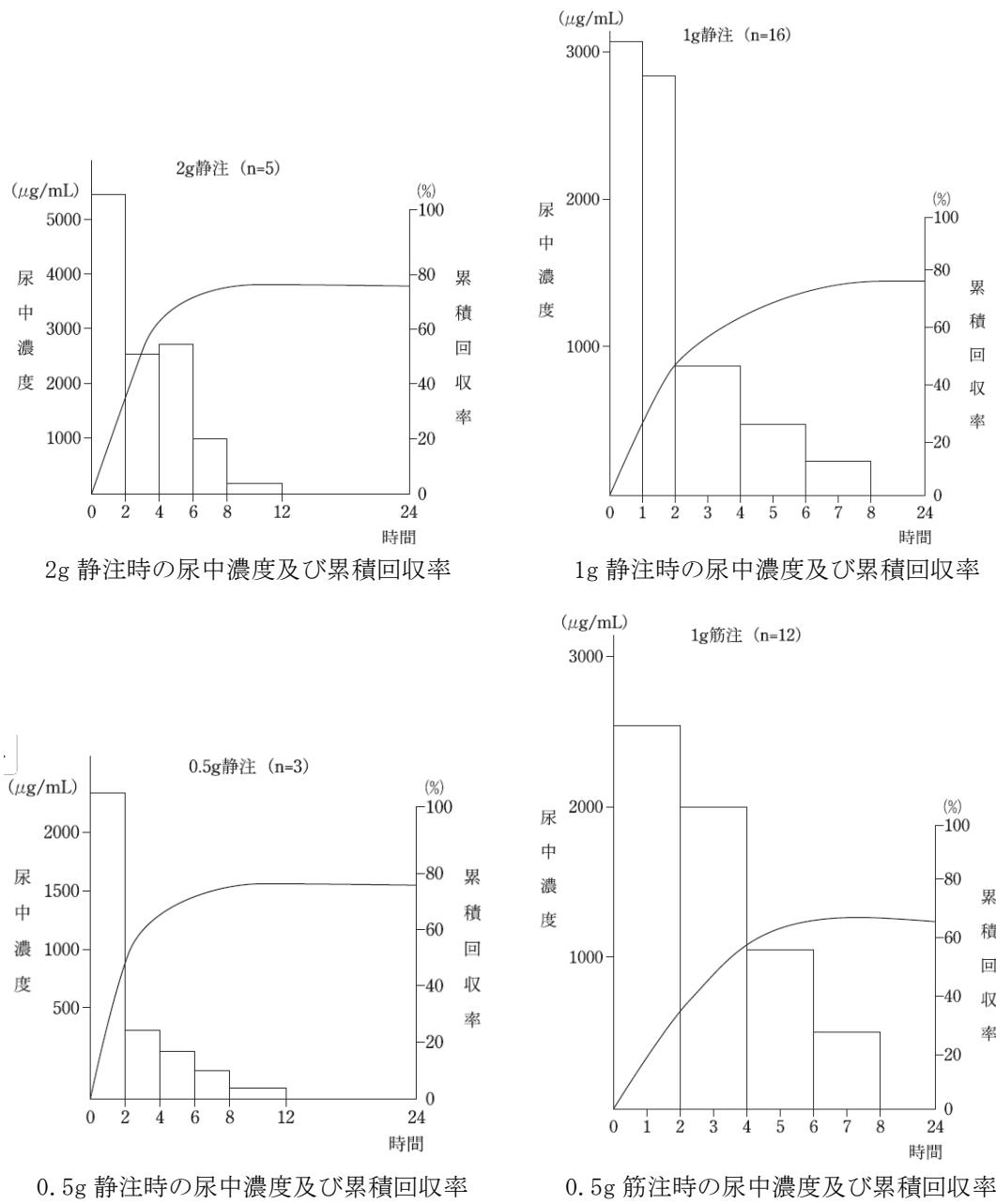
(1) 排泄部位及び経路

本剤は主に腎から排泄されるが、健康成人では本剤単独及びプロベネシド併用の場合の血中濃度等に差がみられなかったことより、主として糸球体濾過によって排泄されることが示唆された。なお、動物実験では、イヌで主に糸球体濾過、ウサギでは糸球体濾過及び尿細管分泌が関与することが示唆された^{36)～39)}。

(2) 排泄率

1) 尿中排泄

本剤を健康成人に静脈内注射及び筋肉内注射した場合の投与後 24 時間までの尿中排泄率は約 60～80%を示し、そのほとんどは投与後 8 時間以内に排泄された³⁸⁾。



図VII-6 静脈内注射及び筋肉内注射した場合の投与後 24 時間までの尿中排泄率

2) 胆汁中排泄

T-チューブ設置 14 例に本剤 1 g を静脈内又は 30~60 分点滴静脈内投与後の胆汁中濃度推移は投与後 2 時間以内にピークがみられる例が多く、ピーク値は 10.3~219.5 μg/mL であった。また、6 時間までの本剤の胆汁中排泄率（9 例）は 0.05~1.93%（平均 0.6%）であった¹¹⁾。

〈参考〉²⁶⁾

表VII-5 各種動物における AZT 単回静脈内投与後の尿中及び糞中排泄

動物種	投与量 (mg/kg)	例数	排泄率 (%)	
			尿 (0~24時間)	糞 (0~96時間)
ラット	20	4	40.4±5.0	N.T.
イヌ	20	4	62.8±7.6	0.5±0.3
	80	4	61.0±6.8	0.5±0.2
	320	3	83.1±3.5	1.4±0.2
サル	20	5	20.2±4.8	N.D.

N.T. : 実施せず、N.D. : 検出不能 (Mean±S.E.)

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

(1) 腹膜透析

持続携行式腹膜透析 (CAPD) 施行中の末期腎疾患患者 6 例 (26~64 歳) に、クロスオーバー法で AZT 1g を 2 分間かけて単回静注、又は AZT 1g を腹膜透析液 2L に混入し、10 分間かけて腹腔内に単回投与した。透析液は AZT 投与 48 時間後まで 6 時間毎に 8 回交換した。AZT 静注時、半減期 ($t_{1/2\beta}$) は 7.08hr、尿中回収率 (0~48hr) は投与量の 1.93%、透析液中回収率 (0~48hr) は 9.74%、AZT の血清クリアランスは 23.8mL/min、腎クリアランスは 0.5mL/min、腹膜透析クリアランスは 2.1mL/min であった。

腹膜透析による尿素クリアランスは 6.5mL/min であり、CAPD 施行中の AZT クリアランスは、尿素クリアランスの 32% であった。AZT 腹腔内投与時、最高透析液中濃度は投与 10 分後に 274 μg/mL に達し、6 時間後には 104.8 μg/mL であったが、透析液交換後は 11.72~0.17 μg/mL で推移した。また、この際の血清 AZT 濃度は投与 6 時間後に最高値の 30.0 μg/mL となった。静注時の血清 AUC (0~48hr) は 808.0 μg · hr/mL、腹腔内投与時の血清 AUC (0~48hr) は 453.5 μg · hr/mL であり、腹腔内投与時のバイオアベイラビリティは 59.4% であった⁴⁰⁾。

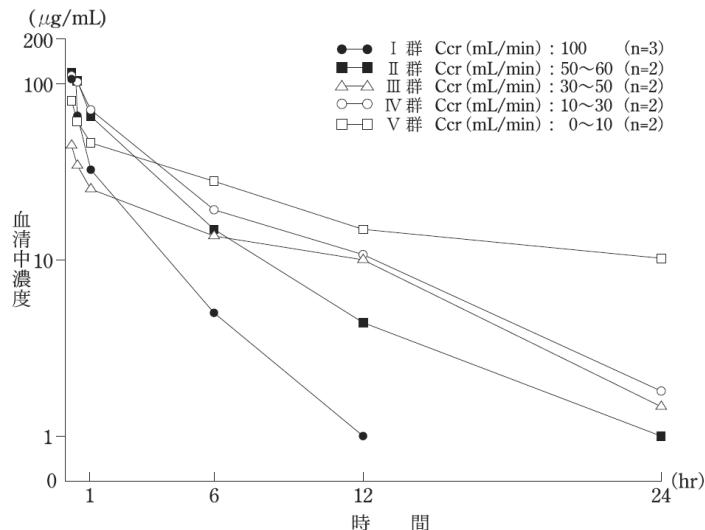
(2) 血液透析

血液透析患者 6 例で、非透析時と透析時の AZT の薬物動態を検討した結果、血清中濃度の半減期は 16.97hr から 3.44hr と短縮し、クリアランスは 0.762L/hr から 3.360L/hr と増加し、本剤は血液透析により除去されることが示唆された。また、血液透析においてクレアチニンクリアランスが 10mL/min 以下の腎機能障害患者では、AZT の維持量の半量を追加投与する必要性が示唆された⁴¹⁾。

10. 特定の背景を有する患者

(1) 腎機能障害時の血中濃度と尿中排泄

健康成人 3 名及び腎機能障害成人 8 例に本剤 1g (力価) を単回静脈内注射したときの血清中濃度を測定した。血清中濃度は、クレアチニン・クリアランス (Ccr) の低下とともに高値を示し、その半減期は延長した。尿中排泄率も Ccr の低下とともに減少した。したがって、腎機能障害患者に本剤を投与する場合には、投与量、投与間隔の適切な調節が必要である⁴²⁾。



図VII-7 腎機能障害患者と健康成人の血清中濃度

表VII-6 本剤 1g 単回静脈内注射後の薬物動態パラメータ

	$ke_{1/2}$ (hr ⁻¹)	$t_{1/2}\beta$ (hr)	Vd (L)	AUC (μg · hr/mL)
I (n=3)	0.719±0.074	1.81±0.01	10.2±0.95	224.2±16.3
II (n=2)	0.347±0.073	3.27±0.38	9.4±0.2	466.3±41.7
III (n=2)	0.245±0.083	5.42±1.98	18.4±0.85	405.6±131.4
IV (n=2)	0.235±0.016	4.41±0.69	10.1±1.8	609.5±5.05
V (n=2)	0.097±0.002	9.15±0.11	12.7±0.9	938.4±27.4

(Mean±S. D.)

(2) 小児に静脈内投与した際の血清中濃度

小児に本剤 10mg (9 名)、20mg (30 名) 及び 50mg (力価) (2 名) /kg を単回静脈内注射した場合、投与 15 分後の平均血清中濃度は 50.1、160.4 及び 179.2 μg/mL であった。半減期は 1.35~1.56 時間と健康成人に比べてやや短かった²⁸⁾。

(3) 低出生体重児・新生児における血清中濃度

点滴静注

低出生体重児 12 名、新生児 22 名に本剤 20mg/kg を 1 時間で点滴静注した場合、最高血清中濃度は点滴静注終了直後にみられた。新生児では最高血清中濃度が 36.2~46.8 μg/mL に達し、半減期は 2.60~3.61 時間、低出生体重児では最高血清中濃度が 35.7~46.4 μg/mL に達し、半減期は 2.83~3.10 時間であり、新生児、低出生体重児とともに日齢の増加とともに半減期は短縮する傾向を示した⁴³⁾。

静脈内投与

低出生体重児 4 名、新生児 17 名に本剤 10mg/kg を静脈内投与した場合、平均血清中濃度は投与 30 分後に低出生体重児では 22.0 μg/mL に達し、半減期は 4.47 時間であった。また、新生児では平均血清中濃度は投与 30 分後に 20.6~26.6 μg/mL に達し、半減期は 3.03~3.96 時間であった⁴³⁾。

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）

本剤の成分によるショックの既往歴のある患者 [8.1、11.1.1 参照]

(解説)

本剤投与によるショックの既往症のある患者に対して、再投与による副作用を回避するため。

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

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 本剤によるショック、アナフィラキシー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。[2.、11.1.1 参照]

- ・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。
- ・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。
- ・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。

8.2 急性腎障害等の重篤な腎障害があらわれることがあるので、定期的に腎機能検査を行うなど、患者の状態を十分に観察すること。[11.1.2 参照]

8.3 本剤の投与により、肝機能異常があらわれることがあるので、必要に応じ肝機能検査を行うことが望ましい。

8.4 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。

(解説)

8.1 抗菌薬投与に伴うショック及びアナフィラキシーの発現を確実に予知する方法はなく、本剤投与の際には十分な問診に加え、ショックに対する準備をしておくことが重要なため設定した。本項の具体的な解説として、日本化学療法学会より、抗菌薬投与に関連するショック等による医療被害を最小限にすることを目的として「抗菌薬投与に関連するアナフィラキシー対策のガイドライン（2004年版）」が出されており、同学会のホームページに掲載されている。

8.3 承認前の臨床試験及び市販後の6年間の使用成績調査で、AST上昇408件、ALT上昇408件、A1-P上昇69件、γ-GTP上昇45件、LDH上昇27件、LAP上昇18件、血清ビリルビン上昇10件の肝機能検査値異常が報告されている。承認前の呼吸器感染症の比較臨床試験で対照薬に比し、AST、ALT上昇の発現頻度が有意に高かったので設定した。

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 ペニシリン系又はセフェム系薬剤に対し過敏症の既往歴のある患者

交叉アレルギー反応が起こるとの報告がある。

9.1.2 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こしやすい体质の患者

9.1.3 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

観察を十分に行うこと。ビタミンK欠乏症があらわれるおそれがある。

(解説)

9.1.1 β-ラクタム剤(ペニシリン系又はセフェム系抗生物質)によって過敏症の既往歴のある患者に別のβ-ラクタム剤を投与した場合、交叉アレルギー反応が起こるおそれがあるので、準拠して設定した。

9.1.2 一般に気管支喘息やアトピー体質の患者では薬物アレルギーの頻度が高い。これらの体質は遺伝的要因が大きく関与しているといわれ、健康な家系に比べ薬物アレルギーの発現頻度が有意に高いという報告があり設定した。

9.1.3 ビタミンK欠乏の原因はビタミンK供給の減少とビタミンKの異常消費が考えられる。供給の減少はビタミンK摂取不良とビタミンKを合成する腸内細菌の減少あるいは消失(抗生物質による殺菌作用のため)が原因であるといわれている。異常消費はβ-ラクタム系抗生物質のうちN-メチルテトラゾールチオメチル基をもつ抗生物質に起こると考えられている。したがって、通常の摂食状態にない上記の患者では、β-ラクタム系抗生物質の投与によりビタミンK欠乏症があらわれやすい。以上の理由で設定した。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

投与量を減ずるか、投与間隔を開けて使用すること。血中濃度が持続する。[16.6.1 参照]

(解説)

腎障害のある患者(Ccr 0~30mL/min)では尿からの本剤の排泄が遅延し、血中濃度が腎機能正常者に比べ長時間高濃度に持続するとの報告があるので、投与量を減ずるか、投与間隔を開けて使用すること⁴²⁾（「VII. 1. (2) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照）。

(3) 肝機能障害患者

設定されていない

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊娠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。

(解説)

妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。

(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

乳中へ移行することがある。

(解説)

「VII. 5. (3) 乳汁への移行性」の項参照

(7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

9.8 高齢者

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。

- ・本剤は、主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多く、高齢者の体内薬物動態試験で高い血中濃度が持続する傾向が認められている。
- ・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。

(解説)

[参考] 外国添付文書（2021年版）には、以下の記載がある。

Dosage in the Elderly

Renal status is a major determinant of dosage in the elderly; these patients in particular may have diminished renal function. Serum creatinine may not be an accurate determinant of renal status. Therefore, as with all antibiotics eliminated by the kidneys, estimates of creatinine clearance should be obtained and appropriate dosage modifications made if necessary.

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
利尿剤 フロセミド等	腎障害が悪化した報告がある。	機序は不明である。

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)

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.、8.1 参照]

11.1.2 急性腎障害 (頻度不明)

急性腎障害等の重篤な腎障害があらわれることがある。[8.2 参照]

11.1.3 大腸炎 (頻度不明)

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、直ちに投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

11.1.4 中毒性表皮壊死融解症 (頻度不明)

11.1.5 溶血性貧血 (頻度不明)

(解説)

11.1.5 ペニシリン系又はセフェム系薬剤で溶血性貧血があらわれたとの報告があるので、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。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

種類\頻度	0.1~5%未満	0.1%未満	頻度不明
過敏症	発疹、発熱	荨麻疹、瘙痒感	発赤
腎臓		血清カリウムの上昇、血尿	蛋白尿
血液	好酸球增多	血小板減少、貧血、顆粒球減少	
肝臓	AST、ALT、Al-P、γ-GTP、LDH、LAP の上昇		黄疸
消化器		嘔吐、食欲不振	
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		胸痛、知覚減退、頭痛、末梢性浮腫、動悸	

発現頻度は製造販売後調査を含む。

表VIII-1 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

副作用発現状況

(調査期間 1987年1月12日～1993年1月11日)

	承認時迄の調査	使用成績調査
調査施設数	280院	2100院
調査症例数	3138例	12129例
副作用発現症例数	355例	485例
副作用発現件数	626件	915件
副作用発現症例率	11.31%	4.00%

副作用の種類	副作用発現頻度			
	承認時迄の調査		使用成績調査	
	発現件数	発現頻度 %	発現件数	発現頻度 %
皮膚・皮膚付属器障害	22	0.70	57	0.47
紅斑性発疹	—	—	3	0.02
湿疹	1	0.03	1	0.01
蕁麻疹	4	0.13	7	0.06
搔痒	1	0.03	2	0.02
斑状丘疹性皮疹	1	0.03	—	—
発疹	16	0.51	50	0.41
中枢・末梢神経系障害	3	0.10	2	0.02
知覚減退	3	0.10	2	0.02
めまい	—	—	1	0.01
自律神経系障害	3	0.10	4	0.03
潮紅（フラッシング）	2	0.06	4	0.03
多汗	1	0.03	—	—
その他の特殊感覚障害	—	—	1	0.01
味覚異常	—	—	1	0.01
精神障害	—	—	1	0.01
不安	—	—	1	0.01
消化管障害	20	0.64	31	0.26
嘔気	6	0.19	8	0.07
嘔吐	2	0.06	3	0.02
下痢	14	0.45	19	0.16
口渴	—	—	1	0.01
食欲不振	1	0.03	—	—
腹痛	1	0.03	4	0.03
口唇腫脹	—	—	1	0.01
舌苔	—	—	1	0.01
血便	—	—	1	0.01
肝臓・胆管系障害	236	7.52	309	2.55
LAP上昇	1	0.03	17	0.14
肝炎	—	—	2	0.02
肝機能異常	—	—	65	0.54
肝細胞性障害	—	—	17	0.14
血清AST上昇	195	6.21	213	1.76
血清ALT上昇	197	6.28	211	1.74
血清ビリルビン上昇	3	0.10	7	0.06
ウロビリノーゲン陽性	1	0.03	—	—
血清トランスアミナーゼ上昇	—	—	2	0.02
γ-GTP上昇	7	0.22	38	0.31
代謝・栄養障害	36	1.15	59	0.49
A1-P上昇	31	0.99	38	0.31
LDH上昇	3	0.10	24	0.20
クレアチニンフオスフォキナーゼ上昇	1	0.03	—	—
血清カリウム上昇	1	0.03	3	0.02

副作用の種類	副作用発現頻度			
	承認時迄の調査		使用成績調査	
	発現件数	発現頻度 %	発現件数	発現頻度 %
血中尿酸上昇	—	—	1	0.01
血清総蛋白減少	—	—	3	0.02
血中ナトリウム低下	—	—	1	0.01
心拍数・心リズム障害	1	0.03	—	—
心悸亢進	1	0.03	—	—
血管（心臓外）障害	—	—	2	0.02
血管痛	—	—	2	0.02
赤血球障害	6	0.19	19	0.16
貧血	—	—	7	0.06
血色素減少	6	0.19	8	0.07
赤血球減少	6	0.19	10	0.08
ヘマトクリット減少	5	0.16	6	0.05
白血球・網内系障害	52	1.66	51	0.42
顆粒球減少（症）	2	0.06	4	0.03
好酸球增多（症）	37	1.18	23	0.19
単球增多（症）	1	0.03	—	—
白血球減少（症）	10	0.32	23	0.19
白血球增多（症）	2	0.06	3	0.02
リンパ球減少	1	0.03	—	—
顆粒球增多（症）	1	0.03	—	—
血小板・出血凝血障害	11	0.35	15	0.12
血小板増加	5	0.16	2	0.02
血小板減少（症）	6	0.19	8	0.07
紫斑（病）	—	—	2	0.02
プロトロンビン時間延長	—	—	3	0.02
泌尿器系障害	17	0.54	26	0.21
尿中NAG上昇	—	—	2	0.02
尿β₂-ミクログロブリン上昇	—	—	1	0.01
血中クレアチニン上昇	8	0.25	10	0.08
クレアチニンクリアランス低下	1	0.03	1	0.01
顕微鏡的血尿	2	0.06	—	—
腎機能試験異常	—	—	4	0.03
尿中白血球增加	1	0.03	—	—
BUN上昇	16	0.51	16	0.13
一般的全身障害	21	0.67	24	0.20
胸痛	4	0.13	2	0.02
頭痛	—	—	4	0.03
発熱	15	0.48	17	0.14
倦怠（感）	1	0.03	1	0.01
四肢熱感	—	—	1	0.01
末梢性浮腫	1	0.03	—	—
適応部位障害	1	0.03	—	—
注射部疼痛	1	0.03	—	—
抵抗機構障害	—	—	2	0.02
菌交代現象	—	—	1	0.01
免疫グロブリン低下	—	—	1	0.01

(1993年1月集計)

〔低出生体重児・新生児における安全性〕⁴³⁾

表VIII-2 副作用発現状況

調査施設数	29院
調査症例数	80例
副作用発現症例数	1例
副作用発現件数	1件
副作用発現症例率	1. 25%

副作用の種類	副作用発現頻度 (%)
消化管障害	1 (1. 25)
軟便	1 (1. 25)

表VIII-3 臨床検査値異常発現状況

調査症例数	80例
臨床検査値異常発現件数	8例
臨床検査値異常発現件数	13件
臨床検査値異常発現率	10. 0%

副作用の種類	副作用発現頻度 (%)
肝臓・胆管系障害	4 (5. 00)
血清AST上昇	4 (5. 00)
血清ALT上昇	3 (3. 75)
代謝・栄養障害	1 (1. 25)
LDH上昇	1 (1. 25)
白血球・網内系障害	3 (3. 75)
好酸球增多(症)	3 (3. 75)
血小板・出血凝血障害	2 (2. 50)
血小板增多	1 (1. 25)
血小板減少(症)	1 (1. 25)

[使用成績調査の分析]

表VIII-4 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

性別

要因	症例数	副作用発現 症例数	副作用発現 件数	副作用発現 症例率(%)
男性	6101例	279例	521件	4.57%
女性	6024例	206例	394件	3.42%
記載なし	4例	0例	0件	0.00%

年齢別*

要因	症例数	副作用発現 症例数	副作用発現 件数	副作用発現 症例率(%)
0歳～15歳	606例	19例	29件	3.14%
16歳～64歳	5920例	264例	489件	4.46%
65歳以上	5594例	201例	396件	3.59%
記載なし	9例	1例	1件	11.11%

*高齢者には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。

アレルギー素因別

要因	症例数	副作用発現 症例数	副作用発現 件数	副作用発現 症例率(%)
アレルギー素因なし	11360例	437例	836件	3.85%
アレルギー素因あり	586例	42例	70件	7.17%
不明	170例	6例	9件	3.53%
記載なし	13例	0例	0件	0.00%

合併症の有無別

要因	症例数	副作用発現 症例数	副作用発現 件数	副作用発現 症例率(%)
合併症なし	4403例	158例	275件	3.59%
合併症あり	7690例	325例	637件	4.23%
記載なし	36例	2例	3件	5.56%

一日投与量別*

要因	症例数	副作用発現 症例数	副作用発現 件数	副作用発現 症例率(%)
～1g/日	794例	24例	37件	3.02%
～2g/日	7301例	285例	568件	3.90%
～3g/日	670例	33例	51件	4.93%
～4g/日	3129例	127例	232件	4.06%
4g/日<	235例	16例	28件	6.81%
記載なし	0例	0例	0件	0.00%

*「V. 3. 用法及び用量」の項参照。

併用薬剤別

要因	症例数	副作用発現 症例数	副作用発現 件数	副作用発現 症例率(%)
併用薬剤なし	6073例	157例	295件	2.59%
併用薬剤あり	5995例	325例	611件	5.42%
記載なし	61例	3例	9件	4.92%

(1993年1月集計)

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

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

〈静脈内注射〉

14.1.1 5mL 以上の日本薬局方注射用水、日本薬局方生理食塩液又は日本薬局方ブドウ糖注射液で溶解し、通常 1g（力価）あたり全量 20mL にすること。

〈点滴静注〉

14.1.2 糖液、電解質液又はアミノ酸製剤などの補液で溶解すること。

なお、溶液が低張になるため注射用水を使用しないこと。

〈筋肉内注射〉

14.1.3 日本薬局方注射用水又は日本薬局方生理食塩液で溶解し、1g（力価）あたり 3mL とすること。

〈投与経路共通〉

14.1.4 本剤は溶解後、微黄色～淡黄色透明であり、この溶液は放置するとわずかに変色するので、溶解後は速やかに使用すること。やむを得ず、保存する場合には、冷蔵庫保存では 48 時間以内、室温保存では 24 時間以内に使用すること。総合アミノ酸補液に溶解して使用する場合には、溶解後保存することにより力価が低下することがあるので、用時溶解して使用すること。

14.2 薬剤投与時の注意

〈静脈内注射〉

14.2.1 静脈内大量投与により血管痛、静脈炎、灼熱感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、その注射の速度はできるだけ遅くすること。

〈筋肉内注射〉

14.2.2 やむを得ない場合にのみ必要最小限に行うこと。

なお、同一部位への反復注射は行わないこと。

14.2.3 低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児には筋肉内投与しないこと。

14.2.4 神経走行部位を避けること。

14.2.5 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には、直ちに針を抜き、部位をかえて注射すること。

14.2.6 注射部位に疼痛、硬結を見ることがある。

(解説)

14.1.4 アザクタム注射用 1g を、生理食塩液、5% ブドウ糖液（3mL、20mL、100mL、500mL）及び注射用水（3mL、20mL）に溶解し、室温・室内散光下で 48 時間、また、冷蔵庫内で 48 時間経時に外観、pH、含量を観察・測定した。その結果、いずれの溶媒においても、3mL の溶解液で溶解した場合、室温・室内散光下において 48 時間後に若干の含量低下を示した。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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

マウス、ラット、ウサギ及びイヌ等に本剤を投与し、中枢神経系、呼吸器及び循環器系、自律神経系、消化器系、平滑筋等に及ぼす影響について検討したところ、臨床上特に問題となる所見は認められなかった⁴⁴⁾。

(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

LD₅₀ (mg/kg)⁴⁵⁾

動物種	性	経 口	皮 下	腹腔内	静脈内
マウス	雄	>10,000	3,906	2,897	1,963
	雌	>10,000	5,368	3,722	2,068
ラット	雄	>10,000	3,578	2,549	2,882
	雌	>10,000	3,154	2,964	3,149

(2) 反復投与毒性試験

ラット、幼若イヌにおける5週間静脈内投与試験及び成熟イヌにおける26週間静脈内投与試験の無影響量は、それぞれ270、300、40mg/kg/日であった。これらの試験では肝臓重量の増加、尿細管上皮細胞の空胞化などの所見が主にラットで認められたが、いずれも休薬により回復した^{46)~48)}。

(3) 遺伝毒性試験

細菌を用いた復帰変異試験及び染色体異常試験 (*in vivo*、*in vitro*)、マウスリンパ腫細胞における前進突然変異試験において変異原性は認められなかつた⁴⁹⁾。

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

ラット(100、270、750mg/kg/日静脈内投与)における器官形成期投与試験では、催奇形性は認められなかつた。また、ラット(100、270、750mg/kg/日静脈内投与)における妊娠前及び妊娠初期投与試験、周産期及び授乳期投与試験においても、特記すべき異常所見は認められていない^{50)~52)}。

(6) 局所刺激性試験

ウサギを用いた筋肉内投与刺激性試験の結果、本剤1gを注射用蒸留水3mLに溶解した溶液の刺激性は、0.75%酢酸よりやや強く、6%酢酸よりも弱かつた⁵³⁾。

(7) その他の特殊毒性

1) 溶血性

ヒト赤血球を用いた *in vitro* の系における試験の結果、溶血性は本剤の 5%溶液では認められなかつたが、29%溶液では弱い作用が認められた⁵⁴⁾。

2) 抗原性試験

マウス、モルモット及びウサギにおいて本剤単独では、免疫原性及び誘発原性は認められなかつた。また、ペニシリソ系、セフェム系薬剤との間に能動性全身アナフィラキシー反応による免疫応答性の実験で免疫学的交差反応性は示さなかつた⁵⁵⁾。

3) その他の毒性

腎に対する影響

10 日間皮下注射したラットの腎に病理組織学的病変を惹起しない最高用量は 1,500mg/kg/日であつた。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：アザクタム注射用 0.5g 処方箋医薬品^(注)
アザクタム注射用 1g 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：アズトレオナム 該当しない

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意

外箱開封後は、遮光して保存すること。本剤は光により徐々に着色する。

「IV. 4. 製剤の各種条件下における安定性」の項参照

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：なし
くすりのしおり：あり
その他の患者向け資材：なし

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：なし
同効薬：なし

7. 国際誕生年月日

該当しない

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

履歴	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
アザクタム 注射用 0.5g	1987年1月12日	16200MZY00336000	1987年3月12日	1987年3月12日
製造販売承認 承継	2026年2月16日	〃	〃	

履歴	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
アザクタム 注射用 1g	1987年1月12日	16200MZY00335000	1987年3月12日	1987年3月12日
製造販売承認 承継	2026年2月16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

効能・効果追加年月日：1988年5月31日「髄膜炎」の効能・効果追加

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

再審査結果通知年月日：1996年3月7日

再審査結果：用法・用量の一部変更（未熟児、新生児の用法・用量の追加）

再評価結果通知年月日：2004年9月30日

再評価結果：効能・効果、用法・用量の一部変更（適応菌種名、適応症名の読替え）

11. 再審査期間

6年間（1987年1月12日～1993年1月11日：終了）

12. 投薬期間制限に関する情報

該当しない

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
アザクタム 注射用 0.5g	6122400D1028	6122400D1028	1106756020101	646130274
アザクタム 注射用 1g	6122400D2024	6122400D2024	1106763020101	646130275

14. 保険給付上の注意

該当しない

XI . 文獻

1. 引用文献

- 1) Use of stems in the selection of International Nonproprietary Names (INN) for pharmaceutical substances, 2024 (Stem Book 2024) (WHO)
- 2) 幸保 文治ら : 医薬ジャーナル, 1987 ; 23 (3) : 589-603
- 3) 幸保 文治ら : 医薬ジャーナル, 1987 ; 23 (6) : 1234-1239
- 4) 幸保 文治ら : 医薬ジャーナル, 1987 ; 23 (11) : 2419-2425
- 5) 厚生労働省健康・生活衛生局 感染症対策部 感染症対策課編 : 抗微生物薬適正使用の手引き
- 6) Nakashima M. et al. : 臨床薬理, 1985 ; 16 (2) : 409-416
- 7) 斎藤 篤ら : 感染症学雑誌, 1985 ; 59 (11) : 1084-1120
- 8) 大森 弘之ら : Jpn. J. Antibiot., 1986 ; 39 (1) : 24-56 (PMID 3517407)
- 9) 小林 宏行ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 389-394
- 10) 鈴山 洋司ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 505-519
- 11) 谷村 弘ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 628-658
- 12) 鈴木 恵三ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 729-756
- 13) 大石 正夫ら : 臨床眼科, 1985 ; 39 (7) : 967-974
- 14) 高瀬 善次郎ら : 産婦人科の世界, 1985 ; 37 (12) : 1303-1318
- 15) 熊本 悅明ら : 泌尿器科紀要, 1985 ; 31 (11) : 2090-2104
- 16) 馬場 駿吉ら : Jpn. J. Antibiot., 1986 ; 39 (1) : 159-176 (PMID 3517406)
- 17) 馬場 駿吉ら : 耳鼻と臨床, 1986 ; 32 (1) : 93-112
- 18) 藤井 良知ら : Jpn. J. Antibiot., 1988 ; 41 (4) : 390-398 (PMID 3136257)
- 19) 大槻 雅子ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 54-74
- 20) 横田 健ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 14-23
- 21) 小川 道雄ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (11) : 963-968
- 22) 紀藤 恭輔ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 87-114
- 23) 三橋 進ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 1-13
- 24) 五島 瑞智子ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 39-53
- 25) Swabb E. A. et al. : Antimicrob. Agents Chemother., 1983 ; 24 (3) : 394-400 (PMID 6685455)
- 26) 植村 家顯ら : 診療と新薬, 1985 ; 22 (5) : 1197-1207
- 27) 高瀬 善次郎ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 891-899
- 28) 藤井 良知ら : Jpn. J. Antibiot., 1985 ; 38 (11) : 3195-3216
- 29) 富井 隆夫ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 139-142
- 30) 奥沢 星二郎ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 571-576
- 31) 藤田 公生ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 132-133
- 32) 松本 慶蔵ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 520-534
- 33) 由良 二郎ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 611-627
- 34) 植村 家顯ら : 診療と新薬, 1985 ; 22 (5) : 1208-1227
- 35) 紀藤 恭輔ら : 診療と新薬, 1985 ; 22 (4) : 899-904
- 36) Kamiya A. et al. : 応用薬理, 1985 ; 30 (1) : 31-35
- 37) 嶋田 甚五郎ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 360-370
- 38) 嶋田 甚五郎ら : 日本化学会第30回東日本支部総会会議報告書 : 59-103
- 39) 常盤 知宣ら : 診療と新薬, 1985 ; 22 (3) : 595-600
- 40) Gerig J. S. et al. : Kidney Int., 1984 ; 26 (3) : 308-318 (PMID 6542606)
- 41) 長坂 肇ら : Jpn. J. Antibiot., 1990 ; 43 (2) : 345-354 (PMID 2362356)
- 42) 水野 全裕ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 126-131
- 43) 藤井 良知ら : Jpn. J. Antibiot., 1990 ; 43 (3) : 543-562
- 44) 成田 聰ら : 基礎と臨床, 1985 ; 19 (1) : 473-497
- 45) 根田 公一ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 143-148
- 46) 川崎 一ら : 日本化学会誌, 1985 ; 33 (S.1) : 149-168

- 47) 永田 良一ら：診療と新薬, 1985 ; 22 (3) : 555-572
- 48) 永田 良一ら：診療と新薬, 1985 ; 22 (4) : 863-887
- 49) 餅田 久利ら：基礎と臨床, 1987 ; 21 (1) : 113-117
- 50) 古橋 忠和ら：日本化学会誌, 1985 ; 33 (S. 1) : 190-202
- 51) 古橋 忠和ら：日本化学会誌, 1985 ; 33 (S. 1) : 203-218
- 52) 古橋 忠和ら：日本化学会誌, 1985 ; 33 (S. 1) : 219-231
- 53) 岩田 達男ら：診療と新薬, 1985 ; 22 (3) : 574-584
- 54) 渡辺 武仁ら：診療と新薬, 1985 ; 22 (5) : 1193-1196
- 55) 長谷川 隆司ら：診療と新薬, 1985 ; 22 (4) : 888-898

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

海外での発売状況は以下のとおりである（2026年2月時点）

国名	販売名
米国	AZACTAM

注) 上記品目については、ライセンス関係のない企業が販売している。

2. 海外における臨床支援情報

(1) 妊婦に関する海外情報（FDA、オーストラリア分類）

本邦における特定の背景を有する患者に関する注意「9.5 妊婦」、「9.6 授乳婦」の項の記載は以下の通りであり、米国の添付文書、オーストラリア分類とは異なる。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

妊娠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。

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。ヒト母乳中へ移行することがある。

出典	記載内容
米国の添付文書※ (2021年4月)	<p>Pregnancy</p> <p>In pregnant women, aztreonam crosses the placenta and enters the fetal circulation. Developmental toxicity studies in pregnant rats and rabbits with daily doses of aztreonam up to 1800 and 1200 mg/kg, respectively, revealed no evidence of embryotoxicity or fetotoxicity or teratogenicity. These doses, based on body surface area, are 2.2- and 2.9 fold greater than the MRHD for adults of 8 g per day. A peri/postnatal study in rats revealed no drug-induced changes in any maternal, fetal, or neonatal parameters. The highest dose used in this study, 1800 mg/kg/day, is 2.2 times the MRHD based on body surface area.</p> <p>There are no adequate and well-controlled studies of aztreonam on human pregnancy outcomes. Because animal reproduction studies are not always predictive of human response, aztreonam should be used during pregnancy only if clearly needed.</p> <p>Nursing Mothers</p> <p>Aztreonam is excreted in human milk in concentrations that are less than 1% of concentrations determined in simultaneously obtained maternal serum; consideration should be given to temporary discontinuation of nursing and use of formula feedings.</p>

※https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2021/0505800rig1s046lbl.pdf

(2026年1月19日アクセス)

オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)

オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)	分類
	B1

<https://www.tga.gov.au/resources/health-professional-information-and-resources/australian-categorisation-system-prescribing-medicines-pregnancy/prescribing-medicines-pregnancy-database> (2026年1月29日アクセス)

分類の概要

B1: Drugs which have been taken by only a limited number of pregnant women and women of childbearing age, without an increase in the frequency of malformation or other direct or indirect harmful effects on the human fetus having been observed.

Studies in animals have not shown evidence of an increased occurrence of fetal damage.

(2) 小児等に関する記載

本邦における特定の背景を有する患者に関する注意「9.7 小児等」の項の記載は以下のとおりであり、米国の添付文書とは異なる。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.7 小児等

設定されていない

出典	記載内容
米国の添付文書※ (2021年4月)	<p>Pediatric Use</p> <p>The safety and effectiveness of intravenous AZACTAM have been established in the age groups 9 months to 16 years. Use of AZACTAM in these age groups is supported by evidence from adequate and well-controlled studies of AZACTAM in adults with additional efficacy, safety, and pharmacokinetic data from noncomparative clinical studies in pediatric patients. Sufficient data are not available for pediatric patients under 9 months of age or for the following treatment indications/pathogens: septicemia and skin and skin-structure infections (where the skin infection is believed or known to be due to H. influenzae type b). In pediatric patients with cystic fibrosis, higher doses of AZACTAM may be warranted.</p>

※https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2021/0505800rig1s046lbl.pdf

(2026年1月19日アクセス)

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

(1) 粉碎

該当しない

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当しない

2. その他の関連資料

該当しない

MEMO

製造販売元
Meiji Seika ファルマ株式会社
東京都中央区京橋 2-4-16

IFAZT024201