

## 機器・薬剤紹介

# 44. アジスロマイシン点眼液 (アジマイシン<sup>®</sup>点眼液 1%, 千寿製薬)

-Azimycin<sup>®</sup> ophthalmic solution 1%-

有田玲子\*

## 1 特徴・利点と欠点

アジスロマイシン点眼液は2007年にアメリカFDA (Food and Drug Administration) で結膜炎に対し承認されたマクロライド系抗菌薬でグラム陽性菌、グラム陰性菌に幅広く効果を示す広い抗菌スペクトルをもっており、さらに抗炎症作用をもつことが報告されている(表1)。発売後、off-labelでありながら、マイボーム腺機能不全(meibomian gland dysfunction: MGD)が関連する後部眼瞼炎に対しその有効性がアメリカ、ヨーロッパから報告され、今では30報以上の論文が発表されている<sup>1)~3)</sup>。また、長時間体内に留まる特徴がある。これは15員環に窒素原子が入っているという構造に由来し(図1)、血中濃度より10~100倍の組織ならびに細胞内濃度を得ることができるため半減期が68.1時間(500mg全身投与時)と極めて長い。アジスロマイシン点眼液はDuraSite<sup>®</sup>と混合させることで眼瞼への移行性、貯留性を高めている<sup>4)</sup>。アジスロマイシン点眼液(アジマイシン<sup>®</sup>点眼液1%, 千寿製薬)は本邦でも2019年9月に発売となり、適応患者に処方できるようになった。適応症は結膜炎、眼瞼炎、涙嚢炎、麦粒腫であるが、特に効果の期待される疾患としてMGDが関連する後部眼瞼

炎が挙げられる。MGD関連後部眼瞼炎の病態として、細菌感染(特に*Cutibacterium acnes*)をきっかけに細菌が産生するリパーゼによりマイボーム腺開口部の炎症や閉塞、マイバムの変性が引き起こされると考えられている<sup>5)</sup>。アジスロマイシン点眼液は*C.acnes*に対する静菌作用+リパーゼ産生を抑制する効果により後部眼瞼炎を改善させると考えられる<sup>1)5)</sup>。さらに、アジスロマイシンが直接、マイボーム腺の上皮細胞に作用し、脂の分泌を促進することが証明されている<sup>6)</sup>。

欠点は殺菌作用でなく、静菌作用ということで耐性化しやすい可能性がある点である。

## 2 使い方

結膜炎の場合は最初の2日は1日2回、その後1日1回5日間点眼する。眼瞼炎・麦粒腫・涙嚢炎の場合は最初の2日は1日2回、その後1日1回12日間点眼する。どろっとした点眼液なので上手に1滴点入できない、眼刺激性が高い、点眼後の霧視などの訴えもあるので、以下のような点をあらかじめ指導して点眼を処方するとよい。

上手にアジスロマイシン点眼液を使ってもらうコツ

- ・最初の2日間はかなり眼刺激性が強く、痛みや充血を訴えるケースが多いが、3日目か

\*Reiko ARITA 伊藤医院(さいたま市)

表1 抗菌スペクトル

点眼薬	メチシリン感受性 ブドウ球菌 (MSSA, MSCNS)	メチシリン耐性 ブドウ球菌 (MRSA, MRCNS)	<i>P. acnes</i>	殺菌的 or 静菌的	眼瞼 移行性	抗炎症
フルオロキノロン	◎	×	○	殺菌	○	△
ベストロン	◎	×	○	殺菌	△	×
トブラシン	△	×	×	殺菌	△	×
アジスロマイシン	△	×	◎	静菌	◎	◎
クロラムフェニコール	△	△	○	静菌	?	?
バンコマイシン	○	○	○	殺菌	△	×

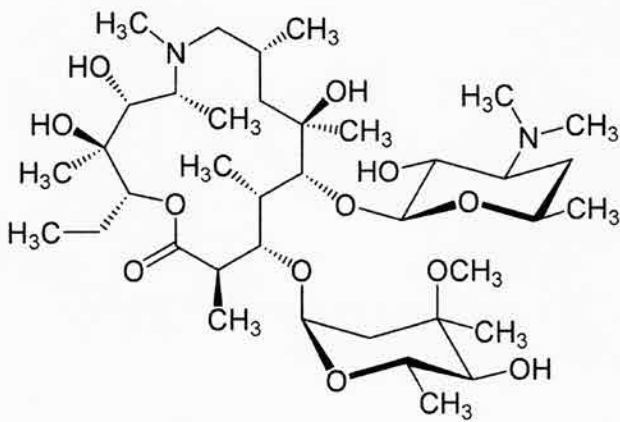


図1 アジスロマイシン  
15員環マクロライド系抗菌薬  
分子量 749 g/mol

- らほぼしみなくなる旨、あらかじめ説明する。
- ・症状は朝つらい人が多いので、3日目以降、1日1回の点眼は夜がおすすめである。
  - ・室温で保存可能だが、室温だと1滴点入できたかがわかりにくいので、冷蔵庫で冷やしておくことをおすすめしている。
  - ・点眼ボトルを真下に向けて垂直に点入し、点眼後はキャップをしっかりと閉める。
  - ・後部眼瞼炎の場合、温罨法、リッドハイジーンとアジスロマイシン点眼液は最初からセットでおすすめる。

### 3 症 例

症例1 38歳男性：分泌減少型MGDに関連する後部眼瞼炎

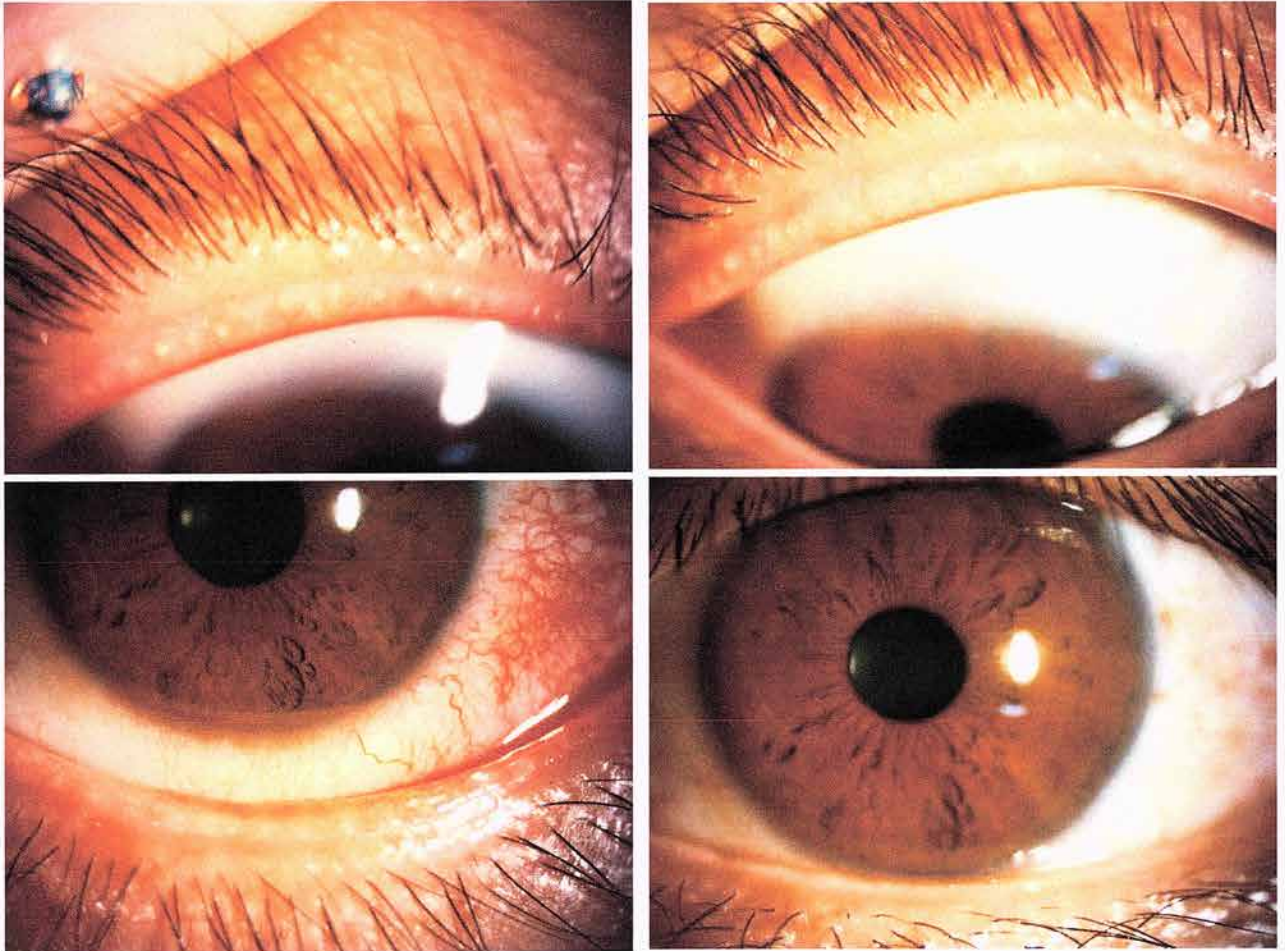
主 訴：5年前から起床時の眼乾燥感、眼異物感、視力低下、眼精疲労、流涙感、開瞼困難、眼痛

自覚症状スコア (SPEED スコア)：20点 (0-28点) と非常に強い自覚症状

今までの治療：温罨法、眼瞼清拭、ジクアホンル点眼、レバミピド点眼、ニューキノロン点眼、低力価ステロイド点眼、ステロイド眼軟膏

HCL 装用歴：20年





**図2 38歳男性(右眼)**

左：アジスロマイシン点眼前，右：点眼開始2週間後

眼の症状のため、カメラマン(職業)を続けることが難しく、転職を考えるほど悩んでいた。

**所見(図2左上下)：**眼瞼縁に Plugging, Vascularity 多数，球結膜の充血，マイバム混濁  
涙液浸透圧；326 mOsm/L (正常は 308 mOsm/L 以下)

BUT (涙液層破壊時間)；3秒と短縮しているが角結膜上皮障害はなし。

**処方：**アジスロマイシン点眼液，温罨法と眼瞼清拭を1日2回

**2週間後の診察時(図2右上下)：**自覚症状は SPEED スコア 4点と劇的に改善し，点眼3日目から明らかに眼症状が楽になったとのこと。他覚所見も改善し，涙液浸透圧も 294 mOsm/L と正

常範囲内になった。BUT も 10秒と延長し，カメラマンとしての業務が継続可能となった，とのことである。

#### 症例2 78歳男性：分泌増加型 MGD に関連する後部眼瞼炎

**主訴：**半年前から，眼脂，流涙感，搔痒感，眼異物感

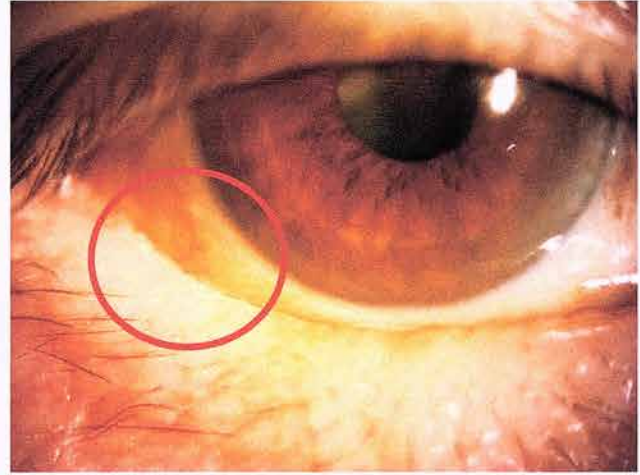
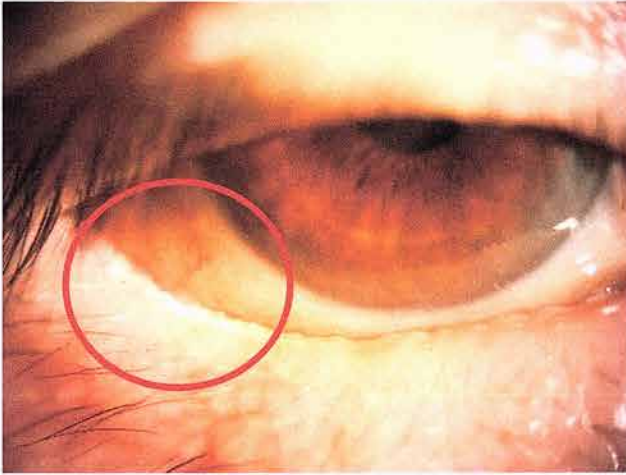
**今までの治療：**キノロン系，セフェム系抗菌薬と低力価ステロイド点眼である程度改善するが，再発を繰り返して困っていた。

**所見(図3左)：**眼瞼縁に Foaming を認めた。

**処方：**アジスロマイシン点眼液，温罨法と眼瞼清拭を1日2回

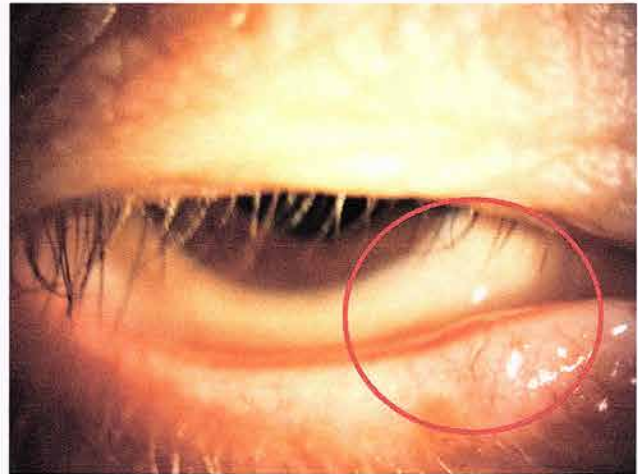
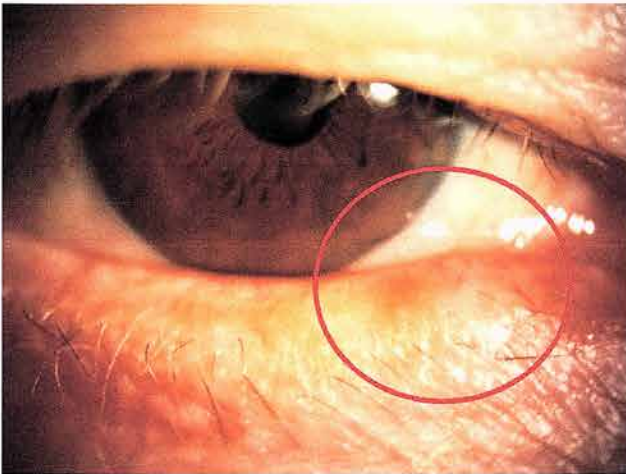
**2週間後の診察時(図3右)：**自覚症状，他覚所





**図3** 78歳男性(右眼)

左：アジスロマイシン点眼前，右：点眼開始2週間後。Foamingが消失している。



**図4** 72歳女性(右眼，内麦粒腫)

左：アジスロマイシン点眼前，右：点眼開始1週間後

見ともに改善し，Foaming (囲み円) は完全に消失した。点眼終了後3か月経過するが，再発せず経過順調である。

### 症例3 72歳女性：内麦粒腫

**主訴**：1週間前から眼異物感，ものもらいができているようだ，と受診された。

**所見(図4左)**：右下眼瞼縁に外麦粒腫を認めた(囲み円)。

**処方**：アジスロマイシン点眼液のみ

**1週間後の診察時(図4右)**；点眼後2日目には症状，所見とも大きく改善した。1週間後の診

察では完治していた。

### 文献

- 1) Luchs J : Efficacy of topical azithromycin ophthalmic solution 1% in the treatment of posterior blepharitis. *Adv Ther* 25 : 858-70, 20058
- 2) Kagkellaris KA, Makri OE, Georgakopoulos CD et al : An eye for azithromycin : review of the literature. *Ther Adv Ophthalmol* 2018 : DOI : 10.1177/2515841418783622
- 3) Ciloglu E, Özcan AA, Incekalan T et al : The Role of Topical Azithromycin in the Treatment of Meibomian Gland Dysfunction. *Cornea* 39 : 321-4,

2020

- 4) Akpek EK, Vittitow J, Verhoeven RS et al : Ocular surface distribution and pharmacokinetics of a novel ophthalmic 1% azithromycin formulation. *J Ocul Pharmacol Ther* **25** : 433-9, 2009
- 5) Geerling G, Tauber J, Baudouin C et al : The international workshop on meibomian gland dysfunction : report of the subcommittee on management and treatment of meibomian gland dysfunction. *Invest Ophthalmol Vis Sci* **52** : 2050-64, 2011
- 6) Liu Y, Kam WR, Ding J et al : Effect of azithromycin on lipid accumulation in immortalized human meibomian gland epithelial cells. *JAMA Ophthalmol* **132** : 226-8, 2014

\*

\*