

TABLE OF CONTENTS

LIST OF TABLES	2
LIST OF FIGURES	2
1. B8441001 試験（資料番号 5.3.3.1.1, 評価資料）	3
1.1. 試験概要	3
1.1.1. 目的.....	3
1.1.2. 試験デザイン	3
1.1.3. 診断および主な組み入れ基準	4
1.1.3.1. 選択基準.....	4
1.1.3.2. 除外基準	4
1.1.4. 試験薬, ロット番号, 用法および用量, 投与期間	6
1.1.4.1. 試験薬およびロット番号	6
1.1.4.2. 用法および用量	6
1.1.4.3. 投与期間	6
1.1.5. 評価項目	6
1.1.5.1. 薬物動態, 薬力学またはその他の評価項目	6
1.1.5.2. 有効性の評価項目	7
1.1.5.3. 安全性の評価項目	7
1.1.6. 統計解析方法	7
1.1.6.1. 解析対象集団	7
1.1.6.2. 統計解析	7
1.2. 試験結果	8
1.2.1. 被験者の内訳および特性	8
1.2.2. 薬物動態の結果	9
1.2.3. 有効性の結果	13
1.2.4. 安全性の結果	13
1.2.4.1. 有害事象	13
1.2.4.2. 死亡	14
1.2.4.3. 重篤な有害事象	14
1.2.4.4. 有害事象による投与中止	14
1.2.4.5. バイタルサイン, 心電図, 臨床検査およびその他の検査	14
1.3. 結論	15

LIST OF TABLES

Table 1-1.	治験薬 (B8441001 試験)	6
Table 1-2.	薬物動態パラメータ (B8441001 試験)	8
Table 1-3.	被験者の内訳 (B8441001 試験)	9
Table 1-4.	血漿中 PCG の薬物動態パラメータの要約 (B8441001 試験)	11
Table 1-5.	治験薬との因果関係を問わない有害事象の要約 (B8441001 試験)	13
Table 1-6.	重症度別の治験薬との因果関係を問わない有害事象の発現状況 (B8441001 試験)	14

LIST OF FIGURES

Figure 1-1.	PCG ベンザチン 240 万単位を単回筋肉内投与したときの血漿中 PCG 濃度 (中央値) ー時間プロファイル (B8441001 試験)	10
Figure 1-2.	PCG ベンザチン 240 万単位を単回筋肉内投与したときの個々の被験者の血漿中 PCG 濃度ー時間プロファイル (B8441001 試験)	12

1. B8441001 試験 (資料番号 5.3.3.1.1, 評価資料)

治験の標題：日本人健康成人を対象にベンジルペニシリンベンザチンを単回筋注したときの薬物動態および安全性を検討する非盲検第1相試験

1.1. 試験概要

治験実施施設：日本 (1 施設)

公表文献：なし

治験期間：2018年8月20日～2018年10月2日

開発段階：第1相

1.1.1. 目的

主要目的：

- 日本人健康成人に penicillin G benzathine (一般名：ベンジルペニシリンベンザチン水和物，以下 PCG ベンザチンと略す) 240 万単位を含有する Bicillin® L-A プレフィルドシリンジの全量を単回筋注したときの薬物動態 (PK) を検討する。

副次目的：

- 日本人健康成人に PCG ベンザチン 240 万単位を含有する Bicillin L-A プレフィルドシリンジの全量を単回筋注したときの安全性を検討する。

1.1.2. 治験デザイン

本試験は、日本人健康成人を対象に、PCG ベンザチン 240 万単位を含有する Bicillin L-A プレフィルドシリンジの全量を単回筋注したときの PK および安全性を検討する非盲検第1相試験であった。8 例を本試験に組み入れ、PCG ベンザチンを投与することとした。スクリーニング評価は、投与日 (Day 1) 前 28 日以内実施した。被験者には Day 1 前日 (Day -1) に治験実施医療機関 (CRU) へ入院してもらい、Day 3 に投与 48 時間後の PK 用血液検体を採取するまで CRU に入院させた。被験者には、その後も PK 用血液検体採取のために、投与 144 時間後 (Day 7) 、312 時間後 (Day 14) 、480 時間後 (Day 21) および 648 時間後 (Day 28) に、CRU へ来院するよう依頼した。フォローアップ来院日は、Day 28+2 日とした。

各被験者のスクリーニング来院からフォローアップ来院までの治験参加期間は、最長約 8 週間であった。本試験を中止した被験者については、治験依頼者と協議の上、治験責任医師の判断により新たに被験者を補充できることとした。

1.1.3. 診断および主な組み入れ基準

1.1.3.1. 選択基準

以下の基準をすべて満たした者を本試験へ組み入れ可能とした^{注1}。

1. スクリーニングの時点で年齢が 20 歳～55 歳の健康な女性（妊娠可能性があるまたは妊娠の可能性がない）または男性。健康とは、詳細な病歴、血圧および脈拍数の測定を含む詳細な身体的検査（診察）、12 誘導心電図（ECG）および臨床検査に基づき、臨床的に意味のある異常が認められないこととした。

妊娠の可能性がない女性被験者とは、以下に示す基準を少なくとも 1 つ以上満たす者とした。

- a. 閉経後の女性：病理学的または生理学的な要因がなく月経が連続して 12 ヶ月以上認められず、血清中卵胞刺激ホルモン（FSH）の濃度により閉経後であること。
- b. 子宮摘出術または両側卵巣摘出術を受けた記録がある女性。
- c. 医学的に卵巣機能不全と確定された女性。

上記以外の女性被験者はすべて妊娠が可能な被験者とみなす（卵管結紮を行った女性被験者を含む）。

2. 肥満指数（BMI）が 17.5～30.5 kg/m² の範囲にあり、かつ体重が 50 kg を超え、100 kg 未満である者

1.1.3.2. 除外基準

以下の基準のいずれかに該当した者は、本試験から除外することとした^{注2}。

1. 臨床的に意味のある血液、腎臓、内分泌、肺、胃腸、心血管、肝臓、精神、神経、またはアレルギー性の疾患（ペニシリン過敏症および／またはアレルギー感受性の既往歴）を認める、または病歴を有する者
2. 尿中薬物スクリーニング検査が陽性の者
3. スクリーニング前 6 ヶ月以内のアルコール摂取量が、常に以下に示す量を超える者。女性については週に 7 単位、男性については週に 14 単位（1 単位=ワイン 150 mL、ビール 360 mL または蒸留酒 45 mL）
4. 治験薬初回投与前 4 ヶ月以内、または治験薬の初回投与までの期間が前治験薬の半減期の 5 倍以内（どちらか長い方）に前治験薬の投与を受けた者

注1 治験実施計画書 4.1 項より追記

注2 治験実施計画書 4.2 項より追記

5. スクリーニング時に、少なくとも5分間安静にした後に、仰臥位にて測定した収縮期血圧が140 mmHg以上、または拡張期血圧が90 mmHg以上の者。収縮期血圧が140 mmHg以上、または拡張期血圧が90 mmHg以上であった場合、さらに2回測定を繰り返し、3回の測定の平均値により判定した。
6. スクリーニング時に、少なくとも10分間安静にした後に、仰臥位にて測定した12誘導ECGにおいて補正後のQT (QTc) 値が450 msecを超える、またはQRS間隔が120 msecを超える者。QTc 値が450 msecを超える、またはQRS間隔が120 msecを超える場合、さらに2回測定を繰り返し、3回の測定の平均値により判定した。
7. スクリーニング時の臨床検査で次のいずれかの異常が認められた被験者（本治験特有の臨床検査で異常が認められ、必要とみなされて実施した1回の再検査により異常が確認された被験者）
 - アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (AST) またはアラニンアミノトランスフェラーゼ (ALT) の値が基準値上限 (ULN) の1.25倍以上
 - 総ビリルビン値がULNの1.5倍以上の場合；ジルベール症候群の病歴のある被験者に対しては直接ビリルビンを測定してもよいこととし、直接ビリルビンがULN以下であれば、本治験に適格とした。
8. 妊婦、授乳婦、ならびに子供をもうけることができる男性被験者および妊娠可能な女性被験者で、治験期間中および治験薬の投与後少なくとも28日間、本治験実施計画書で概略を示した1種類の効果の高い避妊法を使用する意思のない者、または使用することができない者
9. 医療用医薬品、一般用医薬品、または健康補助食品を治験薬初回投与前14日または半減期の5倍（いずれか期間の長い方）以内に服用した者。例外として、アセトアミノフェン/パラセタモールは1日あたり1g以内の服用を認めた。その他一般用医薬品で、被験者の安全性および治験の結果に影響しないと考えられた場合、治験依頼者により限定的な使用が認められた。
 - ハーブ系サプリメント（セントジョーンズワート等）を服用している場合は、治験薬の初回投与の少なくとも28日前に中止した。
10. 治験薬投与前3ヵ月以内に400 mL以上、または1ヵ月以内に200 mL以上の献血（血漿成分献血および血小板献血を除く）を行った者
11. ヘパリンに対する過敏症またはヘパリン起因性血小板減少症の既往歴のある者
12. ヒト免疫不全ウイルス (HIV)、B型肝炎、またはC型肝炎の既往歴のある者。HIV、B型肝炎表面抗原 (HepBsAg)、B型肝炎コア抗体 (HepBcAb)、またはC型肝炎抗体 (HCVAb) についての検査が陽性の者、あるいは梅毒反応が陽性の者
 - ただし、ワクチン接種によるHepBsAb陽性の結果は許容した。

1.1.4. 治験薬, ロット番号, 用法および用量, 投与期間**1.1.4.1. 治験薬およびロット番号**

治験薬のロット番号および製剤識別番号を Table 1-1 に示す。

Table 1-1. 治験薬 (B8441001 試験)

Study Drug Description	Vendor Lot Number	Pfizer Lot Number	Strength/Potency	Dosage Form
Penicillin G benzathine injectable suspension 2,400,000 units per 4 mL	14320.1	W07964	2.4 million units	syringe

1.1.4.2. 用法および用量

PCG ベンザチン懸濁液は、2,400,000 単位の PCG ベンザチンを含有する使い捨て 4 mL のプレフィルドシリンジ製剤で、Bicillin L-A として治験依頼者により提供された。最低 10 時間の夜間絶食後、午前 8 時前後 (±2 時間) に被験者へ治験薬を投与した。治験薬取り扱いマニュアルに従い、治験実施医療機関スタッフがプレフィルドシリンジ内の PCG ベンザチン全量を臀部の上外側四分円に深部筋肉内投与した。

1.1.4.3. 投与期間

Day 1 に治験薬を単回投与した^{注1}。

1.1.5. 評価項目**1.1.5.1. 薬物動態, 薬力学またはその他の評価項目**

PK 解析に用いる血漿を 1.5 mL 以上得るため、Day 1 (投与前, 投与 3, 6, 12 時間後), Day 2 (投与 24, 36 時間後), Day 3 (投与 48 時間後), Day 7 (投与 144 時間後), Day 14 (投与 312 時間後), Day 21 (投与 480 時間後) および Day 28 (投与 648 時間後, フォローアップ期間) に、適切にラベルを貼付したエチレンジアミン四酢酸二カリウム (K2EDTA) 含有採血管に PK 用血液検体約 4 mL を採取した。予定採血時間から 10% 以内 (例: 60 分後の採血の場合は予定時間から ±6 分) に採取した PK 用血液検体については、正確な採血時間が原資料およびデータ収集ツール (例: CRF) に記載されていれば、治験実施計画書からの逸脱としなかった。血漿中 PCG の分析 (定量) は、治験依頼者の標準業務手順書に準拠して行った。バリデーション済みの高感度高速液体クロマトグラフィー・タンデム質量分析法 (HPLC-MS/MS) を用いた。血漿検体は約 -70 °C の温度で冷凍保存し、バリデートされた検体安定性をもつ期間 71 日間以内に分析を行った^{注2,注3}。

注1 治験総括報告書 9.1 項より追記

注2 治験総括報告書 9.5.3.1 項より追記

注3 治験総括報告書 9.5.3.2 項より追記

各被験者について、血漿中濃度－時間データからノンコンパートメント解析法を用いて、以下に記載する血漿中 PCG の PK パラメータを算出した。定量限界下限を 0.500 ng/mL とし、この数値未満の検体の濃度は 0 ng/mL として解析した。PK 解析には検体採取の実時間を用いた。

評価項目：最高血漿中濃度 (C_{max})，最高血漿中濃度到達時間 (T_{max})，血漿中 PCG 濃度が有効濃度 (18 ng/mL) を超えた期間 (TAMIC)，終末相における半減期 ($t_{1/2}$)，0 時間から最終定量可能時間までの血漿中濃度－時間曲線下面積 (AUC_{last})，0 時間から無限大時間までの血漿中濃度－時間曲線下面積 (AUC_{inf})，見かけのクリアランス (CL/F)，見かけの分布容積 (V_z/F)

1.1.5.2. 有効性の評価項目

本試験では有効性の評価は実施しなかった^{注1}。

1.1.5.3. 安全性の評価項目

安全性評価のため、有害事象、重篤な有害事象、バイタルサイン（血圧および心拍数）、ECG、臨床検査値および身体所見の臨床モニタリングを行った。

1.1.6. 統計解析方法

1.1.6.1. 解析対象集団

PK 濃度解析対象集団^{注2}：PCG ベンザチンの投与を受け、かつ少なくとも血漿中濃度が 1 つ以上報告されたすべての組み入れられた被験者と定義した。

PK パラメータ解析対象集団^{注2}：PCG ベンザチンの投与を受け、かつ少なくとも PK パラメータが 1 つ以上算出されたすべての組み入れられた被験者と定義した。

安全性解析対象集団^{注2}：治験薬の投与を受けたすべての被験者と定義した。

1.1.6.2. 統計解析

1.1.6.2.1. 薬物動態

本試験では、6 例の評価可能な PK データを取得するため、組み入れ被験者数を経験則から 8 例とした。治験期間が比較的長期にわたることから、脱落例が発生することを考慮し組み入れ被験者数を決定した^{注3}。

PCG の薬物動態を評価するため、PK パラメータの一覧を作成し、PK パラメータ解析対象集団の被験者について要約した。各 PK パラメータを要約し、Table 1-2 に示したとおり要約統計量を設定した。

注1 治験総括報告書 9.5.2 項より追記

注2 治験実施計画書 9.3.1 項より追記

注3 治験総括報告書 9.7.2 項より追記

Table 1-2. 薬物動態パラメータ (B8441001 試験)

Parameter	Summary Statistics
AUC _{last} , AUC _{inf} , C _{max} , CL/F, and V _z /F	N, arithmetic mean, median, %CV, standard deviation, minimum, maximum, geometric mean and geometric %CV
T _{max} , TAMIC	N, median, minimum, maximum
t _{1/2}	N, arithmetic mean, median, %CV, standard deviation, minimum, maximum

Abbreviations: %CV=percent coefficient of variation; AUC_{inf}=area under the plasma concentration-time profile from time 0 extrapolated to infinite time; AUC_{last}=area under the plasma concentration-time profile from time 0 to the time of the last quantifiable concentration; CL/F=apparent clearance; C_{max}=maximum plasma concentration; N=number of subjects; t_{1/2}=terminal half-life; T_{max}=time for C_{max}; TAMIC=the duration for which plasma concentrations exceeds 18 ng/mL; V_z/F=apparent volume of distribution.

個々の被験者のパラメータ (AUC_{inf}, AUC_{last}, C_{max}) を箱ヒゲ図に示し、幾何平均値と重ね合わせて提示した。

要約統計量の中央値および平均値の採取時間別プロットには PK 用血液検体の予定採取時間を、各被験者の時間別プロットには PK 用血液検体の実採取時間を用いた^{注1}。

1.1.6.2.2. 安全性

治験薬を投与したすべての被験者を安全性解析に含め、一覧表に記載した。

安全性データについては推計的解析を計画しなかった。治験依頼者の報告基準に従い、安全性およびその他の評価項目の一覧表を作成し、要約した。結果データの概要は、安全性解析対象集団の被験者を対象とした。

1.2. 試験結果

1.2.1. 被験者の内訳および特性

被験者の内訳を Table 1-3 に示す。

合計 8 例の被験者に治験薬の投与を割り付け、8 例全例が本試験を完了した。本試験では、中止例はなかった。PCG ベンザチンを投与した 8 例全例を PK および安全性の解析対象とした^{注2}。

注1 治験総括報告書 9.7.3.1 項より追記

注2 治験総括報告書 10.2 項より追記

Table 1-3. 被験者の内訳 (B8441001 試験)

Number (%) of Subjects	Penicillin G Benzathine (N=8) n (%)
Disposition Phase: Treatment	
Subjects Entered:	8 (100.0)
Discontinued	0
Completed	8 (100.0)
Disposition Phase: Follow-Up	
Subjects Entered:	8 (100.0)
Discontinued	0
Completed	8 (100.0)

Compound name: PF-00345307.

Abbreviations: n=number of subjects that met criteria, N=number of subjects evaluable.

本試験に組み入れた 8 例全例が男性であった。被験者の平均年齢は 30.63 歳 (範囲: 21~44 歳), 平均体重は 68.2 kg (範囲: 54.9~81.0 kg), BMI の平均値は 23.3 kg/m² (範囲: 18.6~27.9 kg/m²) であった^{注1}。

1.2.2. 薬物動態の結果

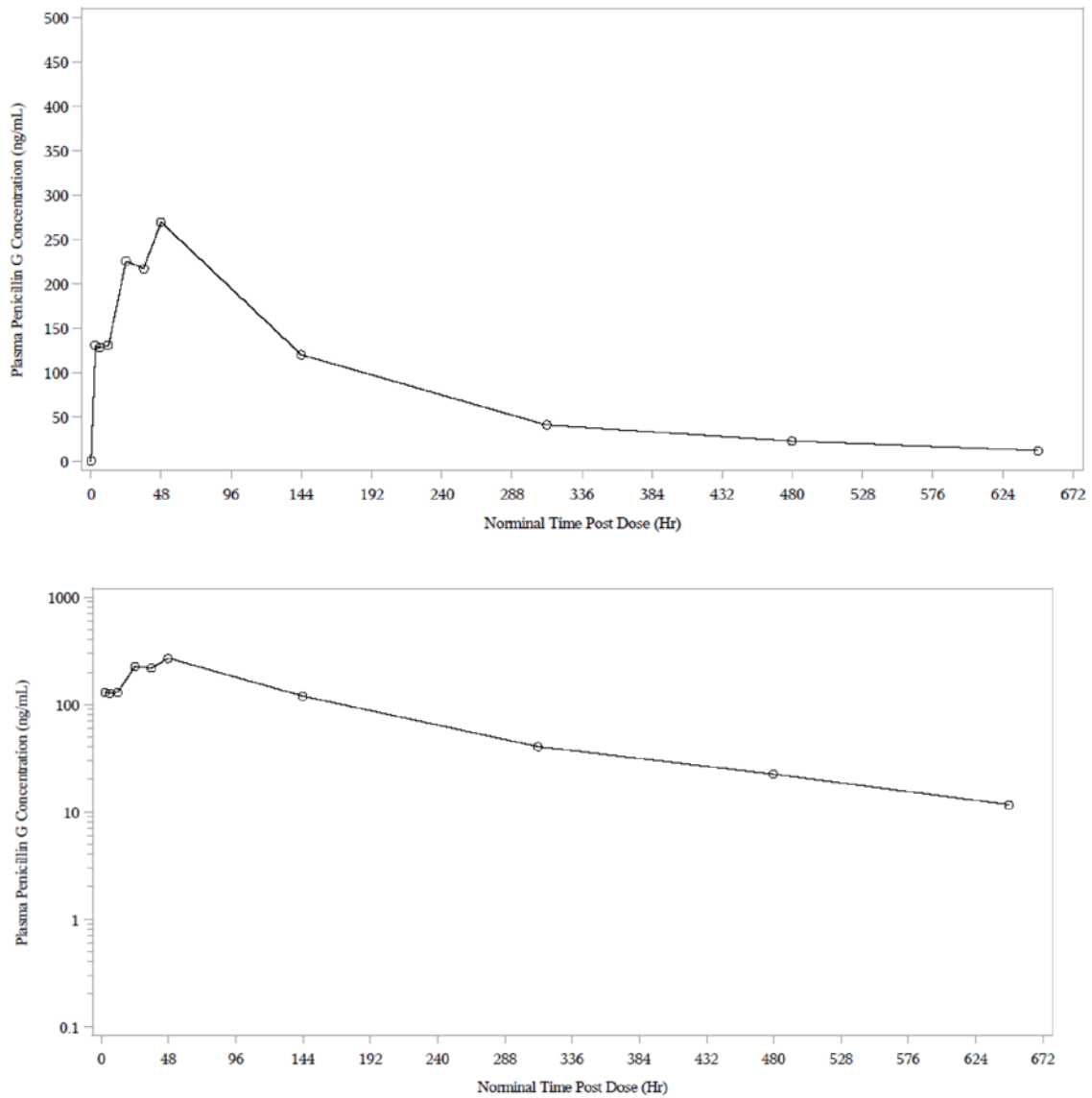
PCG ベンザチンを投与した 8 例全例を PK 解析対象としたが, 全量 (240 万単位) が投与されていないと考えられた 2 例 (それぞれ推定投与量 190 万単位および 210 万単位) のデータは要約統計量には含めないこととしたため, 結果概要は被験者 6 例のデータに基づいている。PCG ベンザチン 240 万単位を単回筋肉内投与したときの血漿中 PCG 濃度-時間プロファイルの中央値を [Figure 1-1](#) に, 血漿中 PCG の PK パラメータの要約を [Table 1-4](#) に示す。

単回筋肉内投与したとき, PCG は注射部位から徐々に吸収され, T_{max} の中央値は投与後 48.00 時間であった。C_{max} 到達後, 血漿中濃度は単相性に徐々に低下し, t_{1/2} の平均値は 188.8 時間であった。AUC_{inf} (幾何平均値) は 50770 ng•h/mL, C_{max} (幾何平均値) は 259.0 ng/mL であった。TAMIC の中央値は 561.0 時間 [範囲: 439~608 時間 (18~25 日)] であった。

PCG 曝露量の被験者間変動は低く, AUC_{inf} および C_{max} の%幾何変動係数がそれぞれ 11% および 28% であった。

^{注1} 治験総括報告書 10.5 項より追記

Figure 1-1. PCG ベンザチン 240 万単位を単回筋肉内投与したときの血漿中 PCG 濃度 (中央値) - 時間プロファイル (B8441001 試験)



Source: Clinical study report Figure 1

Upper and lower panels are linear and semi-log scales, respectively.

The lower limit of quantification was 0.500 ng/mL.

Summary statistics have been calculated by setting concentration values below the lower limit of quantification to 0.

Data for 2 subjects with under dose were excluded.

Table 1-4. 血漿中 PCG の薬物動態パラメータの要約 (B8441001 試験)

Parameter, Units ^a	Penicillin G Benzathine (N=8)
N ₂ , N ₃	6, 6
AUC _{last} (ng•hr/mL)	47410 (12)
AUC _{inf} (ng•hr/mL)	50770 (11)
C _{max} (ng/mL)	259.0 (28)
CL/F (L/hr)	26.87 (11)
V _z /F (L)	7110 (30)
TAMIC (hr)	561 (439-608)
T _{max} (hr)	48.00 (3.00-48.00)
t _{1/2} (hr)	188.8±50.98

Compound name: PF-00345307.

Abbreviations: N: Total number of subjects assigned to the pharmacokinetic parameter analysis population.

N₂ = Number of subjects contributing to the summary statistics

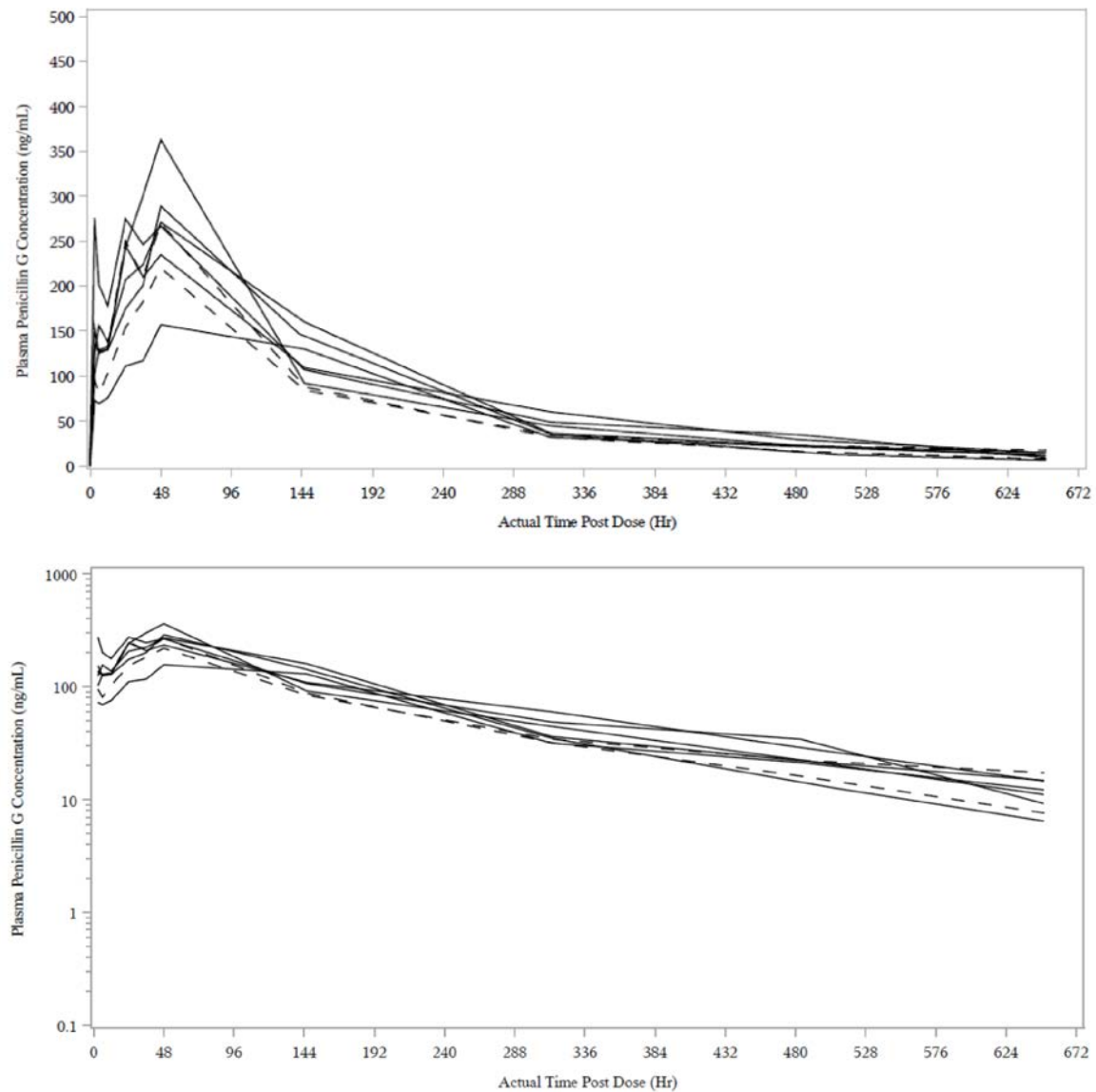
N₃ = Number of subjects contributing to the summary statistics for AUC_{inf}, t_{1/2}, CL/F and V_z/F.

a. Geometric mean (geometric %coefficient of variation) for all expect: median (range) for TAMIC and T_{max}; Arithmetic mean±SD for t_{1/2}.

Data for 2 subjects with under dose were excluded.

個々の被験者の血漿中 PCG 濃度推移を [Figure 1-2](#) に示す。PCG ベンザチンの投与量が全量 (240 万単位) でないと考えられた 2 例 (それぞれ推定量 190 万単位および 210 万単位) のデータも本図に含まれている。投与量が不十分であった被験者 2 例の血漿中濃度は、他の被験者の血漿中濃度とオーバーラップしていた。被験者 2 例の PK パラメータは、PCG ベンザチン 240 万単位の投与を受けた他の 6 例の結果の範囲内に収まっていた。被験者 2 例の TAMIC 値はそれぞれ、461 時間および 624 時間 (19 日および 26 日) であった。

Figure 1-2. PCGベンザチン240万単位を単回筋肉内投与したときの個々の被験者の血漿中PCG濃度-時間プロファイル (B8441001 試験)



Upper and lower panels are linear and semi-log scales, respectively.

The lower limit of quantification was 0.500 ng/mL.

Concentration values below the lower limit of quantification had been set to 0.

Dashed line represented the 2 subjects with under dose.

1.2.3. 有効性の結果

本試験では、有効性の評価を実施しなかった^{注1}。

1.2.4. 安全性の結果**1.2.4.1. 有害事象**

治験薬との因果関係を問わない有害事象の要約および重症度別の治験薬との因果関係を問わない有害事象の発現状況を、それぞれ Table 1-5 および Table 1-6 に要約する。

非重篤の有害事象として軽度の上咽頭炎が 1 例 (12.5%) のみ報告された。本有害事象は消失し、治験責任医師により治験薬と関連なしと判断された。

Table 1-5. 治験薬との因果関係を問わない有害事象の要約 (B8441001 試験)

Number (%) of Subjects	Penicillin G Benzathine (N=8)
Subjects evaluable for adverse events	8
Number of adverse events	1
Subjects with adverse events	1 (12.5)
Subjects with serious adverse events	0
Subjects with severe adverse events	0
Subjects discontinued from study due to adverse events (a)	0
Subjects discontinued study drug due to AE and continue Study (b)	0
Subjects with dose reduced or temporary discontinuation due to adverse events	0

Source: Clinical study report Table 14

Compound name: PF-00345307.

Includes all data collected since the first dose of study drug.

Except for the Number of Adverse Events subjects are counted only once per treatment in each row.

Serious Adverse Events - according to the investigator's assessment.

(a) Subjects who have an AE record that indicates that the AE caused the subject to be discontinued from the study

(b) Subjects who have an AE record that indicates that action taken with study treatment was drug withdrawn but AE did not cause the subject to be discontinued from study

Abbreviations: AE=adverse event, MedDRA=Medical Dictionary for Regulatory Activities, n=number of subjects in specified category.

注1 治験総括報告書 9.5.2 項より追記

Table 1-6. 重症度別の治験薬との因果関係を問わない有害事象の発現状況 (B8441001 試験)

Number of Subjects Evaluable for AEs Severity(a) Number (%) of Subjects: by SYSTEM ORGAN CLASS and Preferred Term	Penicillin G Benzathine (N=8)			Total n (%)
	Mild n (%)	Mod. n (%)	Sev. n (%)	
With any Adverse Event	1 (12.5)	0	0	1 (12.5)
感染症および寄生虫症	1 (12.5)	0	0	1 (12.5)
上咽頭炎	1 (12.5)	0	0	1 (12.5)

Source: Clinical study report Table 15

Compound name: PF-00345307.

(a) If the same subject in a given treatment had more than one occurrence in the same preferred term event category, only the most severe occurrence is counted.

Subjects are counted only once per treatment per event. For the TESS algorithm any missing severities have been imputed as severe unless the subject experienced another occurrence of the same event in a given treatment for which severity was recorded. In this case, the reported severity is summarized. Missing baseline severities are imputed as mild. Includes all data collected since the first dose of study drug.

Maximum severity at any dictionary level is calculated after the report subset criteria is applied.

Abbreviations: AEs=adverse events, MedDRA=Medical Dictionary for Regulatory Activities, N=number of subjects evaluable, n=number of subjects, Mod.=Moderate, Sev.=Severe.

コーディング辞書：日本語訳は MedDRA/J 22.1 を用いた。

1.2.4.2. 死亡

本試験中に死亡例の報告はなかった^{注1}。

1.2.4.3. 重篤な有害事象

本試験では、重篤な有害事象および重度の有害事象は認められなかった^{注2}。

1.2.4.4. 有害事象による投与中止

有害事象による投与中止または減量・休薬はなかった^{注3}。

1.2.4.5. バイタルサイン、心電図、臨床検査およびその他の検査

本試験では、バイタルサインが事前に定めた臨床上注意を要する基準に該当する被験者はいなかった。

基準値上限の 1.2 倍を超えるリンパ球および好酸球が、被験者 1 例 (12.5%) に認められた。尿 pH 値が 8 を超えた被験者が 2 例 (25.0%) 認められた。

注1 治験総括報告書 12.3.1.1 項より追記

注2 治験総括報告書 12.3.1.2 項より追記

注3 治験総括報告書 12.2.3.2 項より追記

1.3. 結論

- PCGベンザチン240万単位を単回筋肉内投与したとき、 AUC_{inf} (幾何平均値)は50770 ng•h/mL、 C_{max} (幾何平均値)は259.0 ng/mL、 T_{max} (中央値)は投与後48.00時間であった。
- 目標有効濃度 (18 ng/mL または 0.03 単位/mL) を超えていた期間の中央値は561.0時間 [範囲：439～608時間 (18～25日)] であった。この値は、梅毒トレポネーマを完全に除菌するために必要とされる維持期間の7～10日間を超えていた。
- 終末相半減期の平均値は188.8時間であった。
- 日本人健康成人被験者において、PCGベンザチン240万単位の単回筋肉内投与は安全であり、忍容性は良好であった。