

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2013に準拠して作成（一部2018に準拠）



剤形	素錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	1錠中に日本薬局方イトラコナゾール50mgを含有する。
一般名	和名：イトラコナゾール（JAN） 洋名：Itraconazole（JAN, INN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2008年3月14日 薬価基準収載年月日：2008年7月4日 発売年月日：2008年7月4日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：科研製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問合せ窓口	科研製薬株式会社 医薬品情報サービス室 TEL：0120-519-874 受付時間：9:00～17:00（土、日、祝日、その他当社の休業日を除く） ホームページアドレス： https://www.kaken.co.jp/

本IFは2022年10月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器総合機構ホームページ <http://www.pmda.go.jp/> にてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要 ー日本病院薬剤師会ー

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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、医薬品医療機器総合機構ホームページ (<http://www.pmda.go.jp/>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載に合わせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い、IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IFの発行]

- ①「IF記載要領 2013」は、平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信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、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	8. 透析等による除去率	13
1. 開発の経緯	1	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	14
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	1. 警告内容とその理由	14
II. 名称に関する項目	2	2. 禁忌内容とその理由	14
1. 販売名	2	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	14
2. 一般名	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	14
3. 構造式又は示性式	2	5. 重要な基本的注意とその理由	14
4. 分子式及び分子量	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	15
5. 化学名（命名法）	2	7. 相互作用	16
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	8. 副作用	25
7. CAS登録番号	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	27
III. 有効成分に関する項目	3	10. 過量投与	27
1. 物理化学的性質	3	11. 適用上の注意	27
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	12. その他の注意	27
3. 有効成分の確認試験法	3	IX. 非臨床試験に関する項目	28
4. 有効成分の定量法	3	1. 薬理試験	28
IV. 製剤に関する項目	4	2. 毒性試験	28
1. 剤形	4	X. 管理的事項に関する項目	29
2. 製剤の組成	4	1. 規制区分	29
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	4	2. 有効期間又は使用期限	29
4. 製剤の各種条件下における安定性	4	3. 貯法・保存条件	29
5. 調製法及び溶解後の安定性	5	4. 薬剤取扱い上の注意点	29
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	5	5. 承認条件等	29
7. 溶出性	5	6. 包装	29
8. 生物学的試験法	6	7. 容器の材質	29
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	6	8. 同一成分・同効薬	29
10. 製剤中の有効成分の定量法	6	9. 国際誕生年月日	30
11. 力価	6	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	30
12. 混入する可能性のある夾雑物	6	11. 薬価基準収載年月日	30
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	6	12. 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	30
14. その他	6	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	30
V. 治療に関する項目	7	14. 再審査期間	30
1. 効能又は効果	7	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	30
2. 用法及び用量	7	16. 各種コード	30
3. 臨床成績	8	17. 保険給付上の注意	30
VI. 薬効薬理に関する項目	9	XI. 文献	31
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	9	1. 引用文献	31
2. 薬理作用	9	2. その他の参考文献	31
VII. 薬物動態に関する項目	10	XII. 参考資料	32
1. 血中濃度の推移・測定法	10	1. 主な外国での発売状況	32
2. 薬物速度論的パラメータ	11	2. 海外における臨床支援情報	32
3. 吸収	12	XIII. 備考	34
4. 分布	12	1. その他の関連資料	34
5. 代謝	12		
6. 排泄	13		
7. トランスポーターに関する情報	13		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

イトラコナゾールはトリアゾール系に分類される抗真菌薬であり、本邦では 1993 年に経口剤（カプセル剤）、2006 年に注射剤が上市され、広く臨床で使用されている。

イトラコナゾール錠 50mg「科研」は、イトラコナゾールを主成分とする経口剤の後発医薬品（錠剤）として科研製薬株式会社が開発を企画し、薬食発第 0331015 号（2005 年 3 月 31 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2008 年 3 月に承認を取得、2008 年 7 月に発売に至った。

また、2010 年 4 月に「爪カンジダ症」「カンジダ性爪囲爪炎」に対する効能・効果を追加する旨の一部変更承認を取得し、現在に至っている。

なお、有効成分であるイトラコナゾールは、第十五改正日本薬局方第一追補に記載された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

本剤は、服薬コンプライアンスの向上を目指し錠剤として研究・開発を進めたイトラコナゾール製剤である。

II. 名称に関する項目

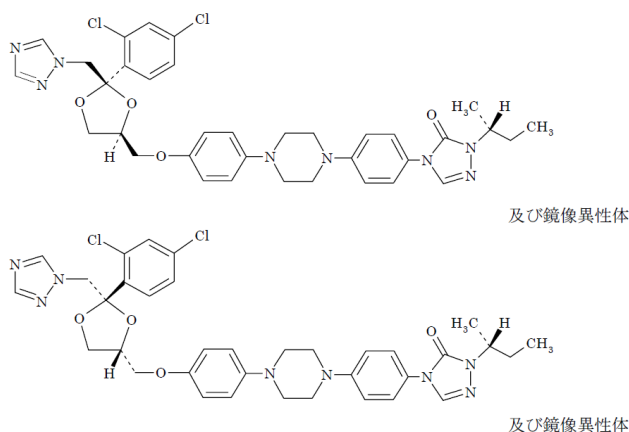
1. 販売名

- (1) 和名：イトラコナゾール錠 50mg 「科研」
- (2) 洋名：Itraconazole Tablets 50mg 「KAKEN」
- (3) 名称の由来：有効成分の一般的名称に由来する。

2. 一般名

- (1) 和名（命名法）：イトラコナゾール（JAN）
- (2) 洋名（命名法）：Itraconazole（JAN, INN）
- (3) ステム：-conazole（ミコナゾール系の合成抗真菌薬）

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₃₅H₃₈Cl₂N₈O₄
分子量：705.63

5. 化学名（命名法）

4-(4-{4-[4-((2*RS*,4*SR*)-2-(2,4-Dichlorophenyl)-2-[(1*H*-1,2,4-triazol-1-yl)methyl]-1,3-dioxolan-4-yl)methoxy)phenyl]piperazin-1-yl}phenyl)-2-[(1*RS*)-1-methylpropyl]-2,4-dihydro-3*H*-1,2,4-triazol-3-one (IUPAC)

4-(4-{4-[4-((2*SR*,4*RS*)-2-(2,4-Dichlorophenyl)-2-[(1*H*-1,2,4-triazol-1-yl)methyl]-1,3-dioxolan-4-yl)methoxy)phenyl]piperazin-1-yl}phenyl)-2-[(1*RS*)-1-methylpropyl]-2,4-dihydro-3*H*-1,2,4-triazol-3-one (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号：ITCZ（日本化学療法学会制定）
治験成分記号：KIT-T

7. CAS 登録番号

84625-61-6

III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の粉末である。

(2) 溶解性

溶 媒	1gを溶かすのに要する溶媒量	日本薬局方の 溶解度表記
<i>N,N</i> -ジメチルホルムアミド	10mL以上 30mL未満	やや溶けやすい
エタノール (99.5)	1000mL以上 10000mL未満	極めて溶けにくい
水、2-プロパノール	10000mL以上	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

融点：166～170℃

(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

旋光度：本品の *N,N*-ジメチルホルムアミド溶液（1→100）は旋光性を示さない。

乾燥減量：0.5%以下（1g、105℃、4時間）

強熱残分：0.1%以下（1g）

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

日本薬局方「イトラコナゾール」の確認試験法による。

1) 紫外可視吸光度測定法

2) 赤外吸収スペクトル測定法

3) 炎色反応

4. 有効成分の定量法




日本薬局方「イトラコナゾール」の定量法による。

・電位差滴定法

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

性状	外形			サイズ・重量
	表面	裏面	側面	
白色～灰白色の素錠				直径：8.5mm 厚さ：3.7mm 重量：0.237g

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

KC55（錠剤表面）

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

1錠中に日本薬局方イトラコナゾール 50mg を含有する。

(2) 添加物

エリスリトール、結晶セルロース・カルメロースナトリウム、ヒプロメロースフタル酸エステル、ポリソルベート 80、マクロゴール 6000、ラウリル硫酸ナトリウム、ヒプロメロース、軽質無水ケイ酸、スクラロース、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

(3) その他

特になし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

最終包装製品を用いた加速試験の結果、本品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¹⁾。

保存条件	包装形態	保存期間	結果
40℃、75%RH	PTP/アルミピロー包装 (乾燥剤入) /紙箱	6 カ月	適合*

※性状、確認試験、溶出性、含量

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、本剤は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが確認された²⁾。

保存条件	包装形態	保存期間	結果
25℃、60%RH	PTP/アルミピロー包装 (乾燥剤入) /紙箱	36 ヶ月	適合 [*]

※性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、溶出性、含量

【無包装状態での安定性試験³⁾】

保存条件		包装形態	保存期間	結果
湿度	25℃、75%RH	無包装	3 ヶ月	変化なし [*]
光	白色蛍光ランプ (約 1000lx)		30 万 lx・hr (13 日間)	変化なし [*]
			60 万 lx・hr (25 日間)	外観の変化が認められた [*]

※性状 (外観)、硬度、崩壊試験、溶出性、含量

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化 (物理化学的変化)

該当しない

7. 溶出性

溶出挙動における類似性

(「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：2006 年 11 月 24 日付 薬食審査発第 1124004 号)

①試験法：日本薬局方一般試験法溶出試験法 パドル法

②試験条件

試験液量：900mL 測定方法：液体クロマトグラフィー

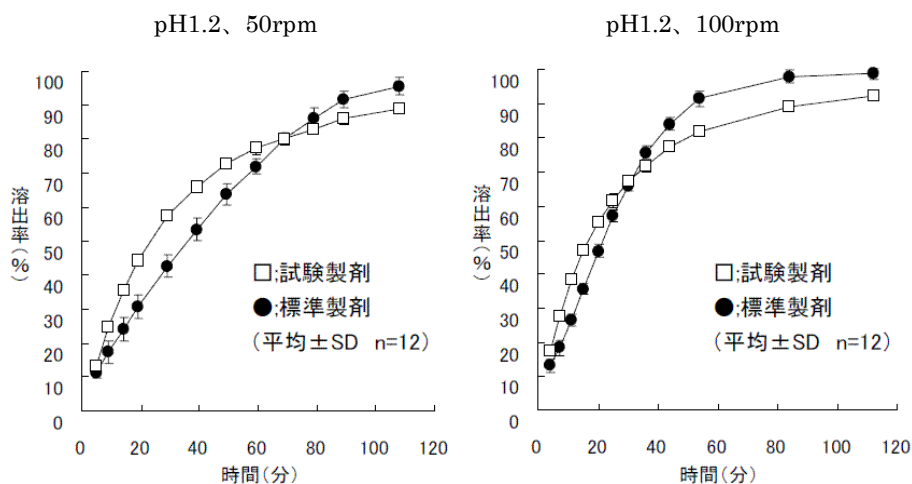
各種条件：

試験液	サンプリング時間 (分)	回転数
pH1.2	標準製剤：10,15,20,25,30,40,50,60,70,80,90,100,120 試験製剤：2,5,7,10,15,20,25,30,45,60,90,120	50rpm
pH3.0	30,60,120,180,240,300,360	
pH6.8		
水		
pH1.2	標準製剤：5,9,13,17,21,26,31,36,42,50,60,90,120 試験製剤：2,4,7,10,14,19,24,30,45,60,90,120	100rpm
試験液温	37.0±0.5℃	
ベッセル数	12 ベッセル	

③試験結果：イトラコナゾールは塩基性薬物であることから、pH が低い試験液以外では溶出が認められず、pH6.8、あるいは水を試験液とした条件では、試験製剤 (イトラコナゾール錠 50mg「科研」)、標準製剤 (50mg、カプセル剤) とともに溶出率は 0% であった。なお、pH3.0 の場合も同様に、イトラコナゾールの溶出は認められなかった (溶出率：2%未満)。

pH1.2、パドル回転数を毎分 50 回転又は 100 回転とした条件における両製剤の溶出挙動は下図のとおりである。なお、標準製剤はカプセル剤であることから、溶出初期においてラグ時間が認められたため、標準製剤のラグ時間を補正した。その結果、いずれのパドル回転数においても「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準を満たし、同等の溶出挙動であることが明らかとなった。以上の結果より、試験製剤と標準製剤の溶出挙動は全ての溶液、条件において「溶出挙動の同等性の判定基準」に適合したことから、試験製剤の溶出挙動は標準製剤と同等であると判定された⁴⁾。

・ pH1.2 における溶出挙動（回転数：50rpm 及び 100rpm）



8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

- 1) クエン酸・酢酸試液による呈色反応
- 2) 紫外可視吸光度測定法
- 3) 薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

14. その他

特になし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

(1) 効能又は効果

[適応菌種]

皮膚糸状菌（トリコフィトン属、ミクロスポルム属、エピデルモフィトン属）、カンジダ属、マラセチア属、アスペルギルス属、クリプトコックス属、スポロトリックス属、ホンセカエア属

[適応症]

○内臓真菌症（深在性真菌症）

真菌血症、呼吸器真菌症、消化器真菌症、尿路真菌症、真菌髄膜炎

○深在性皮膚真菌症

スポロトリコーシス、クロモミコーシス

○表在性皮膚真菌症（爪白癬以外）

白癬：体部白癬、股部白癬、手白癬、足白癬、頭部白癬、ケルスス禿瘡、白癬性毛瘡

カンジダ症：口腔カンジダ症、皮膚カンジダ症、爪カンジダ症、カンジダ性爪囲爪炎、

カンジダ性毛瘡、慢性皮膚粘膜カンジダ症

癬風、マラセチア毛包炎

○爪白癬

(2) 効能又は効果に関連する注意

5. 効能又は効果に関連する注意

〈表在性皮膚真菌症（爪白癬以外）〉

5.1 難治性あるいは汎発性の病型に使用すること。

〈爪白癬（パルス療法）〉

5.2 本剤は抗菌薬であるため、新しい爪が伸びてこない限り、一旦変色した爪所見を回復させるものではない。

2. 用法及び用量

(1) 用法及び用量

〈内臓真菌症（深在性真菌症）〉

通常、成人にはイトラコナゾールとして100～200mgを1日1回食直後に経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、イトラコナゾール注射剤からの切り替えの場合、1回200mgを1日2回（1日用量400mg）食直後に経口投与する。

〈深在性皮膚真菌症〉

通常、成人にはイトラコナゾールとして100～200mgを1日1回食直後に経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、1日最高用量は200mgとする。

〈表在性皮膚真菌症（爪白癬以外）〉

通常、成人にはイトラコナゾールとして50～100mgを1日1回食直後に経口投与する。ただし、爪カンジダ症及びカンジダ性爪囲爪炎に対しては、100mgを1日1回食直後に経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、1日最高用量は200mgとする。

〈爪白癬（パルス療法）〉

通常、成人にはイトラコナゾールとして1回200mgを1日2回（1日量400mg）食直後に1週間経口投与し、その後3週間休薬する。これを1サイクルとし、3サイクル繰り返す。なお、必要に応じ適宜減量する。

(2) 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意

〈効能共通〉

7.1 本剤はイトリゾール内用液と生物学的に同等ではなく、イトリゾール内用液はバイオアベイラビリティが向上しているため、イトリゾール内用液から本剤への切り替えについては、イトラコナゾールの血中濃度が低下することがあるので、イトリゾール内用液の添加剤であるヒドロキシプロピル-β-シクロデキストリンに起因する胃腸障害（下痢、軟便等）による異常を認めた場合などを除き、原則として切り替えを行わないこと。

〈爪白癬（パルス療法）〉

7.2 減量時の有効率に関しては、「17. 臨床成績」の項を参照のこと。

〈爪カンジダ症、カンジダ性爪囲爪炎〉

7.3 長期（6ヵ月程度）にわたって投与しても症状の改善が認められない場合には、本剤の投与を中止する。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果

爪白癬に対するパルス療法の有効率は、400mg/日 3 サイクル投与 84.6% (44/52)、200mg/日 6 サイクル投与 66.7% (34/51)、200mg/日 3 サイクル投与 63.8% (30/47) であった（イトリゾール®カプセル 50 の添付文書による）。

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

該当資料なし

(5) 検証的試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

該当資料なし

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

トリアゾール系化合物（フルコナゾール、ボリコナゾール等）

イミダゾール系化合物（ミコナゾール、ケトコナゾール、ビホナゾール、クロトリマゾール等）

2. 薬理作用

（1）作用部位・作用機序

真菌のチトクローム P450 に特異的に作用して、真菌の細胞膜の主要構成脂質であるエルゴステロールの生合成を阻害する。イトラコナゾールは哺乳類由来のチトクローム P450 には影響が少なかった⁵⁾。

（2）薬効を裏付ける試験成績

抗真菌作用

① トリコフィトン属、ミクロスポルム属、エピデルモフィトン属、カンジダ属、マラセチア属、クリプトコックス属、アスペルギルス属、スポロトリックス属、ホンセカエア属に対して *in vitro* で強い抗真菌活性を示した⁶⁻⁹⁾。

② マウス、ラット、モルモットの免疫正常動物及び実験的な免疫不全動物における実験的皮膚真菌症、クリプトコックス症、アスペルギルス症、カンジダ症、スポロトリコーシスに対して高い有効性を示した¹⁰⁻¹²⁾。

（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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

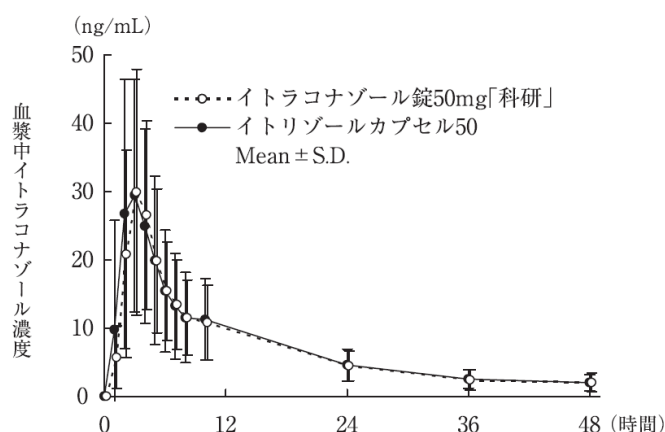
(2) 最高血中濃度到達時間

「(3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（2006年11月24日付 薬食審査発第1124004号）

イトラコナゾール錠 50mg「科研」と標準製剤（イトリゾールカプセル 50）を、クロスオーバー法によりそれぞれ1製剤（イトラコナゾールとして 50mg）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¹³⁾。



健康成人（n=5）にイトラコナゾールカプセルを単回経口投与したときの血漿中濃度推移

健康成人（n=20）に単回投与したときの薬物動態パラメータ

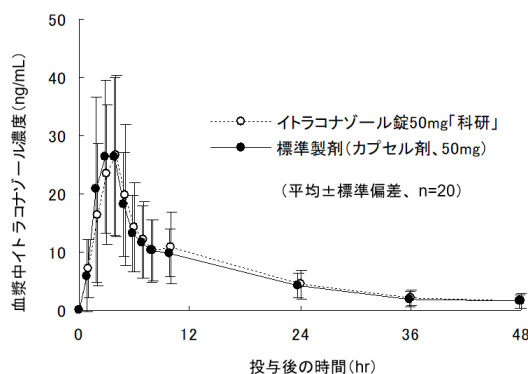
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	T _{1/2} (hr)
イトラコナゾール錠 50mg「科研」	333.4±159.1	34.6±17.0	3.0±0.9	15.9±6.5
標準製剤 (イトリゾールカプセル 50)	347.0±184.9	35.8±19.7	2.8±1.0	15.5±3.7

(平均値±S.D.)

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。

(参考)

イトラコナゾール錠 50mg「科研」1錠（イトラコナゾールとして 50mg）を、水に溶解して懸濁液とし健康成人男子に絶食時単回経口投与した場合の血中濃度推移は以下のとおりであった¹³⁾。



薬物動態パラメータ（平均±標準偏差、n=20）

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₄₈ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
イトラコナゾール錠 50mg「科研」(懸濁投与)	312.0±154.9	31.3±13.6	3.1±0.9	13.6±3.5
標準製剤 (イトリゾールカプセル 50)	300.9±135.5	32.9±13.6	2.9±1.0	12.9±3.1

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

食事の影響

イトラコナゾール 100mg を空腹時に投与したとき、食直後投与時の最高血漿中濃度の約 40%であり、ヒドロキシイトラコナゾールも同様の傾向が認められ、食直後投与によってイトラコナゾールの生物学的利用率が向上した¹⁴⁾。

併用薬の影響

「VIII-7. 相互作用」の項参照

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

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) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数

0.0492±0.0155 (試験製剤単回投与時、平均±標準偏差、n=20) ⁶⁾

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

99.8% (ヒト血漿蛋白、外国人でのデータ) ¹⁵⁾

3. 吸 収

該当資料なし

4. 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

乳汁中への移行が報告されている ¹⁵⁾。

(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

患者・健康成人のデータでは、イトラコナゾール 100mg 経口投与後の肺、腎、肝、皮膚等の組織内未変化体濃度は血漿中濃度よりも高かった。また、皮膚組織内未変化体濃度は、最終投与後 1 週間は治療濃度域であった ¹⁶⁾。(外国人データ)

5. 代 謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

主に肝臓で代謝され、約 30 種類以上の代謝物が確認されている ¹⁵⁾。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種

CYP3A4¹⁵⁾

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

あり (割合は不詳) ¹⁵⁾

(4) 代謝物の活性の有無及び比率

主代謝物である OH-ITZ は、未変化体とほぼ同等の抗真菌活性を有することが知られている¹⁵⁾。

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

主な排泄経路は糞中である¹⁵⁾。

(2) 排泄率

³H-イトラコナゾール 100mg をヒトに単回投与した場合、投与 7 日後までに 35.2% が尿中に、54.1% が糞中に排泄された (外国人データ)¹⁵⁾。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

本剤は血液透析によって除去できない (「VIII-10. 過量投与」の項参照)。

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

該当しない

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）

- 2.1 ピモジド、キニジン、ベプリジル、トリアゾラム、シンバスタチン、アゼルニジピン、アゼルニジピン・オルメサルタン メドキシミル、ニソルジピン、エルゴタミン・カフェイン・イソプロピルアンチピリン、ジヒドロエルゴタミン、エルゴメトリン、メチルエルゴメトリン、バルデナフィル、エプレレノン、プロナンセリン、シルデナフィル（レバチオ）、タダラフィル（アドシルカ）、スポレキサント、イブルチニブ、チカグレロル、ロミタピド、イバブラジン、ベネトクラクス（再発又は難治性の慢性リンパ性白血病（小リンパ球性リンパ腫を含む）の用量漸増期）、ルラシドン塩酸塩、アナモレリン塩酸塩、フィネレノン、アリスキレン、ダビガトラン、リバーロキサパン、リオシグアトを投与中の患者 [10.1 参照]
- 2.2 肝臓又は腎臓に障害のある患者で、コルヒチンを投与中の患者 [9.2.1、9.3.2、10.2 参照]
- 2.3 本剤の成分に対して過敏症の既往歴のある患者 [8.1、9.1.1 参照]
- 2.4 重篤な肝疾患の現症、既往歴のある患者 [8.1、9.3.1 参照]
- 2.5 妊婦又は妊娠している可能性のある女性 [9.5 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

〈表在性皮膚真菌症（爪白癬以外）〉

- 5.1 難治性あるいは汎発性の病型に使用すること。

〈爪白癬（パルス療法）〉

- 5.2 本剤は抗菌薬であるため、新しい爪が伸びてこない限り、一旦変色した爪所見を回復させるものではない。

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

〈効能共通〉

- 7.1 本剤はイトリゾール内用液と生物学的に同等ではなく、イトリゾール内用液はバイオアベイラビリティが向上しているため、イトリゾール内用液から本剤への切り替えについては、イトラコナゾールの血中濃度が低下することがあるので、イトリゾール内用液の添加剤であるヒドロキシプロピル-β-シクロデキストリンに起因する胃腸障害（下痢、軟便等）による異常を認められた場合などを除き、原則として切り替えを行わないこと。

〈爪白癬（パルス療法）〉

- 7.2 減量時の有効率に関しては、「17. 臨床成績」の項を参照のこと。

〈爪カンジダ症、カンジダ性爪囲爪炎〉

- 7.3 長期（6 ヶ月程度）にわたって投与しても症状の改善が認められない場合には、本剤の投与を中止する。

5. 重要な基本的注意とその理由

〈効能共通〉

- 8.1 本剤の投与に際しては、肝疾患の既往歴、薬物過敏症、アレルギー既往歴等について十分な問診を行い、これらの現症又は既往歴のある患者については、投与中止又は慎重投与について考慮すること。 [2.3、2.4、9.1.1、9.3.1、9.3.3 参照]
- 8.2 肝障害、胆汁うっ滞、黄疸があらわれることがあるので、定期的に肝機能検査を行うことが望ましい。 [11.1.2 参照]

- 8.3 本剤投与開始にあたっては、あらかじめワルファリン服用の有無を確認し、ワルファリンと併用する場合は、プロトロンビン時間測定及びトロンボテストの回数を増やすなど慎重に投与すること。[10.2 参照]
- 8.4 低カリウム血症があらわれることがあるので、定期的に血中電解質検査を行うこと。[11.1.6 参照]
- 〈内臓真菌症（深在性真菌症）〉
- 8.5 イトラコナゾール注射剤から本剤 400mg/日長期継続投与へ切り替えた場合、高い血中濃度が持続するので、投与期間中には、血液検査等を定期的に行うことが望ましい。
- 〈爪白癬（パルス療法）〉
- 8.6 本剤は投与終了後も爪甲中に長期間貯留することから、効果判定は爪の伸長期間を考慮して行うこと。

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. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.1 合併症・既往歴等のある患者

- 9.1.1 薬物過敏症の既往歴、アレルギー既往歴のある患者（ただし、本剤に対して過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと）

[2.3、8.1 参照]

9.1.2 うっ血性心不全又はその既往歴のある患者

うっ血性心不全の悪化又は再発を来すおそれがある。虚血性心疾患、基礎心疾患（弁膜症等）、慢性閉塞性肺疾患、腎不全、その他の浮腫性疾患等うっ血性心不全を起こすおそれのある患者に対して本剤を投与する場合には、その危険性について十分に説明するとともに、下肢浮腫、呼吸困難等の異常が認められた場合には直ちに受診するよう患者を指導すること。[11.1.1 参照]

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 腎機能障害のある患者で、コルヒチンを投与中の患者

投与しないこと。[2.2、10.2 参照]

9.2.2 腎機能障害のある患者（コルヒチンを投与中の患者を除く）

本剤及び代謝物等の排泄が遅延し、副作用があらわれやすくなるおそれがある。

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重篤な肝疾患の現症、既往歴のある患者

投与しないこと。不可逆的な肝障害におちいるおそれがある。[2.4、8.1 参照]

9.3.2 肝機能障害のある患者で、コルヒチンを投与中の患者

投与しないこと。[2.2、10.2 参照]

9.3.3 肝機能障害のある患者（コルヒチンを投与中の患者又は重篤な肝疾患のある患者を除く）

肝障害を悪化させるおそれがある。[8.1、11.1.2 参照]

(4) 生殖能を有する者

9.4 生殖能を有する者

妊娠する可能性のある女性には、本剤投与中及び投与終了後一定期間は、適切な避妊を行うよう指導すること。

(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投与しないこと。動物実験（ラット、マウス）で催奇形性が報告されている。[2.5 参照]

(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。ヒトで母乳中へ移行することが報告されている。

(7) 小児等

9.7 小児等

重症な感染症例で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使用すること。承認時までの臨床試験（効能・効果追加承認時を含む）及び再審査期間内に得られた小児に対する使用例数は65症例（1歳以上7歳未満22例、7歳以上15歳未満43例）であり、副作用は4例に下痢、低カリウム血症、AST、LDH、カリウムの上昇が認められた。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

消化器症状等副作用があらわれた場合は減量又は休薬するなど慎重に投与すること。高齢者では生理機能が低下していることが多く、副作用があらわれやすい。

7. 相互作用

10. 相互作用

本剤は、主に肝チトクローム P450 3A4 (CYP3A4) によって代謝される。また、本剤は、CYP3A4 及び P 糖蛋白 に対して阻害作用を示す。他の薬剤との相互作用はすべての薬剤との組み合わせについて検討されているわけではないので、他剤による治療中に新たに本剤を併用したり、本剤による治療中に新たに他の薬剤を併用する場合には、患者の状態を十分観察し、慎重に投与すること。また、本剤投与終了後の血漿中薬物濃度は、本剤の投与量及び投与期間に応じて徐々に低下するため、本剤によって代謝が影響される薬剤の投与開始に際しては患者の状態を十分に観察し、慎重に投与すること。なお、パルス療法中の患者において休薬期間中に新たに他の薬剤を併用する場合にも、患者の状態を十分に観察し、慎重に投与すること。

(1) 併用禁忌とその理由

10.1 併用禁忌（併用しないこと）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ピモジド オーラップ キニジン ベプリジル ベプリコール [2.1 参照]	これらの薬剤の血中濃度上昇により、QT 延長が発現する可能性がある。	本剤の CYP3A4 に対する阻害作用により、これらの薬剤の代謝が阻害される。

トリアゾラム ハルシオン [2.1 参照]	トリアゾラムの血中濃度上昇、作用の増強、作用時間の延長があらわれることがある。
シンバスタチン リポバス [2.1 参照]	シンバスタチンの血中濃度上昇により、横紋筋融解症があらわれやすくなる。
アゼルニジピン カルブロック アゼルニジピン・オルメサルタン メドキシミル レザルタス配合錠 ニソルジピン [2.1 参照]	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがある。
エルゴタミン・カフェイン・イソプロピルアンチピリン クリアミン配合錠 ジヒドロエルゴタミン エルゴメトリン メチルエルゴメトリン パルタンM [2.1 参照]	これらの薬剤の血中濃度上昇により、血管攣縮等の副作用が発現するおそれがある。
バルデナフィル レビトラ [2.1 参照]	バルデナフィルの AUC が増加し C_{max} が上昇するとの報告がある。
エプレレノン セララ [2.1 参照]	エプレレノンの血中濃度を上昇させるおそれがある。
ブロナンセリン ロナセン [2.1 参照]	ブロナンセリンの血中濃度が上昇し、作用が増強するおそれがある。
シルデナフィル レバチオ [2.1 参照]	シルデナフィルの血中濃度を上昇させるおそれがある (シルデナフィルとリトナビルの併用により、シルデナフィルの C_{max} 及び AUC がそれぞれ 3.9 倍及び 10.5 倍に増加したとの報告がある)。
タダラフィル アドシルカ [2.1 参照]	タダラフィルの血中濃度を上昇させるおそれがある (タダラフィルとケトコナゾールの併用により、タダラフィルの AUC 及び C_{max} がそれぞれ 312%及び 22%増加したとの報告がある)。
スボレキサント ベルソムラ [2.1 参照]	スボレキサントの作用を著しく増強させるおそれがある。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

イブルチニブ イムブルピカ [2.1 参照]	イブルチニブの血中濃度が上昇し、副作用が増強されるおそれがある。	
チカグレロル ブリリント [2.1 参照]	チカグレロルの血中濃度が上昇し、出血の危険性が増大するおそれがある。	
ロミタピド ジャクスタピッド [2.1 参照]	ロミタピドの血中濃度が著しく上昇するおそれがある。	
イバブラジン コラン [2.1 参照]	イバブラジンの血中濃度が上昇し、過度の徐脈があらわれることがある。	
ベネトクラクス (再発又は難治性の慢性リンパ性白血病 (小リンパ球性リンパ腫を含む) の用量漸増期) ベネクレクタ [2.1 参照]	ベネトクラクスの血中濃度が上昇し、腫瘍崩壊症候群の発現が増強する可能性がある。	
ルラシドン 塩酸塩 ラツータ [2.1 参照]	ルラシドン 塩酸塩の血中濃度が上昇し、作用が増強するおそれがある。	
アナモレリン 塩酸塩 エドルミズ [2.1 参照]	アナモレリン 塩酸塩の血中濃度が上昇し、副作用の発現が増強するおそれがある。	
フィネレノン ケレンディア [2.1 参照]	フィネレノンの血中濃度が著しく上昇するおそれがある。	
アリスキレン ラジレス [2.1 参照]	イトラコナゾールカプセルの併用投与 (空腹時) により、アリスキレンの C_{max} 及び AUC がそれぞれ約 5.8 倍及び約 6.5 倍に上昇したとの報告がある。	本剤の P 糖蛋白阻害作用により、アリスキレンの排泄が阻害されると考えられる。
ダビガトラン プラザキサ [2.1 参照]	ダビガトランの血中濃度が上昇し、出血の危険性が増大することがある。	本剤の P 糖蛋白阻害作用により、ダビガトランの排泄が阻害されると考えられる。
リバーロキサバン イグザレルト [2.1 参照]	リバーロキサバンの血中濃度が上昇し、出血の危険性が増大するおそれがある (リバーロキサバンとケトコナゾールの併用により、リバーロキサバンの AUC 及び C_{max} がそれぞれ 158% 及び 72% 増加したとの報告がある)。	本剤の CYP3A4 及び P 糖蛋白阻害作用により、リバーロキサバンの代謝及び排泄が阻害され、抗凝固作用が増強されると考えられる。

リオシグアト アデムパス [2.1 参照]	リオシグアトの血中濃度を上昇させるおそれがある(リオシグアトとケトコナゾールの併用により、リオシグアトの AUC 及び C_{max} がそれぞれ 150%及び 46%増加し、また、消失半減期が延長し、クリアランスも低下したとの報告がある)。	本剤の CYP3A4 及び P 糖蛋白阻害作用により、リオシグアトのクリアランスが低下することが考えられる。
-----------------------------	---	--

(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
アトルバスタチン	アトルバスタチンの血中濃度を上昇させることがあり、横紋筋融解症があらわれやすくなる。必要に応じてアトルバスタチンの投与量を減量するなど用量に注意すること。	本剤の CYP3A4 に対する阻害作用により、これらの薬剤の代謝が阻害される。
ビンカアルカロイド系抗悪性腫瘍剤 ビンクリスチン ビンブラスチン等	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがあり、ビンカアルカロイド系抗悪性腫瘍剤の副作用が増強されることがある。必要に応じてこれらの薬剤の投与量を減量するなど用量に注意すること。	
メチルプレドニゾロン デキサメタゾン ブデソニド	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがあり、これらの薬剤の副作用が増強されることがある。必要に応じてこれらの薬剤の投与量を減量するなど用量に注意すること。	
コルヒチン [2.2、9.2.1、9.3.2 参照]	コルヒチンの血中濃度を上昇させることがあり、コルヒチンの作用が増強されることがある。必要に応じてコルヒチンの投与量を減量するなど用量に注意すること。	
ジソピラミド	ジソピラミドの血中濃度上昇により、QT 延長が発現する可能性がある。必要に応じてジソピラミドの投与量を減量するなど用量に注意すること。	

ベンゾジアゼピン系薬剤 ミダゾラム プロチゾラム アルプラゾラム	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがある。必要に応じてこれらの薬剤の投与量を減量するなど用量に注意すること。
抗精神病薬 ハロペリドール アリピプラゾール ペロスピロン クエチアピン	<ul style="list-style-type: none"> • 本剤とアリピプラゾールの併用により、アリピプラゾールの C_{max}、AUC、$t_{1/2}$ がそれぞれ 19.4%、48.0%、18.6%増加したとの報告がある。 • 本剤とペロスピロンの併用により、ペロスピロンの C_{max} 及び AUC がそれぞれ 5.7倍及び6.8倍増加したとの報告がある。
免疫抑制剤 シクロスポリン タクロリムス水和物	
抗悪性腫瘍剤 ドセタキセル水和物 エベロリムス テムシロリムス ゲフィチニブ ダサチニブ エルロチニブ ラパチニブ ボルテゾミブ イマチニブ スニチニブ ボスチニブ カバジタキセル セリチニブ クリゾチニブ シロリムス (錠) パノビノスタット ポナチニブ ルキシロチニブ アパルタミド トレチノイン (カプセル)	<ul style="list-style-type: none"> • クリゾチニブ反復投与時に本剤を併用投与したとき、クリゾチニブの定常状態における AUC_{tau} 及び C_{max} は単独投与と比べそれぞれ 57%及び 33%増加した。
オピオイド系鎮痛剤 フェンタニル オキシコドン メサドン	<ul style="list-style-type: none"> • 本剤とオキシコドンの併用により、オキシコドンのクリアランスが 32%減少し、AUC が 51%増加したとの報告がある (オキシコドン注射剤)。また、オキシコドンの AUC が 144%上昇したとの報告がある (オキシコドン経口剤)。
ブプレノルフィン セレギリン	<ul style="list-style-type: none"> • トルバプタンとの併用が避けられない場合は、トル

<p> ガランタミン モザバプタン トルバプタン エレトリプタン サルメテロール シクレソニド フルチカゾン アプレピタント イミダフェナシン ソリフェナシン トルテロジン シロスタゾール シナカルセト エバスチン ダルナビル マラビロク オキシブチニン ドンペリドン シロドシン キニーネ ゴピクロン グアンファシン ジエノゲスト </p>	<p> バプタンの減量あるいは、低用量から開始するなど用量に注意すること。 ・本剤とイミダフェナシンの併用により、イミダフェナシンのC_{max}及びAUCがそれぞれ 1.32 倍及び 1.78 倍増加したとの報告がある。 </p>	
<p> シルデナフィル バイアグラ </p>	<p> シルデナフィルとエリスロマイシンの併用によりシルデナフィルのC_{max}、AUCの増加が認められたとの報告がある。必要に応じてシルデナフィルの投与量を減量するなど用量に注意すること。 </p>	
<p> タダラフィル シアリス ザルティア </p>	<p> タダラフィルの血中濃度を上昇させるおそれがある(タダラフィルとケトコナゾールの併用により、タダラフィルのAUC及びC_{max}がそれぞれ312%及び22%増加したとの報告がある)。必要に応じてタダラフィルの投与量を減量するなど用量に注意すること。 </p>	
<p> ワルファリン [8.3 参照] </p>	<p> ワルファリンの作用が増強し、著しいINR上昇があらわれることがある。必要に応じてワルファリンの投与量を減量するなど用量に注意すること。 </p>	
<p> アキシチニブ </p>	<p> アキシチニブの血中濃度が上昇し、副作用の発現頻度及び重症度が増加するおそれがある。やむを得ず併用する際にはアキシチニブの減量 </p>	

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

	を考慮するとともに、患者の状態を慎重に観察し、副作用発現に十分注意すること。	
フェソテロジン	活性代謝物 5-HMT の血漿中濃度の上昇に伴い効果や副作用の増強が予想される。必要に応じてフェソテロジンの投与量を減量するなど用量に注意すること。	
ボセンタン	ボセンタンの血中濃度が上昇し、ボセンタンの副作用が発現しやすくなるおそれがある。必要に応じてボセンタンの投与量を減量するなど用量に注意すること。	
アルテメテル・ルメファントリン	アルテメテル及びルメファントリンの血中濃度が上昇し、QT 延長が起こるおそれがある。必要に応じてアルテメテル・ルメファントリンの投与量を減量するなど用量に注意すること。	
デソゲストレル・エチニルエストラジオール	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがある。必要に応じてデソゲストレル・エチニルエストラジオールの投与量を減量するなど用量に注意すること。	
ベネトクラクス (再発又は難治性の慢性リンパ性白血病 (小リンパ球性リンパ腫を含む) の維持投与期、急性骨髄性白血病)	ベネトクラクスの血中濃度が上昇し、副作用が増強する可能性があるため、ベネトクラクスを減量するとともに患者の状態を慎重に観察すること。	
ジヒドロピリジン系 Ca 拮抗剤 ニフェジピン ニルバジピン フェロジピン等 ベラパミル	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがある。また、心機能が低下する可能性がある。必要に応じてこれらの薬剤の投与量を減量するなど用量に注意すること。	本剤の CYP3A4 に対する阻害作用により、これらの薬剤の代謝が阻害される。また、両剤の心抑制作用が増強する可能性がある。
イリノテカン	イリノテカンの活性代謝物の血中濃度が上昇することがある。必要に応じてイリノテカンの投与量を減量するなど用量に注意すること。	本剤の CYP3A4 阻害作用により、イリノテカンの活性代謝物の無毒化が阻害されると考えられる。
ニロチニブ	ニロチニブの血中濃度が上昇し、QT 延長があらわれることがある。必要に応じてニロチニブの投与量を減量する	本剤の CYP3A4 及び P 糖蛋白阻害作用により、ニロチニブの代謝及び排泄が阻害されると考えられる。

	など用量に注意すること。	
アピキサバン	アピキサバンの血中濃度を上昇させることがある。必要に応じてアピキサバンの投与量を減量するなど用量に注意すること。	本剤の CYP3A4 及び P 糖蛋白阻害作用により、アピキサバンの代謝及び排泄が阻害されると考えられる。
エドキサバン	エドキサバンの血中濃度を上昇させ、出血の危険性を増大させるおそれがある。必要に応じてエドキサバンの投与量を減量するなど用量に注意すること。	本剤の P 糖蛋白阻害作用により、エドキサバンのバイオアベイラビリティを上昇させると考えられる。
ジゴキシン ブスルファン	これらの薬剤の血中濃度を上昇させることがある。本剤とブスルファンの併用により、ブスルファンのクリアランスが 20%減少したとの報告がある。必要に応じてこれらの薬剤の投与量を減量するなど用量に注意すること。	機序不明
ロペラミド	ロペラミドの血中濃度が上昇することがある。必要に応じてロペラミドの投与量を減量するなど用量に注意すること。	本剤の CYP3A4 及び P 糖蛋白阻害作用により、ロペラミドの代謝及び排泄が阻害されると考えられる。
クラリスロマイシン リトナビル ホスアンプレナビル/リトナビル エリスロマイシン シプロフロキサシン	本剤の血中濃度が上昇することがある。本剤とシプロフロキサシンの併用により、イトラコナゾールの C_{max} 及び AUC がそれぞれ 53.13%及び 82.46%増加したとの報告がある。必要に応じて本剤の投与量を減量するなど用量に注意すること。	これらの薬剤の CYP3A4 に対する阻害作用により、本剤の代謝が阻害される。
ダルナビル/リトナビル	本剤又はダルナビルの血中濃度が上昇する可能性がある(ダルナビル/リトナビルとケトコナゾールの併用により、ダルナビルとケトコナゾールの血中濃度の上昇が認められたとの報告がある)。必要に応じて本剤又はこれらの薬剤の投与量を調節するなど用量に注意すること。	本剤及びこれらの薬剤の CYP3A4 に対する阻害作用により、血中濃度の変化が起こる場合がある。
エルビテグラビル・コビスタット・エムトリシタビン・テノホビル アラフェナミドフマル酸塩	本剤、エルビテグラビル及びコビスタットの血中濃度が上昇する可能性がある。必要に応じて本剤又はこれら	本剤及びコビスタットの CYP3A 等阻害作用により、相互に代謝が阻害される。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

エルビテグラビル・コビスタット・エムトリシタビン・テノホビル ジソプロキシルフマル酸塩	の薬剤の投与量を調節するなど用量に注意すること。	
ダルナビル エタノール付加物・コビスタット	本剤、ダルナビル又はコビスタットの血中濃度が上昇する可能性がある。必要に応じて本剤又はダルナビル エタノール付加物・コビスタットの投与量を調節するなど用量に注意すること。	本剤とダルナビル及びコビスタットの CYP3A 阻害作用により、相互に代謝が阻害される。
ダルナビル エタノール付加物・コビスタット・エムトリシタビン・テノホビル アラフェナミドフマル酸塩	本剤、ダルナビル、コビスタット又はテノホビル アラフェナミドの血中濃度が上昇する可能性がある。必要に応じて本剤又はダルナビル エタノール付加物・コビスタット・エムトリシタビン・テノホビル アラフェナミドフマル酸塩の投与量を調節するなど用量に注意すること。	本剤とダルナビル、コビスタット及びテノホビル アラフェナミドの CYP3A 及び P 糖蛋白阻害作用により、相互に代謝が阻害される。
カルバマゼピン エトラビリン リファブチン	本剤の血中濃度が低下することがある。また、これらの薬剤の血中濃度が上昇する可能性がある。必要に応じて本剤又はこれらの薬剤の投与量を調節するなど用量に注意すること。	これらの薬剤の肝薬物代謝酵素誘導により、本剤の肝代謝が促進される。また、本剤の CYP3A4 に対する阻害作用によりこれらの薬剤の代謝が阻害される。
リファンピシン フェニトイン イソニアジド フェノバルビタール エファビレンツ ネビラピン	本剤の血中濃度が低下することがある。 本剤とネビラピンの併用により、本剤の C _{max} 、AUC 及び t _{1/2} がそれぞれ 38%、61%及び 31%減少したとの報告がある。必要に応じて本剤の投与量、両剤の投与間隔を調節するなど注意すること。	これらの薬剤の肝薬物代謝酵素誘導により、本剤の肝代謝が促進される。
H ₂ 遮断薬 ファモチジン等	本剤の血中濃度が低下することがある。併用する場合には両剤の投与間隔をできる限り空けるなど慎重に投与すること。	酸分泌量低下のため本剤の消化管での溶解性が低下し、吸収が低下することがある。
プロトンポンプ阻害剤 オメプラゾール ランソプラゾール ラベプラゾール エソメプラゾール ボノプラザンフマル酸塩	本剤の血中濃度が低下することがある。必要に応じて本剤の投与量、両剤の投与間隔を調節するなど注意すること。	

制酸剤 乾燥水酸化アルミニウムゲル 乾燥水酸化アルミニウムゲル・水酸化マグネシウム等	本剤と制酸剤の併用により、本剤の C_{max} 及び AUC がそれぞれ 70%及び 66%減少したとの報告がある。必要に応じて本剤の投与量、両剤の投与間隔を調節するなど注意すること。	
メロキシカム	本剤とメロキシカムの併用により、メロキシカムの C_{max} 及び AUC がそれぞれ 64%及び 37%減少したとの報告がある。必要に応じてメロキシカムの投与量を調節するなど用量に注意すること。	本剤がメロキシカムの消化管からの吸収を抑制すると考えられる。

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 うっ血性心不全（頻度不明）、肺水腫（頻度不明）

下肢浮腫、呼吸困難等の症状に注意すること。[9.1.2 参照]

11.1.2 肝障害（0.25%）、胆汁うっ滞（頻度不明）、黄疸（0.02%）

食欲不振、嘔気、嘔吐、倦怠感、腹痛、褐色尿等の症状に注意すること。[8.2、9.3.3 参照]

11.1.3 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）（0.1%未満）、急性汎発性発疹性膿疱症（頻度不明）、剥脱性皮膚炎（頻度不明）、多形紅斑（頻度不明）

11.1.4 ショック（頻度不明）、アナフィラキシー（頻度不明）

チアノーゼ、冷汗、血圧低下、呼吸困難、胸内苦悶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。

11.1.5 間質性肺炎（頻度不明）

咳嗽、呼吸困難、発熱、肺音の異常（捻髪音）等が認められた場合には、速やかに胸部 X 線、胸部 CT、血清マーカー等の検査を実施し、本剤の投与を中止するとともに、適切な処置を行うこと。

11.1.6 低カリウム血症（0.1%未満）

[8.4 参照]

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	0.1%未満	頻度不明
感染症			鼻炎
過敏症			血管浮腫
循環器		不整脈	心室性期外収縮、房室ブロック、動悸、狭心症発

Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

			作、徐脈、心電図異常、血管障害、血圧上昇、頻脈、高血圧、低血圧
消化器	腹痛、嘔気、便秘、下痢、嘔吐、消化不良、食欲不振、鼓腸放屁	おくび、舌炎、口内炎、腹部腰背部痛	軟便、腹部不快感、口腔内痛、歯周炎、胃炎、胃十二指腸潰瘍
肝臓	肝機能異常、AST 増加、ALT 増加、LDH 増加、 γ -GTP 増加、ALP 増加	血中ビリルビン増加、LAP 増加	
呼吸器			咽喉頭疼痛、呼吸困難、咳嗽
皮膚	発疹、そう痒症	紅斑性発疹、脱毛、蕁麻疹、光線過敏性反応	白血球破砕性血管炎、湿疹、皮膚乾燥、皮膚腫脹
精神神経系	倦怠感	肩こり、不眠、めまい、頭痛、末梢神経障害	眠気、錯感覚、感覚鈍麻、不安、傾眠、発声障害、錯乱状態、振戦
腎臓	BUN の上昇	尿蛋白及び尿糖の陽性、腎障害	頻尿、尿失禁、血尿、尿検査異常、尿円柱、尿量減少、腎機能検査値異常 ^{注)} 、腎尿細管障害
血液	好酸球増多、白血球減少、血小板減少	貧血	白血球増多、顆粒球減少、好中球減少
生殖器			月経異常、勃起不全
その他	浮腫	発熱、ほてり、味覚異常、耳鳴、難聴	胸痛、血清病、視覚障害(霧視、複視を含む)、筋痛、関節痛、悪寒、異常感、無力症、腫脹、自傷、体重増加、高血糖、多汗症、顔面浮腫
臨床検査	トリグリセライドの上昇	血清尿酸上昇、血清カリウムの上昇、血中アマラーゼ増加、総蛋白増加、総コレステロール増加	血中リン増加、血中コレステロール減少、血中ナトリウム減少、CRP 増加、CK 増加

注) イトリゾール内用液の国内臨床試験において認められた以下の事象を含む：尿中 β_2 ミクログロブリン増加、 β -N アセチル D グルコサミニダーゼ増加、尿中 α_1 ミクログロブリン増加、尿検査異常
 発現頻度は、内在性真菌症に対する臨床試験（注射剤を最大 2 週間投与後、本剤を最大 12 週間投与）での安全性評価対象例 51 例（うちカプセル剤継続投与 36 例）及び使用成績調査を含む。

(3) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

(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

該当資料なし

(5) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「2. 禁忌内容とその理由」「5. 重要な基本的注意とその理由」「8. (1) 重大な副作用と初期症状」及び「8. (2) その他の副作用」の項参照

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

本剤は血液透析によって除去できない。

11. 適用上の注意

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。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15. その他の注意

15.1 臨床使用に基づく情報

類似化合物（ミコナゾール）では血糖降下剤との併用により、著しい血糖低下が認められたとの報告がある。

(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」参照

(2) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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

該当資料なし

(3) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) その他の特殊毒性

該当資料なし

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（注意－医師等の処方箋により使用すること）
有効成分：劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

（1）薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

（2）薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

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報告されている。〕

患者向医薬品ガイド：あり
くすりのしおり：あり

（3）調剤時の留意点について

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 包 装

PTP：56錠（8錠×7）、100錠（10錠×10）

7. 容器の材質

PTP……ポリ塩化ビニル、アルミニウム
ピロー……アルミニウム、ポリエチレン
個装箱……紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：イトリゾールカプセル 50、イトリゾール内用液 1%、イトリゾール注 1%等
同 効 薬：フルコナゾール、フルシトシン、アムホテリシン B、ミコナゾール、
テルビナフィン等

9. 国際誕生年月日

1988年4月1日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日：2008年3月14日

承認番号：22000AMX01268000

11. 薬価基準収載年月日

2008年7月4日

12. 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

○追加された効能・効果および用法・用量（下線部、2010年4月8日承認）

【効能・効果】爪カンジダ症、カンジダ性爪囲爪炎

【用法・用量】表在性皮膚真菌症（爪白癬以外）

通常、成人にはイトラコナゾールとして50～100mgを1日1回食直後に経口投与する。ただし、爪カンジダ症及びカンジダ性爪囲爪炎に対しては、100mgを1日1回食直後に経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、1日最高用量は200mgとする。

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

HOT（9桁）番号	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード
118521801	6290004F1011	620007914

17. 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。

XI. 文 献

1. 引用文献

- 1) 科研製薬株式会社：イトラコナゾール錠 50mg「科研」の安定性に関する資料（加速試験）（社内資料）
- 2) 科研製薬株式会社：イトラコナゾール錠 50mg「科研」の安定性に関する資料（長期保存試験）（社内資料）
- 3) 科研製薬株式会社：イトラコナゾール錠 50mg「科研」の安定性に関する資料（無包装状態での安定性試験）（社内資料）
- 4) 科研製薬株式会社：イトラコナゾール錠 50mg「科研」の溶出性に関する資料（社内資料）
- 5) Vanden Bossche H.et al. : Mycoses.1989 ; 32(Suppl.1) : 35-52
- 6) 平谷民雄 他 : Jpn J Antibiotics.1991 ; 44 : 580-587
- 7) 内田勝久 他 : Jpn J Antibiotics.1991 ; 44 : 562-570
- 8) 内田勝久 他 : Jpn.J Antibiotics.1991 ; 44 : 571-579
- 9) Van Cutsem J : Mycoses.1989 ; 32(Suppl.1) : 7-13
- 10) 内田勝久 他 : Jpn J Antibiotics.1991 ; 44 : 588-599
- 11) Van Cutsem J.et al. : Rev Infect Dis.1987 ; 9(Suppl.1) : 15-32
- 12) Van Cutsem J : Mycoses.1989 ; 32(Suppl.1) : 14-34
- 13) 科研製薬株式会社：イトラコナゾール錠 50mg「科研」の生物学的同等性に関する資料（社内資料）
- 14) 小口勝司 他 : 基礎と臨床.1991 ; 25 : 397-407
- 15) 医薬品服薬指導情報集, Vol.6, 135~146 (1996) (日本薬剤師研修センター)
- 16) Heykants J, et al. : Recent Trends in the Discovery,Development and Evaluation of Antifungal Agents. 1987 ; 223-249

2. その他の参考文献

特になし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

(1) 妊婦への投与に関する海外情報

イトラコナゾール製剤（内用剤）の海外（オーストラリア）における妊婦への投与に関する分類は以下のとおりである。

	分類
オーストラリアの分類 (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)	B3 (2020 年)

<参考：分類の概要>

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

B3 : 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 shown evidence of an increased occurrence of fetal damage, the significance of which is considered uncertain in humans.

なお、本剤の本邦における添付文書の「9.4 生殖能を有する者」、「9.5 妊婦」、「9.6 授乳婦」の項の記載は以下のとおりである。

9.4 生殖能を有する者

妊娠する可能性のある女性には、本剤投与中及び投与終了後一定期間は、適切な避妊を行うよう指導すること。

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。動物実験（ラット、マウス）で催奇形性が報告されている。[2.5 参照]

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。ヒトで母乳中へ移行することが報告されている。

(2) 小児等への投与に関する海外情報

イトラコナゾール製剤（内用剤）の米国の添付文書及び英国の SPC における記載は以下のとおりである。

出典	記載内容
米国の添付文書 (2018年5月)	<p>Pediatric Use: The efficacy and safety of SPORANOX^{®注)} have not been established in pediatric patients. The long-term effects of itraconazole on bone growth in children are unknown. In three toxicology studies using rats, itraconazole induced bone defects at dosage levels as low as 20 mg/kg/day (2.5 times the MRHD). The induced defects included reduced bone plate activity, thinning of the zona compacta of the large bones, and increased bone fragility. At a dosage level of 80 mg/kg/day (10 times the MRHD) over 1 year or 160 mg/kg/day (20 times the MRHD) for 6 months, itraconazole induced small tooth pulp with hypocellular appearance in some rats.</p>
英国の SPC (2013年4月)	<p>Paediatrics Clinical data on the use of Sporanox^{®注)} Capsules in paediatric patients are limited. The use of Sporanox Capsules in paediatric patients is not recommended unless it is determined that the potential benefit outweighs the potential risks. See section 4.4 Special warnings and precautions for use.</p>

注：SPORANOX・・・米国、英国におけるイトラコナゾール製剤の商品名の一つ

なお、本剤の本邦における「9.7 小児等」の項の記載は以下のとおりである。

9.7 小児等

重症な感染症例で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使用すること。
承認時までの臨床試験（効能・効果追加承認時を含む）及び再審査期間内に得られた小児に対する使用例数は65症例（1歳以上7歳未満22例、7歳以上15歳未満43例）であり、副作用は4例に下痢、低カリウム血症、AST、LDH、カリウムの上昇が認められた。

XIII. 備 考

1. その他の関連資料

(1) GS1コード

製品名	包装	GS1コード	
		販売包装単位	調剤包装単位
イトラコナゾール錠 50mg「科研」	56錠 PTP	(01)14987042 372025	(01)04987042 372516
	100錠 PTP	(01)14987042 372056	(01)04987042 372523