

貯法：室温保存  
有効期間：60ヵ月



抗真菌剤  
イソコナゾール硝酸塩錠錠

**アデスタン<sup>®</sup> 錠錠300mg**

Adestan vaginal tablets 300mg

日本標準商品分類番号

872529

承認番号

22100AMX00740000

販売開始

1985年7月

D7

## 2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

## 3. 組成・性状

### 3.1 組成

販売名	アデスタン錠錠300mg
有効成分	1錠中イソコナゾール硝酸塩300mg含有
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム

### 3.2 製剤の性状

販売名	アデスタン錠錠300mg
剤形	錠錠
色調	白色
外形	
長径	26mm
短径	14mm
厚さ	6.2mm
質量	1.6g
識別コード	

## 4. 効能又は効果

カンジダに起因する膣炎及び外陰膣炎

## 6. 用法及び用量

イソコナゾール硝酸塩として、1週1回600mgを膣深部に挿入する。

なお、真菌学的効果(一次効果)が得られない場合は、600mgをさらに1回使用する。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

### 9.5 妊婦

妊娠3ヵ月までの妊婦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使用すること。

### 9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら慎重に使用すること。一般に生理機能が低下している。

## 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使用を中止するなど適切な処置を行うこと。

### 11.2 その他の副作用

	1%未満	頻度不明
膣	刺激感	疼痛、腫脹感、そう痒感、発赤、熱感

## 14. 適用上の注意

### 14.1 薬剤交付時の注意

本剤はPTPシートから取り出して膣内にもみ使用するよう指導すること。

## 16. 薬物動態

### 16.2 吸収

健康女性2名に<sup>3</sup>H-イソコナゾール硝酸塩100mgを、また健康女性3名に<sup>3</sup>H-イソコナゾール硝酸塩600mgをそれぞれ膣内投与したところ、膣粘膜からの吸収は、投与量の約5%及び10%以下と推定された。なお、血漿中の放射活性濃度は検出限界0.2 $\mu$ g/mL以下であった<sup>1),2)</sup>(外国人データ)。

### 16.5 排泄

健康女性3名に<sup>3</sup>H-イソコナゾール硝酸塩600mgを膣内投与したところ、投与後7日までの尿中排泄量は、投与量の平均3.73 $\pm$ 0.27%、糞中排泄量は4.81 $\pm$ 3.35%で総排泄量は8.54 $\pm$ 3.52%であった<sup>2)</sup>(外国人データ)。

## 17. 臨床成績

### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

#### 17.1.1 国内臨床試験

パイロット試験<sup>3)</sup>、二重盲検試験<sup>4)</sup>及び一般臨床試験の成績は、次のとおりであった。

臨床症状改善率	菌陰転率	有効率
95.5%(338/354)	84.1%(280/333)	83.2%(277/333)

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

イソコナゾール硝酸塩は真菌類の細胞膜の透過性を迅速かつ強力に変化させることによって抗真菌作用を発揮する。この結果、細胞呼吸が抑制され、細胞膜構造が破壊される<sup>5)</sup>。

### 18.2 抗菌作用

イソコナゾール硝酸塩は*in vitro*の試験の結果、皮膚糸状菌、酵母及び酵母様真菌、カビ類、グラム陽性細菌、膣のトリコモナスに対して広範な抗菌活性スペクトルを示した<sup>6)-8)</sup>。

SPECIES	MICROORGANISMS	最小発育阻止濃度(MIC) <sup>6)</sup> ( $\mu$ g/mL)
Dermatophytes	<i>Trichophyton mentagrophytes</i>	0.10-3.13
	<i>Trichophyton rubrum</i>	0.10-0.39
	<i>Microsporum canis</i>	0.10-3.13
	<i>Epidermophyton floccosum</i>	0.10-0.20
Yeast & yeastlike fungi	<i>Candida albicans</i>	0.20-3.13
	<i>Candida tropicalis</i>	0.78-3.13
	<i>Candida parapsilosis</i>	0.78-1.56
	<i>Candida stellatoidea</i>	0.10-0.20
	<i>Torulopsis glabrata</i>	1.56-6.25
Moulds	<i>Aspergillus fumigatus</i>	1.56-6.25
	<i>Aspergillus niger</i>	0.78-1.56
Grampositive bacteria	<i>Nocardia asteroides</i>	0.78-1.56
	<i>Staphylococcus/Micrococcus</i> <sup>**</sup>	1.6-6.3

MIC定量は、Sabouraud's dextrose agar(ブドウ糖2%)の寒天平板希釈法による<sup>8)</sup>。

※：液体培地の倍数希釈法による<sup>6)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：イソコナゾール硝酸塩 (Isoconazole Nitrate)

化学名：1-[2-[(2,6-Dichlorobenzyl)oxy]-2-(2,4-dichlorophenyl)ethyl]imidazole nitrate

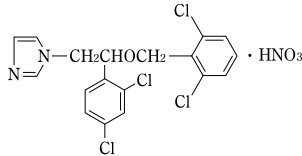
分子式：C<sub>18</sub>H<sub>14</sub>Cl<sub>4</sub>N<sub>2</sub>O · HNO<sub>3</sub>

分子量：479.14

性状：本品は白色～微黄白色の結晶性の粉末である。

本品はメタノールにやや溶けやすく、酢酸(100)にやや溶けにくく、エタノール(95)に溶けにくく、水に極めて溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

化学構造式：



融点：約178℃(分解)

## 20. 取扱い上の注意

小児の手のとどかない所に保管するよう指導すること。

## 22. 包装

40錠[2錠(PTP) × 20]

## 23. 主要文献

- 1) 社内資料: 薬物動態(外国データ)
- 2) 社内資料: 薬物動態(外国データ)
- 3) 水野重光他: 産婦人科の世界. 1982; 34: 201-208
- 4) 水野重光他: 産婦人科の世界. 1982; 34: 541-549
- 5) 西木克侑他: 真菌と真菌症. 1982; 22: 227-239
- 6) Kessler HJ: Arzneimittel-Forsch/Drug Res. 1979; 29: 1344-1351
- 7) 渡辺昌平他: 皮膚科紀要. 1978; 73: 209-214
- 8) 岩田和夫他: Chemotherapy. 1981; 29: 1149-1153

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

文献請求先

バイエル薬品株式会社・メディカルインフォメーション

〒530-0001大阪市北区梅田二丁目4番9号

バイエル医療用医薬品のお問い合わせ先

電話0120-106-398

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元

バイエル薬品株式会社

大阪市北区梅田二丁目4番9号