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

経口抗真菌剤

イトラコナゾール錠

イトラコナゾール錠50mg「科研」

ITRASCONSZOLE Tablets「KAKEN」

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 日局イトラコナゾール 50mg
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・ 販売開始年月日	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 販売開始年月日：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	
問合わせ窓口	科研製薬株式会社 医薬品情報サービス室 T E L：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 2024 年 2 月改訂の添付文書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下さい。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要　－日本病院薬剤師会－

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・表現には医薬品，医療機器等の品質，有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン，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 を利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．

（2020 年 4 月改訂）

目　次

I. 概要に関する項目 …… 1
1．開発の経緯 …… 1
2．製品の治療学的特性 …… 1
3．製品の製剤学的特性 …… 1
4．適正使用に関して周知すべき特性 …… 1
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項 …… 1
（1）承認条件 …… 1
（2）流通・使用上の制限事項 …… 1
6．RMP の概要 …… 1
II. 名称に関する項目 …… 2
1．販売名 …… 2
（1）和　　名 …… 2
（2）洋　　名 …… 2
（3）名称の由来 …… 2
2．一般名 …… 2
（1）和　　名（命名法） …… 2
（2）洋　　名（命名法） …… 2
（3）ステム（stem） …… 2
3．構造式又は示性式 …… 2
4．分子式及び分子量 …… 2
5．化学名（命名法）又は本質 …… 2
6．慣用名、別名、略号、記号番号 …… 2
III. 有効成分に関する項目 …… 3
1．物理化学的性質 …… 3
（1）外観・性状 …… 3
（2）溶解性 …… 3
（3）吸湿性 …… 3
（4）融点（分解点）、沸点、凝固点 …… 3
（5）酸塩基解離定数 …… 3
（6）分配係数 …… 3
（7）その他の主な示性値 …… 3
2．有効成分の各種条件下における安定性 …… 3
3．有効成分の確認試験法，定量法 …… 3
IV. 製剤に関する項目 …… 4
1．剤　　形 …… 4
（1）剤形の区別 …… 4
（2）製剤の外観及び性状 …… 4
（3）識別コード …… 4
（4）製剤の物性 …… 4
（5）その他 …… 4
2．製剤の組成 …… 4
（1）有効成分（活性成分）の含量及び添加剤 …… 4
（2）電解質等の濃度 …… 4
（3）熱量 …… 4
3．添付溶解液の組成及び容量 …… 4
4．力価 …… 4
5．混入する可能性のある夾雑物 …… 4
6．製剤の各種条件下における安定性 …… 5
7．調製法及び溶解後の安定性 …… 5
8．他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 5
9．溶出性 …… 5
10．容器・包装 …… 6
（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 …… 6
（2）包装 …… 6
（3）予備容量 …… 6
（4）容器の材質 …… 6
11．別途提供される資材類 …… 6
12．その他 …… 6
V. 治療に関する項目 …… 7
1．効能又は効果 …… 7
2．効能又は効果に関連する注意 …… 7
3．用法及び用量 …… 7
（1）用法及び用量の解説 …… 7
（2）用法及び用量の設定経緯・根拠 …… 7
4．用法及び用量に関連する注意 …… 8
5．臨床成績 …… 8
（1）臨床データパッケージ …… 8
（2）臨床薬理試験 …… 8
（3）用量反応探索試験 …… 8
（4）検証的試験 …… 8
（5）患者・病態別試験 …… 9
（6）治療的使用 …… 9
（7）その他 …… 9
VI. 薬効薬理に関する項目 …… 10
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …… 10
2．薬理作用 …… 10
（1）作用部位・作用機序 …… 10
（2）薬効を裏付ける試験成績 …… 10
（3）作用発現時間・持続時間 …… 10
VII. 薬物動態に関する項目 …… 11
1．血中濃度の推移 …… 11
（1）治療上有効な血中濃度 …… 11
（2）臨床試験で確認された血中濃度 …… 11
（3）中毒域 …… 12
（4）食事・併用薬の影響 …… 13
2．薬物速度論的パラメータ …… 13
（1）解析方法 …… 13
（2）吸収速度定数 …… 13
（3）消失速度定数 …… 13
（4）クリアランス …… 13
（5）分布容積 …… 13
（6）その他 …… 13
3．母集団（ポピュレーション）解析 …… 13
（1）解析方法 …… 13
（2）パラメータ変動要因 …… 13
4．吸　　収 …… 13
5．分　　布 …… 13
（1）血液 - 脳関門通過性 …… 13
（2）血液 - 胎盤関門通過性 …… 13
（3）乳汁への移行性 …… 13
（4）髄液への移行性 …… 14
（5）その他の組織への移行性 …… 14
（6）血漿蛋白結合率 …… 14
6．代　　謝 …… 14
（1）代謝部位及び代謝経路 …… 14
（2）代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種，寄与率 …… 14
（3）初回通過効果の有無及びその割合 …… 14

（4）代謝物の活性の有無及び活性比，
存在比率 …… 14
7．排　　泄 …… 14
（1）排泄部位及び経路 …… 14
（2）排泄率 …… 14
（3）排泄速度 …… 14
8．トランスポーターに関する情報 …… 14
9．透析等による除去率 …… 14
10．特定の背景を有する患者 …… 14
11．その他 …… 14
VIII．安全性（使用上の注意等）に関する項目 … 15
1．警告内容とその理由 …… 15
2．禁忌内容とその理由 …… 15
3．効能又は効果に関連する注意とその理由 …… 15
4．用法及び用量に関連する注意とその理由 …… 15
5．重要な基本的注意とその理由 …… 15
6．特定の背景を有する患者に関する注意 …… 16
（1）合併症・既往歴等のある患者 …… 16
（2）腎機能障害患者 …… 16
（3）肝機能障害患者 …… 16
（4）生殖能を有する者 …… 16
（5）妊婦 …… 17
（6）授乳婦 …… 17
（7）小児等 …… 17
（8）高齢者 …… 17
7．相互作用 …… 17
（1）併用禁忌とその理由 …… 17
（2）併用注意とその理由 …… 20
8．副作用 …… 25
（1）重大な副作用と初期症状 …… 25
（2）その他の副作用 …… 26
9．臨床検査結果に及ぼす影響 …… 26
10．過量投与 …… 26
11．適用上の注意 …… 27
12．その他の注意 …… 27
（1）臨床使用に基づく情報 …… 27
（2）非臨床試験に基づく情報 …… 27
IX．非臨床試験に関する項目 …… 28
1．薬理試験 …… 28
（1）薬効薬理試験 …… 28
（2）安全性薬理試験 …… 28
（3）その他の薬理試験 …… 28
2．毒性試験 …… 28
（1）単回投与毒性試験 …… 28
（2）反復投与毒性試験 …… 28
（3）遺伝毒性試験 …… 28
（4）がん原性試験 …… 28
（5）生殖発生毒性試験 …… 28
（6）局所刺激性試験 …… 28
（7）その他の特殊毒性 …… 28
X．管理的事項に関する項目 …… 29
1．規制区分 …… 29
2．有効期間 …… 29
3．包装状態での貯法 …… 29
4．取扱い上の注意 …… 29
5．患者向け資材 …… 29
6．同一成分・同効薬 …… 29
7．国際誕生年月日 …… 29
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 …… 29
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 …… 29
10．再審査結果、再評価結果公表年月日及び
その内容 …… 29
11．再審査期間 …… 29
12．投薬期間制限に関する情報 …… 30
13．各種コード …… 30
14．保険給付上の注意 …… 30
XI．文献 …… 31
1．引用文献 …… 31
2．その他の参考文献 …… 32
XII．参考資料 …… 33
1．主な外国での発売状況 …… 33
2．海外における臨床支援情報 …… 33
XIII．備考 …… 35
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 …… 35
（1）粉砕 …… 35
（2）崩壊・懸濁性及び
経管投与チューブの通過性 …… 35
2．その他の関連資料 …… 35
（1）患者向け説明用資材 …… 35
（2）GS1 コード …… 35

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収載された。

２．製品の治療学的特性

（１）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。（**「Ⅵ．薬効薬理に関する項目」、「Ⅴ．治療に関する項目」**の項参照）。
（２）重大な副作用として、うっ血性心不全、肺水腫、肝障害、胆汁うっ滞、黄疸、中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）、急性汎発性発疹性膿疱症、剥脱性皮膚炎、多形紅斑、ショック、アナフィラキシー、間質性肺炎、低カリウム血症、偽アルドステロン症が報告されている。（**「Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目」**参照）

３．製品の製剤学的特性

（１）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。
（２）PTP シートはピッチ印刷の採用により「製品名」「含量」「識別コード」を判りやすく表示している。

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 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

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

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

「有効成分名」＋「剤形」＋「規格」＋「屋号」より命名。

２．一般名

（１）和　　名（命名法）

イトラコナゾール（JAN）

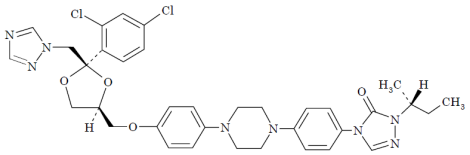
（２）洋　　名（命名法）

Itraconazole（JAN, INN）

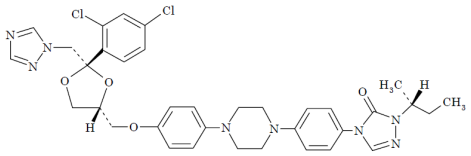
（３）ステム（stem）

-conazole（ミコナゾール系の合成抗真菌薬）

３．構造式又は示性式



及び鏡像異性体



及び鏡像異性体

４．分子式及び分子量

分子式：$C_{35}H_{38}Cl_2N_8O_4$
分子量：705.63

５．化学名（命名法）又は本質

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

別　名：-
略　号：ITCZ（日本化学療法学会制定）
治験成分記号：KIT-T
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
N,N–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）	1,000mL以上10,000mL未満	極めて溶けにくい
水、2-プロパノール	10,000mL未満	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，定量法

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。
・紫外可視吸光度測定法
・赤外吸収スペクトル測定法
・炎色反応

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

素錠

（２）製剤の外観及び性状

色	白色～灰白色		
形状	表	裏	側面
直径	8.5mm		
厚さ	3.7mm		
質量	0.237g		

（３）識別コード

表示部位：錠剤表面
表示内容：KC55

（４）製剤の物性

該当資料なし

（５）その他

該当資料なし

２．製剤の組成

（１）有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

有効成分	1 錠中日局イトラコナゾール 50mg
添加剤	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

（２）電解質等の濃度

該当しない

（３）熱量

該当しない

３．添付溶解液の組成及び容量

該当しない

４．力価

該当しない

５．混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

６．製剤の各種条件下における安定性

試験名	保存条件	保存期間	保存形態	結果
加速試験 1)	40℃、75%RH	6 ヵ月	PTP/アルミピロー包装（乾燥剤入）/紙箱	規格内※1
長期保存試験 2)	25℃、60%RH	36 ヵ月	PTP/アルミピロー包装（乾燥剤入）/紙箱	規格内※2
無包装試験 3)	25℃、75%RH	3 ヵ月	無包装	規格内※3
	白色蛍光ランプ（約 1,000 lx）	30 万 lx・hr（13 日間）		規格内※3
		60 万 lx・hr（25 日間）		外観に規格外の変化が認められた※3

※1 試験項目：性状、確認試験、溶出性、含量
※2 試験項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、溶出性、含量
※3 試験項目：性状、硬度、崩壊試験、溶出性、含量

７．調製法及び溶解後の安定性

該当しない

８．他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

９．溶出性

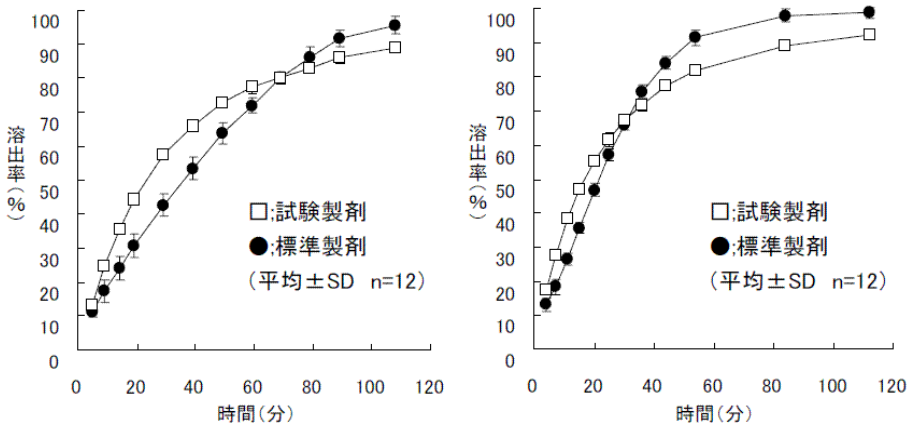
［後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（2006年11月24日付 薬食審査発第1124004号）］
①試験法：日本薬局方一般試験法溶出試験法　パドル法
②被験薬剤
試験製剤：イトラコナゾール錠 50mg「科研」
標準製剤：イトリゾールカプセル 50（カプセル剤、イトラコナゾールとして 50mg）
③試験条件
試験液量：900mL　測定方法：液体クロマトグラフィー
各種条件：

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	

④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（イトリゾールカプセル 50）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)。

［イトラコナゾール錠 50mg「科研」と標準製剤の各種条件下における溶出挙動］

pH1.2、50rpm　　pH1.2、100rpm



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

該当資料なし

（２）包装

PTP：　56 錠　［ 8 錠（PTP）× 7］
　　100 錠　［10 錠（PTP）×10］

（３）予備容量

該当しない

（４）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

11. 別途提供される資材類

なし

12. その他

該当資料なし

Ⅴ. 治療に関する項目

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
癜風、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。

３．用法及び用量

（１）用法及び用量の解説

〈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）用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

４．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。

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

該当資料なし

（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

〈内臓真菌症（深在性真菌症）、深在性皮膚真菌症、表在性皮膚真菌症（爪白癬以外）〉

①国内臨床試験

二重盲検比較試験を含む総計782例における臨床試験の概要は以下のとおりであった[5-14]。

疾患名	臨床効果	（有効率）
内臓真菌症		
カンジダ血症	5/6	(83.3%)
肺カンジダ症	5/5	(100.0%)
食道カンジダ症	11/13	(84.6%)
尿路カンジダ症	7/7	(100.0%)
肺アスペルギルス症	8/9	(88.9%)
肺アスペルギローマ	17/30	(56.7%)
クリプトコックス髄膜炎	1/2	(50.0%)
肺クリプトコックス症	1/1	(100.0%)
深在性皮膚真菌症		
スポロトリコーシス	28/32	(87.5%)
クロモミコーシス	6/10	(60.0%)
表在性皮膚真菌症		
体部白癬	112/125	(89.6%)
股部白癬	51/57	(89.5%)
手白癬	23/23	(100.0%)
足白癬	202/250	(80.8%)
頭部白癬	11/11	(100.0%)
ケルスス禿瘡	15/17	(88.2%)
白癬性毛瘡	8/8	(100.0%)
口腔カンジダ症	26/29	(89.7%)
皮膚カンジダ症	44/46	(95.7%)
爪カンジダ症	28/32	(87.5%)
カンジダ性爪囲爪炎	18/20	(90.0%)
カンジダ性毛瘡	4/5	(80.0%)
慢性皮膚粘膜カンジダ症	5/6	(83.3%)
癜風	25/28	(89.3%)
マラセチア毛包炎	10/10	(100.0%)

原因菌	真菌学的効果（菌陰性化率）	
Candida albicans	107/115	(93.0%)
C.glabrata	3/4	(75.0%)
C.parapsilosis	5/5	(100.0%)
Aspergillus fumigatus	14/16	(87.5%)
A.niger	2/2	(100.0%)
Cryptococcus neoformans	2/4	(50.0%)
Sporothrix schenckii	27/31	(87.1%)
Fonsecaea pedrosoi	5/7	(71.4%)
Trichophyton rubrum	266/301	(88.4%)
T.mentagrophytes	54/61	(88.5%)
Microsporum canis	20/21	(95.2%)
M.gypseum	3/3	(100.0%)
Epidermophyton floccosum	3/3	(100.0%)
Malassezia furfur	31/34	(91.2%)

〈爪白癬（パルス療法）〉

②国内第Ⅱ/Ⅲ相試験（R051211-CP-JPN-01）

爪白癬患者を対象とし、パルス療法（400mg/日 3 サイクル投与、200mg/日 6 サイクル投与、200mg/日 3 サイクル投与）を行った際の有効率は、それぞれ 84.6%（44/52）、66.7%（34/51）、63.8%（30/47）であり、400mg/日 3 サイクル投与時の主要原因菌である *Trichophyton rubrum* の真菌学的効果（菌陰性化率）は 62.5%（15/24）であった[16)]。安全性解析集団 185 例中、副作用（臨床検査値異常変動を含む）は 25 例（13.51%）62 件に認められた。その主なものは ALT 増加 9 件（4.86%）、AST 増加、γ-GTP 増加各 8 件（4.32%）、Al-P 増加、LDH 増加各 3 件（1.62%）、腹痛、ビリルビン値増加、鼓腸放屁各 2 件（1.08%）等であった。

（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

該当資料なし

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

該当資料なし

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

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）
注意：関連のある化合物の効能・効果等は，最新の添付文書を参照すること

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[17)]。

（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[18-21)]。

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[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

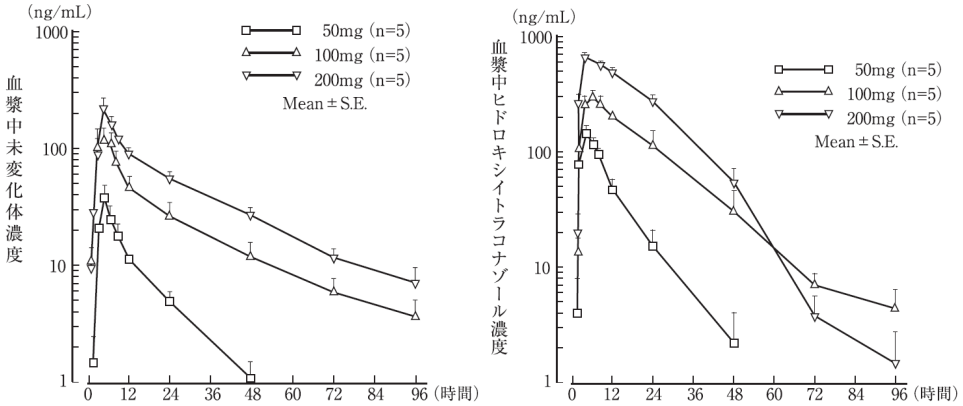
（1）治療上有効な血中濃度

該当資料なし

（2）臨床試験で確認された血中濃度

1）単回投与

健康成人にイトラコナゾールカプセル 50～200mg を経口投与したとき、速やかに吸収され、血漿中未変化体濃度は投与後約 4～5 時間で最高値に達し、その後二相性で消失し、β相の消失半減期は約 14～28 時間であった。主活性代謝物ヒドロキシイトラコナゾールの血漿中濃度は投与後約 4～6 時間で最高値に達した後、約 10～21 時間の消失半減期で消失した[25]。



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=5）に単回投与したときの薬物動態パラメータ

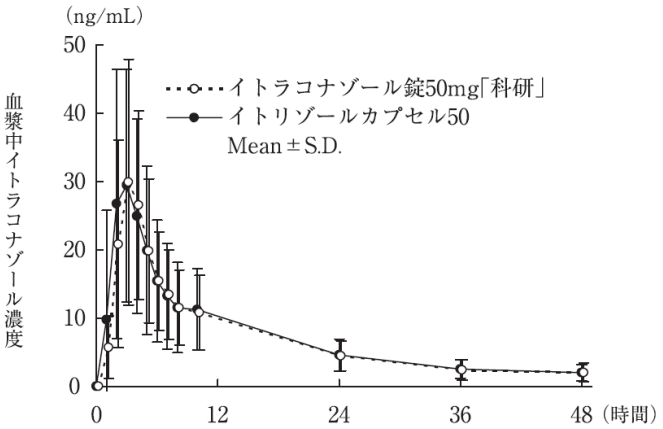
用量 (mg)	対象	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	AUC (ng･hr/mL)	$t_{1/2}$ (hr)
50	未変化体	37.0±14.9	4.4±0.9	456±184	13.8±7.0
	主活性代謝物	146.2±43.8	4.4±0.9	1,819±612	21.3±36.0
100	未変化体	132.2±80.7	4.8±1.8	2,221±1,141	24.9±7.7
	主活性代謝物	267.4±71.4	6.0±1.4	6,772±3,221	17.4±11.2
200	未変化体	215.6±58.1	4.4±0.9	4,142±1,272	27.9±9.9
	主活性代謝物	678.6±62.4	5.2±1.8	15,028±2,524	9.5±2.1

（平均値±S.D.）

2）生物学的同等性試験

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[26]。



健康成人（n=20）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

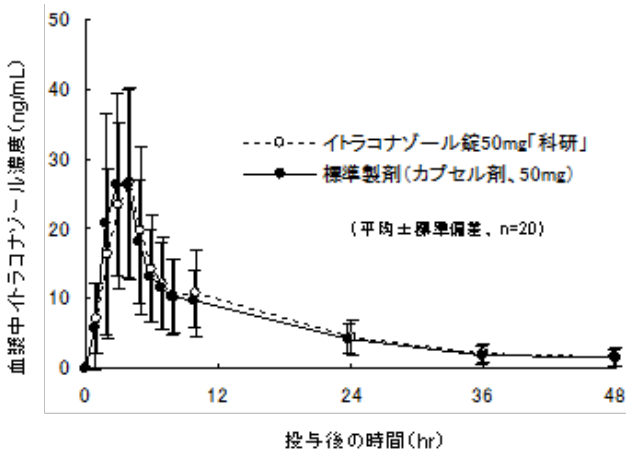
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}48}$ (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
イトラコナゾール錠 50mg「科研」	333.4±159.1	34.6±17.0	3.0±0.9	15.9±6.5
イトリゾールカプセル 50	347.0±184.9	35.8±19.7	2.8±1.0	15.5±3.7

（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[26]。



血漿中イトラコナゾール濃度推移

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	
	$AUC_{0\text{-}48}$ (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」（懸濁投与）	312.0±154.9	31.3±13.6	3.1±0.9	13.6±3.5
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

（平均値±標準偏差）

（３）中毒域

該当資料なし

（４）食事・併用薬の影響

1）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[25]。

2）併用薬の影響

「VIII. 7. 相互作用」の項参照

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

0.0492±0.0155（試験製剤単回投与時、平均±標準偏差、n=20）[18]

（４）クリアランス

該当資料なし

（５）分布容積

該当資料なし

（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

該当資料なし

５．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

健康女性のデータでは、授乳婦にイトラコナゾール 1 回 200mg を 1 日 2 回経口投与したとき、乳汁中に未変化体が検出された[27]。（外国人データ）（「VIII. ６．（６）授乳婦」の項参照）

（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[28]。（外国人データ）

（６）血漿蛋白結合率

99.8%（*in vitro*、平衡透析法、0.5μg/mL）[29]

６．代　　謝

（１）代謝部位及び代謝経路

ヒトにイトラコナゾールを経口投与したとき、肝臓で主に代謝される。

（２）代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種，寄与率

CYP3A4

（３）初回通過効果の有無及びその割合

あり（割合は不明）

（４）代謝物の活性の有無及び活性比，存在比率

主な代謝物はヒドロキシイトラコナゾール（主活性代謝物）であり、未変化体と比較してほぼ同等の抗真菌活性を示す[30]。

７．排　　泄

（１）排泄部位及び経路

主な排泄経路は糞中である[28]。

（２）排泄率

健康成人に ^{3}H-イトラコナゾール 100mg 経口投与したとき、投与 7 日間以内に放射活性の 54.1%が糞中に、35.2%が尿中に排泄された[28]。（外国人データ）

（３）排泄速度

該当資料なし

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

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）。

10. 特定の背景を有する患者

該当資料なし

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

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 メドキソミル、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、ブロナンセリン、シルデナフィル（レバチオ）、タダラフィル（アドシルカ）、スボレキサント、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、イサブコナゾニウム硫酸塩、アリスキレン、ダビガトラン、リバーロキサバン、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

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。

４．用法及び用量に関連する注意とその理由

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。

５．重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意
〈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、11.1.7 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

（１）併用禁忌とその理由

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く、下表における併用薬剤は包括的なものではない。そのため、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、併用薬剤の添付文書情報（代謝経路、相互作用経路、潜在的リスク及び併用時の具体的な対処方法等）を確認するとともに患者の状態を十分に観察し、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。

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 [31,32] ベプリジル [33] 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 [34] 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[35] 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 メドキソミル レザルタス配合錠 ニソルジピン[36] [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[37] 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[38] 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。
イブルチニブ イムブルビカ [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 ブリリンタ [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） ベネクレクスタ [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 ラツーダ [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。	
イサブコナゾニウム硫酸塩 クレセンバ [2.1 参照]	イサブコナゾールの血中濃度が上昇し、作用が増強するおそれがある。	
アリスキレン[39] 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[40]	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[41] 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[42] デキサメタゾン[43] ブデソニド[44]	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[45] ブロチゾラム アルプラゾラム[46]	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[47] ペロスピロン[48] クエチアピン	・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[49]		
抗悪性腫瘍剤 ドセタキセル水和物[50] 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 ルキソリチニブ アパルタミド トレチノイン（カプセル） ペミガチニブ エヌトレクチニブ	・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[51] メサドン	・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[52] 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[53] 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 ゾピクロン グアンファシン ジエノゲスト	・トルバプタンとの併用が避けられない場合は、トル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。	

シルデナフィル バイアグラ	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。	
タダラフィル シアリス ザルティア	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。	
ワルファリン[54] ［8.3 参照］	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。	
アキシチニブ	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ので、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[55] ニルバジピン フェロジピン[56]等 ベラパミル[57]	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。
バルベナジン	バルベナジン及び活性代謝物の血漿中濃度が上昇するおそれがある。バルベナジンの作用が増強することで副作用があらわれるおそれがあるため、観察を十分に行うこと。本剤を併用する場合にはバルベナジンの増量はしないこと。	本剤の CYP3A 阻害作用により、バルベナジン及び活性代謝物の代謝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、ニロチニブの代謝及び排泄が阻害されると考えられる。
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[58] ブスルファン[59]	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[60] 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[61]	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・コビシスタット・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 エルビテグラビル・コビシスタット・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	本剤、エルビテグラビル及びコビシ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。	本剤及びコビシスタットのCYP3A 等阻害作用により、相互に代謝が阻害される。
ダルナビル エタノール付加物・コビシスタット	本剤、ダルナビル又はコビシ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・コビシ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シスタットの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・コビシスタット・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、コビシ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・コビシスタット・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、コビシ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[62,63] 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[64] フェノバルビタール エファビレンツ ネビラピン[65]	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[66] 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[67] 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[68]	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**（0.1%未満）
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]

11.1.7 **偽アルドステロン症**（頻度不明）
低カリウム血症、血圧上昇、ナトリウム・体液の貯留、浮腫、体重増加等があらわれることがある。[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、血中アミラーゼ増加、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、内臓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。

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）安全性薬理試験

該当資料なし

（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

該当資料なし

（２）反復投与毒性試験

該当資料なし

（３）遺伝毒性試験

該当資料なし

（４）がん原性試験

該当資料なし

（５）生殖発生毒性試験

該当資料なし

（６）局所刺激性試験

該当資料なし

（７）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

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 小児の手の届かない所に保管すること。

５．患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり
くすりのしおり　　：あり
その他の患者向け資材：爪水虫のパルス療法を行う患者様へ（患者向け説明用資材）
「XIII．２．その他の関連資料」の項参照

６．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

７．国際誕生年月日

1988 年 4 月 1 日

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

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
2008 年 3 月 14 日	22000AMX01268	2008 年 7 月 4 日	2008 年 7 月 4 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

○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】<u>爪カンジダ症、カンジダ性爪囲爪炎</u>
【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。<u>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。</u>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。

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

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	レセプト電算コード
6290004F1011	6290004F1062	118521801	620007914

14. 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) 社内資料：安定性に関する試験（加速試験）
2) 社内資料：安定性に関する試験（長期保存試験）
3) 社内資料：安定性に関する試験（無包装状態）
4) 社内資料：溶出性に関する試験
5) Itraconazole 皮膚科領域研究班：基礎と臨床. 1991；25：409-421
6) Itraconazole 皮膚科領域研究班：基礎と臨床. 1991；25：423-432
7) Itraconazole 皮膚科領域研究班：基礎と臨床. 1991；25：433-448
8) Itraconazole 皮膚科領域研究班：基礎と臨床. 1991；25：449-462
9) Itraconazole 皮膚科領域研究班：基礎と臨床. 1991；25：463-477
10) Itraconazole 皮膚科領域研究班：基礎と臨床. 1991；25：479-496
11) Itraconazole 内科領域研究班：基礎と臨床. 1991；25：585-616
12) Itraconazole 内科領域研究班：基礎と臨床. 1991；25：618-625
13) Itraconazole 皮膚科領域研究班：西日本皮膚科. 1996；58：865-875
14) 松本忠彦 他：西日本皮膚科. 1996；58：887-895
15) 河野茂 他：日本化学療法学会雑誌. 2006；54(Suppl.1)：32-47
16) 渡辺晋一 他：日本皮膚科学会雑誌. 2004；114：55-72
17) Vanden Bossche H, et al.：Mycoses. 1989；32(Suppl.1)：35-52（PMID：2561184）
18) 平谷民雄 他：Jpn J Antibiotics. 1991；44：580-587（PMID：1652656）
19) 内田勝久 他：Jpn J Antibiotics. 1991；44：562-570（PMID：1652654）
20) 内田勝久 他：Jpn J Antibiotics. 1991；44：571-579（PMID：1652655）
21) Van Cutsem J：Mycoses. 1989；32(Suppl.1)：7-13（PMID：2561189）
22) 内田勝久 他：Jpn J Antibiotics. 1991；44：588-599（PMID：1652657）
23) Van Cutsem J, et al.：Rev Infect Dis. 1987；9(Suppl.1)：15-32（PMID：3027843）
24) Van Cutsem J：Mycoses. 1989；32(Suppl.1)：14-34（PMID：2561183）
25) 小口勝司 他：基礎と臨床. 1991；25：397-407
26) 社内資料：生物学的同等性に関する試験
27) イトラコナゾールのヒト乳汁中への排泄
（イトリゾール内用液 2006 年 7 月 26 日承認、CTD 2.6.4.6）
28) Heykants J, et al.：Recent Trends in the Discovery, Development and Evaluation of Antifungal Agents. 1987；223-249
29) イトラコナゾールの蛋白結合率の検討（イトリゾール内用液 2006 年 7 月 26 日承認、CTD 2.6.4.4）
30) 三上襄 他：Chemotherapy. 1994；42：290-296
31) Cruccu V, et al.：Clin Ter. 1995；146：383-389（PMID：7796571）
32) Kaukonen KM, et al.：Clin Pharmacol Ther. 1997；62：510-517（PMID：9390107）
33) Gopaul VS, et al.：Drug Metab Rev. 2004；36(Suppl.1)：208
34) Varhe A, et al.：Clin Pharmacol Ther. 1994；56：601-607（PMID：7995001）
35) Horn M：Arch Dermatol. 1996；132：1254（PMID：8859048）
36) Heinig R, et al.：Eur J Clin Pharmacol. 1999；55：57-60（PMID：10206086）
37) Cook CS, et al.：Xenobiotica. 2004；34：215-228（PMID：15204695）
38) Muirhead GJ, et al.：Br J Clin Pharmacol. 2000；50：99-107（PMID：10930961）
39) Tapaninen T, et al.：J Clin Pharmacol. 2011；51：359-367（PMID：20400651）
40) Kantola T, et al.：Clin Pharmacol Ther. 1998；64：58-65（PMID：9695720）
41) Boehme A, et al.：Onkologie. 1994；17(Suppl.2)：13（PMID：8534764）
42) Linthoudt H, et al.：J Heart Lung Transplant. 1996；15：1165（PMID：8956126）
43) Varis T, et al.：Clin Pharmacol Ther. 2000；68：487-494（PMID：11103751）
44) Raaska K, et al.：Clin Pharmacol Ther. 2002；72：362-369（PMID：12386638）
45) Olkkola K, et al.：Clin Pharmacol Ther. 1994；55：481-485（PMID：8181191）
46) Yasui N, et al.：Psychopharmacology. 1998；139：269-273（PMID：9784084）
47) Kubo M, et al.：Drug Metab Pharmacokinet. 2005；20：55-64（PMID：15770075）
48) Masui T, et al.：Ther Drug Monit. 2006；28：73-75（PMID：16418697）
49) Furlan V, et al.：Pharm Hosp Fr. 1997；14-16

50) Royer I, et al. : Cancer Res. 1996 ; 56 : 58-65（PMID : 8548776）
51) Saari TI, et al. : Eur J Clin Pharmacol. 2010 ; 66 : 387-397（PMID : 20076952）
52) Wacher VJ, et al. : 7th North American ISSX Meeting. 1996 ; 10 : 351
53) Ohno T, et al. : J Clin Pharmacol. 2008 ; 48 : 330-334（PMID : 18218784）
54) Yeh J, et al. : Br Med J. 1990 ; 301 : 669（PMID : 2171705）
55) Tailor S, et al. : Arch Dermatol. 1996 ; 132 : 350-352（PMID : 8607648）
56) Neuvonen P, et al. : J Am Acad Dermatol. 1995 ; 33 : 134-135（PMID : 7601933）
57) Kroemer HK, et al. : Arch Pharmacol. 1993 ; 348 : 332-337（PMID : 8232610）
58) Sachs M, et al. : Clin Infect Dis. 1993 ; 16 : 400-403（PMID : 8384010）
59) Buggia I, et al. : Anticancer Res. 1996 ; 16 : 2083-2088（PMID : 8712747）
60) Hardin TC, et al. : Pharmacother. 1997 ; 17 : 195
61) Sriwiriyajan S, et al. : Biopharm Drug Dispos. 2011 ; 32 : 168-174（PMID : 21360715）
62) Bonay M, et al. : Drug Safety. 1993 ; 9 : 309-311（PMID : 8260123）
63) Spina E, et al. : Ther Drug Monit. 1997 ; 19 : 535-538（PMID : 9357097）
64) Pilheu JA, et al. : Medicina. 1989 ; 49 : 43-47（PMID : 2698437）
65) Jaruratanasirikul S, et al. : Eur J Clin Pharmacol. 2007 ; 63 : 451-456（PMID : 17342480）
66) Jaruratanasirikul S, et al. : Eur J Clin Pharmacol. 1998 ; 54 : 159-161（PMID : 9626921）
67) Lohitnavy M, et al. : J Clin Pharm Ther. 2005 ; 30 : 201-206（PMID : 15896236）
68) Hynninen VV, et al. : Antimicrob Agents Chemother. 2009 ; 53 : 587-592

２．その他の参考文献

該当資料なし

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）	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.
英国の SPC （2013 年 4 月）	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.

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．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）粉砕

該当資料なし

（２）崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

２．その他の関連資料

（１）患者向け説明用資材

爪水虫のパルス療法を行う患者様へ
https://www.kaken.co.jp/medical/shidousen/index.html

（２）GS1 コード

販売名	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 100 錠 PTP	(01)14987042 372025 (01)14987042 372056	(01)04987042 372516 (01)04987042 372523