

# 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

## 深在性真菌症治療剤

日本薬局方 フルコナゾールカプセル

フルコナゾールカプセル50mg「JG」

フルコナゾールカプセル100mg「JG」

Fluconazole Capsules

|                               |   |
|-------------------------------|---|
| 剤形                            | 硬カプセル剤  |
| 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                         | カプセル 50mg：1カプセル中 日局 フルコナゾール 50mg 含有<br>カプセル 100mg：1カプセル中 日局 フルコナゾール 100mg 含有  |
| 一般名                           | 和名：フルコナゾール（JAN）<br>洋名：Fluconazole（JAN、INN）  |
| 製造販売承認年月日<br>薬価基準収載・<br>発売年月日 | 製造販売承認年月日：2010年8月31日<br>薬価基準収載年月日：2011年6月24日<br>発売年月日：2011年6月24日  |
| 開発・製造販売（輸入）・<br>提携・販売会社名      | 製造販売元：日本ジェネリック株式会社  |
| 医薬情報担当者の連絡先                   |   |
| 問い合わせ窓口                       | 日本ジェネリック株式会社 お客様相談室<br>TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172<br>医療関係者向けホームページ：<br><a href="https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/">https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/</a> |

本IFは2023年5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、(独)医薬品医療機器総合機構(PMDA)ホームページ「医薬品に関する情報」  
<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

# IF 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、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。この変更に合わせて、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、(独)医薬品医療機器総合機構(PMDA)ホームページ「医薬品に関する情報」(<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>) 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 PMDA ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて 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、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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 PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」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  | 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報                | 13 |
| 1. 開発の経緯                       | 1  | 14. その他                                    | 13 |
| 2. 製品の治療学的・製剤学的特性              | 1  |  |    |
| II. 名称に関する項目                   | 2  | V. 治療に関する項目                                | 14 |
| 1. 販売名                         | 2  | 1. 効能又は効果                                  | 14 |
| (1)和名                          | 2  | 2. 用法及び用量                                  | 14 |
| (2)洋名                          | 2  | 3. 臨床成績                                    | 15 |
| (3)名称の由来                       | 2  | (1)臨床データパッケージ                              | 15 |
| 2. 一般名                         | 2  | (2)臨床効果                                    | 15 |
| (1)和名(命名法)                     | 2  | (3)臨床薬理試験                                  | 15 |
| (2)洋名(命名法)                     | 2  | (4)探索的試験                                   | 15 |
| (3)ステム                         | 2  | (5)検証的試験                                   | 15 |
| 3. 構造式又は示性式                    | 2  | 1)無作為化並行用量反応試験                             | 15 |
| 4. 分子式及び分子量                    | 2  | 2)比較試験                                     | 15 |
| 5. 化学名(命名法)                    | 2  | 3)安全性試験                                    | 15 |
| 6. 慣用名、別名、略号、記号番号              | 2  | 4)患者・病態別試験                                 | 15 |
| 7. CAS登録番号                     | 2  | (6)治療の使用                                   | 15 |
|                                |    | 1)使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験) | 15 |
| III. 有効成分に関する項目                | 3  | 2)承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要                | 15 |
| 1. 物理化学的性質                     | 3  | VI. 薬効薬理に関する項目                             | 16 |
| (1)外観・性状                       | 3  | 1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群                       | 16 |
| (2)溶解性                         | 3  | 2. 薬理作用                                    | 16 |
| (3)吸湿性                         | 3  | (1)作用部位・作用機序                               | 16 |
| (4)融点(分解点)、沸点、凝固点              | 3  | (2)薬効を裏付ける試験成績                             | 16 |
| (5)酸塩基解離定数                     | 3  | (3)作用発現時間・持続時間                             | 16 |
| (6)分配係数                        | 3  |  |    |
| (7)その他の主な示性値                   | 3  | VII. 薬物動態に関する項目                            | 17 |
| 2. 有効成分の各種条件下における安定性           | 3  | 1. 血中濃度の推移・測定法                             | 17 |
| 3. 有効成分の確認試験法                  | 3  | (1)治療上有効な血中濃度                              | 17 |
| 4. 有効成分の定量法                    | 3  | (2)最高血中濃度到達時間                              | 17 |
|                                |    | (3)臨床試験で確認された血中濃度                          | 17 |
| IV. 製剤に関する項目                   | 4  | (4)中毒域                                     | 19 |
| 1. 剤形                          | 4  | (5)食事・併用薬の影響                               | 19 |
| (1)剤形の区別、外観及び性状                | 4  | (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        | 19 |
| (2)製剤の物性                       | 4  | 2. 薬物速度論的パラメータ                             | 19 |
| (3)識別コード                       | 4  | (1)解析方法                                    | 19 |
| (4)pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等 | 4  | (2)吸収速度定数                                  | 19 |
| 2. 製剤の組成                       | 4  | (3)バイオアベイラビリティ                             | 19 |
| (1)有効成分(活性成分)の含量               | 4  | (4)消失速度定数                                  | 19 |
| (2)添加物                         | 4  | (5)クリアランス                                  | 19 |
| (3)その他                         | 4  | (6)分布容積                                    | 20 |
| 3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意            | 4  | (7)血漿蛋白結合率                                 | 20 |
| 4. 製剤の各種条件下における安定性             | 5  | 3. 吸収                                      | 20 |
| 5. 調製法及び溶解後の安定性                | 8  | 4. 分布                                      | 20 |
| 6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)           | 8  | (1)血液-脳関門通過性                               | 20 |
| 7. 溶出性                         | 8  | (2)血液-胎盤関門通過性                              | 20 |
| 8. 生物学的試験法                     | 13 | (3)乳汁への移行性                                 | 20 |
| 9. 製剤中の有効成分の確認試験法              | 13 |  |    |
| 10. 製剤中の有効成分の定量法               | 13 |  |    |
| 11. 力価                         | 13 |  |    |
| 12. 混入する可能性のある夾雑物              | 13 |  |    |



|  |    |  |    |
|--|----|--|----|
| (4)髄液への移行性                             | 20 | 2. 毒性試験                                | 30 |
| (5)その他の組織への移行性                         | 20 | (1)単回投与毒性試験                            | 30 |
| 5. 代謝                                  | 20 | (2)反復投与毒性試験                            | 30 |
| (1)代謝部位及び代謝経路                          | 20 | (3)生殖発生毒性試験                            | 30 |
| (2)代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の<br>分子種       | 20 | (4)その他の特殊毒性                            | 30 |
| (3)初回通過効果の有無及びその割合                     | 20 | <b>X. 管理的事項に関する項目</b>                  | 31 |
| (4)代謝物の活性の有無及び比率                       | 20 | 1. 規制区分                                | 31 |
| (5)活性代謝物の速度論的パラメータ                     | 20 | 2. 有効期間又は使用期限                          | 31 |
| 6. 排泄                                  | 20 | 3. 貯法・保存条件                             | 31 |
| (1)排泄部位及び経路                            | 20 | 4. 薬剤取扱い上の注意点                          | 31 |
| (2)排泄率                                 | 20 | (1)薬局での取扱い上の留意点について                    | 31 |
| (3)排泄速度                                | 20 | (2)薬剤交付時の取扱いについて (患者等に<br>留意すべき必須事項等)  | 31 |
| 7. トランスポーターに関する情報                      | 21 | (3)調剤時の留意点について                         | 31 |
| 8. 透析等による除去率                           | 21 | 5. 承認条件等                               | 31 |
| <b>VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目</b>      | 22 | 6. 包装                                  | 31 |
| 1. 警告内容とその理由                           | 22 | 7. 容器の材質                               | 31 |
| 2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)                 | 22 | 8. 同一成分・同効薬                            | 31 |
| 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意と<br>その理由          | 22 | 9. 国際誕生年月日                             | 32 |
| 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意と<br>その理由          | 22 | 10. 製造販売承認年月日及び承認番号                    | 32 |
| 5. 慎重投与内容とその理由                         | 22 | 11. 薬価基準収載年月日                          | 32 |
| 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法                 | 22 | 12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追<br>加等の年月日及びその内容 | 32 |
| 7. 相互作用                                | 23 | 13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及び<br>その内容         | 32 |
| (1)併用禁忌とその理由                           | 23 | 14. 再審査期間                              | 32 |
| (2)併用注意とその理由                           | 24 | 15. 投薬期間制限医薬品に関する情報                    | 32 |
| 8. 副作用                                 | 26 | 16. 各種コード                              | 32 |
| (1)副作用の概要                              | 26 | 17. 保険給付上の注意                           | 32 |
| (2)重大な副作用と初期症状                         | 26 | <b>X I. 文献</b>                         | 33 |
| (3)その他の副作用                             | 28 | 1. 引用文献                                | 33 |
| (4)項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異<br>常一覧           | 28 | 2. その他の参考文献                            | 33 |
| (5)基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有<br>無等背景別の副作用発現頻度 | 28 | <b>X II. 参考資料</b>                      | 34 |
| (6)薬物アレルギーに対する注意及び試験法                  | 28 | 1. 主な外国での発売状況                          | 34 |
| 9. 高齢者への投与                             | 28 | 2. 海外における臨床支援情報                        | 34 |
| 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与                     | 28 | <b>X III. 備考</b>                       | 36 |
| 11. 小児等への投与                            | 29 | 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行う<br>にあたっての参考情報    | 36 |
| 12. 臨床検査結果に及ぼす影響                       | 29 | (1)粉碎                                  | 36 |
| 13. 過量投与                               | 29 | (2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通<br>過性            | 37 |
| 14. 適用上の注意                             | 29 | 2. その他の関連資料                            | 37 |
| 15. その他の注意                             | 29 |  |    |
| 16. その他                                | 29 |  |    |
| <b>IX. 非臨床試験に関する項目</b>                 | 30 |  |    |
| 1. 薬理試験                                | 30 |  |    |
| (1)薬効薬理試験 (「VI. 薬効薬理に関する<br>項目」参照)     | 30 |  |    |
| (2)副次的薬理試験                             | 30 |  |    |
| (3)安全性薬理試験                             | 30 |  |    |
| (4)その他の薬理試験                            | 30 |  |    |

# I. 概要に関する項目

---

## 1. 開発の経緯

フルコナゾールカプセル 50mg「JG」及びフルコナゾールカプセル 100mg「JG」は、フルコナゾールを含有する深在性真菌症治療剤である。

フルコナゾールは、トリアゾール系抗真菌薬であり、ラノステロールの C-14 脱メチル化酵素（チトクロム P450）を阻害し、真菌の細胞膜にラノステロールを蓄積させ、細胞膜の機能の維持に必要なエルゴステロールの欠乏をきたす。<sup>1)</sup>

本邦では、1989 年に発売されている。

本剤は、「医薬品の承認申請について（平成 11 年 4 月 8 日 医薬発第 481 号）」に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2010 年 8 月に製造販売承認を得て、2011 年 6 月に販売開始した。

また、2012 年 6 月には、「造血幹細胞移植患者における深在性真菌症の予防」の効能・効果及び用法・用量並びに「小児」及び「新生児」における用法・用量が追加され、2015 年 11 月には、「カンジダ属に起因する膣炎及び外陰膣炎」の効能・効果及び用法・用量が追加された。

## 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

(1) カプセル剤本体に含量を印字し、識別性を向上させている。

(2) 重大な副作用として、ショック、アナフィラキシー、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)、薬剤性過敏症症候群、血液障害、急性腎障害、肝障害、意識障害、痙攣、高カリウム血症、心室頻拍、QT 延長、不整脈、間質性肺炎、偽膜性大腸炎が報告されている (全て頻度不明)。

## II. 名称に関する項目

---

### 1. 販売名

#### (1) 和名

- ・フルコナゾールカプセル 50mg 「JG」
- ・フルコナゾールカプセル 100mg 「JG」

#### (2) 洋名

- ・Fluconazole Capsules 50mg “JG”
- ・Fluconazole Capsules 100mg “JG”

#### (3) 名称の由来

「一般的名称」 + 「剤形」 + 「含量」 + 「屋号」 より命名

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

フルコナゾール (JAN)

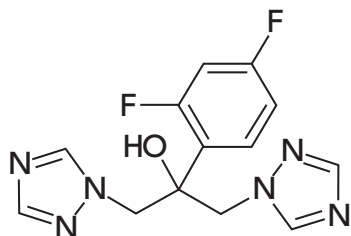
#### (2) 洋名 (命名法)

Fluconazole (JAN、INN、USP、EP)

#### (3) ステム

全身性抗真菌薬、ミコナゾール誘導体：-conazole

### 3. 構造式又は示性式



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>13</sub>H<sub>12</sub>F<sub>2</sub>N<sub>6</sub>O

分子量：306.27

### 5. 化学名 (命名法)

2- (2,4-Difluorophenyl) -1,3-bis (1*H*-1,2,4-triazol-1-yl) propan-2-ol (IUPAC)

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

### 7. CAS 登録番号

86386-73-4

### 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～微黄白色の結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

エタノール（99.5）にやや溶けやすく、水に溶けにくい。  
希塩酸に溶ける。

|                        |   |
|------------------------|---|
| 溶解度（37℃） <sup>2)</sup> | pH1.2 : 16.0mg/mL<br>pH4.0 : 4.7mg/mL<br>pH6.8 : 4.5mg/mL<br>水 : 4.0mg/mL |
|------------------------|---|

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点 : 137～141℃

##### (5) 酸塩基解離定数

pKa : 1.81（トリアゾール基、滴定法）<sup>2)</sup>

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 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

日局「フルコナゾール」の確認試験による。

- (1) ライネッケ塩試液による沈殿反応
- (2) 紫外可視吸光度測定法
- (3) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

#### 4. 有効成分の定量法

日局「フルコナゾール」の定量法による。

電位差滴定法

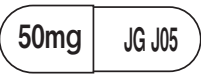
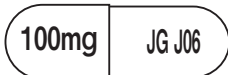
0.1mol/L 過塩素酸 1mL=15.31mg C<sub>13</sub>H<sub>12</sub>F<sub>2</sub>N<sub>6</sub>O



## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、外観及び性状

|         |   |   |
|---------|---|---|
| 販売名     | フルコナゾールカプセル 50mg「JG」  | フルコナゾールカプセル 100mg「JG」   |
| 色・剤形    | キャップ部白色不透明、ボディ一部白色不透明の硬カプセル剤  | キャップ部だいたい色不透明、ボディ一部だいたい色不透明の硬カプセル剤  |
| 外形      |  |  |
| 大きさ     | 4号カプセル  | 3号カプセル  |
| 重量 (mg) | 200   | 270   |

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

- ・フルコナゾールカプセル 50mg「JG」  
カプセル剤本体ならびに PTP シート上に記載：JG J05
- ・フルコナゾールカプセル 100mg「JG」  
カプセル剤本体ならびに PTP シート上に記載：JG J06

#### (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

- ・フルコナゾールカプセル 50mg「JG」  
1カプセル中 日局 フルコナゾール 50mg 含有
- ・フルコナゾールカプセル 100mg「JG」  
1カプセル中 日局 フルコナゾール 100mg 含有

#### (2) 添加物

- ・フルコナゾールカプセル 50mg「JG」  
乳糖水和物、トウモロコシデンプン、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム、ラウリル硫酸ナトリウム、ゼラチン、酸化チタン
- ・フルコナゾールカプセル 100mg「JG」  
乳糖水和物、トウモロコシデンプン、含水二酸化ケイ素、ステアリン酸マグネシウム、赤色 102 号、黄色 5 号、ラウリル硫酸ナトリウム、ゼラチン、酸化チタン

#### (3) その他

該当しない

### 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

##### フルコナゾールカプセル 50mg 「JG」

###### ◎ 長期保存試験<sup>3)</sup>

包装形態：PTP 包装

保存条件：室温

保存期間：3 年

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性試験、溶出試験、定量試験

| 試験項目  | 性状  | 確認試験 |     | 製剤均一性試験 | 溶出試験 (%) | 定量試験 (%) |
|-------|-----|------|-----|---------|----------|----------|
|       |     | (2)  | (3) |         |          |          |
| 規格    | (1) | (2)  | (3) | (4)     | (5)      | (6)      |
| 試験開始時 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 97       | 98.4     |
| 3 年後  | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 94       | 97.2     |

- (1) キャップ部白色不透明、ボディー部白色不透明の硬カプセル剤であり、内容物は白色～微黄白色の粉末で、わずかに特異なおいがあり、味は苦い。
- (2) ライネッケ塩試液による沈殿反応：淡赤色の沈殿を生じる。
- (3) 紫外可視吸光度測定法：波長 259～263nm 及び波長 265～269nm に吸収の極大を示す。
- (4) 質量偏差試験：判定値が 15.0%を超えない。
- (5) 90 分間、80%以上（水 900mL、パドル法（シンカーを用いる）、50rpm）
- (6) 表示量の 95.0～105.0%

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温、3 年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、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。

###### ◎ 加速試験<sup>4)</sup>

包装形態：PTP 包装

保存条件：40℃/75%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性試験、溶出試験、定量試験

| 試験項目  | 性状  | 確認試験 |     | 製剤均一性試験 | 溶出試験 (%) | 定量試験 (%) |
|-------|-----|------|-----|---------|----------|----------|
|       |     | (2)  | (3) |         |          |          |
| 規格    | (1) | (2)  | (3) | (4)     | (5)      | (6)      |
| 試験開始時 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 93       | 100.4    |
| 1 ヶ月後 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 93       | 100.2    |
| 3 ヶ月後 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 93       | 100.4    |
| 6 ヶ月後 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 93       | 100.3    |

- (1) キャップ部白色不透明、ボディー部白色不透明の硬カプセル剤であり、内容物は白色～微黄白色の粉末で、わずかに特異なおいがあり、味は苦い。
- (2) ライネッケ塩試液による沈殿反応：淡赤色の沈殿を生じる。
- (3) 紫外可視吸光度測定法：波長 259～263nm 及び波長 265～269nm に吸収の極大を示す。
- (4) 質量偏差試験：判定値が 15.0%を超えない。
- (5) 90 分間、80%以上（水 900mL、パドル法（シンカーを用いる）、50rpm）
- (6) 表示量の 95.0～105.0%

◎無包装状態での安定性試験<sup>5)</sup>

試験条件：①温度に対する安定性試験：40℃、3ヵ月（遮光・気密容器）

②湿度に対する安定性試験：30℃/75%RH、3ヵ月（遮光・開放）

③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lx・hr（気密容器）

試験項目：性状、崩壊試験、溶出試験、定量試験

| 試験項目  |             | 性状   | 崩壊試験 | 溶出試験 (%) | 定量試験 (%) |
|-------|-------------|------|------|----------|----------|
| 規格    |             | (1)  | (2)  | (3)      | (4)      |
| 試験開始時 |             | 適合   | 適合   | 97       | 101.6    |
| ①温度   | 3ヵ月後        | 変化なし | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     |
| ②湿度   | 3ヵ月後        | 変化なし | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     |
| ③光    | 120 万 lx・hr | 変化なし | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     |

(1) キャップ部白色不透明、ボディー部白色不透明の硬カプセル剤であり、内容物は白色～微黄白色の粉末で、わずかに特異なおいがある。

(2) 日局一般試験法崩壊試験法：20 分以内

(3) 90 分間、80%以上（水 900mL、パドル法（シンカーを用いる）、50rpm）

(4) 表示量の 95.0～105.0%

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）平成 11 年 8 月 20 日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

フルコナゾールカプセル 100mg 「JG」

◎長期保存試験<sup>6)</sup>

包装形態：PTP 包装

保存条件：室温

保存期間：3 年

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性試験、溶出試験、定量試験

| 試験項目  | 性状  | 確認試験 |     | 製剤均一性試験 | 溶出試験 (%) | 定量試験 (%) |
|-------|-----|------|-----|---------|----------|----------|
| 規格    | (1) | (2)  | (3) | (4)     | (5)      | (6)      |
| 試験開始時 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 94       | 102.2    |
| 3 年後  | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 92       | 99.2     |

(1) キャップ部だいたい色不透明、ボディー部だいたい色不透明の硬カプセル剤であり、内容物は白色～微黄白色の粉末で、わずかに特異なおいがあり、味は苦い。

(2) ライネッケ塩試液による沈殿反応：淡赤色の沈殿を生じる。

(3) 紫外可視吸光度測定法：波長 259～263nm 及び波長 265～269nm に吸収の極大を示す。

(4) 質量偏差試験：判定値が 15.0%を超えない。

(5) 90 分間、70%以上（水 900mL、パドル法（シンカーを用いる）、50rpm）

(6) 表示量の 95.0～105.0%

最終包装製品を用いた長期保存試験（室温、3 年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、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。

◎ 加速試験<sup>7)</sup>

包装形態：PTP 包装

保存条件：40℃/75%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、製剤均一性試験、溶出試験、定量試験

| 試験項目  | 性状  | 確認試験 |     | 製剤均一性試験 | 溶出試験 (%) | 定量試験 (%) |
|-------|-----|------|-----|---------|----------|----------|
| 規格    | (1) | (2)  | (3) | (4)     | (5)      | (6)      |
| 試験開始時 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 86       | 100.1    |
| 1 ヶ月後 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 86       | 100.2    |
| 3 ヶ月後 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 86       | 100.0    |
| 6 ヶ月後 | 適合  | 適合   | 適合  | 適合      | 86       | 99.9     |

- (1) キャップ部だいたい色不透明、ボディー部だいたい色不透明の硬カプセル剤であり、内容物は白色～微黄白色の粉末で、わずかに特異なおいがあり、味は苦い。
- (2) ライネツケ塩試液による沈殿反応：淡赤色の沈殿を生じる。
- (3) 紫外可視吸光度測定法：波長 259～263nm 及び波長 265～269nm に吸収の極大を示す。
- (4) 質量偏差試験：判定値が 15.0%を超えない。
- (5) 90 分間、70%以上（水 900mL、パドル法（シンカーを用いる）、50rpm）
- (6) 表示量の 95.0～105.0%

◎ 無包装状態での安定性試験

試験条件：①温度に対する安定性試験：40℃、3 ヶ月（遮光・気密容器）

②湿度に対する安定性試験：30℃/75%RH、3 ヶ月（遮光・開放）

③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lx・hr（気密容器）

試験項目：性状、崩壊試験、溶出試験、定量試験

| 試験項目  | 性状          | 崩壊試験 | 溶出試験 (%) | 定量試験 (%) |
|-------|-------------|------|----------|----------|
| 規格    | (1)         | (2)  | (3)      | (4)      |
| 試験開始時 | 適合          | 適合   | 95       | 102.0    |
| ①温度   | 3 ヶ月後       | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     |
| ②湿度   | 3 ヶ月後       | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     |
| ③光    | 120 万 lx・hr | 変化なし | 変化なし     | 変化なし     |

- (1) キャップ部だいたい色不透明、ボディー部だいたい色不透明の硬カプセル剤であり、内容物は白色～微黄白色の粉末で、わずかに特異なおいがある。
- (2) 日局一般試験法崩壊試験法：20 分以内
- (3) 90 分間、70%以上（水 900mL、パドル法（シンカーを用いる）、50rpm）
- (4) 表示量の 95.0～105.0%

安定性の評価は「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）平成 11 年 8 月 20 日」に記載された各試験項目の評価基準に従った。

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（物理化学的变化）

該当資料なし

7. 溶出性

【溶出挙動の類似性】

フルコナゾールカプセル 50mg 「JG」<sup>9)</sup>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインについて（平成9年12月22日 医薬審第487号）」に従う。

|                         |                        |       |                    |                    |
|-------------------------|------------------------|-------|--------------------|--------------------|
| 試験方法                    | 日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法） |       |                    |                    |
| 試験条件                    | 回転数/試験液                | 50rpm | pH1.2              | 日本薬局方 崩壊試験第1液      |
|                         |                        |       | pH4.0              | 薄めた McIlvaine の緩衝液 |
|                         |                        |       | pH6.8              | 日本薬局方 崩壊試験第2液      |
|                         |                        |       | 水                  | 日本薬局方 精製水          |
|                         | 100rpm                 | pH4.0 | 薄めた McIlvaine の緩衝液 |                    |
| 試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル |                        |       |                    |                    |
| 分析法                     | 液体クロマトグラフィー            |       |                    |                    |

・ 判定基準

| 回転数 (rpm) | 試験液   | 判定基準  |
|-----------|-------|---|
| 50        | pH1.2 | 標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。 |
|           | pH4.0 | 標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。 |
|           | pH6.8 |   |
|           | 水     |   |
| 100       | pH4.0 | 標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。 |



・ 試験結果

|   |   |
|---|---|
| <p>(50rpm、pH1.2)</p> <p>○ フルコナゾールカプセル50mg「JG」<br/>● 標準製剤 (カプセル剤、50mg)</p>                     | <p>(50rpm、pH4.0)</p> <p>○ フルコナゾールカプセル50mg「JG」<br/>● 標準製剤 (カプセル剤、50mg)</p>                     |
| <p>判定時点である9分及び19分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率<math>\pm 15\%</math>の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>  | <p>判定時点である23分及び94分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率<math>\pm 15\%</math>の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p> |
| <p>(50rpm、pH6.8)</p> <p>○ フルコナゾールカプセル50mg「JG」<br/>● 標準製剤 (カプセル剤、50mg)</p>                     | <p>(50rpm、水)</p> <p>○ フルコナゾールカプセル50mg「JG」<br/>● 標準製剤 (カプセル剤、50mg)</p>                         |
| <p>判定時点である15分及び46分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率<math>\pm 15\%</math>の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p> | <p>判定時点である18分及び53分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率<math>\pm 15\%</math>の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p> |
| <p>(100rpm、pH4.0)</p> <p>○ フルコナゾールカプセル50mg「JG」<br/>● 標準製剤 (カプセル剤、50mg)</p>                    |   |
| <p>判定時点である11分及び24分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率<math>\pm 15\%</math>の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p> |   |

溶出挙動の類似性の判定（平均溶出率）

| 回転数<br>(rpm) | 試験液   | 判定<br>時点<br>(min) | 平均溶出率 (%)            |                                   | 判定 |
|--------------|-------|-------------------|----------------------|-----------------------------------|----|
|              |       |                   | 標準製剤<br>(カプセル剤、50mg) | 試験製剤<br>(フルコナゾールカプセル<br>50mg「JG」) |    |
| 50           | pH1.2 | 9                 | 56.7                 | 54.4                              | 適合 |
|              |       | 19                | 89.4                 | 89.1                              |    |
|              | pH4.0 | 23                | 43.1                 | 40.7                              | 適合 |
|              |       | 94                | 85.9                 | 86.5                              |    |
|              | pH6.8 | 15                | 37.1                 | 34.8                              | 適合 |
|              |       | 46                | 84.1                 | 79.8                              |    |
|              | 水     | 18                | 42.5                 | 39.4                              | 適合 |
| 53           |       | 89.2              | 87.5                 |                                   |    |
| 100          | pH4.0 | 11                | 55.2                 | 47.7                              | 適合 |
|              |       | 24                | 86.8                 | 84.9                              |    |

・結論

標準製剤と試験製剤の平均溶出率を比較したところ、いずれの試験条件においても「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合していた。

以上より、標準製剤と試験製剤の溶出挙動の類似性が確認された。

フルコナゾールカプセル 100mg「JG」<sup>10)</sup>

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインについて（平成9年12月22日 医薬審第487号）」に従う。

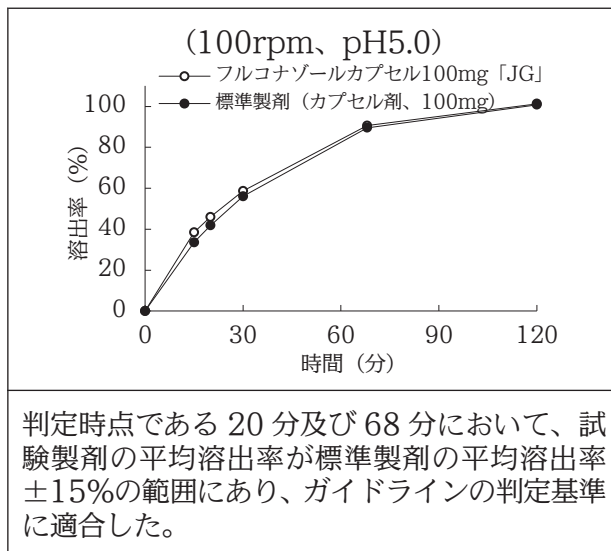
| 試験方法                    | 日本薬局方 一般試験法溶出試験法（パドル法） |       |                    |                    |
|-------------------------|------------------------|-------|--------------------|--------------------|
| 試験条件                    | 回転数/試験液                | 50rpm | pH1.2              | 日本薬局方 崩壊試験第1液      |
|                         |                        |       | pH5.0              | 薄めた McIlvaine の緩衝液 |
|                         |                        |       | pH6.8              | 日本薬局方 崩壊試験第2液      |
|                         |                        |       | 水                  | 日本薬局方 精製水          |
|                         | 100rpm                 | pH5.0 | 薄めた McIlvaine の緩衝液 |                    |
| 試験液量：900mL 試験回数：12 ベッセル |                        |       |                    |                    |
| 分析法                     | 液体クロマトグラフィー            |       |                    |                    |

・判定基準

| 回転数 (rpm) | 試験液   | 判定基準  |
|-----------|-------|---|
| 50        | pH1.2 | 標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。 |
|           | pH5.0 |   |
|           | pH6.8 |   |
|           | 水     |   |
| 100       | pH5.0 |   |

・試験結果

|   |   |
|---|---|
| <p>(50rpm、pH1.2)</p>  | <p>(50rpm、pH5.0)</p>  |
| <p>判定時点である 15 分及び 26 分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>  | <p>判定時点である 40 分及び 141 分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p> |
| <p>(50rpm、pH6.8)</p>  | <p>(50rpm、水)</p>  |
| <p>判定時点である 34 分及び 112 分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p> | <p>判定時点である 32 分及び 99 分において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。</p>  |



溶出挙動の類似性の判定 (平均溶出率)

| 回転数 (rpm) | 試験液   | 判定時点 (min) | 平均溶出率 (%)          |                              | 判定 |
|-----------|-------|------------|--------------------|------------------------------|----|
|           |       |            | 標準製剤 (カプセル剤、100mg) | 試験製剤 (フルコナゾールカプセル 100mg「JG」) |    |
| 50        | pH1.2 | 15         | 59.2               | 61.7                         | 適合 |
|           |       | 26         | 84.8               | 87.3                         |    |
|           | pH5.0 | 40         | 39.6               | 42.9                         | 適合 |
|           |       | 141        | 83.0               | 86.0                         |    |
|           | pH6.8 | 34         | 40.2               | 48.1                         | 適合 |
|           |       | 112        | 85.9               | 88.9                         |    |
| 水         | 32    | 43.5       | 42.5               | 適合                           |    |
|           | 99    | 89.7       | 89.9               |                              |    |
| 100       | pH5.0 | 20         | 41.8               | 46.0                         | 適合 |
|           |       | 68         | 89.6               | 90.6                         |    |

・ 結論

標準製剤と試験製剤の平均溶出率を比較したところ、いずれの試験条件においても「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合していた。

以上より、標準製剤と試験製剤の溶出挙動の類似性が確認された。

### 【公的溶出規格への適合性】

フルコナゾールカプセル50mg「JG」及びフルコナゾールカプセル100mg「JG」は、日本薬局方医薬品各条に定められたフルコナゾールカプセルの溶出規格に適合していることが確認されている。

|      |   |
|------|---|
| 試験方法 | 日局 一般試験法溶出試験法（パドル法、シンカーを用いる）                |
| 試験条件 | 回転数：50rpm 試験液：水 試験液量：900mL                  |
| 分析法  | 液体クロマトグラフィー                                 |
| 溶出規格 | カプセル50mg：90分間、80%以上<br>カプセル100mg：90分間、70%以上 |

### 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

日局「フルコナゾールカプセル」の確認試験による。

紫外可視吸光度測定法（極大吸収波長：259～263nm 及び 265～269nm）

### 10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「フルコナゾールカプセル」の定量法による。

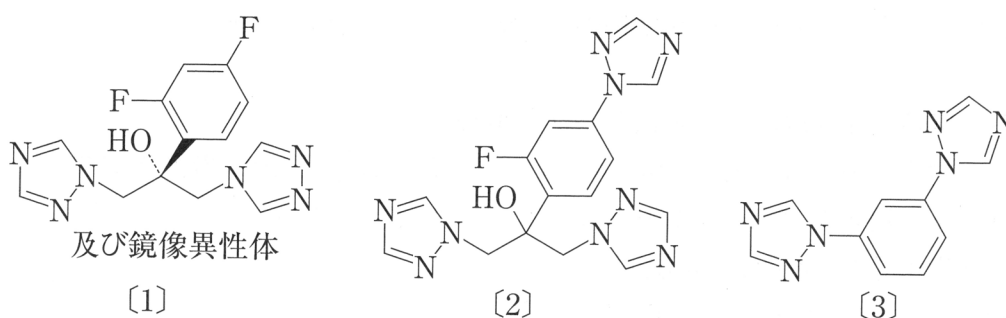
液体クロマトグラフィー

### 11. 力価

該当しない

### 12. 混入する可能性のある夾雑物

混在が予想される類縁物質の主なものは〔1〕～〔3〕である。<sup>1)</sup>



### 13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

### 14. その他

該当しない



## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

カンジダ属及びクリプトコッカス属による下記感染症  
真菌血症、呼吸器真菌症、消化管真菌症、尿路真菌症、真菌髄膜炎  
造血幹細胞移植患者における深在性真菌症の予防  
カンジダ属に起因する膣炎及び外陰膣炎

### 2. 用法及び用量

成人

カンジダ症：通常、成人にはフルコナゾールとして50～100mgを1日1回経口投与する。  
クリプトコッカス症：通常、成人にはフルコナゾールとして50～200mgを1日1回経口投与する。  
なお、重症又は難治性真菌感染症の場合には、1日量として400mgまで増量できる。  
造血幹細胞移植患者における深在性真菌症の予防：成人には、フルコナゾールとして400mgを1日1回経口投与する。  
カンジダ属に起因する膣炎及び外陰膣炎：通常、成人にはフルコナゾールとして150mgを1回経口投与する。

小児

カンジダ症：通常、小児にはフルコナゾールとして3mg/kgを1日1回経口投与する。  
クリプトコッカス症：通常、小児にはフルコナゾールとして3～6mg/kgを1日1回経口投与する。  
なお、重症又は難治性真菌感染症の場合には、1日量として12mg/kgまで増量できる。  
造血幹細胞移植患者における深在性真菌症の予防：小児には、フルコナゾールとして12mg/kgを1日1回経口投与する。  
なお、患者の状態に応じて適宜減量する。

ただし、1日量として400mgを超えないこと。

新生児

生後14日までの新生児には、フルコナゾールとして小児と同じ用量を72時間毎に投与する。  
生後15日以降の新生児には、フルコナゾールとして小児と同じ用量を48時間毎に投与する。

#### 〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

造血幹細胞移植患者における深在性真菌症の予防：

- (1) 好中球減少症が予想される数日前から投与を開始することが望ましい。
- (2) 好中球数が $1000/\text{mm}^3$ を超えてから7日間投与することが望ましい。

カンジダ属に起因する膣炎及び外陰膣炎：

本剤の効果判定は投与後4～7日目を目安に行い、効果が認められない場合には、他の薬剤の投与を行うなど適切な処置を行うこと。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### 2) 比較試験

該当資料なし

##### 3) 安全性試験

該当資料なし

##### 4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

該当しない

## 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（イトラコナゾール、エフィナコナゾール、ホスフルコナゾール、ボスラブコナゾール L-リシンエタノール付加物、ポリコナゾール）

イミダゾール系化合物（オキシコナゾール、クロトリマゾール、ケトコナゾール、スルコナゾール硝酸塩、ネチコナゾール塩酸塩、ミコナゾール、ラノコナゾール、ルリコナゾール）

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

アゾール系抗真菌薬で、真菌細胞膜の主成分であるエルゴステロールの合成を阻害し膜機能を障害するが、作用機序はラノステロール C14 $\alpha$  脱メチル化酵素の阻害である。<sup>5)</sup>

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (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

健康成人男子

| 薬剤名                      | 投与量                        | 投与方法         | n  | Tmax (hr) |
|--------------------------|----------------------------|--------------|----|-----------|
| フルコナゾールカプセル<br>50mg「JG」  | 2カプセル<br>(フルコナゾールとして100mg) | 絶食単回<br>経口投与 | 20 | 2.1±0.6   |
| フルコナゾールカプセル<br>100mg「JG」 | 1カプセル<br>(フルコナゾールとして100mg) |              | 18 | 2.1±0.4   |

(Mean±S.D.)

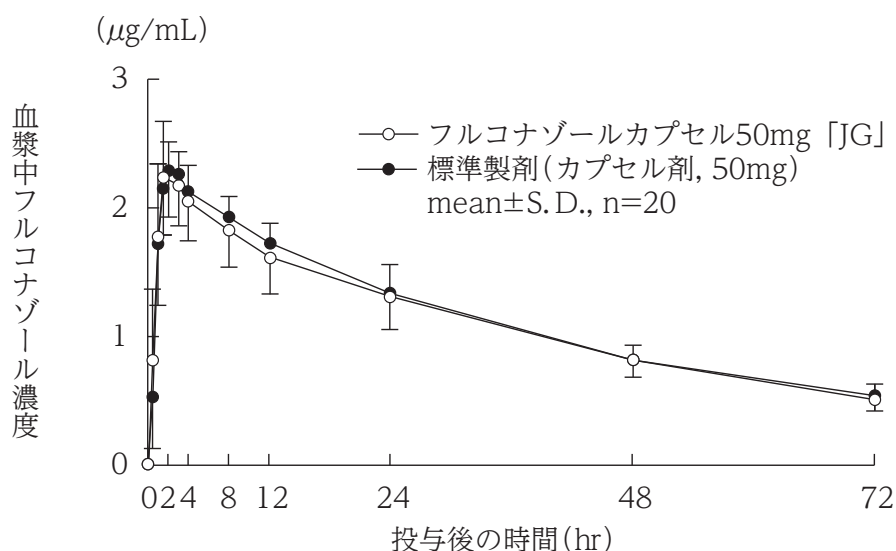
#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 【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について(平成9年12月22日 医薬審第487号)」に従う。

#### フルコナゾールカプセル 50mg「JG」<sup>12)</sup>

フルコナゾールカプセル 50mg「JG」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2カプセル(フルコナゾールとして100mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中フルコナゾール濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)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。<sup>2)</sup>



<薬物動態パラメータ>

|                          | 判定パラメータ  |                                     | 参考パラメータ      |                          |
|--------------------------|--|-------------------------------------|--------------|--------------------------|
|                          | AUC <sub>0-72</sub><br>( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ ) | Cmax<br>( $\mu\text{g}/\text{mL}$ ) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| フルコナゾールカプセル<br>50mg 「JG」 | 80.94±11.60  | 2.40±0.31                           | 2.1±0.6      | 35.7±5.4                 |
| 標準製剤<br>(カプセル剤、50mg)     | 82.95±8.80   | 2.34±0.20                           | 2.1±0.5      | 35.2±5.1                 |

(Mean±S.D.,n=20)

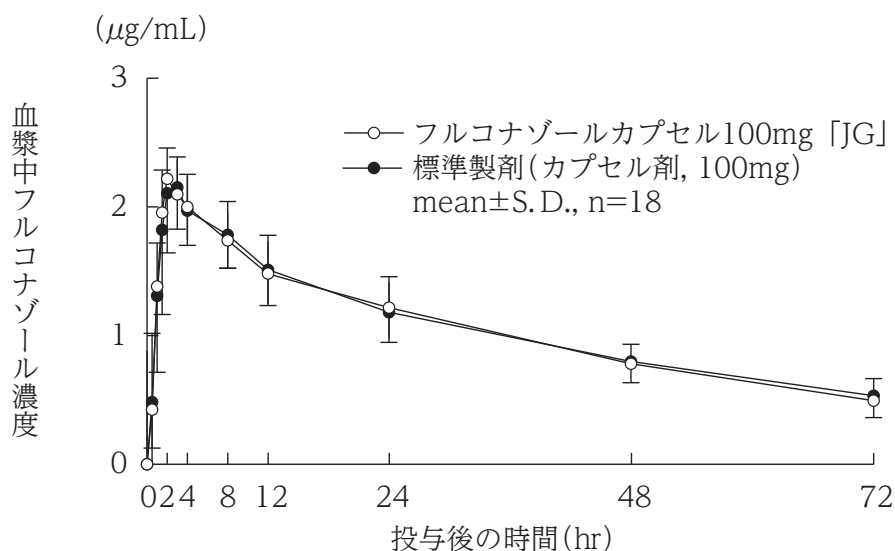
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

<同等性の判定結果>

|         | AUC <sub>0-72</sub>            | Cmax                          |
|---------|--------------------------------|-------------------------------|
| 90%信頼区間 | log (0.887692) ~log (1.063016) | log (0.94932) ~log (1.097839) |

フルコナゾールカプセル 100mg 「JG」<sup>13)</sup>

フルコナゾールカプセル 100mg 「JG」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1カプセル（フルコナゾールとして100mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中フルコナゾール濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）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。<sup>3)</sup>





<薬物動態パラメータ>

|                          | 判定パラメータ  |                                     | 参考パラメータ      |                          |
|--------------------------|--|-------------------------------------|--------------|--------------------------|
|                          | AUC <sub>0-72</sub><br>( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ ) | Cmax<br>( $\mu\text{g}/\text{mL}$ ) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| フルコナゾールカプセル<br>100mg「JG」 | 76.04±11.55  | 2.23±0.26                           | 2.1±0.4      | 38.1±12.3                |
| 標準製剤<br>(カプセル剤、100mg)    | 76.52±11.88  | 2.26±0.24                           | 2.1±0.5      | 40.6±7.6                 |

(Mean±S.D.,n=18)

血漿中濃度並びにAUC、Cmax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。

<同等性の判定結果>

|         | AUC <sub>0-72</sub>           | Cmax                           |
|---------|-------------------------------|--------------------------------|
| 90%信頼区間 | log (0.88845) ~log (1.112223) | log (0.920069) ~log (1.056565) |

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 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

健康成人男子

| 薬剤名                       | 投与量                            | 投与方法         | n  | kel (hr <sup>-1</sup> ) |
|---------------------------|--------------------------------|--------------|----|-------------------------|
| フルコナゾール<br>カプセル 50mg「JG」  | 2カプセル<br>(フルコナゾール<br>として100mg) | 絶食単回<br>経口投与 | 20 | 0.019813±0.003019       |
| フルコナゾール<br>カプセル 100mg「JG」 | 1カプセル<br>(フルコナゾール<br>として100mg) |              | 18 | 0.019568±0.005323       |

(Mean±S.D.)

(5) クリアランス

該当資料なし

## (6) 分布容積

50mg を静脈内単回投与時の分布容積は 45.8L であった。<sup>11)</sup>

## (7) 血漿蛋白結合率

約 10%<sup>11)</sup>

## 3. 吸収

消化管からほぼ完全に吸収される。<sup>14)</sup>

## 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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 10. 妊娠、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

### (3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 10. 妊娠、産婦、授乳婦等への投与」の項参照

### (4) 髄液への移行性

髄液中のフルコナゾール濃度は血漿中濃度の 52～62%との報告がある。<sup>11)</sup>

### (5) その他の組織への移行性

該当資料なし

## 5. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

### (2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 7. 相互作用」の項参照

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

### (4) 代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

### (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

主として腎臓から排泄される。

### (2) 排泄率

健常成人に 100mg を単回経口投与したとき、未変化体が約 77%、代謝物として 1,2,4-トリアゾールが 2.4%、脱トリアゾール体のグルクロン酸抱合体が 0.18%尿中に排泄された。<sup>11)</sup>

### (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

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 13. 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（原則禁忌を含む）

#### 【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

- (1) 次の薬剤を投与中の患者：トリアゾラム、エルゴタミン酒石酸塩・無水カフェイン・イソプロピルアンチピリン、ジヒドロエルゴタミン、キニジン、ピモジド、アスナプレビル、ダクラタスビル・アスナプレビル・ベクラブビル、アゼルニジピン、オルメサルタン メドキシミル・アゼルニジピン、ロミタピド、プロナンセリン、ルラシドン（「相互作用」の項参照）
- (2) 本剤に対して過敏症の既往歴のある患者
- (3) 妊婦又は妊娠している可能性のある患者（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「V. 治療に関する項目 - 2. 用法及び用量」の項参照

### 5. 慎重投与内容とその理由

#### 1. 慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

- (1) 薬物過敏症の既往歴のある患者
- (2) 腎障害のある患者 [血中濃度が持続するので、投与量を減ずるか、投与間隔をあけて使用すること]
- (3) 肝障害のある患者 [肝障害を悪化させることがある]
- (4) 心疾患又は電解質異常のある患者 [心室頻拍 (torsade de pointes を含む)、QT 延長、心室細動、房室ブロック、徐脈等があらわれることがある。（「副作用 重大な副作用」の項参照）]
- (5) ワルファリンを投与中の患者（「重要な基本的注意」及び「相互作用」の項参照）

### 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

#### 2. 重要な基本的注意

- (1) 腎障害のある患者に投与する場合は、投与前にクレアチニン・クリアランス試験を行い、投与量及び投与間隔に十分注意すること。
- (2) 本剤とワルファリンとの併用において、ワルファリンの作用が増強し、著しい INR 上昇を来した症例が報告されている。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。（「相互作用」の項参照）

(3) 本剤の投与に際しては適宜、血液検査、腎機能・肝機能検査、血中電解質検査等を行うことが望ましい。

(4) 本剤の投与に際しては、アレルギー既往歴、薬物過敏症等について十分な問診を行うこと。

## 7. 相互作用

本剤は、CYP2C9、2C19 及び 3A4 を阻害する。

### (1) 併用禁忌とその理由

| 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   |
| トリアゾラム<br>ハルシオン等  | トリアゾラムの代謝遅滞による血中濃度の上昇、作用の増強及び作用時間延長の報告がある。                                    | 本剤はこれらの薬剤の肝臓における主たる代謝酵素である CYP3A4 を阻害するので、併用によりこれらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。 |
| エルゴタミン酒石酸塩・無水カフェイン・イソプロピルアンチピリン<br>クリアミン配合錠<br>ジヒドロエルゴタミン | アゾール系抗真菌剤等の CYP3A4 を阻害する薬剤とエルゴタミンとの併用により、エルゴタミンの血中濃度が上昇し、血管攣縮等の副作用を起こすおそれがある。 |   |
| キニジン<br>キニジン硫酸塩<br>ピモジド                                   | これらの薬剤の血中濃度が上昇することにより、QT 延長、torsade de pointes を発現するおそれがある。                   | 本剤はこれらの薬剤の肝臓における主たる代謝酵素である CYP3A4 を阻害するので、併用によりこれらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。 |
| アスナプレビル<br>スンベプラ<br>ダクラタスビル・アスナプレビル・ベクラブビル<br>ジメンシー配合錠    | これらの薬剤の血中濃度が上昇することにより、肝胆道系の副作用が発現し、また重症化するおそれがある。                             |   |
| アゼルニジピン<br>カルブロク<br>オルメサルタン メドキシミル・アゼルニジピン<br>レザルタス配合錠    | イトラコナゾールとの併用によりアゼルニジピンの AUC が上昇することが報告されている。                                  |   |
| ロミタピド<br>ジャクスタピッド   | ロミタピドの血中濃度が著しく上昇するおそれがある。   | 本剤はこれらの薬剤の主たる代謝酵素である CYP3A4 を阻害するので、併用によりこれらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。       |
| プロナンセリン<br>ロナセン<br>ルラシドン<br>ラツータ                          | これらの薬剤の血中濃度が上昇し、作用が増強するおそれがある。  |   |

(2) 併用注意とその理由

| 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  |
| ワルファリン  | プロトロンビン時間の延長、著しいINR上昇及び出血傾向（挫傷、鼻出血、消化管出血、血尿、下血等）の報告がある。（「 <b>重要な基本的注意</b> 」の項参照） | 本剤はこれらの薬剤の肝臓における主たる代謝酵素であるCYP2C9を阻害するので、併用によりこれらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。        |
| フェニトイン<br>イブプロフェン<br>フルビプロフェン   | これらの薬剤の血中濃度上昇の報告がある。   |  |
| セレコキシブ  | セレコキシブの血中濃度が上昇することがある。<br>本剤を使用中の患者にはセレコキシブの投与を低用量から開始すること。                      |  |
| ロサルタン   | ロサルタンの血中濃度上昇、及び活性代謝物であるカルボン酸体の血中濃度減少の報告がある。                                      | 本剤はロサルタンの肝臓における主たる代謝酵素であるCYP2C9を阻害するので、併用により活性代謝物であるカルボン酸体の血中濃度が減少することがある。 |
| HMG-CoA還元酵素阻害薬<br>フルバスタチン   | これらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。   | 本剤はフルバスタチンの肝臓における主たる代謝酵素であるCYP2C9を阻害するので、併用によりフルバスタチンの血中濃度が上昇することがある。      |
| アトルバスタチン<br>シンバスタチン等  |  |  |
| カルバマゼピン   | カルバマゼピンの血中濃度が上昇し、悪心・嘔吐、めまい、複視等が発現したとの報告がある。                                      | 本剤はこれらの薬剤の肝臓における主たる代謝酵素であるCYP3A4を阻害するので、併用によりこれらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。        |
| ミタゾラム<br>エプレレノン<br>メサドン   | これらの薬剤の血中濃度上昇の報告がある。   |  |
| カルシウム拮抗薬<br>ニフェジピン等<br>ビンカルカロイド系<br>抗悪性腫瘍薬<br>ビクリスチン<br>ビンブラスチン<br>エリスロマイシン | これらの薬剤の血中濃度上昇のおそれがある。  |  |
| タクロリムス水和物<br>シクロスポリン  | これらの薬剤の血中濃度上昇の報告がある。<br>また、併用により腎障害の報告がある。                                       |  |
| リファブチン  | リファブチンのAUC上昇の報告があり、リファブチンの作用が増強するおそれがある。   |  |

| 薬剤名等                                      | 臨床症状・措置方法   | 機序・危険因子   |
|---|---|---|
| リトナビル<br>ニルマトレルビル・リ<br>トナビル               | リトナビルの AUC 上昇の報告がある。<br>ニルマトレルビル・リトナビルの血中濃度上昇のおそれがある。   | 本剤はこれらの薬剤の肝臓における主たる代謝酵素である CYP3A4 を阻害するので、併用によりこれらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。     |
| オキシコドン                                    | オキシコドンの AUC 上昇の報告がある。   |   |
| トルバプタン                                    | トルバプタンの血中濃度上昇の報告があり、トルバプタンの作用が増強するおそれがある。やむを得ず併用する際は、トルバプタンを減量あるいは低用量から開始すること。  |   |
| イブルチニブ<br>ラロトレクチニブ                        | これらの薬剤の副作用が増強されるおそれがある。やむを得ず併用する際は、これらの薬剤の減量を考慮するとともに、患者の状態を慎重に観察すること。  | 本剤はこれらの薬剤の主たる代謝酵素である CYP3A を阻害するので、併用によりこれらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。            |
| レンボレキサント                                  | レンボレキサントの血中濃度上昇の報告があり、傾眠等の副作用が増強されるおそれがある。本剤とレンボレキサントの併用にあたっては、患者の状態を慎重に観察した上で、レンボレキサント投与の可否を判断すること。なお、併用する際はレンボレキサントを 1 日 1 回 2.5mg とすること。 |   |
| バレメトスタット                                  | バレメトスタットの副作用が増強されるおそれがあるので、患者の状態を慎重に観察すること。   |   |
| フェンタニル                                    | フェンタニルの血中濃度上昇のおそれがある。   | 本剤はこれらの薬剤の肝臓における主たる代謝酵素である CYP3A4 を阻害するので、併用によりこれらの薬剤の代謝が遅れることが           |
| リバーロキサバン                                  | リバーロキサバンの血中濃度が上昇したとの報告がある。  |   |
| テオフィリン                                    | テオフィリンの血中濃度上昇の報告がある。  | 本剤はこれらの薬剤の肝臓における主たる代謝酵素であるチトクローム P450 を阻害するので、併用によりこれらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。 |
| 経口避妊薬                                     | エチニルエストラジオール、レボノルゲストレルの血中濃度上昇の報告がある。  |   |
| スルホニル尿素系血糖<br>降下薬<br>クロルプロパミド<br>グリベンクラミド | スルホニル尿素系血糖降下薬の血中濃度上昇の報告がある。また、併用により低血糖の報告がある。   |   |
| ナテグリニド                                    | ナテグリニドの AUC 上昇及び血中濃度半減期の延長の報告がある。   |   |



| 薬剤名等                 | 臨床症状・措置方法  | 機序・危険因子  |
|----------------------|--|--|
| トレチノイン               | 中枢神経系の副作用が発現するおそれがある。                                      | 本剤はこれらの薬剤の肝臓における主たる代謝酵素であるチトクロームP450を阻害するので、併用によりこれらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。        |
| ジアゼパム                | ジアゼパムのAUC上昇及び血中濃度半減期の延長の報告がある。                             | 本剤はこれらの薬剤の肝臓における主たる代謝酵素であるCYP3A4及び2C19を阻害するので、併用によりこれらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。      |
| トファシチニブ              | トファシチニブのAUCが79%、Cmaxが27%増加したとの報告がある。                       |  |
| シクロホスファミド            | ビリルビンの上昇、クレアチニンの上昇の報告がある。                                  | 本剤はシクロホスファミドの肝臓における主たる代謝酵素であるCYP3A4及び2C9を阻害するので、併用によりシクロホスファミドの血中濃度が上昇することがある。 |
| アプロシチニブ              | アプロシチニブの作用が増強するおそれがある。可能な限り本剤を他の類薬に変更する、又は本剤を休薬する等を考慮すること。 | 本剤はアプロシチニブの代謝酵素であるCYP2C19を阻害するので、併用によりアプロシチニブの血中濃度が上昇することがある。                  |
| アミトリプチリン<br>ノルトリプチリン | これらの薬剤の作用が増強するおそれがある。                                      | 本剤はこれらの薬剤の代謝を阻害するので、これらの薬剤の血中濃度が上昇することがある。                                     |
| ジドブジン                | ジドブジンの血中濃度上昇の報告がある。  |  |
| リファンピシン              | 本剤の血中濃度の低下及び血中濃度半減期の減少の報告がある。                              | リファンピシンは代謝酵素であるチトクロームP450を誘導する。その結果、本剤の肝代謝が増加すると考えられる。                         |
| 三酸化二ヒ素               | QT延長、心室頻拍（torsade de pointesを含む）を起こすおそれがある。                | 本剤及び三酸化二ヒ素は、いずれもQT延長、心室頻拍（torsade de pointesを含む）を起こすことがある。                     |

## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

### (2) 重大な副作用と初期症状

重大な副作用（以下、全て頻度不明）

#### 1) ショック、アナフィラキシー

ショック、アナフィラキシー（血管浮腫、顔面浮腫、痒痒等）を起こすことがあるので、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し、適切な処置を行うこと。

**2) 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)**

中毒性表皮壊死融解症、皮膚粘膜眼症候群があらわれることがあるので、このような症状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。

**3) 薬剤性過敏症症候群**

初期症状として発疹、発熱がみられ、更に肝機能障害、リンパ節腫脹、白血球増加、好酸球増多、異型リンパ球出現等を伴う遅発性の重篤な過敏症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような症状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。なお、ヒトヘルペスウイルス 6 (HHV-6) 等のウイルスの再活性化を伴うことが多く、投与中止後も発疹、発熱、肝機能障害等の症状が再燃あるいは遷延化することがあるので注意すること。<sup>15)</sup>

**4) 血液障害**

無顆粒球症、汎血球減少症、血小板減少、白血球減少、貧血等の重篤な血液障害があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

**5) 急性腎障害**

急性腎障害等の重篤な腎障害が報告されているので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、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。

**6) 肝障害**

黄疸、肝炎、胆汁うっ滞性肝炎、肝壊死、肝不全等の肝障害が報告されており、これらの症例のうち死亡に至った例も報告されている。これらの発症と 1 日投与量、治療期間、患者の性別・年齢との関連性は明らかではない。本剤による肝障害は通常、投与中止により回復している。投与にあたっては、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し、適切な処置を行うこと。

**7) 意識障害**

錯乱、見当識障害等の意識障害があらわれることがあるので、このような症状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。

**8) 痙攣**

痙攣等の神経障害があらわれることがあるので、このような症状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。

**9) 高カリウム血症**

高カリウム血症があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止し、電解質補正等の適切な処置を行うこと。

**10) 心室頻拍、QT 延長、不整脈**

心室頻拍 (torsade de pointes を含む)、QT 延長、心室細動、房室ブロック、徐脈等があらわれることがあるので、定期的に心電図検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

**11) 間質性肺炎**

間質性肺炎があらわれることがあるので、発熱、咳嗽、呼吸困難、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 線等の検査を実施し、本剤の投与を中止するとともに、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

## 12) 偽膜性大腸炎

偽膜性大腸炎等の重篤な大腸炎（初期症状：発熱、腹痛、頻回の下痢）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し、適切な処置を行うこと。

### (3) その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。

|   |       | 頻 度 不 明   |
|---|-------|---|
| 肝 | 臓     | AST (GOT) の上昇、ALT (GPT) の上昇、ALP の上昇、LDH の上昇、ビリルビンの上昇、黄疸 |
| 皮 | 膚     | 発疹 <sup>注1)</sup> 、剥脱性皮膚炎                               |
| 消 | 化 器   | 悪心、しゃっくり、食欲不振、下痢、腹部不快感、腹痛、口渇、嘔吐、消化不良、鼓腸放屁               |
| 精 | 神・神経系 | 頭痛、手指のこわばり、めまい、傾眠、振戦                                    |
| 腎 | 臓     | BUN の上昇、クレアチニンの上昇、乏尿                                    |
| 代 | 謝 異 常 | 低カリウム血症、高コレステロール血症、高トリグリセリド血症、高血糖                       |
| 血 | 液     | 好酸球増多、好中球減少   |
| そ | の 他   | 浮腫、発熱 <sup>注1)</sup> 、倦怠感、熱感、脱毛、味覚倒錯、副腎機能不全             |

注1) 発現した場合には投与を中止すること。

### (4) 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

### (5) 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

### (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）(2)、  
- 5. 慎重投与内容とその理由 (1)、 - 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 (4)、  
- 8. 副作用 (2) 重大な副作用と初期症状、(3) その他の副作用「皮膚」の項参照

## 9. 高齢者への投与

本剤は主として腎臓から排泄されるが、高齢者では腎機能が低下していることが多いため高い血中濃度が持続するおそれがあるので、用量ならびに投与間隔に留意するなど慎重に投与すること。

## 10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1) 催奇形性を疑う症例報告があるので、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。
- (2) 母乳中に移行することが認められているので、授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。

## 11. 小児等への投与

新生児においては、腎機能が未熟なため血中濃度半減期が延長することから、投与間隔に留意すること。

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

## 13. 過量投与

症状：

- (1) 外国の癌患者での過量投与（フルコナゾール 1,200～2,000mg/日、経口投与）の症例報告では、フルコナゾール 1,600mg/日投与例において、肝機能検査値上昇がみられた。また、2,000mg/日投与例において、中枢神経系障害（錯乱、嗜眠、見当識障害、不眠、悪夢、幻覚）、多形性紅斑、悪心・嘔吐、肝機能検査値上昇等がみられたとの報告がある。
- (2) フルコナゾール 8,200mg 経口摂取後、幻覚、妄想行動の症状があらわれ、48 時間の経過観察が行われた結果、症状は回復したとの報告がある（自殺企図例）。

処置：

- (1)、(2) とも対症療法を行う。フルコナゾールは、大部分が腎から排泄される。3 時間の血液透析により、約 50%が血清より除去される。

## 14. 適用上の注意

薬剤交付時：

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）。

## 15. その他の注意

該当しない

## 16. その他

該当しない

# 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     | フルコナゾールカプセル 50mg 「JG」<br>フルコナゾールカプセル 100mg 「JG」 | 処方箋医薬品※ |
| 有 効 成 分 | フルコナゾール   | 該当しない   |

※注意－医師等の処方箋により使用すること

### 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、気密容器

### 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）

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 - 14. 適用上の注意」の項参照

- ・患者向医薬品ガイド：有り
- ・くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当しない

### 5. 承認条件等

該当しない

### 6. 包装

- ・フルコナゾールカプセル 50mg 「JG」  
PTP：20カプセル（10カプセル×2）
- ・フルコナゾールカプセル 100mg 「JG」  
PTP：50カプセル（10カプセル×5）

### 7. 容器の材質

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム・アルミニウム箔（PTP）、紙箱

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分：ジフルカンカプセル 50mg/100mg 他

同 効 薬：イトラコナゾール、ホスフルコナゾール、ボリコナゾール 等

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

| 販売名                    | 製造販売承認年月日  | 承認番号             |
|------------------------|------------|------------------|
| フルコナゾールカプセル 50mg 「JG」  | 2010年8月31日 | 22200AMX00918000 |
| フルコナゾールカプセル 100mg 「JG」 | 2010年8月31日 | 22200AMX00919000 |

11. 薬価基準収載年月日

2011年6月24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

|  |
|--|
| 承認年月日：2012年6月15日<br>効能・効果の内容：「造血幹細胞移植患者における深在性真菌症の予防」の効能・効果を追加した。<br>用法・用量の内容：効能・効果追加に伴い、関連の用法・用量を追加した。<br>また、小児及び新生児に対する用法・用量を追加した。 |
| 承認年月日：2015年11月4日<br>効能・効果の内容：「カンジダ属に起因する膣炎及び外陰膣炎」の効能・効果を追加した。<br>用法・用量の内容：効能・効果追加に伴い、関連の用法・用量を追加した。                                  |

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（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

| 販売名                       | HOT (9桁) 番号 | 厚生労働省薬価基準<br>収載医薬品コード | レセプト電算<br>コード |
|---------------------------|-------------|-----------------------|---------------|
| フルコナゾールカプセル<br>50mg 「JG」  | 120703301   | 6290002M1011          | 622070301     |
| フルコナゾールカプセル<br>100mg 「JG」 | 120704001   | 6290002M2018          | 622070401     |

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。



# X I . 文献

---

## 1. 引用文献

- 1) 田中千賀子、加藤隆一、成宮周編集；NEW 薬理学（改訂第7版）、574（2017）、南江堂
- 2) ジェネリック医薬品品質情報検討会；医療用医薬品最新品質情報集（ブルーブック）  
<http://www.nihs.go.jp/drug/ecqaged/bluebook/list.html>（2023/5/2 アクセス）
- 3) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
フルコナゾールカプセル 50mg「JG」の長期保存試験
- 4) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
フルコナゾールカプセル 50mg「JG」の加速試験
- 5) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
フルコナゾールカプセル 50mg「JG」の無包装状態での安定性試験
- 6) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
フルコナゾールカプセル 100mg「JG」の長期保存試験
- 7) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
フルコナゾールカプセル 100mg「JG」の加速試験
- 8) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
フルコナゾールカプセル 100mg「JG」の無包装状態での安定性試験
- 9) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
フルコナゾールカプセル 50mg「JG」の溶出試験
- 10) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
フルコナゾールカプセル 100mg「JG」の溶出試験
- 11) 第十七改正日本薬局方解説書、C-4622（2016）、廣川書店
- 12) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
フルコナゾールカプセル 50mg「JG」の生物学的同等性試験
- 13) 日本ジェネリック株式会社 社内資料；  
フルコナゾールカプセル 100mg「JG」の生物学的同等性試験
- 14) 高折修二 他監訳；グッドマン・ギルマン薬理書（下）薬物治療の基礎と臨床（第12版）、  
2048（2013）、廣川書店
- 15) 厚生労働省：重篤副作用疾患別対応マニュアル 薬剤性過敏症症候群

## 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 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) 妊婦に関する海外情報

本邦における使用上の注意「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項の記載は以下のとおりであり、米FDA、オーストラリア分類とは異なる。

#### 【使用上の注意】「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」

- (1) 催奇形性を疑う症例報告があるので、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。
- (2) 母乳中に移行することが認められているので、授乳中の婦人には本剤投与中は授乳を避けさせること。

|   | 分類  |
|---|---|
| FDA : Pregnancy Category  | Single 150mg tablet use for Vaginal Candidiasis : C<br>All other indication : D<br>(2011年11月) |
| ADEC :<br>(An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy) | D (2019年11月)  |

参考：分類の概要

FDA : Pregnancy Category

C : Animal reproduction studies have shown an adverse effect on the fetus, but there are no adequate and well-controlled studies of humans. The benefits from the use of the drug in pregnant women might be acceptable despite its potential risks. Or animal studies have not been conducted and there are no adequate and well-controlled studies of humans.

D : There is positive evidence of human fetal risk based on adverse reaction data from investigational or marketing experience or studies of humans, but the potential benefits from the use of the drug in pregnant women might be acceptable despite its potential risks.

< [https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda\\_docs/label/2011/019949s055,019950s059,020090s038lbl.pdf](https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2011/019949s055,019950s059,020090s038lbl.pdf) > (2020/6/5 アクセス)

《オーストラリア分類》

ADEC : (An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy)

D : Drugs which have caused, are suspected to have caused or may be expected to cause, an increased incidence of human fetal malformations or irreversible damage. These drugs may also have adverse pharmacological effects. Accompanying texts should be consulted for further details.

< <https://www.tga.gov.au/prescribing-medicines-pregnancy-database> >  
(2020/6/5 アクセス)

## 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

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

#### (1) 粉砕

(脱カプセル)

##### 1. 保存条件

開放条件：25℃/60%RH、30日間（開放・シャーレ）

密閉条件：25℃/60%RH、30日間（密閉・遮光・気密容器）

##### 2. 試験項目

性状、定量試験

##### 3. 試験結果

フルコナゾールカプセル 50mg 「JG」

|      |          | 試験開始時 <sup>(1)</sup> | 14日後 | 30日後  |
|------|----------|----------------------|------|-------|
| 開放条件 | 性状       | 白色の粉末                | 変化なし | 変化なし  |
|      | 定量試験 (%) | 100 <sup>(2)</sup>   | 97.3 | 101.5 |
| 密閉条件 | 性状       | 白色の粉末                | 変化なし | 変化なし  |
|      | 定量試験 (%) | 100 <sup>(2)</sup>   | 99.8 | 98.4  |

(1) 試験開始時は共通

(2) 試験開始時を 100 とした残存率で表示

フルコナゾールカプセル 100mg 「JG」

|      |          | 試験開始時 <sup>(1)</sup> | 14日後  | 30日後  |
|------|----------|----------------------|-------|-------|
| 開放条件 | 性状       | 白色の粉末                | 変化なし  | 変化なし  |
|      | 定量試験 (%) | 100 <sup>(2)</sup>   | 99.8  | 96.5  |
| 密閉条件 | 性状       | 白色の粉末                | 変化なし  | 変化なし  |
|      | 定量試験 (%) | 100 <sup>(2)</sup>   | 100.1 | 100.3 |

(1) 試験開始時は共通

(2) 試験開始時を 100 とした残存率で表示

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

### 1. 試験方法

#### 崩壊懸濁試験：

ディスペンサー内にカプセル剤 1 個を入れ、55℃の温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置した。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認した。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行った。

#### 通過性試験：

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管栄養チューブの注入端より 2~3mL/秒の速度で注入し、チューブのサイズ、8, 12, 14, 16, 18 フレンチ（以下 Fr.とする）において通過する最小経管栄養チューブのサイズを確認した。

### 2. 試験結果

#### 崩壊懸濁試験結果

| 品目名                   | 崩壊・懸濁状況                 |
|-----------------------|-------------------------|
| フルコナゾールカプセル 50mg「JG」  | 10 分の時点で崩壊・懸濁した         |
| フルコナゾールカプセル 100mg「JG」 | 10 分以上、20 分以内の間で崩壊・懸濁した |

#### 通過性試験結果

| 品目名                   | 最小通過サイズ       |
|-----------------------|---------------|
| フルコナゾールカプセル 50mg「JG」  | 8Fr.チューブを通過した |
| フルコナゾールカプセル 100mg「JG」 | 8Fr.チューブを通過した |

8Fr. : 8 フレンチ 約 2.7 mm<外径>

## 2. その他の関連資料

該当資料なし

*Memo*



日本ジェネリック株式会社

東京都千代田区丸の内一丁目9番1号