

**2011年6月改訂(第6版)
*2009年9月改訂

抗真菌剤

* アデスタン® 錠300mg

(イソコナゾール硝酸塩錠)

日本標準商品分類番号 872529	
* 承認番号	22100AMX00740
* 薬価収載	2009年9月
販売開始	1985年7月
再審査結果	1992年12月

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示



Adestan® 300mg

D6

■ 禁忌(次の患者には使用しないこと)

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

■ 組成・性状

* 販売名	アデスタン錠300mg	
成分・含量	1錠中、イソコナゾール硝酸塩300mg含有	
添加物	乳糖水和物、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム	
色・剤形	白色の錠錠	
外形 (識別コード)		
長径(mm)	26	
短径(mm)	14	
厚さ(mm)	6.2	
重さ(g)	1.6	

■ 効能・効果

カンジダに起因する陰炎及び外陰陰炎

** ■ 用法・用量

イソコナゾール硝酸塩として、1週1回600mgを陰深部に挿入する。

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

■ 使用上の注意

** 1. 副作用

承認時までの調査症例368例中1例(0.3%)に副作用が認められ、その副作用は局所の刺激感であった。(承認時)
市販後使用成績調査での調査症例2,995例中15例(0.5%)に副作用が認められ、主な副作用は疼痛7件(0.2%)、腫脹感6件(0.2%)等であった。(再審査終了時)

下記の副作用があらわれることがあるので、このような場合には使用を中止するなど適切な処置を行うこと。

	0.1~1%未満	0.1%未満	頻度不明
陰	疼痛、腫脹感	痒痒感、発赤、刺激感	熱感

2. 高齢者への使用

一般に高齢者では生理機能が低下しているので、患者の状態を観察しながら慎重に使用すること。

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への使用

本剤の妊娠初期の使用に関する安全性はまだ確立されていないので、妊娠3ヵ月までの妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ使用すること。

** 4. 適用上の注意

本剤はPTPシートから取り出して陰内へのみ使用するように指導すること。

■ 薬物動態

1. 吸収

健康女性2名に³H-イソコナゾール硝酸塩100mgを、また健康女性3名に³H-イソコナゾール硝酸塩600mgをそれぞれ陰内投与したところ、陰粘膜からの吸収は、投与量の約5%及び10%以下と推定された。なお、血漿中の放射活性濃度は検出限界0.2μg/mL以下であった¹²⁾。(外国データ)

2. 排泄

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

** ■ 臨床成績

有効率

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

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

■ 薬効薬理

1. 抗菌作用

イソコナゾール硝酸塩は*in vitro*の試験の結果、皮膚糸状菌、酵母及び酵母様真菌、カビ類、グラム陽性細菌、陰のトリコモナスに対して広範な抗菌活性スペクトルを示した⁵⁻⁷⁾。

最小発育阻止濃度(MIC)⁷⁾

SPECIES	MICROORGANISMS	MIC(μg/mL)
Dermatophytes	<i>Trichophyton mentagrophytes</i>	0.10-3.13
	<i>Trichophyton rubrum</i>	0.10-0.39
	<i>Microsporium canis</i>	0.10-3.13
	<i>Epidermophyton floccosum</i>	0.10-0.20
Yeast & yeastlike fungi	<i>Candida albicans</i>	0.20-3.13
	<i>Candida tropicalis</i>	0.78-3.13
	<i>Candida parapsilosis</i>	0.78-1.56
	<i>Candida stellatoidea</i>	0.10-0.20
	<i>Torulopsis glabrata</i>	1.56-6.25
Moulds	<i>Aspergillus fumigatus</i>	1.56-6.25
	<i>Aspergillus niger</i>	0.78-1.56
Grampositive bacteria	<i>Nocardia asteroides</i>	0.78-1.56
	<i>Staphylococcus/Micrococcus</i> ⁸⁾	1.6-6.3

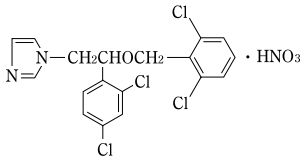
MIC定量は、Sabouraud's dextrose agar(ブドウ糖2%)の寒天平板希釈法による⁷⁾。(液体培地の倍数希釈法による⁵⁾)

2. 抗真菌作用機序

イソコナゾール硝酸塩は真菌類の細胞膜の透過性を迅速かつ強力に変化させることによって抗真菌作用を発揮する。この結果、細胞呼吸が抑制され、細胞膜構造が破壊される⁸⁾。

■ 有効成分に関する理化学的知見

構造式：



一般名：イソコナゾール硝酸塩 (Isoconazole Nitrate)

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

分子式：C₁₈H₁₄Cl₄N₂O · HNO₃

分子量：479.14

融点：約178℃ (分解)

性状：本品は白色～微黄白色の結晶性の粉末である。

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

■ 取扱い上の注意

小児の手のとどかない所に保管するよう指導すること。

■ 包装

錠錠

300mg PTP包装 40錠(2錠×20)

■ 主要文献

- 1) Speck, U. et al. : バイエル薬品社内資料[薬物動態(外国データ)] (1975)
- 2) Speck, U. et al. : バイエル薬品社内資料[薬物動態(外国データ)] (1975)
- 3) 水野重光他：産婦人科の世界 34：201(1982)
- 4) 水野重光他：産婦人科の世界 34：541(1982)
- 5) Kessler, H. J. : Arzneim.-Forsch. 29：1344(1979)
- 6) 渡辺昌平他：皮膚科紀要 73：209(1978)
- 7) 岩田和夫他：Chemotherapy 29：1149(1981)
- 8) 西木克佑他：真菌と真菌症 22：227(1982)

■ 文献請求先

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

バイエル薬品株式会社・メディカルインフォメーション
〒530-0001 大阪市北区梅田二丁目4番9号

■ バイエル医療用医薬品のお問い合わせ先

バイエル薬品株式会社・くすり相談 ☎ 0120-106-398