

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（1998年9月）に準拠して作成

抗真菌剤

オキコナール[®]膾錠100mg
オキコナール[®]膾錠600mg

オキシコナゾール硝酸塩膾錠
 OKICONALE[®] vaginal tablets

剤形	錠剤（膾錠）
規格・含量	オキコナール膾錠 100mg 1錠中、オキシコナゾール硝酸塩 100mg 含有 オキコナール膾錠 600mg 1錠中、オキシコナゾール硝酸塩 600mg 含有
一般名	和名：オキシコナゾール硝酸塩 洋名：Oxiconazole Nitrate
製造・輸入承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	製造承認年月日：2008年2月28日 薬価基準収載年月日：2008年6月20日 発売年月日：2000年7月7日
開発・製造・ 輸入・発売・提携・ 販売会社名	製造販売元：富士製薬工業株式会社
担当者の連絡先・ 電話番号・FAX番号	

本 IF は、2009年10月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。

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

当該医薬品についての製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR と略す）等にインタビューし、当該医薬品の評価を行うのに必要な医薬品情報源として使われていたインタビューフォームを、昭和 63 年日本病院薬剤師会（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）として位置付けを明確化し、その記載様式を策定した。そして、平成 10 年日病薬学術第 3 小委員会によって新たな位置付けと IF 記載要領が策定された。

2. IF とは

IF は「医療用医薬品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適正使用や評価のための情報あるいは薬剤情報提供の裏付けとなる情報等が集約された総合的な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。しかし、薬事法の規制や製薬企業の機密等に関わる情報、製薬企業の製剤意図に反した情報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。

3. IF の様式・作成・発行

規格は A4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体で記載し、印刷は一色刷りとする。表紙の記載項目は統一し、原則として製剤の投与経路別に作成する。IF は日病薬が策定した「IF 記載要領」に従って記載するが、本 IF 記載要領は、平成 11 年 1 月以降に承認された新医薬品から適用となり、既発売品については「IF 記載要領」による作成・提供が強制されるものではない。また、再審査及び再評価（臨床試験実施による）がなされた時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載内容が大きく異なる場合には IF が改訂・発行される。

4. IF の利用にあたって

IF 策定の原点を踏まえ、MR へのインタビュー、自己調査のデータを加えて IF の内容を充実させ、IF の利用性を高めておく必要がある。MR へのインタビューで調査・補足する項目として、開発の経緯、製剤的特徴、薬理作用、臨床成績、非臨床試験等の項目が挙げられる。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、当該医薬品の製薬企業の協力のもと、医療用医薬品添付文書、お知らせ文書、緊急安全性情報、Drug Safety Update（医薬品安全対策情報）等により薬剤師等自らが加筆、整備する。そのための参考として、表紙の下段に IF 作成の基となった添付文書の作成又は改訂年月を記載している。なお、適正使用や安全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」に関する項目等には承認外の用法・用量、効能・効果が記載されている場合があり、その取扱いには慎重を要する。

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII-4. 用法・用量に関連する使用上の注意と その理由	8
I-1. 開発の経緯	1	VIII-5. 慎重投与内容とその理由	8
I-2. 製品の特徴及び有用性	1	VIII-6. 重要な基本的注意とその理由 及び処置方法	8
II. 名称に関する項目	2	VIII-7. 相互作用	8
II-1. 販売名	2	VIII-8. 副作用	8
II-2. 一般名	2	VIII-9. 高齢者への投与	8
II-3. 構造式又は示性式	2	VIII-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	8
II-4. 分子式及び分子量	2	VIII-11. 小児等への投与	9
II-5. 化学名（命名法）	2	VIII-12. 臨床検査結果に及ぼす影響	9
II-6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	VIII-13. 過量投与	9
II-7. CAS登録番号	2	VIII-14. 適用上及び薬剤交付時の注意 （患者等に留意すべき必須事項等）	9
III. 有効成分に関する項目	3	VIII-15. その他の注意	9
III-1. 有効成分の規制区分	3	VIII-16. その他	9
III-2. 物理化学的性質	3	IX. 非臨床試験に関する項目	9
III-3. 有効成分の各種条件下における安定性	3	IX-1. 一般薬理	9
III-4. 有効成分の確認試験法 ¹⁾	3	IX-2. 毒性	9
III-5. 有効成分の定量法 ¹⁾	3	X. 取扱い上の注意等に関する項目	10
IV. 製剤に関する項目	4	X-1. 有効期間又は使用期限	10
IV-1. 剤形	4	X-2. 貯法・保存条件	10
IV-2. 製剤の組成	4	X-3. 薬剤取扱い上の注意点	10
IV-3. 製剤の各種条件下における安定性	4	X-4. 承認条件	10
IV-4. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	4	X-5. 包装	10
IV-5. 混入する可能性のある夾雑物	4	X-6. 同一成分・同効薬	10
IV-6. 製剤中の有効成分の確認試験法	5	X-7. 国際誕生年月日	10
IV-7. 製剤中の有効成分の定量法	5	X-8. 製造・輸入承認年月日及び承認番号	10
IV-8. 容器の材質	5	X-9. 薬価基準収載年月	10
IV-9. 刺激性	5	X-10. 効能・効果追加、用法・用量 変更追加等の年月日及びその内容	10
IV-10. その他	5	X-11. 再審査結果、再評価結果公表年月日 及びその内容	10
V. 治療に関する項目	6	X-12. 再審査期間	10
V-1. 効能又は効果	6	X-13. 長期投与の可否	10
V-2. 用法及び用量	6	X-14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	10
V-3. 臨床成績	6	X-15. 保険給付上の注意	11
VI. 薬効薬理に関する項目	6	X I. 文献	11
VI-1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	6	X I-1. 引用文献	11
VI-2. 薬理作用	6	X I-2. その他の参考文献	11
VII. 薬物動態に関する項目	7	X II. 参考資料	11
VII-1. 血中濃度の推移・測定法	7	X II-1. 主な外国での発売状況	11
VII-2. 薬物速度論的パラメータ	7	X III. 備考	11
VII-3. 吸収	7		
VII-4. 分布	7		
VII-5. 代謝	7		
VII-6. 排泄	7		
VII-7. 透析等による除去率	7		
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	8		
VIII-1. 警告内容とその理由	8		
VIII-2. 禁忌内容とその理由	8		
VIII-3. 効能・効果に関連する使用上の注意と その理由	8		

I. 概要に関する項目

I-1. 開発の経緯

オキシコナゾール硝酸塩 (OCZ) はスイスの Siegfried 社と F. Hoffmann-La Roche 社とによって共同開発されたイミダゾール系抗真菌剤で、強い抗真菌作用と広範囲な抗真菌スペクトルを有する。

本邦ではクリーム剤、液剤および錠剤が承認・販売されている。

本剤はオキナゾール錠剤 100mg、錠剤 600mg の後発品の錠剤製剤として 2000 年に製造承認を受けた。その後、「医療事故を防止するための医薬品の表示事項及び販売名の取扱いについて」（平成 12 年 9 月 19 日付医薬発第 935 号）に基づき、医療事故防止対策として、販売名をオキコナール錠剤 100mg、オキコナール錠剤 600mg に変更し、2008 年に製造販売承認を受けた。

I-2. 製剤の特徴及び有用性

1. *Candida glabrata* に対する改善率が高い。
2. 脱落しにくく、投与しやすい小型の錠剤である。

II. 名称に関する項目

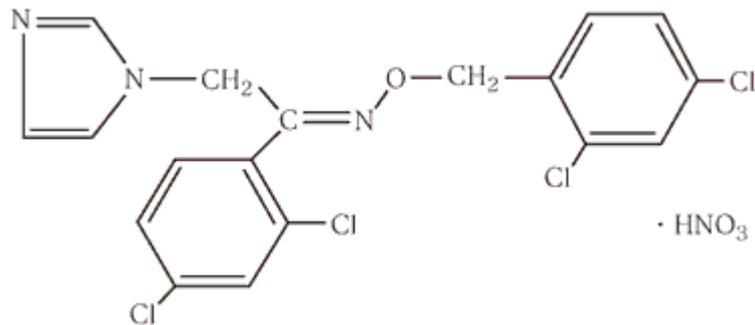
II-1. 販売名

- (1) 和名 : オキコナール®錠 100mg、オキコナール®錠 600mg
- (2) 洋名 : OKICONALE® vaginal tablets
- (3) 名称の由来 : なし

II-2. 一般名

- (1) 和名 (命名法) : オキシコナゾール硝酸塩 (JAN)
- (2) 洋名 (命名法) : Oxiconazole Nitrate (JAN, USAN)

II-3. 構造式又は示性式



II-4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{18}H_{13}Cl_4N_3O \cdot HNO_3$
分子量 : 492.14

II-5. 化学名 (命名法)

2',4'-Dichloro-2-imidazol-1-ylacetophenone (*Z*)-[*O*-(2,4-dichlorobenzyl) oxime]
mononitrate

II-6. 慣用名、別名、略号、記号番号

略号 : OCZ

II-7. CAS 登録番号

64211-46-7

Ⅲ. 有効成分に関する項目

Ⅲ-1. 有効成分の規制区分

指定医薬品

Ⅲ-2. 物理化学的性質

- (1) 外観・性状：
白色～微黄白色の結晶または結晶性の粉末で、わずかに特異なおいがある。
- (2) 溶解性：
N,N-ジメチルホルムアミドに溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、エタノール(95)、無水酢酸または酢酸(100)にやや溶けにくく、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。
- (3) 吸湿性：該当資料なし
- (4) 融点（分解点）、沸点、凝固点：融点 約 142°C（分解）
- (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：該当資料なし

Ⅲ-3. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

Ⅲ-4. 有効成分の確認試験法¹⁾

- (1) 本品 5mg を水/メタノール混液(1:1)5mL に溶かし、ライネッケ塩試液 0.5mL を加えるとき、淡赤色の沈殿を生じる。
- (2) 本品につき、炎色反応試験(2)を行うとき、緑色を呈する。
- (3) 本品を乾燥し、赤外吸収スペクトル測定法の臭化カリウム錠剤法により測定するとき、波数 2600 cm^{-1} 、1390 cm^{-1} 、1042 cm^{-1} 、937 cm^{-1} 及び 827 cm^{-1} 付近に吸収を認める。
- (4) 本品 2.0g をジメチルホルムアミド 70mL に溶かし、水を加えて 100mL とした液は硝酸塩の定性反応(2)を呈する。

Ⅲ-5. 有効成分の定量法¹⁾

本品を乾燥し、その約 0.25g を精密に量り、無水酢酸/氷酢酸混液(1:1)40mL に溶かし、0.1mol/L 過塩素酸で滴定する(電位差滴定法)。同様の方法で空試験を行い、補正する。
0.1mol/L 過塩素酸 1mL = 49.21mg $\text{C}_{18}\text{H}_{13}\text{Cl}_4\text{N}_3\text{O}\cdot\text{HNO}_3$

IV. 製剤に関する項目

IV-1. 剤形

- (1) 投与経路：膣
 (2) 剤形の区別、規格及び性状

販売名	オキコナール膣錠 100mg	オキコナール膣錠 600mg	
有効成分	オキシコナゾール硝酸塩		
含量（1錠中）	100mg	600mg	
添加物	乳糖水和物 結晶セルロース 低置換度ヒドロキシプロピルセルロース ヒドロキシプロピルセルロース ステアリン酸マグネシウム	結晶セルロース 低置換度ヒドロキシプロピルセルロース ヒドロキシプロピルセルロース ステアリン酸マグネシウム	
色・剤形	白色・アーモンド形の素錠		
外形			
大きさ	長径	20mm	20mm
	短径	12mm	12mm
	厚さ	5.5mm	5.8mm
	質量	1.2g	1.2g
識別コード	FJ 003 100	FJ 003 600	

- (3) 製剤の物性：
 日局 一般試験法 崩壊試験法(1)錠剤の項に準じて試験を行うとき、これに適合する。
 (4) 識別コード：上記表参照
 (5) 無菌の有無：無菌製剤ではない

IV-2. 製剤の組成

- (1) 有効成分(活性成分)の含量
 オキコナール膣錠 100mg：1錠中、オキシコナゾール硝酸塩 100mg 含有する
 オキコナール膣錠 600mg：1錠中、オキシコナゾール硝酸塩 600mg 含有する
 (2) 添加物：上記表参照

IV-3. 製剤の各種条件下における安定性

安定性試験²⁾

最終包装製品を用いた加速試験（40±1℃、相対湿度 75±5%、遮光、6ヵ月）の結果、オキコナール膣錠 100mg およびオキコナール膣錠 600mg は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

IV-4. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

IV-5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

IV-6. 製剤中の有効成分の確認試験法

- (1) ライネッケ塩試液による沈殿反応試験
- (2) 炎色反応試験
- (3) 薄層クロマトグラフィー

IV-7. 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

IV-8. 容器の材質

PTP包装（ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔）、アルミピロー包装、紙箱

IV-9. 刺激性

刺激感等があらわれることがある（「VIII-8. 副作用」の項参照）

IV-10. その他

崩壊試験：

本品は日局 一般試験法 崩壊試験法（1）錠剤の項に準じて試験をおこなうとき、これに適合する。

重量偏差試験：

本品は日局 一般試験法 重量偏差試験法の項に準じて試験をおこなうとき、これに適合する。

本規格及び試験方法は別に規定するもののほか、日局通則、製剤総則及び一般試験法ならびに局外規 通則、一般試験法を準用するものとする。

V. 治療に関する項目

V-1. 効能又は効果

カンジダに起因する膣炎および外陰膣炎

V-2. 用法及び用量

オキコナール膣錠 100mg

1日1回1錠を膣深部に挿入し、6日間継続使用する。

なお、真菌学的効果(一次効果)が得られない場合は、オキコナール膣錠 100mg をさらに1日1回1錠6日間継続使用する。

オキコナール膣錠 600mg

1週1回1錠を膣深部に挿入する。

なお、真菌学的効果(一次効果)が得られない場合は、オキコナール膣錠 600mg をさらに1回1錠使用する。

V-3. 臨床成績

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

VI-1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

その他のイミダゾール系化合物 (クロトリマゾール等)

VI-2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

真菌細胞膜に直接作用し、その透過性を変化させ、必須代謝基質の取り込み阻害及び細胞内成分の放出を起こす。また、低濃度域での部分的発育阻止効果には、エルゴステロールの合成阻害作用が関与している。³⁾

酵母状真菌に対する MIC 値は下記の通りであった (Sabouraud dextrose agar 培地)。⁴⁾

菌種	MIC (μ g/mL)
<i>Candida albicans</i>	<0.04~10
<i>Torulopsis glabrata</i> (<i>Candida glabrata</i>)	<0.04~0.16

(2) 薬効を裏付ける試験成績⁵⁾

オキシコナゾール硝酸塩の作用機序を解明するため、*Candida albicans* を試験菌として検討した。

結果

- ① 10~20 μ g/mL 以上の濃度で、生体高分子物質などの主要細胞成分の合成を阻害し、また 2-デオキシグルコースの取込みを阻害した。
- ② 10 μ g/mL 以上の濃度で、細胞内 K⁺及び無機リン酸などの成分の放出、ならびに細胞外液 pH 値の迅速な上昇を引き起こした。
- ③ 1 μ g/mL 以下の濃度でエルゴステロール合成を 90%以上阻止した。

VII. 薬物動態に関する項目

VII-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：該当資料なし
- (3) 通常用量での血中濃度：該当資料なし
- (4) 中毒症状を発現する血中濃度：該当資料なし

VII-2. 薬物速度論的パラメータ

- (1) 吸収速度定数：該当資料なし
- (2) バイオアベイラビリティ：該当資料なし
- (3) 消失速度定数：該当資料なし
- (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) 血漿蛋白結合率：該当資料なし

VII-3. 吸収

該当資料なし

VII-4. 分布

- (1) 血液-脳関門通過性：該当資料なし
- (2) 胎児への移行性：該当資料なし
- (3) 乳汁中への移行性：該当資料なし
- (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：該当資料なし

VII-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：該当資料なし
- (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

VII-6. 排泄

- (1) 排泄部位：該当資料なし
- (2) 排泄率：該当資料なし
- (3) 排泄速度：該当資料なし

VII-7. 透析等による除去率

- (1) 腹膜透析：該当資料なし
- (2) 血液透析：該当資料なし
- (3) 直接血液灌流：該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

VIII-1. 警告内容とその理由

該当しない

VIII-2. 禁忌内容とその理由

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】
本剤および他のオキシコナゾール硝酸塩製剤に過敏な患者

VIII-3. 効能・効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

VIII-4. 用法・用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

VIII-5. 慎重投与内容とその理由

該当しない

VIII-6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

該当しない

VIII-7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

該当しない

(2) 併用注意とその理由

該当しない

VIII-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ため、文献等を参考にした。

(1) 重大な副作用

該当しない

(2) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 ^{注)}	発疹等
腔・外陰	発赤、刺激感、ひりひり感、そう痒感、疼痛等

注) このような場合には、使用を中止すること。

(2) 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

(3) 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

(4) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法：該当しない

VIII-9. 高齢者への投与

該当しない

VIII-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

妊娠 12 週未満の妊婦または妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ使用すること。[安全性は確立していない。]

VIII-11. 小児等への投与

該当しない

VIII-12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当しない

VIII-13. 過量投与

該当しない

VIII-14. 適用上及び薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

適応上の注意

(1) 本剤は腔内にもみ使用し、経口投与しないよう指導すること。

(2) 薬剤交付時

PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して使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、更には穿孔を起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)

VIII-15. その他の注意

取り扱い上の注意

小児の手のとどかない所に保管するよう指導すること。

VIII-16. その他

なし

IX. 非臨床試験に関する項目

IX-1. 一般薬理

該当資料なし

IX-2. 毒性

- (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. 取扱い上の注意等に関する項目

X-1. 有効期間又は使用期限

使用期限 3 年（外箱に表示の使用期限内に使用すること。）

X-2. 貯法・保存条件

室温保存、遮光・気密容器

X-3. 薬剤取扱い上の注意点

該当しない

X-4. 承認条件

特になし

X-5. 包装

オキコナール膈錠 100mg： 120 錠（PTP）

オキコナール膈錠 600mg： 30 錠（PTP）

X-6. 同一成分・同効薬

<同一成分薬>

オキナゾール膈錠 100mg、オキナゾール膈錠 600mg（田辺三菱）

<同効薬>

クロトリマゾール、イソコナゾール硝酸塩、ミコナゾール硝酸塩、エコナゾール硝酸塩

X-7. 国際誕生年月日

不明

X-8. 製造・輸入承認年月日及び承認番号

品 名	オキコナール膈錠 100mg	オキコナール膈錠 600mg
製造承認年月日	2008 年 2 月 28 日	
承認番号	22000AMX00173000	22000AMX00174000

X-9. 薬価基準収載年月

2008 年 6 月 20 日

X-10. 効能・効果追加、用法・用量変更追加等の年月日及びその内容

なし

X-11. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

なし

X-12. 再審査期間

なし

X-13. 長期投与の可否

該当しない

X-14. 厚生労働省薬価基準収載医薬品コード

オキコナール膈錠 100mg： 2529709H1054

オキコナール膈錠 600mg： 2529709H2050

X-15. 保険給付上の注意

本品は保険診療上の後発医薬品に該当する。

X I . 文献

X I -1. 引用文献

- 1) 日本薬局方外医薬品規格 2002
- 2) 富士製薬工業株式会社 社内資料 (安定性試験)
- 3) 医薬品要覧 第5版 (薬業時報社)
- 4) 平谷民雄 他 : CHEMOTHERAPY 32(9), 568-584 (1984)
- 5) 平谷民雄 他 : CHEMOTHERAPY 33(3), 215-226 (1985)

X I -2. その他の参考文献

なし

X II . 参考資料

X II -1. 主な外国での発売状況

該当しない

X III . 備考