

抗トリコモナス剤

フラジール[®]錠250mg

メトロニダゾール錠
Flagyl[®]

承認番号	22000AMX00666
薬価収載	2008年6月
販売開始	1961年11月
再評価結果	1976年10月
効能追加	2012年3月

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

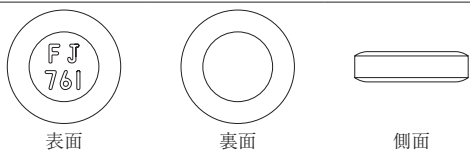
既往に本剤の成分に対する過敏症を起こした患者

【組成・性状】

1. 組成

販売名	フラジール錠250mg
有効成分	日局 メトロニダゾール
含量（1錠中）	250mg
添加物	酒石酸、ホウ酸、酒石酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム、コムギデンプン、メチルセルロース、タルク

2. 性状

販売名	フラジール錠250mg
性状・剤形	白色円形の錠剤で水によって発泡する。
外形	
大きさ	直径 約15.0mm 厚さ 約4.0mm
重量	約0.95g
識別コード	FJ761

【効能・効果】

1. トリコモナス膣炎

2. 細菌性膣症

<適応菌種>

本剤に感性のペプトストレプトコッカス属、バクテロイデス・フラジリス、プレボテラ・ビビア、モビルンカス属、ガードネラ・バジナリス

<適応症>

細菌性膣症

【用法・用量】

1. トリコモナス膣炎

通常、成人にはメトロニダゾールとして、1クールとして、1日1回250mgを10～14日間膣内に挿入する。

2. 細菌性膣症

通常、成人にはメトロニダゾールとして、1日1回250mgを7～10日間膣内に挿入する。

<用法・用量に関連する使用上の注意>

本剤の使用にあたっては、耐性菌の発現等を防ぐため、原則として感受性を確認し、疾病の治療上必要な最小限の期間の投与にとどめること。

【使用上の注意】

1. 副作用

トリコモナス膣炎に対する再評価結果における安全性評価対象例456例中、副作用は10例（2.2%）に認められた¹⁾。

種類\頻度	5%以上又は頻度不明	0.1～5%未満
過敏症 ^{注1)}		そう痒感、膣壁充血等の局所刺激、局所の発赤
生殖器	<i>Candida albicans</i> の出現	

注1：症状があらわれた場合には投与を中止すること。

2. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立されていない。[使用経験がない。]

※3. 適用上の注意

本剤はPTPシートから取り出して膣内にもみ使用するよう指導すること。

【薬物動態】

健康女性12例、妊娠初期女性16例、妊娠後期女性10例、骨盤内性器感染女性9例を対象として、1日1回メトロニダゾール錠250mg（1錠）を膣内に挿入して生物学的定量法により体内移行を検討した。本剤は局所集中度が高く血中濃度、尿中排泄としてみるべきほどの移行を示さなかった²⁾。

1. 吸収

2、4時間後に測定した血中濃度は、妊娠後期女性の1例の2時間間に2μg/mL以下が測定されただけで、その他は全く血中移行を認めなかった。

4時間後の健康女性10例の膣内残存率は70～95%（平均83.0%）であった。

2. 排泄

4時間後に測定した尿中濃度は、健康女性8例において0～3μg/mL（平均1.13μg/mL）であった。

【臨床成績】

トリコモナス膣炎に対する再評価結果における有効性評価対象例332例中、治癒率は97.9%（325例）であり、原虫再出現率は有効性評価対象例270例中、29.3%（79例）であった³⁾。

【薬効薬理】

1. 薬理作用

*Trichomonas vaginalis*に対し、抗原虫作用を示す⁴⁾。

2. 作用機序

抗原虫及び抗菌作用

メトロニダゾールは原虫又は菌体内の酸化還元系によって還元を受け、ニトロソ化合物（R-NO）に変化する。このR-NOが抗原虫作用及び抗菌作用を示す。また、反応の途中で生成したヒドロキシラジカルがDNAを切断し、DNAらせん構造の不安定化を招く^{5)～7)}。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般的名称：メトロニダゾール（JAN）[日局]

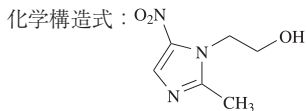
Metronidazole

化学名：2-(2-Methyl-5-nitro-1H-imidazol-1-yl)ethanol

分子式：C₆H₉N₃O₃

分子量：171.15

フラジール錠(2)



性状： 白色～微黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。
酢酸（100）に溶けやすく、エタノール（99.5）又はアセトンにやや溶けにくく、水に溶けにくい。
希塩酸に溶ける。
光によって黄褐色になる。

融点： 159～163℃

分配係数： 0.81 [pH7.4、1-オクタノール/緩衝液]

【包装】

※フラジール錠250mg：PTP60錠（6錠×10）

【主要文献】

- 1) 富士製薬工業株式会社集計；山田文夫ほか：産科と婦人科，1963, **38** (9), 1136を含む計17文献
- 2) 青河寛次ほか：産婦人科の世界，1976, **28** (3), 231
- 3) 富士製薬工業株式会社集計；青河寛次：ファルマシア，1971, **7** (3), 205を含む計11文献
- 4) Jennison, R. F. et al. : J. Clin. Pathol., 1961, **14**, 431
- 5) Osato, MS. : Curr. Pharm. Des., 2000, **6**, 1545
- 6) 山本達男ほか：日本臨牀，2005, **63** (S-11), 376
- 7) Upcroft, P. et al. : Clin. Microbiol. Rev., 2001, **14** (1), 150

【文献請求先】

富士製薬工業株式会社 富山工場 学術情報課
〒939-3515 富山県富山市水橋辻ヶ堂1515番地
(TEL) 076-478-0032
(FAX) 076-478-0336

