＊2026年10月改訂（第３版）
2025年３月改訂（第２版）

日本標準商品分類番号
872699

貯法：室温保存
有効期間：3年

承認番号	30500AMX00021
販売開始	2025年３月

がん性皮膚潰瘍臭改善薬
メトロニダゾール ゲル

メトロニダゾールゲル0.75%「マルイシ」

Metronidazole Gel 0.75% “Maruishi”

2．禁忌（次の患者には投与しないこと）
2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2.2 脳、脊髄に器質的疾患のある患者（脳・脊髄腫瘍の患者を除く）［中枢神経系症状があらわれることがある。］
2.3 妊娠3ヵ月以内の女性［9.5.1、16.3.2 参照］

3．組成・性状

3.1 組成

販売名	メトロニダゾールゲル0.75%「マルイシ」
有効成分	100g中　日局メトロニダゾール　0.75g
添加剤	エデト酸ナトリウム水和物、疎水化ヒドロキシプロピルメチルセルロース、プロピレングリコール、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸プロピル

3.2 製剤の性状

販売名	メトロニダゾールゲル0.75%「マルイシ」
性状	無色～微黄色で異物を含まない単一相、粘稠で均一なゲル剤である。

4．効能又は効果

がん性皮膚潰瘍部位の殺菌・臭気の軽減

6．用法及び用量

症状及び病巣の広さに応じて適量を使用する。潰瘍面を清拭後、1日1～2回ガーゼ等にのばして貼付するか、患部に直接塗布しその上をガーゼ等で保護する。

8．重要な基本的注意

8.1 本剤の使用中は、日光又は日焼けランプ等による紫外線曝露を避けること。本剤は紫外線照射により不活性体に転換され、効果が減弱することがある。
8.2 本剤の皮膚潰瘍部位への塗布により全身吸収が認められるため、塗布部位が広範囲の場合等には、経口用又は点滴静注用製剤の投与により認められる副作用（末梢神経障害、中枢神経障害、白血球減少、好中球減少など）が、血中濃度の上昇により発現するおそれがある。［16.1.1 参照］
8.3 本剤の長期の使用経験はないため、本剤を長期に使用する場合には、使用の継続を慎重に判断すること。［15.2.1 参照］

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 血液疾患のある患者
白血球減少、好中球減少があらわれることがある。

9.1.2 脳・脊髄腫瘍の患者
中枢神経系症状があらわれることがある。

＊9.1.3 コケイン症候群の患者
経口用又は点滴静注用製剤の投与により、重度の肝毒性又は急性肝不全が発現し死亡に至った症例が報告されている。

9.5 妊婦

9.5.1 妊娠3ヵ月以内の女性
使用しないこと。妊婦への経口投与により、胎盤関門を通過して胎児へ移行することが報告されている[1]。［2.3、16.3.2 参照］

9.5.2 妊娠3ヵ月を過ぎた女性
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。［16.3.2 参照］

9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。授乳婦への経口投与により、母体血漿中と同程度の濃度で母乳中に移行することが報告されている[2]。［16.3.3 参照］

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。

10．相互作用

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
アルコール	精神症状、腹部の疝痛、嘔吐、潮紅があらわれることがあるので、使用期間中は飲酒を避けること。	本剤はアルコールの代謝過程においてアルデヒド脱水素酵素を阻害し、血中アセトアルデヒド濃度を上昇させる。
リトナビル含有製剤（内用液）	ジスルフィラム-アルコール反応を起こすおそれがある。	リトナビル含有製剤（内用液）はエタノールを含有するので本剤により血中アセトアルデヒド濃度を上昇させる。
ジスルフィラム	精神症状（錯乱等）があらわれることがある。	不明
クマリン系抗凝血剤　ワルファリン等	ワルファリンの抗凝血作用を増強し、出血等があらわれることがある。	本剤はワルファリンの代謝を阻害し、その血中濃度を上昇させる。
リチウム	リチウムの血中濃度が上昇し、リチウム中毒があらわれることがある。	不明
5-フルオロウラシル	5-フルオロウラシルの血中濃度が上昇し、5-フルオロウラシルの作用が増強することがある。	発現機序の詳細は不明であるが、本剤が5-フルオロウラシルの全身クリアランスを低下させる。
ブスルファン	ブスルファンの作用が増強されることがある。	本剤はブスルファンの血中濃度を上昇させる。
シクロスポリン	シクロスポリンの作用が増強される可能性がある。	本剤はシクロスポリンの血中濃度を上昇させる。
フェノバルビタール	本剤の作用が減弱する可能性がある。	フェノバルビタールは本剤の代謝酵素を誘導し、その血中濃度を低下させる。

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使用を中止するなど適切な処置を行うこと。

11.2 その他の副作用

	5%以上	5%未満	頻度不明
皮膚	潰瘍部位からの出血（9.5%）	接触皮膚炎、乾燥、そう痒、つっぱり感、皮脂欠乏症	紅斑、皮膚不快感（皮膚灼熱感、皮膚疼痛、皮膚刺痛）、皮膚刺激、皮膚剥脱、顔面腫脹
神経系			末梢神経障害（四肢のしびれ、感覚鈍麻、錯感覚等）、味覚異常（金属味）
胃腸障害			悪心
＊過敏症			蕁麻疹、血管性浮腫

14．適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

刺激感を伴う皮膚症状が認められた場合は、使用回数を減らす又は一時的に本剤の使用を中止し、必要に応じ医師の指示を受けるよう患者に指導すること。

14.2 薬剤使用時の注意

ガーゼ等の交換時に患部を刺激することにより、潰瘍部位の血管が損傷し、出血を招くことがあるので、浸潤させる等本剤塗布部位の乾燥に注意すること。

15．その他の注意

15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 長期経口投与により、マウスでは肺腫瘍が[3),4)]、またラットでは乳房腫瘍の発生が報告されているが[5)]、ハムスターの生涯投与試験では腫瘍はみられていないとの報告がある[4)]。［8.3 参照］

15.2.2 経皮投与によるがん原性試験は実施していない。

16．薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 国内第Ⅲ相臨床試験

がん性皮膚潰瘍に伴う臭気を有する患者20例に1日最大30g（メトロニダゾールとして225mg）を7日間潰瘍部位に塗布後の平均最高血漿中濃度は852ng/mL（範囲：136～2872ng/mL）であり、血漿中トラフ濃度（平均値±標準偏差）は投与7日目で380±281ng/mL、14日目で510±565ng/mLであった[6)]。［8.2 参照］

16.1.2 全身暴露量試験

がん性皮膚潰瘍患者を対象に、ロゼックスゲル0.75%（標準製剤）1日最大30g（メトロニダゾールとして225mg）を7日間投与し、引き続いて同様にメトロニダゾールゲル0.75%「マルイシ」（本剤）1日最大30g（メトロニダゾールとして225mg）を7日間投与した。薬物動態解析対象集団17例における7日間投与後の平均最高血漿中濃度は、標準製剤で303.650ng/mL（範囲：5.881～1112.000ng/mL）、本剤で305.078ng/mL（範囲：5.175～871.000ng/mL）であった。また、最高血漿中濃度到達時間（中央値）は標準製剤で4.0時間、本剤で2.0時間であったが、投与2、4、6時間後の血漿中メトロニダゾール濃度はいずれの製剤もほぼ定常状態であった。被験者ごとの最高血漿中濃度の標準製剤に対する本剤の比は1前後であった。

本剤投与時の19例中1例（5.3%）に、乳腺炎の副作用が認められた[7)]。

16.2 吸収

経口剤に対する相対的バイオアベイラビリティは、41.2%であった[8)]（外国人データ）。

16.3 分布

16.3.1 組織分布

メトロニダゾールをラット[9)]及びウサギ[10)]に静脈内投与した後、又はマウス[11)]及びラット[12)]に経口投与した後の血中から組織への分布は速やかであり、排泄器官（胃腸管、腎臓及び膀胱）並びに肝臓への分布が高かった。投与24時間後に残存濃度が高かったのは、肝臓、消化管及び腎臓であった[9),11)]。

16.3.2 胎児への移行

分娩開始初期からメトロニダゾール内服錠200mgを3時間ごとに投与して、母子の血中濃度を測定したとき、胎盤関門を通過して胎児に移行することが認められた[1)]（外国人データ）。［2.3、9.5.1、9.5.2 参照］

16.3.3 母乳中への移行

平均年齢22.5歳の母親及び生後5日の新生児10例を選び、母親にメトロニダゾール内服錠200mgを経口投与し、4時間ごとに授乳して母乳中及び新生児の血中への移行を測定した。母乳中の平均濃度は4時間3.4μg/mL、8時間2.2μg/mL、12時間1.3μg/mLで母親の血中と同程度に移行したが、新生児の血中濃度は痕跡～0.4μg/mLと極めて微量であった（測定法：polarography）[2)]（外国人データ）。［9.6 参照］

16.4 代謝

主として肝臓で代謝される[13)]。

尿中に排泄されたニトロ基を含む代謝物中、未変化のメトロニダゾール及びそのグルクロン酸抱合体が30～40%を占め、1-（2-ヒドロキシエチル）-2-ヒドロキシメチル-5-ニトロイミダゾール及びそのグルクロン酸抱合体が主代謝物で40～50%を占めた[14)]（外国人データ）。

16.5 排泄

メトロニダゾールをラット[9)]及びウサギ[10)]に静脈内投与した後、又はマウス[14)]及びラット[15)]に経口投与した後の主要な排泄経路は尿中であり、ラットにおいてメトロニダゾール及び代謝物の腸肝循環は著明には認められなかった[15)]。

17．臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内第Ⅲ相臨床試験

がん性皮膚潰瘍に伴う臭気を有する患者を対象にメトロニダゾールゲル0.75% 1日最大30gを14日間投与した。その結果、改善率（「においがない」又は「においがあるが不快ではない」にまで改善した割合）は95.2%（21例中20例）であり、90%信頼区間（正確法）は79.3～99.8%であった。

安全性評価対象例21例中2例（9.5%）に潰瘍部位からの出血の副作用が認められた[6)]。

17.2 製造販売後調査等

17.2.1 国内使用成績調査

有効性解析対象症例において、最終観察時（メトロニダゾールゲル0.75%使用開始から最大3ヵ月後）のにおい改善率（医師の評価が「においがない」又は「においはあるが不快でない」となった症例の割合）は80.2%（203/253例）であった。

安全性解析対象症例301例中10例（3.3%）に副作用が認められた。その内訳は適用部位出血6例（2.0%）、適用部位疼痛3例（1.0%）、適用部位乾燥、滲出液が各1例（0.3%）であった[16)]。

18．薬効薬理

18.1 作用機序

メトロニダゾールは嫌気性条件下で原虫又は細菌内の酸化還元系によって還元を受け、ニトロソ化合物に変化する。このニトロソ化合物がDNAと結合してDNA合成を阻害し、また、反応途中で生成したヒドロキシルアミン付加体がDNA損傷を惹起して、抗原虫作用及び抗菌作用を示す[17),18)]。

18.2 抗菌作用

メトロニダゾールは、皮膚潰瘍部位において臭気物質（プトレシン、カダベリン）を産生する数種類のグラム陽性及びグラム陰性嫌気性菌に対して抗菌作用を発揮することによってがん性皮膚潰瘍に伴う臭気を軽減する[19)]。

18.3 生物学的同等性試験

メトロニダゾールゲル0.75%「マルイシ」とロゼックスゲル0.75%について、皮膚潰瘍部位における臭気の原因菌となる菌種を対象に*in vitro*試験として最小発育阻止濃度（MIC）を測定した。その結果、両製剤のMICは同等であり生物学的同等性が確認された[20)]。

19．有効成分に関する理化学的知見

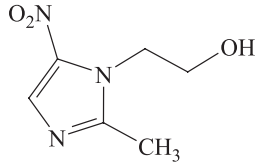
一般的名称：メトロニダゾール（Metronidazole）（JAN）

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

分子式：$C_6H_9N_3O_3$

分子量：171.15

化学構造式：



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。

20．取扱い上の注意

凍結をさせないこと。

22．包装

チューブ：50g×1、100g×1

23．主要文献

1）Gray M.S.：J. Obstet. Gynaecol. Br. Commonw., 1961；68（5）：723-729［J0610001］
2）Gray M.S., et al.：Br. J. Vener. Dis., 1961；37（4）：278-279［J0610002］
3）Rustia M., et al.：J. Natl. Cancer Inst., 1972；48（3）：721-729［J0720001］
4）Roe F.J.C., et al.：Surgery, 1983；93（1）：158-164［J0830001］
5）Rustia M., et al.：J. Natl. Cancer Inst., 1979；63（3）：863-868［J0790001］
6）Watanabe K., et al.：Support. Care Cancer, 2016；24（6）：2583-2590［J2160001］
7）社内資料：メトロニダゾールゲル0.75%「マルイシ」の安全性確認試験
8）海外第Ⅰ相臨床試験（1.CG.03.SUM.0443試験）（ロゼックスゲル0.75%：2014年12月26日承認、申請資料概要2.7.6.4）
9）Buttar H.S., et al.：Arch. Int. Pharmacodyn., 1980；245（1）：4-19［J0800001］
10）Buttar H.S.：J. Toxicol. Environ. Health, 1982；9（2）：305-316［J0820001］
11）Placidi G.F., et al.：Arch. Int. Pharmacodyn., 1970；188（1）：168-179［J0700001］
12）Buttar H.S., et al.：J. Pharm. Pharmacol., 1979；31（8）：542-544［J0790002］
13）代謝（ロゼックスゲル0.75%：2014年12月26日承認、申請資料概要2.5.3.3.3）
14）Stambaugh J.E., et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther., 1968；161（2）：373-381［J0680001］
15）Ings R.M.J., et al.：Xenobiotica., 1975；5（4）：223-235［J0750001］
16）製造販売後調査（ロゼックスゲル0.75%：2022年6月24日公表、再審査報告書）
17）Freeman C.D., et al.：Drugs, 1997；54（5）：679-708［J0970001］
18）Bendesky A., et al.：Mutat. Res., 2002；511（2）：133-144［J2020001］
19）Paul J.C., et al.：Ostomy Wound Manage., 2008；54（3）：18-27［J2080001］
20）社内資料：メトロニダゾールゲル0.75%「マルイシ」の生物学的同等性試験

24．文献請求先及び問い合わせ先

丸石製薬株式会社　学術情報部
〒538-0042　大阪市鶴見区今津中2-4-2
TEL. 0120-014-561

26．製造販売業者等

26.1 製造販売元

㊧丸石製薬株式会社
大阪市鶴見区今津中2-4-2