

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 2018（2019 年更新版）に準拠して作成

前立腺癌治療剤（CYP17 阻害剤）

アビラテロン酢酸エステル錠

アビラテロン酢酸エステル錠250mg「JG」

Abiraterone Acetate Tablets

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	劇薬、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	1 錠中 アビラテロン酢酸エステル 250.00mg 含有
一般名	和名：アビラテロン酢酸エステル（JAN） 洋名：Abiraterone Acetate（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・ 販売開始年月日	製造販売承認年月日：2023 年 8 月 15 日 薬価基準収載年月日：薬価基準未収載 販売開始年月日：
製造販売（輸入）・ 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 TEL 0120 - 893 - 170 FAX 0120 - 893 - 172 医療関係者向けホームページ： https://medical.nihon-generic.co.jp/

本 IF は 2025 年 8 月作成の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

(2020 年 4 月改訂)

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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I F と略す）が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第 2 小委員会が I F の位置付け、I F 記載様式、I F 記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第 3 小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会が I F 記載要領の改訂を行ってきた。

I F 記載要領 2008 以降、I F は P D F 等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加した I F が速やかに提供されることとなった。最新版の I F は、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<https://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品の I F の情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々の I F が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、「I F 記載要領 2018」が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. I F とは

I F は「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

I F に記載する項目配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等は I F 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 I F は、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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。

I F の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I F の利用にあたって

電子媒体の I F は、PMDA の医療用医薬品情報検索のページ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 I F を作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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利用者自らが内容を充実させ、I F 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、I F が改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMDA の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、
「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには
十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

I Fを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いただきたい。I Fは
日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正
使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性
及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、製薬協コード・オ
ブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承
認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うこ
とは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自ら
がI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得ら
れる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは
薬剤師の本務であり、I Fを利用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目次

I. 概要に関する項目	1	8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	8
1. 開発の経緯	1	9. 溶出性	9
2. 製品の治療学的特性	1	10. 容器・包装	11
3. 製品の製剤学的特性	1	(1)注意が必要な容器・包装、外観が特殊な 容器・包装に関する情報	11
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	(2)包装	11
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(3)予備容量	11
(1)承認条件	1	(4)容器の材質	11
(2)流通・使用上の制限事項	1	11. 別途提供される資材類	11
6. RMPの概要	1	12. その他	11
II. 名称に関する項目	2	V. 治療に関する項目	12
1. 販売名	2	1. 効能又は効果	12
(1)和名	2	2. 効能又は効果に関連する注意	12
(2)洋名	2	3. 用法及び用量	12
(3)名称の由来	2	(1)用法及び用量の解説	12
2. 一般名	2	(2)用法及び用量の設定経緯・根拠	12
(1)和名（命名法）	2	4. 用法及び用量に関連する注意	12
(2)洋名（命名法）	2	5. 臨床成績	13
(3)ステム（stem）	2	(1)臨床データパッケージ	13
3. 構造式又は示性式	2	(2)臨床薬理試験	13
4. 分子式及び分子量	2	(3)用量反応探索試験	13
5. 化学名（命名法）又は本質	2	(4)検証的試験	13
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	1)有効性検証試験	13
III. 有効成分に関する項目	3	2)安全性試験	16
1. 物理化学的性質	3	(5)患者・病態別試験	16
(1)外観・性状	3	(6)治療的使用	16
(2)溶解性	3	1)使用成績調査（一般使用成績調査、特 定使用成績調査、使用成績比較調査）、 製造販売後データベース調査、製造販 売後臨床試験の内容	16
(3)吸湿性	3	2)承認条件として実施予定の内容又は実 施した調査・試験の概要	16
(4)融点（分解点）、沸点、凝固点	3	(7)その他	16
(5)酸塩基解離定数	3	VI. 薬効薬理に関する項目	17
(6)分配係数	3	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	17
(7)その他の主な示性値	3	2. 薬理作用	17
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	(1)作用部位・作用機序	17
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	(2)薬効を裏付ける試験成績	17
IV. 製剤に関する項目	4	(3)作用発現時間・持続時間	17
1. 剤形	4	VII. 薬物動態に関する項目	18
(1)剤形の区別	4	1. 血中濃度の推移	18
(2)製剤の外観及び性状	4	(1)治療上有効な血中濃度	18
(3)識別コード	4	(2)臨床試験で確認された血中濃度	18
(4)製剤の物性	4	(3)中毒域	21
(5)その他	4	(4)食事・併用薬の影響	21
2. 製剤の組成	4	2. 薬物速度論的パラメータ	22
(1)有効成分（活性成分）の含量及び添加剤	4	(1)解析方法	22
(2)電解質等の濃度	4	(2)吸収速度定数	22
(3)熱量	4	(3)消失速度定数	22
3. 添付溶解液の組成及び容量	4		
4. 力価	4		
5. 混入する可能性のある夾雑物	5		
6. 製剤の各種条件下における安定性	5		
7. 調製法及び溶解後の安定性	8		

(4)クリアランス	22
(5)分布容積	22
(6)その他	22
3. 母集団（ポピュレーション）解析	22
(1)解析方法	22
(2)パラメータ変動要因	22
4. 吸収	22
5. 分布	22
(1)血液－脳関門通過性	22
(2)血液－胎盤関門通過性	22
(3)乳汁への移行性	22
(4)髄液への移行性	22
(5)その他の組織への移行性	23
(6)血漿蛋白結合率	23
6. 代謝	23
(1)代謝部位及び代謝経路	23
(2)代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率	23
(3)初回通過効果の有無及びその割合	23
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	23
7. 排泄	23
8. トランスポーターに関する情報	23
9. 透析等による除去率	23
10. 特定の背景を有する患者	23
11. その他	24
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	25
1. 警告内容とその理由	25
2. 禁忌内容とその理由	25
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	25
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	25
5. 重要な基本的注意とその理由	25
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	25
(1)合併症・既往歴等のある患者	25
(2)腎機能障害患者	26
(3)肝機能障害患者	26
(4)生殖能を有する者	26
(5)妊婦	26
(6)授乳婦	26
(7)小児等	26
(8)高齢者	26
7. 相互作用	26
(1)併用禁忌とその理由	26
(2)併用注意とその理由	26
8. 副作用	27
(1)重大な副作用と初期症状	27
(2)その他の副作用	28
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	28
10. 過量投与	29
11. 適用上の注意	29
12. その他の注意	29

(1)臨床使用に基づく情報	29
(2)非臨床試験に基づく情報	29
IX. 非臨床試験に関する項目	30
1. 薬理試験	30
(1)薬効薬理試験	30
(2)安全性薬理試験	30
(3)その他の薬理試験	30
2. 毒性試験	30
(1)単回投与毒性試験	30
(2)反復投与毒性試験	30
(3)遺伝毒性試験	30
(4)がん原性試験	30
(5)生殖発生毒性試験	30
(6)局所刺激性試験	30
(7)その他の特殊毒性	30
X. 管理的事項に関する項目	31
1. 規制区分	31
2. 有効期間	31
3. 包装状態での貯法	31
4. 取扱い上の注意	31
5. 患者向け資料	31
6. 同一成分・同効薬	31
7. 国際誕生年月日	31
8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	31
9. 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	31
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	31
11. 再審査期間	31
12. 投薬期間制限に関する情報	32
13. 各種コード	32
14. 保険給付上の注意	32
X I. 文献	33
1. 引用文献	33
2. その他の参考文献	34
X II. 参考資料	35
1. 主な外国での発売状況	35
2. 海外における臨床支援情報	35
X III. 備考	36
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	36
(1)粉碎	36
(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	37
2. その他の関連資料	38

略語表

略語	略語内容
ALP	アルカリホスファターゼ (Alkaline Phosphatase)
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ (Alanine aminotransferase)
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (Aspartate aminotransferase)
AUC	血漿中濃度－時間曲線下面積 (Area under the plasma concentration-time curve)
AUC ₂₄	投与 24 時間後までの AUC (AUC from zero to 24 hours)
AUC ₀₋₇₂	投与 72 時間後までの AUC (AUC from zero to 72 hours)
AUC _∞	無限大時間までの AUC (AUC from zero to infinity)
AUC _{last}	最終定量時点までの AUC (AUC from zero to last)
CK	クレアチンキナーゼ (Creatine kinase)
C _{max}	最高血漿中濃度 (Maximum plasma concentration)
CYP	チトクローム P450 (Cytochrome P450)
kel	消失速度定数 (Elimination rate constant)
LDH	乳酸脱水素酵素 (Lactate dehydrogenase)
OATP	有機アニオントランスポーター (Organic anion transporting polypeptide)
OS	全生存期間 (Overall survival)
P-gp	P 糖タンパク質 (P-glycoprotein)
PSA	前立腺特異抗原 (Prostate specific antigen)
RH	相対湿度 (Relative humidity)
rPFS	画像判定による無増悪生存期間 (Radiographic progression free survival)
S.D.	標準偏差 (Standard deviation)
T _{1/2}	消失半減期 (Elimination half-life)
T _{max}	最高血漿中濃度到達時間 (Time to maximum plasma concentration)

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「JG」はアビラテロン酢酸エステルを含有する前立腺癌治療剤（CYP17 阻害剤）である。

本邦でアビラテロン酢酸エステル製剤は 2014 年に発売されている。

本剤は日本ジェネリック株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について（平成 26 年 11 月 21 日 薬食発 1121 第 2 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、2023 年 8 月に製造販売承認を取得した。

2. 製品の治療学的特性

重大な副作用として、心障害、劇症肝炎、肝不全、肝機能障害、低カリウム血症、血小板減少、横紋筋融解症が報告されている。（「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）」に関する項目 - 8. 副作用、（1）重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

錠剤本体の両面に成分名（アビラテロン）、含量及び屋号を印字し、識別性を向上させている。（「Ⅳ. 製剤に関する項目 - 1. 剤形、（2）製剤の外観及び性状」の項参照）

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル・参照先
RMP	—	準備中
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	—	準備中
最適使用推進ガイドライン	無	—
保険適用上の留意事項通知	無	—

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

（1）承認条件

医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

（2）流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

準備中

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

アビラテロン酢酸エステル錠 250mg 「JG」

(2) 洋名

Abiraterone Acetate Tablets 250mg “JG”

(3) 名称の由来

「一般的名称」＋「剤形」＋「含量」＋「屋号」より命名

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号)に基づく〕

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

アビラテロン酢酸エステル (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

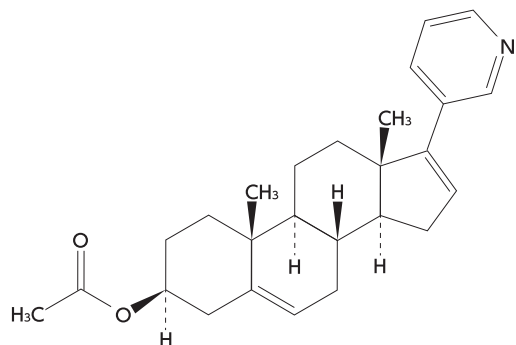
Abiraterone Acetate (JAN)

abiraterone (INN)

(3) ステム (s t e m)

抗アンドロゲン剤：-terone

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₆H₃₃NO₂

分子量：391.55

5. 化学名 (命名法) 又は本質

17-(Pyridin-3-yl)androst-5,16-dien-3 β -yl acetate (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

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、アセトニトリルにやや溶けにくく、水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

該当資料なし

(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

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、定量法

有効成分の確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観及び性状

販 売 名	アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「JG」		
色 ・ 剤 形	やわらかい黄みの赤色のフィルムコーティング錠		
外 形	表面	裏面	側面
			
大きさ (mm)	長径：16.1 短径：9.6 厚さ：6.5		
重 量 (mg)	736		

(3) 識別コード

錠剤本体に記載：アビラテロン 250 JG

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

有効成分（活性成分）の含量

1 錠中 アビラテロン酢酸エステル 250.00mg 含有

添加剤

乳糖水和物、結晶セルロース、クロスカルメロースナトリウム、ポビドン、ラウリル硫酸ナトリウム、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、ポリビニルアルコール（部分けん化物）、ヒドロキシプロピルセルロース、酸化チタン、タルク、黄色三二酸化鉄、三二酸化鉄、カルナウバロウ

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

◎加速試験¹⁾

包装形態：PTP/アルミピロー包装（脱酸素剤入り）

保存条件：40±1℃/75±5%RH

保存期間：6 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、純度試験、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	純度試験	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	適合	100.1
1 ヶ月後	適合	—	適合	—	適合	99.8
3 ヶ月後	適合	—	適合	—	適合	99.0
6 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	98.6

(1) やわらかい黄みの赤色のフィルムコーティング錠である。

(2) 液体クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液の主ピークの保持時間は等しい。また、それらのピークの吸収スペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

(3) 類縁物質：アビラテロン酢酸エステルに対する相対保持時間約 0.58 の類縁物質 A のピークの量は 0.20%以下であり、相対保持時間約 0.55 の類縁物質 B のピークの量は 0.25%以下であり、相対保持時間約 0.72 の類縁物質 C のピークの量は 0.40%以下であり、相対保持時間約 0.78 の類縁物質 D のピークの量は 0.35%以下であり、アビラテロン酢酸エステル及び上記以外のピークの量は、それぞれ 0.20%以下である。また、試料溶液のアビラテロン酢酸エステル以外のピークの合計量は 2.0%以下である。

(4) 含量均一性試験：判定値が 15.0%を超えない。

(5) 45 分間、72%以上（ラウリル硫酸ナトリウム 1.0g に pH4.0 の薄めた McIlvaine 緩衝液を加えて 1000mL とした液 900mL、パドル法（シンカー使用）、50rpm）

(6) 表示量の 95.0～105.0%

◎長期保存試験²⁾

包装形態：PTP/アルミピロー包装（脱酸素剤入り）

保存条件：25±2℃/60±5%RH

保存期間：24 ヶ月

試験項目：性状、確認試験、純度試験、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	純度試験	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	適合	100.1
6 ヶ月後	適合	—	適合	—	適合	99.3
12 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	99.5
24 ヶ月後	適合	—	適合	—	適合	99.1
36 ヶ月後	適合	適合	適合	適合	適合	99.1

(1) やわらかい黄みの赤色のフィルムコーティング錠である。

(2) 液体クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液の主ピークの保持時間は等しい。また、それらのピークの吸収スペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

(3) 類縁物質：アビラテロン酢酸エステルに対する相対保持時間約 0.58 の類縁物質 A のピークの量は 0.20%以下であり、相対保持時間約 0.55 の類縁物質 B のピークの量は 0.25%以下であり、相対保持時間約 0.72 の類縁物質 C のピークの量は 0.40%以下であり、相対保持時間約 0.78 の類縁物質 D のピークの量は 0.35%以下であり、アビラテロン酢酸エステル及び上記以外のピークの量は、それぞれ 0.20%以下である。また、試料溶液のアビラテロン酢酸エステル以外のピークの合計量は 2.0%以下である。

(4) 含量均一性試験：判定値が 15.0%を超えない。

(5) 45 分間、72%以上（ラウリル硫酸ナトリウム 1.0g に pH4.0 の薄めた McIlvaine 緩衝液を加えて 1000mL とした液 900mL、パドル法（シンカー使用）、50rpm）

(6) 表示量の 95.0～105.0%

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）及び長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、24 か月）の結果、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。また、その後の長期保存試験の結果、3 年間安定であった。

◎アルミピロー開封後の安定性試験³⁾

包装形態：PTP シート

試験条件：①温度に対する安定性試験：40±2℃、3 ヶ月（遮光）

②湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、3 ヶ月（遮光）

③光に対する安定性試験：総照度 120 万 lx・hr/25℃/湿度なりゆき（4000lx）

試験項目：性状、純度試験、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目		性状	純度試験	溶出試験	定量試験 (%)	硬度 (N)
規格		(1)	(2)	(3)	(4)	(5)
試験開始時		適合	適合	適合	101.2	204
①温度	3 ヶ月後	適合	適合	適合	99.1	203
②湿度	3 ヶ月後	適合	適合	適合	99.9	165
③光	120 万 lx・hr	適合	適合	適合	100.3	200

(1) やわらかい黄みの赤色のフィルムコーティング錠である。

(2) 類縁物質：アピラテロン酢酸エステルに対する相対保持時間約 0.58 の類縁物質 A のピークの量は 0.20%以下であり、相対保持時間約 0.55 の類縁物質 B のピークの量は 0.25%以下であり、相対保持時間約 0.72 の類縁物質 C のピークの量は 0.40%以下であり、相対保持時間約 0.78 の類縁物質 D のピークの量は 0.35%以下であり、アピラテロン酢酸エステル及び上記以外のピークの量は、それぞれ 0.20%以下である。また、試料溶液のアピラテロン酢酸エステル以外のピークの合計量は 2.0%以下である。

(3) 45 分間、72%以上（ラウリル硫酸ナトリウム 1.0g に pH4.0 の薄めた McIlvaine 緩衝液を加えて 1000mL とした液 900mL、パドル法（シンカー使用）、50rpm）

(4) 表示量の 95.0～105.0%

(5) 参考値

◎無包装状態での安定性試験⁴⁾

試験条件：①温度に対する安定性試験：40±2℃、3 ヶ月（遮光・気密容器）

②湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%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/25℃/湿度なりゆき（4000lx・シヤール+ラップ（フタ））

試験項目：性状、純度試験、溶出試験、定量試験、硬度

試験項目		性状	純度試験 (%)					類縁物質の合計
			類縁物質 A	類縁物質 B	類縁物質 C	類縁物質 D	その他の類縁物質	
規格		(1)	(2)					
試験開始時		適合	0.04	検出限界未満	0.04	検出限界未満	定量限界未満	0.08
①温度	2 ヶ月後	適合	0.14	0.03	0.39	0.25	0.03	0.84
	3 ヶ月後	適合	0.15	0.03	0.49 (不適合)	0.37 (不適合)	0.04	1.12
②湿度	3 ヶ月後	適合	0.06	検出限界未満	0.08	0.07	0.03	0.24
③光	120 万 lx・hr	適合	0.05	検出限界未満	0.04	検出限界未満	定量限界未満	0.09

試験項目		溶出試験	定量試験 (%)	硬度 (N)
規格		(3)	(4)	(5)
試験開始時		適合	101.2	204
①温度	2 ヶ月後	適合	99.2	208
	3 ヶ月後	適合	98.3	205
②湿度	3 ヶ月後	適合	100.0	150
③光	120 万 lx・hr	適合	99.8	201

- (1) やわらかい黄みの赤色のフィルムコーティング錠である。
- (2) 類縁物質：アピラテロン酢酸エステルに対する相対保持時間約 0.58 の類縁物質 A のピークの量は 0.20%以下であり、相対保持時間約 0.55 の類縁物質 B のピークの量は 0.25%以下であり、相対保持時間約 0.72 の類縁物質 C のピークの量は 0.40%以下であり、相対保持時間約 0.78 の類縁物質 D のピークの量は 0.35%以下であり、アピラテロン酢酸エステル及び上記以外のピークの量は、それぞれ 0.20%以下である。また、試料溶液のアピラテロン酢酸エステル以外のピークの合計量は 2.0%以下である。
- (3) 45 分間、72%以上（ラウリル硫酸ナトリウム 1.0g に pH4.0 の薄めた McIlvaine 緩衝液を加えて 1000mL とした液 900mL、パドル法（シンカー使用）、50rpm）
- (4) 表示量の 95.0～105.0%
- (5) 参考値：下記答申では、硬度変化が 30%以上で「変化あり（規格内）」、かつ硬度が 2.0kg 重（19.6N）未満の場合、「変化あり（規格外）」とされている。

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。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

9. 溶出性

【溶出挙動の類似性】⁵⁾

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について（令和2年3月19日 薬生薬審発 0319 第1号）」に従う。

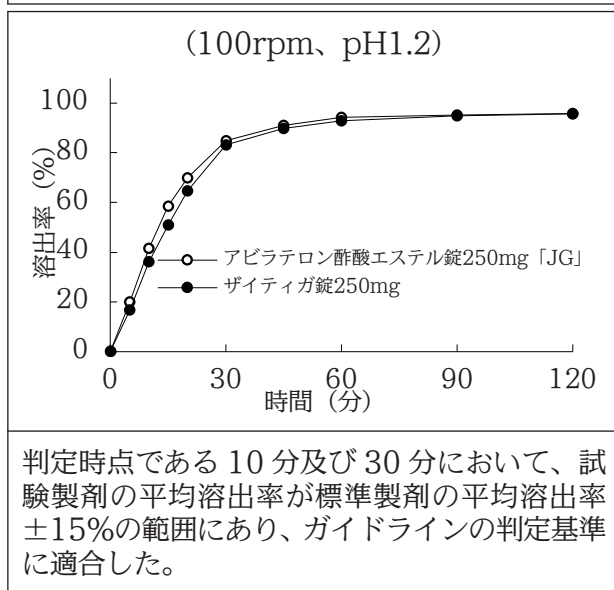
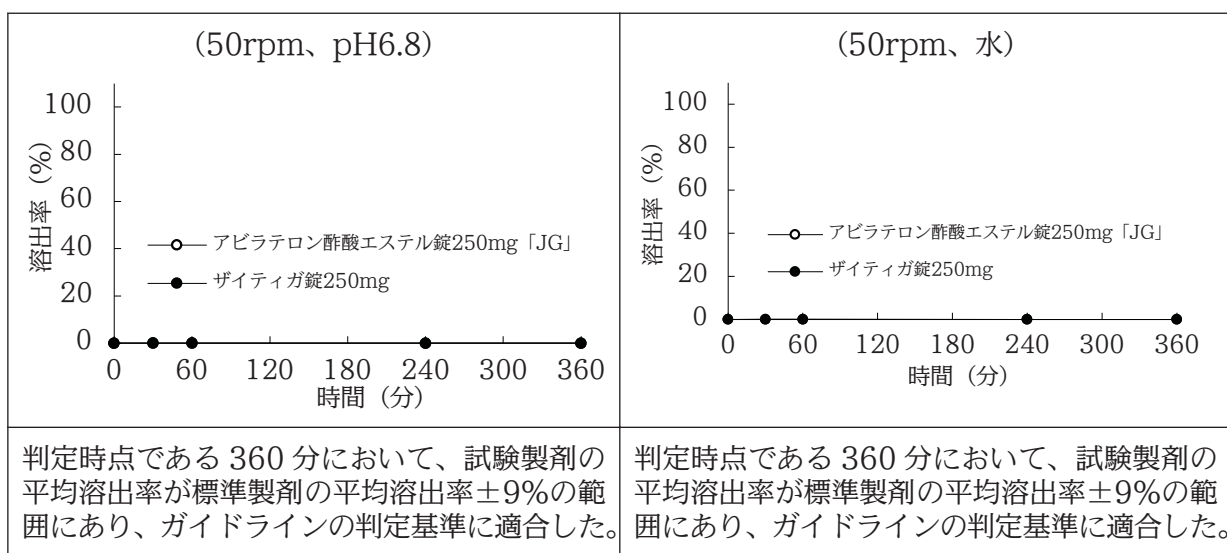
試験方法	日本薬局方　一般試験法溶出試験法（パドル法）			
試験条件	回転数/試験液	75rpm	pH1.2	日本薬局方　溶出試験第 1 液
		50rpm	pH3.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	日本薬局方　溶出試験第 2 液
			水	日本薬局方　精製水
		100rpm	pH1.2	薄めた McIlvaine の緩衝液
	試験液量：900mL　　　試験回数：12 ベッセル			
分析法	液体クロマトグラフィー			

・判定基準

回転数 (rpm)	試験液	判定基準
75	pH1.2	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が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値は 42 以上である。
50	pH3.0	規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 9\%$ の範囲にある。
	pH6.8	
	水	
100	pH1.2	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が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値は 42 以上である。

・試験結果

(75rpm、pH1.2) アピラテロン酢酸エステル錠250mg「JG」 ザイティガ錠250mg	(50rpm、pH3.0) アピラテロン酢酸エステル錠250mg「JG」 ザイティガ錠250mg
判定時点である 15 分及び 45 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 $\pm 15\%$ の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。	判定時点である 360 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 $\pm 9\%$ の範囲にあり、ガイドラインの判定基準に適合した。



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（ザイティガ錠 250mg）	試験製剤（アビラテロン酢酸 エステル錠 250mg「JG」）	
75	pH1.2	15	36.0	35.0	適合
		45	87.5	85.7	
50	pH3.0	360	1.1	0.3	適合
	pH6.8	360	0.0	0.0	適合
	水	360	0.0	0.0	適合
100	pH1.2	10	36.1	41.5	適合
		30	83.1	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。

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

56 錠 [8 錠 (PTP) ×7、脱酸素剤入り]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

ポリ塩化ビニルフィルム/アルミニウム箔 (PTP)、アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム (ピロー)、脱酸素剤、紙箱

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

○去勢抵抗性前立腺癌

○内分泌療法未治療のハイリスクの予後因子を有する前立腺癌

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能又は効果に関連する注意

ハイリスクの予後因子を有する患者の定義等について、「17.臨床成績」の項の内容を熟知し、本剤の有効性及び安全性を十分に理解した上で適応患者の選択を行うこと。[17.1.1-17.1.5 参照]

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

プレドニゾロンとの併用において、通常、成人にはアビラテロン酢酸エステルとして1日1回1,000mgを空腹時に経口投与する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 本剤は食事の影響により C_{max} 及び AUC が上昇するため、食事の1時間前から食後2時間までの間の服用は避けること。[16.2.1 参照]

7.2 プレドニゾロンの投与に際しては、「17.臨床成績」の項の内容を熟知し、投与すること。[17.1.1-17.1.5 参照]

7.3 本剤投与中に肝機能検査値の上昇が認められた場合は、以下の基準を参考に、休薬、減量又は中止すること。[8.2、11.1.2 参照]

検査項目	用法・用量変更の目安
ALT、AST 値 > 施設正常値上限の5倍 又は ビリルビン値 > 施設正常値上限の3倍	検査値が投与前値若しくはALT、AST 値が施設正常値上限の2.5倍以下かつビリルビン値が施設正常値上限の1.5倍以下に回復するまで休薬する。回復後は750mgに減量して投与を再開する。 肝機能検査値異常が再発した場合、検査値が投与前値若しくはALT、AST 値が施設正常値上限の2.5倍以下かつビリルビン値が施設正常値上限の1.5倍以下に回復するまで休薬する。回復後は500mgに減量して投与を再開する。 検査値が再度悪化した場合は投与を中止する。
ALT、AST 値 > 施設正常値上限の20倍 又は ビリルビン値 > 施設正常値上限の10倍	投与を中止する。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

〈去勢抵抗性前立腺癌〉

海外第Ⅲ相臨床試験（COU-AA-302 試験）

無症候性又は軽度の症状^{注1)}を伴う化学療法歴のない転移性去勢抵抗性前立腺癌患者^{注2)}を対象に、プレドニゾン^{注3)} 5mg の1日2回経口投与との併用下で、プラセボを対照として、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を1日1回食事の1時間以上前又は食事の2時間以上後に連日経口投与した（有効性解析対象例は 1,088 例）。主要評価項目は、画像判定（中央判定）による無増悪生存期間（radiographic progression free survival, rPFS）及び全生存期間（OS）と設定された。rPFS の中央値は、アビラテロン酢酸エステル群では推定不能、プラセボ群では 8.3 カ月であり、アビラテロン酢酸エステル群のプラセボ群に対する優越性が示された（ハザード比 0.425、95%信頼区間：0.347-0.522、p 値<0.0001、層別ログランク検定）。また、OS に関する中間解析（目標イベント数である 773 イベントの 43%のイベントが発生した時点）の結果、中央値は、アビラテロン酢酸エステル群では推定不能、プラセボ群では 27.2 カ月であった（ハザード比 0.752、95%信頼区間：0.606-0.934、p 値=0.0097、層別ログランク検定）⁶⁾。

注 1) Brief Pain Inventory-Short Form (BPI-SF) の項目 3 のスコアが 0～1（無症候性）又は 2～3（軽度の症状）

注 2) 肝臓等の実質臓器への転移を有する患者は除外された。

注 3) 国内未承認

安全性評価対象例 542 例中 402 例（74.2%）に副作用が認められた。主なものは、疲労 124 例（22.9%）、ほてり 92 例（17.0%）、低カリウム血症 78 例（14.4%）、高血圧 69 例（12.7%）、末梢性浮腫 66 例（12.2%）であった。

海外第Ⅲ相臨床試験（COU-AA-301 試験）

2 レジメン以内で、かつ少なくとも一つはドセタキセル水和物による化学療法歴を有する転移性去勢抵抗性前立腺癌患者を対象に、プレドニゾン^{注)} 5mg の1日2回経口投与との併用下で、プラセボを対照として、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を1日1回食事の1時間以上前又は食事の2時間以上後に連日経口投与した（有効性解析対象例は 1,195 例）。主要評価項目である OS の中間解析（目標イベント数である 797 イベントの 69%のイベントが発生した時点）の結果、中央値は、アビラテロン酢酸エステル群で 14.8 カ月、プラセボ群で 10.9 カ月であり、アビラテロン酢酸エステル群のプラセボ群に対する優越性が示された（ハザード比 0.646、95%信頼区間：0.543-0.768、p 値<0.0001、層別ログランク検定）⁷⁾。

注)国内未承認

安全性評価対象例 791 例中 589 例 (74.5%) に副作用が認められた。主なものは、疲労 204 例 (25.8%)、悪心 129 例 (16.3%)、低カリウム血症 110 例 (13.9%)、ほてり 110 例 (13.9%)、末梢性浮腫 94 例 (11.9%) であった。

国内第Ⅱ相臨床試験 (JPN-201 試験)

化学療法歴のない転移性去勢抵抗性前立腺癌患者を対象に、プレドニゾロン 5mg の 1 日 2 回経口投与との併用下で、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を 1 日 1 回、食事の 1 時間以上前又は食事の 2 時間以上後に連日経口投与した。治療開始 12 週時点までの PSA 奏効率 (PSA 値がベースラインから 50%以上低下し、その時点から 4 週間以降の測定においても PSA 値の 50%以上低下が確認された患者の割合) (12 週時の PSA 奏効率) は 60.4% (29/48 例、90%信頼区間: 47.5%-72.3%) であった⁸⁾。

安全性評価対象例 48 例中 37 例 (77.1%) に副作用が認められた。主なものは、糖尿病 11 例 (22.9%)、ALT 増加 9 例 (18.8%)、AST 増加 9 例 (18.8%)、低カリウム血症 8 例 (16.7%)、高脂血症 6 例 (12.5%)、高血圧 5 例 (10.4%) であった。

国内第Ⅱ相臨床試験 (JPN-202 試験)

ドセタキセル水和物による化学療法歴を有する転移性去勢抵抗性前立腺癌患者を対象に、プレドニゾロン 5mg の 1 日 2 回経口投与との併用下で、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を 1 日 1 回、食事の 1 時間以上前又は食事の 2 時間以上後に連日経口投与した。12 週時の PSA 奏効率は 28.3% (13/46 例、90%信頼区間: 17.6%-41.1%) であり、90%信頼区間の下限値は閾値奏効率 (20%) を下回った⁹⁾。

安全性評価対象例 47 例中 28 例 (59.6%) に副作用が認められた。主なものは、糖尿病 6 例 (12.8%)、低カリウム血症 5 例 (10.6%)、高脂血症 5 例 (10.6%)、AST 増加 5 例 (10.6%)、高血圧 4 例 (8.5%) であった。

〈内分泌療法未治療のハイリスクの予後因子を有する前立腺癌〉

国際共同第Ⅲ相試験 (PCR3011 試験)

内分泌療法未治療^{注1)}のハイリスクの予後因子を有する^{注2)}前立腺癌患者を対象に、アビラテロン酢酸エステル及びプレドニゾン^{注3)}の併用投与 (アビラテロン酢酸エステル群) とプラセボ^{注4)} (プラセボ群) を比較する二重盲検ランダム化試験を実施した (有効性解析対象例 1,199 例、日本人 70 例を含む)。アビラテロン酢酸エステル群では、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を 1 日 1 回食事の 1 時間以上前又は食事の 2 時間以上後に連日経口投与し、プレドニゾン 5mg を 1 日 1 回連日経口投与^{注5)}した。主要評価項目は、OS 及び rPFS と設定された。OS の中間解析 (目標イベント数である 852 イベントの 48%のイベントが発生した時点) の結果、中央値は、アビラテロン酢酸エステル群では推定不能、プラセボ群では 34.73 カ月であり、アビラテロン酢酸エステル群のプラセボ群に対する優越性が示された (ハザード比 0.621、95%信頼区間: 0.509-0.756、p 値<0.0001、層別ログランク検定)。また、rPFS の解析の結果、中央値は、アビラテロン酢酸エステル群では 33.02 カ月、プラセボ群では 14.78 カ月であり、アビラテロン酢酸エステル群のプラセボ群に対する優越性が示された (ハザード比 0.466、95%信頼区間: 0.394-0.550、p 値<0.0001、層別ログランク検定)。

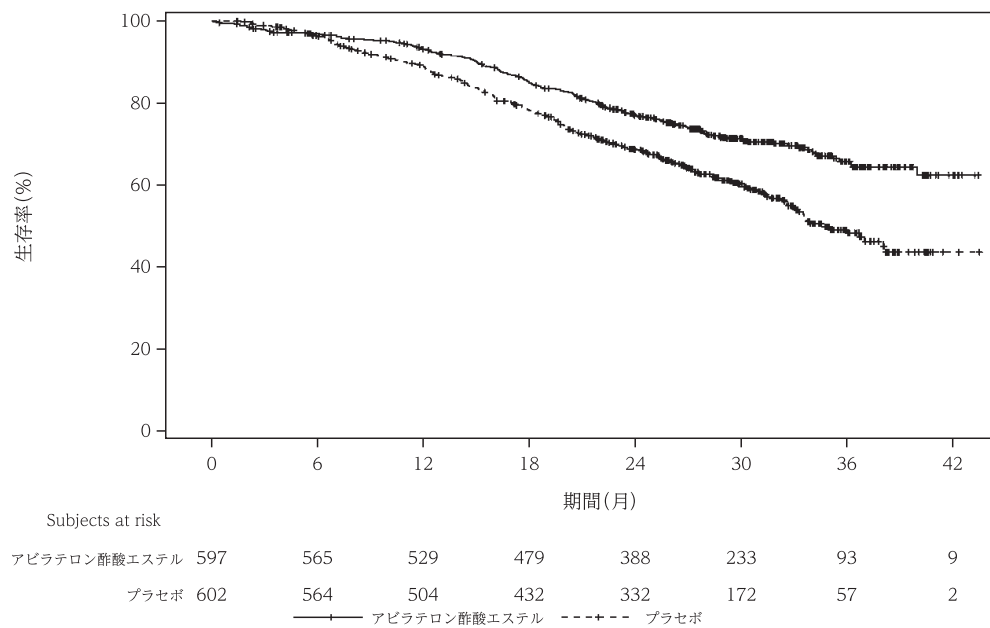
注 1) 治験薬投与開始前 3 カ月以内のアンドロゲン除去療法の施行は許容された。

注 2) 3 つの予後因子 ((1) Gleason スコアが 8 以上、(2) 骨スキャンで 3 カ所以上の骨病変あり、(3) 内臓転移あり (リンパ節転移を除く)) のうち、2 つ以上を有する。

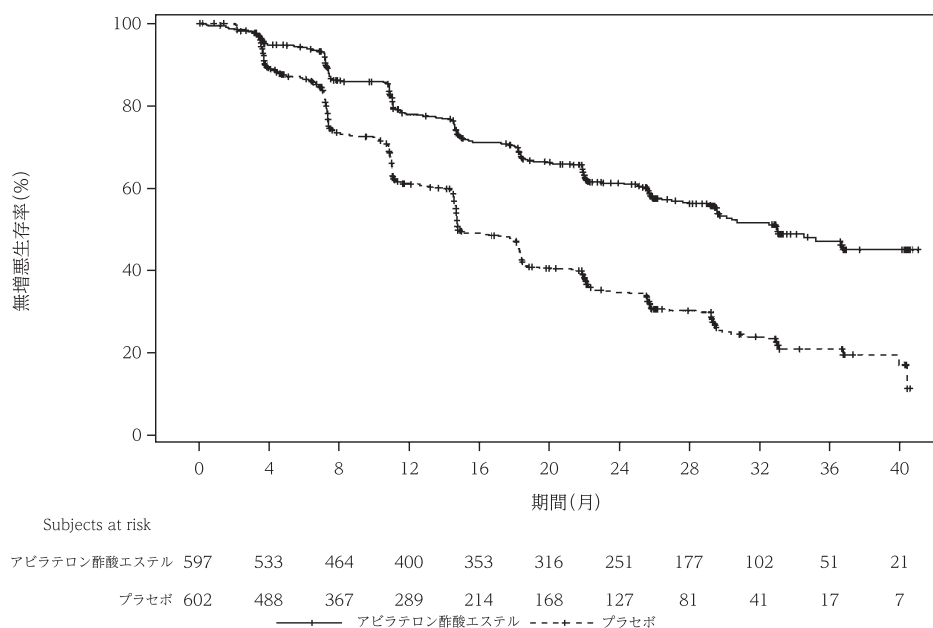
注 3) 国内未承認

注 4) アビラテロン酢酸エステル プラセボ及びプレドニゾンのプラセボを投与した。

注 5) 鉍質コルチコイド過剰による有害事象が発現した際には、5mg/日ずつ増量可能とされた。



OS の Kaplan-Meier 曲線 [PCR3011 試験 有効性解析対象例]



rPFS の Kaplan-Meier 曲線 [PCR3011 試験 有効性解析対象例]

安全性評価対象例 597 例（日本人 35 例を含む）中 336 例（56.3%）に副作用が認められた。主なものは、高血圧 110 例（18.4%）、低カリウム血症 83 例（13.9%）、ALT 増加 70 例（11.7%）、AST 増加 60 例（10.1%）、ほてり 41 例（6.9%）、末梢性浮腫 25 例（4.2%）であった。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

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

アパルタミド、エンザルタミド、クロルマジノン酢酸エステル、ダロルタミド、ビカルタミド、フルタミド

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

アビラテロン酢酸エステルは生体内で速やかにアビラテロンへ加水分解され、アンドロゲン合成酵素である 17α -hydroxylase/ $C_{17,20}$ -lyase (CYP17) 活性を阻害する。

In vitro において、アビラテロンはヒト副腎皮質由来腫瘍細胞株 (NCI-H295R) におけるテストステロンの合成を阻害した。マウス及びラットにおいてアビラテロン酢酸エステル (反復腹腔内又は経口投与) は血漿中テストステロン濃度を低下させた^{10~14)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

抗腫瘍効果

ヒト去勢抵抗性前立腺癌患者由来の腫瘍組織片 (LuCaP23CR 及び LuCaP35CR) を移植した去勢マウスにおいて、アビラテロン酢酸エステルの反復腹腔内投与は腫瘍内のテストステロン及びジヒドロテストステロン含量を低下させ、腫瘍の増殖を抑制し、無増悪生存期間を延長した¹⁵⁾。

(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

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

【単回投与】

健康成人にアビラテロン酢酸エステル 250mg、500mg 及び 1,000mg^{注)} を絶食下で単回経口投与したとき、アビラテロンの血漿中濃度は投与後 1.5～2.0 時間（中央値）に最高濃度に達し、14.2～16.6 時間（平均値）の消失半減期で消失した。血漿中アビラテロンの $C_{\max}$ 及び AUC_{∞} は、用量比を若干下回る増加を示した¹⁶⁾。

健康成人にアビラテロン酢酸エステル 250mg～1,000mg を単回経口投与したときの
血漿中アビラテロンの薬物動態パラメータ [平均値（標準偏差）]

薬物動態パラメータ	250mg	500mg	1,000mg
n	30	30	30
$C_{\max}$ (ng/mL)	53.2 (48.6)	90.5 (75.0)	172.1 (150.4)
AUC_{∞} (ng・hr/mL)	294 (290)	494 (434)	822 (616)
$T_{\max}$ (hr)	2.0 [1.0-4.0]	2.0 [1.0-4.0]	1.5 [1.0-4.0]
$T_{1/2}$ (hr)	14.2 (5.1)	15.1 (6.1)	16.6 (6.9)

$T_{\max}$: 中央値 [範囲]

注) 承認用法・用量はプレドニゾロンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

【反復投与】

前立腺癌患者に、アビラテロン酢酸エステル 250mg、500mg 及び 1,000mg^{注)} を食事の 1 時間以上前又は食事の 2 時間以上後に反復経口投与したとき、血漿中アビラテロン濃度は用量によらず、投与後 7 日目までに定常状態に達した。反復経口投与による累積率は用量によらず 1.3～1.7 であった。また、プレドニゾロン併用投与時の血漿中アビラテロンの $C_{\max}$ 及び AUC_{24} は、用量によらず、アビラテロン酢酸エステル単剤投与時と大きく異ならなかった¹⁷⁾。

前立腺癌患者にアビラテロン酢酸エステル 250mg～1,000mg を反復経口投与したときの
血漿中アビラテロンの薬物動態パラメータ [平均値 (標準偏差)]

投与量 (mg)		250	500	1000	1000
投与時期		食事の 1 時間以上前又は食事の 2 時間以上後		食事の 1 時間 以上前	食事の 2 時間 以上後
n		9	6	6	6
C _{max} (ng/mL)	1 日目 (アビラテロン 酢酸エステル 単独)	121.3 (37.9)	385.7 (181.5)	185.7 (104.4)	788.8 (343.2)
	7 日目 (アビラテロン 酢酸エステル 単独)	183.6 (69.8)	625.5 (253.2)	205.4 (97.2)	949.5 (338.1)
	15 日目 (プレドニゾロ ン併用)	168.8 (83.0)	542.2 (231.4)	166.4 (70.9)	999.7 (386.2)
T _{max} (hr)	1 日目 (アビラテロン 酢酸エステル 単独)	3.00 [1.97-5.92]	2.95 [2.00-3.95]	2.00 [0.57-2.95]	2.50 [0.98-3.97]
	7 日目 (アビラテロン 酢酸エステル 単独)	2.97 [1.77-3.05]	1.99 [1.98-5.98]	2.00 [1.03-4.05]	2.46 [1.98-3.25]
	15 日目 (プレドニゾロ ン併用)	2.08 [0.97-10.30]	2.46 [1.97-3.22]	1.98 [0.95-2.95]	2.97 [1.95-4.02]
AUC ₂₄ (ng・ hr/mL)	1 日目 (アビラテロン 酢酸エステル 単独)	516.0 (114.4)	1,698.0 (830.1)	869.7 (523.9)	2,724.7 (1109.8)
	7 日目 (アビラテロン 酢酸エステル 単独)	708.8 (164.7)	2,348.8 (774.8)	1,137.6 (524.4)	3,924.6 (1137.2)
	15 日目 (プレドニゾロ ン併用)	673.2 (131.7)	2,235.8 (1100.2)	964.8 (375.1)	3,955.7 (1260.0)

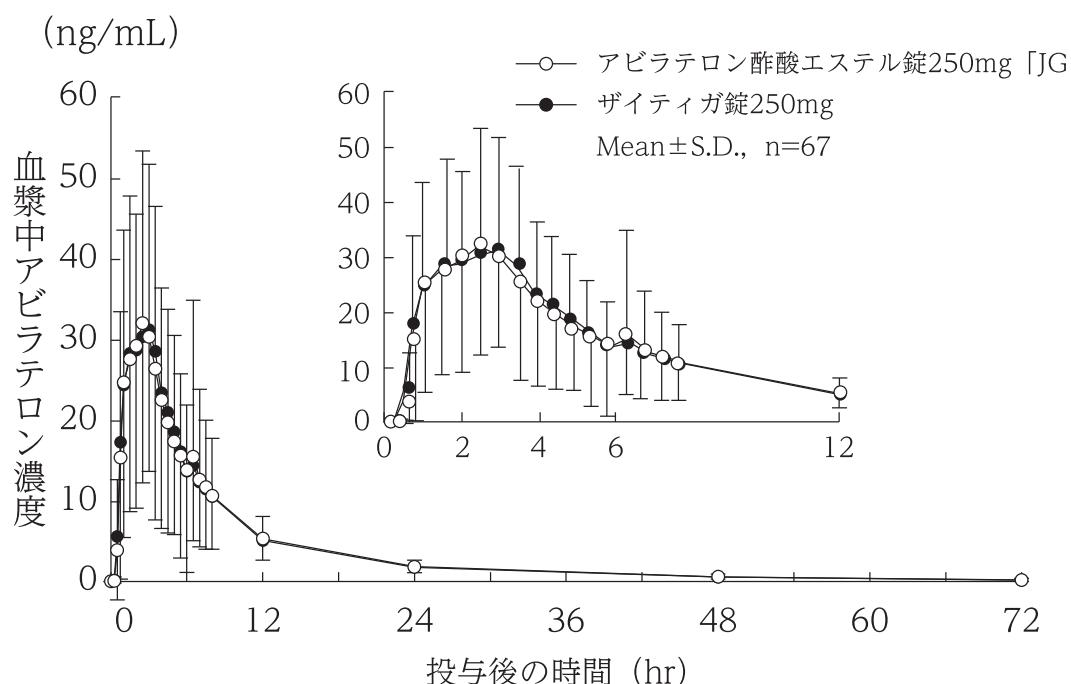
T_{max} : 中央値 [範囲]

注) 承認用法・用量はプレドニゾンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

【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等の一部改正について（令和2年3月19日薬生薬審発0319第1号）」に従う。

アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「JG」とザイティガ錠 250mgを、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠（アビラテロン酢酸エステルとして250mg）健康成人男性に絶食単回経口投与して血漿中アビラテロン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された¹⁸⁾。



<薬物動態パラメータ>

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
アビラテロン酢酸 エステル錠 250mg 「JG」	266.07±136.82	44.91±26.00	2.36±1.43	14.11±6.41
ザイティガ錠 250mg	264.51±112.17	45.05±19.56	2.22±1.26	14.09±5.69

(Mean±S.D., n=67)

血漿中濃度並びに AUC、 C_{max} 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 ₀₋₇₂	C_{max}
2 製剤の平均値の差	$\log(0.9723)$	$\log(0.9454)$
90%信頼区間	$\log(0.8962) \sim \log(1.0550)$	$\log(0.8436) \sim \log(1.0595)$

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響

健康成人にアビラテロン酢酸エステル 1,000mg^{注)} を食後（低脂肪食又は高脂肪食）に単回経口投与したとき、絶食時投与と比較して、血漿中アビラテロンの C_{max} 及び AUC_{∞} は、それぞれ 7 倍及び 5 倍（低脂肪食）、17 倍及び 10 倍（高脂肪食）増加した¹⁹⁾（外国人データ）。日本人及び外国人健康成人にアビラテロン酢酸エステル 1,000mg を、食事 1 時間前（投与法 B：投与 4 時間後に食事摂取）及び食事の 2 時間後（投与法 C：投与 2 時間後に食事摂取、投与法 D：投与 4 時間後に食事摂取）に単回経口投与したとき、空腹時投与（投与法 A）と比較して、血漿中アビラテロンの C_{max} 及び AUC_{∞} は、それぞれ 2 及び 1.6 倍、12 及び 7.5 倍、10 及び 7 倍増加した²⁰⁾。

注)承認用法・用量はプレドニゾンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

2) 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

薬物相互作用

① デキストロメトर्फアン

転移性去勢抵抗性前立腺癌（mCRPC）患者にアビラテロン酢酸エステル 1,000mg（プレドニゾン併用）と CYP2D6 の基質であるデキストロメトर्फアンを併用投与したとき、デキストロメトर्फアン単剤投与時と比較して、デキストロメトर्फアンの AUC_{last} は 200%増加した。また、デキストロメトर्फアンの活性代謝物であるデキストルフアンの AUC は 33%増加した²¹⁾（外国人データ）。

② リファンピシン

健康成人に CYP3A4 の誘導作用を有するリファンピシンを 6 日間反復投与後、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を単回経口投与したとき、アビラテロンの AUC_{∞} は 55%減少した²²⁾（外国人データ）。

③ その他の薬剤

テオフィリン

mCRPC 患者にアビラテロン酢酸エステル 1,000mg（プレドニゾン併用）と CYP1A2 の基質であるテオフィリンを併用投与したとき、テオフィリンの C_{max} 及び AUC_{last} はテオフィリン単剤投与時と同様であった²¹⁾（外国人データ）。

ケトコナゾール

健康成人に CYP3A4 の阻害作用を有するケトコナゾールをアビラテロン酢酸エステル 1,000mg と併用投与したとき、アビラテロンの C_{max} 及び AUC_{last} はアビラテロン酢酸エステル単剤投与時と同様であった²³⁾（外国人データ）。

ピオグリタゾン

健康成人に CYP2C8 の基質であるピオグリタゾンをアビラテロン酢酸エステル 1,000mg と併用投与したとき、ピオグリタゾンの AUC は 46%増加し、その活性代謝物である M-III、M-IV の AUC はそれぞれ 10%減少した²⁴⁾（外国人データ）。

④ *In vitro*

アビラテロン酢酸エステルは P-gp を阻害し、アビラテロン及びその主要代謝物は肝取り込みトランスポーターである OATP1B1 を阻害した^{25, 26)}。

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) 消失速度定数

健康成人男性

薬剤名	投与量	投与方法	kel (hr ⁻¹)
アビラテロン酢酸エステル錠 250mg 「JG」	1 錠 (アビラテロン酢酸エステルとして 250mg)	絶食単回経口投与	0.058±0.024

(Mean±S.D., n=67)

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

アビラテロンのみかけの分布容積は 4,150L であった²⁷⁾。

(6) その他

該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

該当資料なし

5. 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

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

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

(6) 血漿蛋白結合率

アビラテロンの血漿蛋白結合率は 99.8%であった (*in vitro*、平衡透析法)²⁸⁾。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

健康成人に ¹⁴C-アビラテロン酢酸エステルを単回経口投与^{注)}したとき、アビラテロン酢酸エステルは速やかにアビラテロンに加水分解された。アビラテロンは主として肝臓で代謝され、血漿中総放射能の 92%はアビラテロンの代謝物であった。血漿中の主要な代謝物は、アビラテロン硫酸抱合体及び N-オキシドアビラテロン硫酸抱合体であり、それぞれ血漿中総放射能の 43%を占めた²⁹⁾ (外国人データ)。

注) 承認用法・用量はプレドニゾロンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

健康成人に ¹⁴C-アビラテロン酢酸エステルを単回経口投与^{注)}したとき、投与後 264 時間までに投与した放射能の 88%が糞中に、5%が尿中に排泄された。糞中には、主にアビラテロン酢酸エステル及びアビラテロンとして排泄され、それぞれ投与量の 55%及び 22%を占めた²⁹⁾ (外国人データ)。

注) 承認用法・用量はプレドニゾロンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

8. トランスポーターに関する情報

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目-1. 血中濃度の推移、(4) 食事・併用薬の影響」の項参照

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

1) 肝機能障害患者

軽度 (Child-Pugh スコア A) 及び中等度 (Child-Pugh スコア B) の肝機能障害患者に、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を単回経口投与したとき、血漿中アビラテロンの AUC は、肝機能正常被験者と比較してそれぞれ 11%及び 260%増加した³⁰⁾ (外国人データ)。

肝機能正常被験者並びに軽度及び中等度肝機能障害患者にアビラテロン酢酸エステル 1,000mg を単回経口投与したときの血漿中アビラテロンの薬物動態パラメータ [平均値 (標準偏差)]

薬物動態 パラメータ	肝機能正常 被験者	軽度 肝機能障害患者	中等度 肝機能障害患者
n	8	8	8
T _{max} (hr)	1.75 [1.0-3.0]	2.0 [0.5-3.0]	1.5 [1.0-2.0]
C _{max} (ng/mL)	85.7 (46.6)	71.9 (40.2)	297 (258)
AUC _{last} (ng・hr/mL)	321 (166)	355 (191)	1,530 (1,350)

T_{max} : 中央値 [範囲]

重度 (Child-Pugh スコア C) の肝機能障害患者に、アビラテロン酢酸エステル懸濁液 125mg (錠剤 62.5mg に相当)^{注)} を単回経口投与したとき、肝機能正常被験者 [懸濁液 2,000mg (錠剤 1,000mg に相当)]^{注)} と比較して、用量で規格化した血漿中アビラテロンの AUC_∞ は 597% 増加した³¹⁾ (外国人データ)。

注) 承認用法・用量はプレドニゾロンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

2) 腎機能障害患者

血液透析を受けている末期腎疾患を有する被験者に、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を単回経口投与したとき、血漿中アビラテロンの C_{max} 及び AUC_{last} は腎機能正常被験者と比較して増加しなかった³²⁾ (外国人データ)。

11. その他

該当資料なし

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

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 重度の肝機能障害患者（Child-Pugh スコア C）[9.3.1、16.6.1 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目 - 2. 効能又は効果に関連する注意」の項参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 治療に関する項目 - 4. 用法及び用量に関連する注意」の項参照

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 血圧の上昇、低カリウム血症、体液貯留があらわれることがあるので、下記の点に留意すること。[9.1.1、9.1.2、10.2、11.1.3 参照]

8.1.1 本剤投与開始前に血清カリウム値等の血清電解質濃度を測定し、低カリウム血症が認められた場合には、血清カリウム値を補正した後に、本剤の投与を開始すること。定期的に血清カリウム値等の血清電解質濃度の測定を行うこと。

8.1.2 本剤投与中は定期的に血圧測定、血液検査、体重の測定等を行い、患者の状態を十分に観察すること。必要に応じて降圧剤の投与、カリウムの補給を行うなど、適切な処置を行うこと。

8.2 劇症肝炎があらわれることがあり、また、肝機能障害があらわれ、肝不全に至ることがあるので、本剤投与中は定期的（特に投与初期は頻回）に肝機能検査を行い、患者の状態を十分に観察すること。[7.3、11.1.2 参照]

8.3 本剤は内分泌療法剤であり、がんに対する薬物療法について十分な知識・経験を持つ医師のもとで、本剤による治療が適切と判断される患者についてのみ使用すること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 心血管疾患のある患者又はその既往歴のある患者

本剤の 17α -hydroxylase/ $C_{17,20}$ -lyase (CYP17) 阻害作用に伴う鉱質コルチコイド濃度の上昇により、高血圧、低カリウム血症及び体液貯留があらわれる可能性がある。[8.1 参照]

9.1.2 低カリウム血症の患者又は合併症等により低カリウム血症を起こすおそれのある患者
低カリウム血症が発現、又は増悪するおそれがある。[8.1、10.2 参照]

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重度の肝機能障害患者（Child-Pugh スコア C）

投与しないこと。[2.2、16.6.1 参照]

9.3.2 中等度の肝機能障害患者（Child-Pugh スコア B）

血漿中濃度が上昇するおそれがある。[16.6.1 参照]

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

設定されていない

(6) 授乳婦

設定されていない

(7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら投与すること。一般に高齢者では生理機能が低下していることが多い。

7. 相互作用

10. 相互作用

アビラテロンは CYP3A4 の基質である。また、*in vitro* 試験において、アビラテロン酢酸エステルは P-gp を阻害し、アビラテロンは CYP2C8、CYP2D6 及び OATP1B1 を阻害することが示されている。[16.7.4 参照]

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

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
CYP2D6 基質 デキストロメトर्फアン プロパフェノン フレカイニド ハロペリドール等 [16.7.1 参照]	CYP2D6 により代謝される 薬剤と併用する場合は、これ らの薬剤の血中濃度が上昇す る可能性がある。	本剤の CYP2D6 阻害作用 により、これらの薬剤の代謝 が阻害される。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
CYP3A4 誘導剤 リファンピシン フェニトイン カルバマゼピン リファブチン フェノバルビタール等 [16.7.2 参照]	本剤の血漿中濃度が低下し、 本剤の有効性が減弱する可能性 があるので、CYP3A4 誘導 作用のない又は弱い薬剤への 代替を考慮すること。	これらの薬剤の CYP3A4 誘導作用により、本剤の代謝 が促進される。
低カリウム血症を起こすおそれ のある薬剤 [8.1、9.1.2 参照]	低カリウム血症が発現、又は 増悪するおそれがある。	本剤及びこれらの薬剤は、低 カリウム血症をおこすおそれ がある。
ピオグリタゾン レパグリニド [16.7.3 参照]	ピオグリタゾン又はレパグリ ニドと併用する場合は、これ らの薬剤の血中濃度が上昇 し、低血糖が発現するおそれ があるため、患者の状態を十 分に観察すること。	本剤の CYP2C8 阻害作用 により、これらの薬剤の代謝 が阻害される。

8. 副作用

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投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 心障害

心不全（0.5%）等の重篤な心障害があらわれることがある。

11.1.2 劇症肝炎、肝不全、肝機能障害

劇症肝炎（頻度不明）があらわれることがある。また、AST 増加（7.1%）、ALT 増加（7.4%）、ビリルビン上昇（1.4%）等を伴う肝機能障害があらわれ、肝不全に至ることがある。[7.3、8.2 参照]

11.1.3 低カリウム血症（14.0%）

痙攣、筋力低下等の症状を伴う低カリウム血症があらわれることがあり、QT 延長、Torsade de Pointes を含む不整脈に至った例が報告されている。異常が認められた場合にはカリウムの補給や本剤の休薬等、適切な処置を行うこと。[8.1 参照]

11.1.4 血小板減少（0.8%）

11.1.5 横紋筋融解症（頻度不明）

筋力低下、筋肉痛、CK 上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇に注意し、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。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用				
	5%以上	5%未満 1%以上	1%未満	頻度不明
感染症		尿路感染		
血液			リンパ球減少症、白血球減少	発熱性好中球減少症
内分泌			副腎不全	
代謝・栄養		糖尿病、高脂血症	高アミラーゼ血症、脱水、低アルブミン血症	
電解質			高カリウム血症、高マグネシウム血症	
精神神経系		浮動性めまい、頭痛、味覚異常		
眼			眼精疲労、羞明	
循環器	高血圧		心房細動、頻脈、狭心症、不整脈、徐脈、右脚ブロック、心室性頻脈	
呼吸器			胸膜炎	アレルギー性細胞隔炎
消化器	悪心、便秘、下痢	嘔吐、消化不良	胃潰瘍、膵炎	
肝臓		ALP 増加	LDH 増加	
皮膚				皮疹
筋骨格			骨折、骨粗鬆症	
腎臓・泌尿器		血尿		
生殖器			精巣上体炎	
全身	疲労、末梢性浮腫		浮腫、顔面浮腫、倦怠感	
その他	ほてり	体重増加	血中尿酸減少、高比重リポ蛋白増加、膵管内乳頭粘液性腫瘍	

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

過量投与により、低カリウム血症及びそれに伴う無力症、悪心、嘔吐等の症状が発現することがある。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

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ある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 スピロノラクトン併用時に、PSA の上昇が認められた症例が報告されている。スピロノラクトンは、アンドロゲン受容体と結合し PSA を上昇させる可能性がある。

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

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」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) 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	アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「JG」	劇薬、処方箋医薬品※
有効成分	アビラテロン酢酸エステル	劇薬

※注意－医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間

3 年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

抗がん薬の取扱い基準：危険度Ⅱ³³⁾

5. 患者向け資材

- ・ くすりのしおり：作成中

6. 同一成分・同効薬

同一成分：ザイティガ錠 250mg/500mg

同 効 薬：エストラムスチンリン酸エステルナトリウム水和物、エチニルエストラジオール、エンザルタミド、ビカルタミド、フルタミド

7. 国際誕生年月日

不明

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始年月日
アビラテロン酢酸 エステル錠 250mg「JG」	2023 年 8 月 15 日	30500AMX00214000	—	—

9. 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

該当しない

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

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。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJ コード)	HOT (9 桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
アビラテロン酢酸 エステル錠 250mg「JG」	—	—	—	—

14. 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) 社内資料：加速試験
- 2) 社内資料：長期保存試験
- 3) 社内資料：アルミピロー開封後の安定性試験
- 4) 社内資料：無包装状態での安定性試験
- 5) 社内資料：溶出試験
- 6) Ryan, C.J. et al. : N. Engl. J. Med. 2013 ; 368 : 138-148
- 7) de Bono, J.S. et al. : N. Engl. J. Med. 2011 ; 364 : 1995-2005
- 8) 化学療法未治療患者を対象とした国内第Ⅱ相臨床試験成績（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.3.2）
- 9) ドセタキセルを含む化学療法既治療患者を対象とした国内第Ⅱ相臨床試験成績（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.3.2）
- 10) Potter, G.A. et al. : J. Med. Chem. 1995 ; 38 : 2463-2471
- 11) Haidar, S. et al. : J. Steroid Biochem. Mol. Biol. 2003 ; 84 : 555-562
- 12) 細胞内ステロイド合成阻害作用（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
- 13) Barrie, S.E. et al. : J. Steroid Biochem. Mol. Biol. 1994 ; 50 : 267-273
- 14) Duc, I. et al. : J. Steroid Biochem. Mol. Biol. 2003 ; 84 : 537-542
- 15) Mostaghel, E.A. et al. : Clin. Cancer Res. 2011 ; 17 : 5913-5925
- 16) 健康成人におけるアビラテロンの薬物動態の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 17) 患者におけるアビラテロンの薬物動態の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.2.3）
- 18) 社内資料：生物学的同等性試験
- 19) アビラテロンの薬物動態に対する食事の影響の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.3）
- 20) アビラテロンの薬物動態に対する食事のタイミングの影響の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.1.2）
- 21) テオフィリン又はデキストロメトルファンとアビラテロンの相互作用の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.16）
- 22) リファンピシンとアビラテロンの相互作用の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 23) ケトコナゾールとアビラテロンの相互作用の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 24) ピオグリタゾンとアビラテロンの相互作用の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、審査報告書）
- 25) アビラテロンの排出トランスポーターを介した相互作用の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.6.4.7）
- 26) アビラテロンの OATP1B1 阻害に関する検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、審査報告書）

- 27) アビラテロンの母集団薬物動態解析による検討（ザイティガ錠：2014 年 7 月 4 日承認、申請資料概要 2.7.2.3）
- 28) アビラテロンの血漿蛋白結合の検討（ザイティガ錠：2014 年 7 月 4 日承認、申請資料概要 2.7.2.3）
- 29) アビラテロンのマスバランスの検討（ザイティガ錠：2014 年 7 月 4 日承認、申請資料概要 2.7.2.3、2.7.6.1）
- 30) 軽度及び中等度肝機能障害患者におけるアビラテロンの薬物動態の検討（ザイティガ錠：2014 年 7 月 4 日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 31) 重度肝機能障害患者におけるアビラテロンの薬物動態の検討（ザイティガ錠：2014 年 7 月 4 日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.15）
- 32) 腎機能障害患者におけるアビラテロンの薬物動態の検討（ザイティガ錠：2014 年 7 月 4 日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.14）
- 33) 日本病院薬剤師会 監修：抗悪性腫瘍薬の院内取扱い指針 抗がん薬調製マニュアル（第 4 版）
じほう 2019；380-381

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

該当しない

X III. 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

1. 保存条件

①温度に対する安定性試験：40±2℃、4 週〔遮光・気密容器〕

②湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、4 週〔遮光・開放〕

③光に対する安定性試験：60 万 lx・hr/25℃/湿度なりゆき（4000lx）〔シャーレ+ラップ（フタ）〕

2. 試験項目

性状、純度試験（類縁物質）、定量試験

3. 試験結果

試験項目		性状	純度試験（％）			
			類縁物質 A	類縁物質 B	類縁物質 C	類縁物質 D
製剤の規格 ＜参考＞ （粉砕前の状態）		(1)	(2)			
試験開始時		やわらかい黄みの赤色の フィルムの混じった 白色の粉末	0.04	検出限界 未満	定量限界 未満	検出限界 未満
①温度	4 週間	やわらかい黄みの赤色の フィルムの混じった 白色の粉末	0.10	0.02	0.21	0.14
②湿度	4 週間	やわらかい黄みの赤色の フィルムの混じった 白色の粉末	0.05	検出限界 未満	0.04	検出限界 未満
③光	30 万 lx・hr	やわらかい黄みの赤色の フィルムの混じった 白色の粉末	0.05	検出限界 未満	0.06	0.05
	60 万 lx・hr	やわらかい黄みの赤色の フィルムの混じった 黄みの白色の粉末	0.05	検出限界 未満	0.08	0.09

試験項目		純度試験 (%)		定量試験 (%)
		その他の類縁物質	類縁物質の合計	
製剤の規格<参考> (粉碎前の状態)		(2)		(3)
試験開始時		定量限界 未満	0.04	100.3
①温度	4 週間	定量限界 未満	0.46	99.2
②湿度	4 週間	定量限界 未満	0.09	99.7
③光	30 万 lx・hr	定量限界 未満	0.16	100.1
	60 万 lx・hr	定量限界 未満	0.22	99.5

(1) やわらかい黄みの赤色のフィルムコーティング錠である。

(2) 類縁物質：アビラテロン酢酸エステルに対する相対保持時間約 0.58 の類縁物質 A のピークの量は 0.20%以下であり、相対保持時間約 0.55 の類縁物質 B のピークの量は 0.25%以下であり、相対保持時間約 0.72 の類縁物質 C のピークの量は 0.40%以下であり、相対保持時間約 0.78 の類縁物質 D のピークの量は 0.35%以下であり、アビラテロン酢酸エステル及び上記以外のピークの量は、それぞれ 0.20%以下である。また、試料溶液のアビラテロン酢酸エステル以外のピークの合計量は 2.0%以下である。

(3) 表示量の 95.0～105.0%

(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錠剤 1 個を入れ、55℃のお湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後に崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後、ディスペンサーを 180 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。

10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、錠剤破壊器（らくラッシュ）で錠剤に亀裂を加え、上記と同様の操作を行う。

上記でも崩壊しなかった場合、錠剤を薬包紙の上から乳棒で叩いて亀裂を加え、同様の操作を行う。

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約 20mL/10 秒の速度で注入し、チューブの通過性を確認する。

2. 試験結果

崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「JG」	コーティングに大きめの亀裂※ ¹ を入れたが、10分以内に崩壊しなかった。 乳棒で叩き亀裂を入れて粉砕※ ² し、5分以内に崩壊・懸濁した。 (フィルム(約1mm)の残存が認められたが、通過性試験時は残存が認められなかった。)

※¹: らくラッシュを使用し、亀裂を入れた

※²: 15回程度乳棒で叩き、亀裂を入れた

通過性試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「JG」	8Fr.のチューブを通過した。

8Fr.: 8 フレンチ 約 2.7 mm<外径>

3. 備考

- ・ 抗がん薬の取扱い基準: 危険度Ⅱ

「X. 管理的事項に関する項目 - 4. 取扱い上の注意」の項参照

2. その他の関連資料

該当資料なし

Memo

Memo

Memo

