

※※2014年8月改訂 5  
 ※2014年3月改訂 4

|            |
|------------|
| 日本標準商品分類番号 |
| 874291     |

アロマトーゼ阻害剤／閉経後乳癌治療剤

# エキセメスタン錠 25mg「NK」

Exemestane Tab. 25mg「NK」

エキセメスタン錠

|                            |
|----------------------------|
| 〈規制区分〉<br>処方箋医薬品*          |
| 〈貯法〉<br>室温保存               |
| 〈使用期限〉<br>3年(外箱に表示)        |
| 〈取扱い上の注意〉<br>【取扱い上の注意】の項参照 |

|      |               |
|------|---------------|
| 承認番号 | 22300AMX00869 |
| 薬価収載 | 2011年11月      |
| 販売開始 | 2011年11月      |

\*注意-医師等の処方箋により使用すること

|  |
|--|
| <p><b>【禁忌】</b>(次の患者には投与しないこと)</p> <p>(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人<br/>                 [[5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与]の項参照]</p> <p>(2) 授乳婦<br/>                 [[5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与]の項参照]</p> <p>(3) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者</p> |
|--|

**【組成・性状】**

※1. 組成

エキセメスタン錠25mg「NK」は、1錠中に次の成分を含有する。

|          |   |
|----------|---|
| 有効成分・含有量 | エキセメスタン 25.00mg   |
| 添加物      | D-マンニトール、結晶セルロース、デンプン、グリコール酸ナトリウム、クロスポビドン、ヒプロメロース、ポリビニルアルコール(部分けん化物)、パラオキシ安息香酸メチル、ポリソルベート80、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、マクロゴール6000、精製白糖、炭酸マグネシウム、酸化チタン、カルナウバロウ |

2. 製剤の性状

エキセメスタン錠25mg「NK」は、白色～微灰白色の糖衣錠である。

| 識別コード              | 直径 (mm) | 厚さ (mm) | 質量 (mg) |
|--------------------|---------|---------|---------|
| NK7041<br>(PTPに表示) | 6.2     | 3.9     | 100     |

**【効能・効果】**

閉経後乳癌

**【用法・用量】**

通常、成人にはエキセメスタンとして1日1回25mgを食後に経口投与する。

**【使用上の注意】**

1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1) 重度の肝障害のある患者  
 [本剤の重度の肝障害患者における長期安全性は確立していない。]
- (2) 重度の腎障害のある患者  
 [本剤の重度の腎障害患者における長期安全性は確立していない。]

2. 重要な基本的注意

- (1) 本剤はホルモン療法剤であり、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。
- (2) 本剤は末梢アロマトーゼを阻害することにより治療効果を発揮するものであり、活発な卵巣機能を有する閉経前の患者ではアロマトーゼを阻害する効果は不十分であると予想されること、ならびに閉経前の患者では使用経験がないことを考慮して、閉経前患者に対し使用しないこと。
- (3) 本剤の投与によって、骨粗鬆症、骨折が起こりやすくなるので、骨密度等の骨状態を定期的に観察することが望ましい。
- (4) 本剤の使用による嗜眠、傾眠、無力(症)及びめまいが報告されており、このような症状がある場合、機械操作や自動車の運転はさせないよう十分注意すること。

3. 相互作用

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                       |
|------------|--------------------|-------------------------------|
| エストロゲン含有製剤 | 本剤の効果を減弱させる可能性がある。 | 本剤の薬理作用はエストロゲン合成阻害によるものであるため。 |

4. 副作用

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。

(1) 重大な副作用(頻度不明)

肝炎、肝機能障害、黄疸：肝炎、AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、γ-GTP等の上昇を伴う肝機能障害、黄疸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し適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

|       | 頻度不明   |
|-------|--|
| 精神神経系 | 傾眠、多汗、めまい、しびれ(感)、頭痛、知覚障害、ふらつき(感)、不眠(症)、抑うつ、不安、手根管症候群 |
| 消化器   | 悪心、食欲不振、腹痛、嘔吐、腸管閉塞、のどの通過障害感、胃もたれ感、心窩部痛(心窩部の疼痛)、下痢    |
| 肝臓    | 肝機能異常、Al-P上昇   |
| 皮膚    | 蕁麻疹、痒痒症、発疹、脱毛(症)、爪の変化                                |
| 循環器   | 高血圧、動悸、低血圧   |

# エキセメスタン錠25mg「NK」

|     |   |
|-----|---|
|     | 頻度不明  |
| 呼吸器 | 鼻出血、かぜ症候群、肺炎  |
| 泌尿器 | 膀胱炎、尿検査異常   |
| 生殖器 | 不正（子宮）出血 <sup>※</sup> 、帯下                                 |
| その他 | 骨折、骨粗鬆症、過敏症、ほてり、疲労、疼痛、体重減少、倦怠（感）、体臭、浮腫、関節痛、味覚異常、嗅覚障害、筋骨格痛 |

注：異常が認められた場合には直ちに検査を行うなど適切な処置を行うこと。

## 5. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

本剤は、閉経後の患者を対象とするため、妊婦、授乳婦に対する投与は想定されていないが、妊婦、授乳婦への投与の安全性については次の知見がある。

### (1) 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人に対する安全性は確立していない。

[動物実験（ラット）で、分娩障害、妊娠期間の延長、吸収胚数の増加及び生存胎児数の減少が認められている。また動物実験（ウサギ）で、流産、吸収胚数の増加及び胎児体重の低下が認められている。しかし両種による動物実験で、催奇形性は認められてはいない。本剤の妊婦又は妊娠している可能性のある婦人における臨床使用経験はない。]

### (2) 授乳婦

授乳中の婦人に対する安全性は確立していない。

[動物実験（ラット）で乳汁中への移行が認められている。本剤の授乳中の婦人における臨床使用経験はない。]

## 6. 適用上の注意

**薬剤交付時：**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）

## 7. その他の注意

24ヵ月間のマウスがん原性試験において、中用量（150mg/kg/日）、高用量（450mg/kg/日）で雌雄において肝細胞腫及び肝細胞癌の発生率の上昇が認められている。また、雄の高用量群で腎腺腫の発生の上昇がみられている。これらの腫瘍はマウス特有のものである可能性が高くヒトにおける臨床的安全性との関連は低いと考えられている。

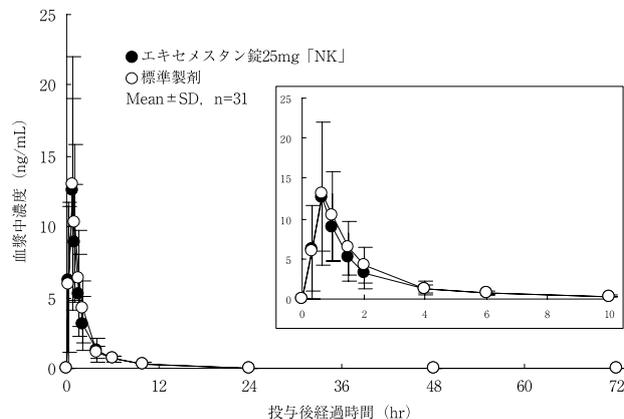
## 【薬物動態】

**生物学的同等性試験：**エキセメスタン錠25mg「NK」と標準製剤を、クロスオーバー試験法によりそれぞれ1錠（エキセメスタンとして25mg）65歳未満の閉経後健康女性に空腹時単回経口投与して血漿中エキセメスタン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。<sup>1)</sup>

エキセメスタン濃度から得られた薬物動態パラメータ

|                   | 判定パラメータ                           |                 | 参考パラメータ      |                          |
|-------------------|-----------------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|
|                   | AUC <sub>0-72</sub><br>(ng・hr/mL) | Cmax<br>(ng/mL) | tmax<br>(hr) | t <sub>1/2</sub><br>(hr) |
| エキセメスタン錠25mg「NK」  | 21.8±8.6                          | 13.0±6.1        | 0.75±0.28    | 2.08±0.71                |
| 標準製剤<br>(錠剤、25mg) | 23.6±10.1                         | 14.3±7.8        | 0.96±0.68    | 1.77±0.74                |

(Mean ± S.D., n=31)



血漿中濃度並びにAUC、Cmax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。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

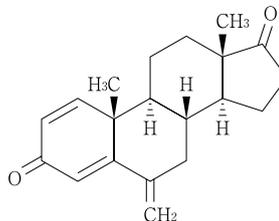
一般名：エキセメスタン（exemestane）

化学名：(+)-6-methyleneandrosta-1,4-diene-3,17-dione

分子式：C<sub>20</sub>H<sub>24</sub>O<sub>2</sub>

分子量：296.40

構造式：



**性状：**白色～黄白色の粉末である。N,N-ジメチルホルムアミド及びテトラヒドロフランに溶けやすく、メタノール及びエタノール（95）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。

## 【取扱い上の注意】

**安定性試験：**PTP包装（PTPシートをアルミピロー包装）したものをを用いた加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、エキセメスタン錠25mg「NK」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。<sup>2)</sup>

## 【承認条件】

閉経後乳癌に対する本薬の有効性及び安全性の更なる明確化を目的とした十分なサンプルサイズを持つ無作為化比較試験を国内で実施すること。

## 【包装】

30錠、100錠、140錠

## ※※【主要文献及び文献請求先】

### 〈主要文献〉

- 1) 日本化薬株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 日本化薬株式会社 社内資料：安定性試験

### 〈文献請求先〉

主要文献に記載の社内資料につきましては下記にご請求下さい。

日本化薬株式会社 医薬事業本部

営業本部 医薬品情報センター

(住所) 〒100-0005 東京都千代田区丸の内二丁目1番1号

(TEL) 0120-505-282 (フリーダイヤル)



※※製造販売元  **日本化薬株式会社**  
東京都千代田区丸の内二丁目1番1号