

## 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2013に準拠して作成

### 前立腺癌治療剤

# ビカルタミド錠 80mg「サワイ」

# ビカルタミドOD錠 80mg「サワイ」

BICALUTAMIDE

ビカルタミド製剤

剤形	錠80mg : フィルムコーティング錠 OD錠80mg : 素錠(口腔内崩壊錠)
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錠中ビカルタミド80mg含有
一般名	和名：ビカルタミド 洋名：Bicalutamide
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	製造販売承認年月日：2009年 1月14日(錠80mg) ：2016年 2月15日(OD錠80mg) 薬価基準収載年月日：2009年 5月15日(錠80mg) ：2016年 6月17日(OD錠80mg) 発売年月日：2009年 5月15日(錠80mg) ：2016年 6月17日(OD錠80mg)
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-6394-7355 医療関係者向けホームページ：http://med.sawai.co.jp

本IFは2015年1月改訂(錠80mg)、2016年3月作成(OD錠80mg)の添付文書の記載に基づき改訂した。  
最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ<http://www.pmda.go.jp/>にて  
ご確認ください。

# 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

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、添付文書と略す)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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会(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)の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

## 2. IFとは

IFは「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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの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。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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。

### [IFの様式]

①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体(図表は除く)で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

- ②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

#### [IFの作成]

- ①IFは原則として製剤の投与経路別(内用剤、注射剤、外用剤)に作成される。
- ②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領2013」(以下、「IF記載要領2013」と略す)により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体(PDF)から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IFの発行]

- ①「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果(臨床再評価)が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

### 3. IFの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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」に従って作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF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薬剤師等自らが内容を充実させ、IF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、IFが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり、その取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

IFを薬剤師等の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頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013年4月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	25
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	25
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	25
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	25
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	25
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	25
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	25
4. 分子式及び分子量	2	7. 相互作用	26
5. 化学名(命名法)	2	8. 副作用	26
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	28
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	28
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	28
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	28
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	28
3. 有効成分の確認試験法	4	14. 適用上の注意	28
4. 有効成分の定量法	4	15. その他の注意	28
IV. 製剤に関する項目	5	16. その他	28
1. 剤形	5	IX. 非臨床試験に関する項目	29
2. 製剤の組成	5	1. 薬理試験	29
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	2. 毒性試験	29
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	X. 管理的事項に関する項目	30
5. 調製法及び溶解後の安定性	7	1. 規制区分	30
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	7	2. 有効期間又は使用期限	30
7. 溶出性	8	3. 貯法・保存条件	30
8. 生物学的試験法	12	4. 薬剤取扱い上の注意点	30
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	12	5. 承認条件等	31
10. 製剤中の有効成分の定量法	12	6. 包装	31
11. 力価	12	7. 容器の材質	31
12. 混入する可能性のある夾雑物	12	8. 同一成分・同効薬	32
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	12	9. 国際誕生年月日	32
14. その他	12	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	32
V. 治療に関する項目	13	11. 薬価基準収載年月日	32
1. 効能又は効果	13	12. 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	32
2. 用法及び用量	13	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	32
3. 臨床成績	13	14. 再審査期間	32
VI. 薬効薬理に関する項目	15	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	32
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	15	16. 各種コード	33
2. 薬理作用	15	17. 保険給付上の注意	33
VII. 薬物動態に関する項目	19	XI. 文献	34
1. 血中濃度の推移・測定法	19	1. 引用文献	34
2. 薬物速度論的パラメータ	22	2. その他の参考文献	34
3. 吸収	22	XII. 参考資料	35
4. 分布	22	1. 主な外国での発売状況	35
5. 代謝	23	2. 海外における臨床支援情報	35
6. 排泄	23	XIII. 備考	35
7. トランスポーターに関する情報	24	その他の関連資料	35
8. 透析等による除去率	24		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ビカルタミド錠80mg/OD錠80mg「サワイ」は、ビカルタミドを含有する前立腺癌治療剤である。ビカルタミドは、非ステロイド性抗アンドロゲン薬である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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、承認を得て上市に至った。

	ビカルタミド錠80mg「サワイ」	ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」
承認申請に際し 準拠した通知名	平成17年3月31日 薬食発第 0331015号	平成26年11月21日 薬食発1121第 2号
承認	2009年1月	2016年2月
上市	2009年5月	2016年6月

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 識別性を考慮し、錠剤本体に含量の分かる識別コードを印刷している。[錠80mg]
- 2) 識別性を考慮し、錠剤本体に成分名及び含量を刻印している。[OD錠80mg]
- 3) 水なし(唾液のみ)でも服用可能な口腔内崩壊錠である。[OD錠80mg]
- 4) 非ステロイド性抗アンドロゲン薬である。
- 5) アンドロゲン受容体へのアンドロゲンの結合を競合的に阻害することにより、アンドロゲンによる前立腺細胞の増殖を抑制する。<sup>1)</sup>
- 6) アンドロゲン受容体との結合力が高く、血中半減期が長い。<sup>2)</sup>
- 7) ヒト前立腺癌細胞移植モデルを用いた薬理的試験において、標準製剤と比較し同等の抗腫瘍作用を有することが確認された(VI. -2. 参照)。<sup>3)</sup>
- 8) 重大な副作用として、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、白血球減少、血小板減少、間質性肺炎、心不全、心筋梗塞が報告されている(頻度不明)。  
また、その他の副作用として、乳房腫脹、乳房圧痛、勃起力低下、AST(GOT)上昇、腎機能障害(クレアチニン上昇、BUN上昇)、そう痒、性欲減退、便秘、貧血等が報告されている(頻度不明)。

## II. 名称に関する項目

---

### II. 名称に関する項目

---

#### 1. 販売名 .....

##### 1) 和名

ビカルタミド錠80mg「サワイ」

ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」

##### 2) 洋名

BICALUTAMIDE

BICALUTAMIDE OD

##### 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

#### 2. 一般名 .....

##### 1) 和名(命名法)

ビカルタミド(JAN)

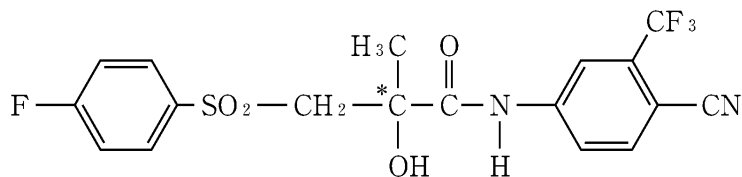
##### 2) 洋名(命名法)

Bicalutamide(JAN、INN)

##### 3) ステム

-lutamide : non-steroid antiandrogens

#### 3. 構造式又は示性式 .....



#### 4. 分子式及び分子量 .....

分子式 : C<sub>18</sub>H<sub>14</sub>F<sub>4</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S

分子量 : 430.37

#### 5. 化学名(命名法) .....

(*RS*)-*N*-[4-Cyano-3-(trifluoromethyl)phenyl]-3-[(4-fluorophenyl)sulfonyl]-2-hydroxy-2-methylpropanamide(IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....  
特になし

7. CAS登録番号 .....  
90357-06-5

---

### 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～淡黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。
  - 2) 溶解性  
アセトン及び*N, N*-ジメチルホルムアミドに溶けやすく、アセトニトリル及びメタノールにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。
  - 3) 吸湿性  
水分：0.2%以下(0.5g、容量滴定法、直接滴定)
  - 4) 融点(分解点)、沸点、凝固点  
融点：190～195℃
  - 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  
旋光性：メタノール溶液(1→100)は旋光性を示さない。
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……………
  - 1) 紫外可視吸光度測定法
  - 2) 赤外吸収スペクトル測定法
4. 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、外観及び性状

品名	剤形	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
ビカルタミド錠80mg 「サワイ」	フィルム コーティング錠	 7.6	 約206	 4.4	白色
ビカルタミドOD錠 80mg「サワイ」	素錠 (口腔内崩壊錠)	 10.0	 約300	 3.2	白色～微 黄白色

## 2) 製剤の物性

## ●ビカルタミド錠80mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

## ●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

## 3) 識別コード

●ビカルタミド錠80mg「サワイ」 : SW BLT 80

●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」 : ビカルタミド SW

## 4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当資料なし

## 2. 製剤の組成

## 1) 有効成分(活性成分)の含量

●ビカルタミド錠80mg「サワイ」 : 1錠中にビカルタミド80mgを含有する。

●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」 : 1錠中にビカルタミド80mgを含有する。

IV. 製剤に関する項目

2) 添加物

●ビカルタミド錠80mg「サワイ」

添加物として、カルナウバロウ、酸化チタン、ステアリン酸Mg、デンプングリコール酸Na、乳糖、ヒプロメロース、ポビドン、マクロゴール6000を含有する。

●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」

添加物として、アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)、カルメロース、クロスポビドン、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、フマル酸ステアリルNa、D-マンニトール、香料を含有する。

3) その他

該当資料なし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 .....  
該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性.....

●ビカルタミド錠80mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)

ビカルタミド錠80mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。<sup>4)</sup>

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色のフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.0	100.0

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性

ビカルタミド錠80mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。<sup>5)</sup>

保存条件	イニシャル	温度 (40°C3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温散光下 (なりゆき 3ヵ月)
性状	白色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	11.3	9.6	20.2	12.1	14.8
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	98.6	99.6	100.4	98.6

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

## ●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」

## 1) PTP包装品の安定性(加速試験)

ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、定量試験等の規格に適合し、安定な製剤であることが確認された。<sup>6)</sup>

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の素錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験 <sup>※</sup>	99.8	99.6

※：表示量に対する含有率(%)

## 2) 無包装下の安定性

ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、安定な製剤であることが確認された。<sup>7)</sup>

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 60万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
性状	白色の素錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	6.1	6.2	4.3	4.9	5.2
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験 <sup>※</sup>	100.0	100.2	100.0	100.2	100.1

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

## 5. 調製法及び溶解後の安定性 .....

該当しない

## 6. 他剤との配合変化(物理化学的变化) .....

## ●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」

XIII. 備考「配合変化試験成績」参照<sup>8)</sup>

IV. 製剤に関する項目

7. 溶出性 .....

＜溶出挙動における同等性及び類似性＞

●ビカルタミド錠80mg「サワイ」<sup>9, 10)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成18年11月24日 薬食 審査発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水、pH1.2ポリソルベート80 1.0% (W/V) 添加、pH4.0ポリソルベート80 1.0% (W/V) 添加、pH6.8ポリソル ベート80 1.0% (W/V) 添加) 100rpm(pH4.0ポリソルベート80 1.0% (W/V) 添加)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

＜50rpm：pH1.2＞

標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(15分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

＜50rpm：pH4.0＞

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(10分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

＜50rpm：pH6.8＞

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(10分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

＜50rpm：水＞

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(10分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

＜50rpm：pH1.2ポリソルベート80 1.0% (W/V) 添加＞

標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(15分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。

＜50rpm：pH4.0ポリソルベート80 1.0% (W/V) 添加＞

標準製剤の平均溶出率が40% (10分) 及び85% (180分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

＜50rpm：pH6.8ポリソルベート80 1.0% (W/V) 添加＞

標準製剤の平均溶出率が40% (10分) 及び85% (120分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

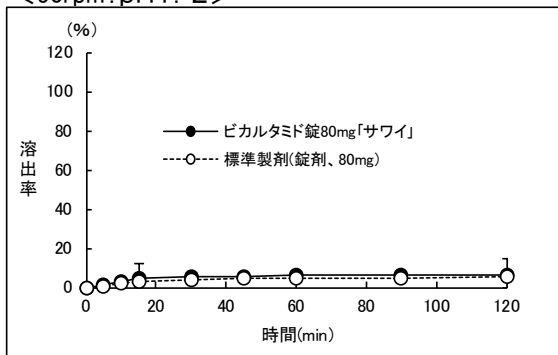
＜100rpm：pH4.0ポリソルベート80 1.0% (W/V) 添加＞

標準製剤の平均溶出率が40% (10分) 及び85% (120分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

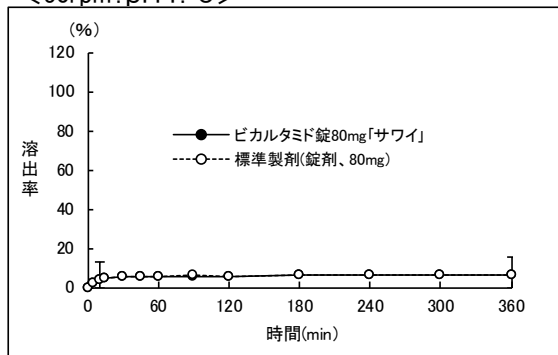
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)

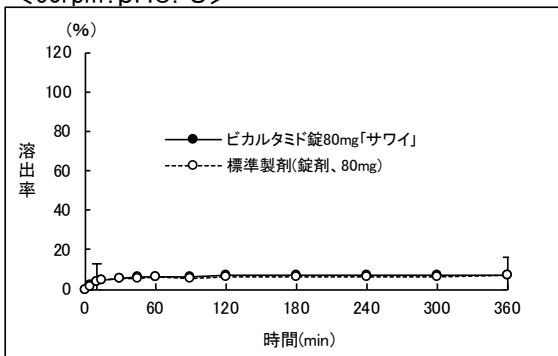
<50rpm:pH1. 2>



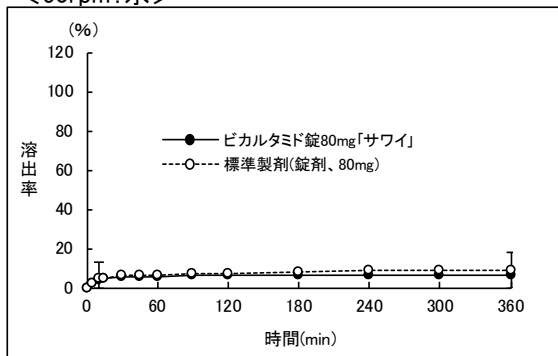
<50rpm:pH4. 0>



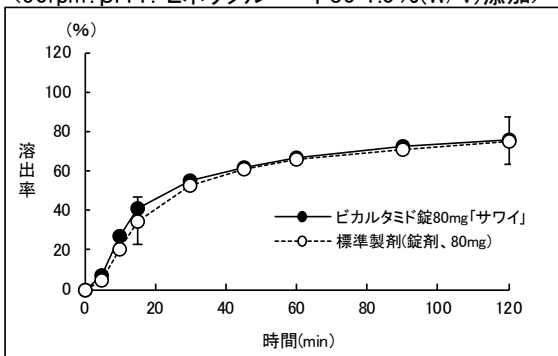
<50rpm:pH6. 8>



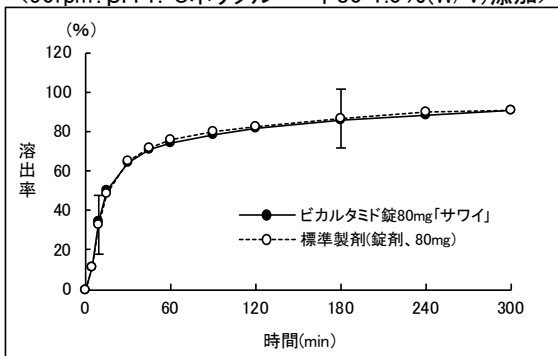
<50rpm:水>



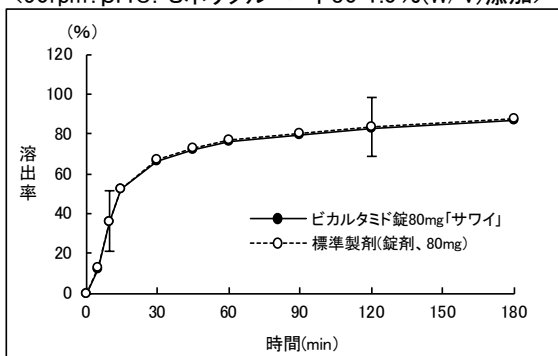
<50rpm:pH1. 2ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



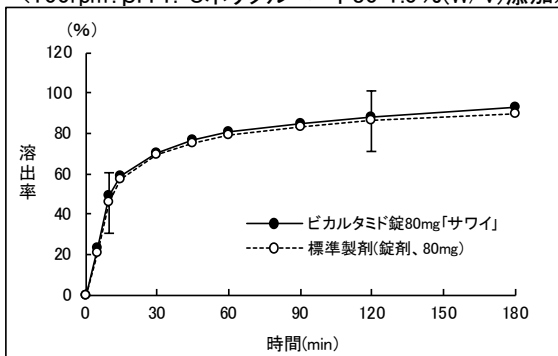
<50rpm:pH4. 0ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



<50rpm:pH6. 8ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



<100rpm:pH4. 0ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



( I : 判定基準の適合範囲)

IV. 製剤に関する項目

●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」<sup>11)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水、pH1.2ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加、pH4.0ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加、pH6.8ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加) 100rpm(pH6.8ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm：pH1.2>

規定された試験時間(120分)において試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

<50rpm：pH4.0>

規定された試験時間(360分)において試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

<50rpm：pH6.8>

規定された試験時間(360分)において試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

<50rpm：水>

規定された試験時間(360分)において試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

<50rpm：pH1.2ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>

標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(10分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。

<50rpm：pH4.0ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>

標準製剤の平均溶出率が40%(5分)及び85%(90分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

<50rpm：pH6.8ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>

標準製剤の平均溶出率が40%(5分)及び85%(90分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

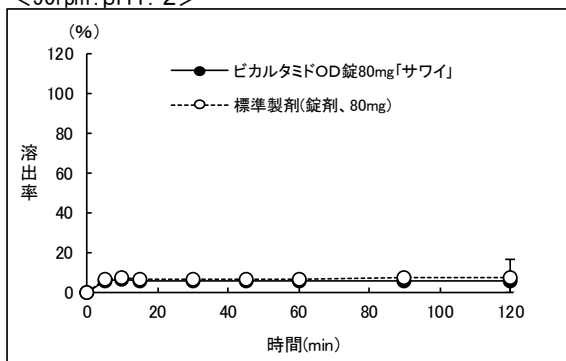
<100rpm：pH6.8ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>

標準製剤の平均溶出率が40%(5分)及び85%(30分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

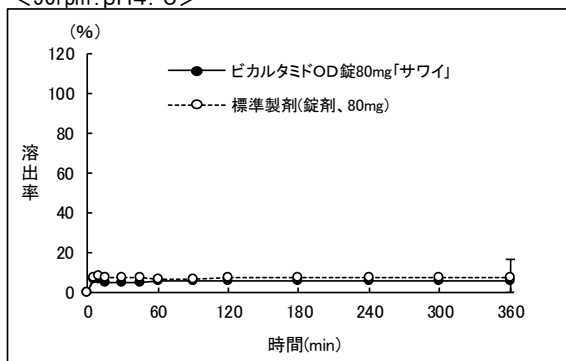
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)

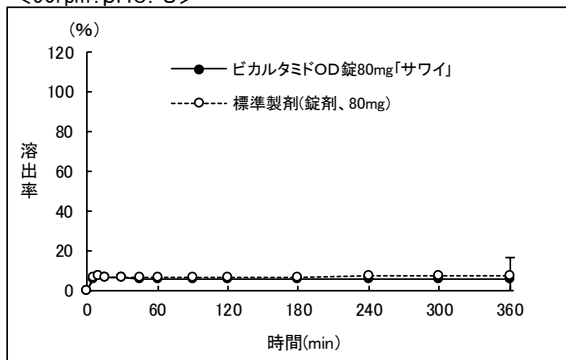
<50rpm: pH1. 2>



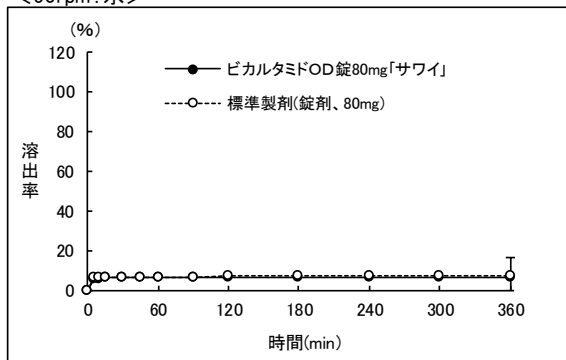
<50rpm: pH4. 0>



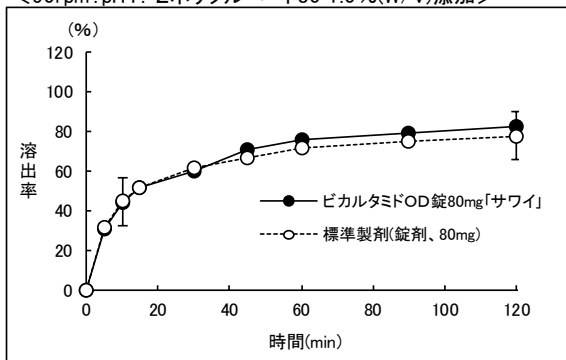
<50rpm: pH6. 8>



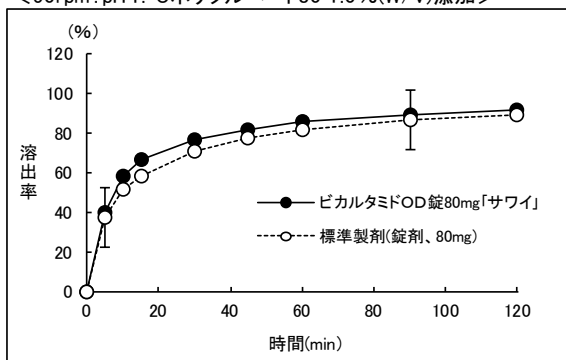
<50rpm: 水>



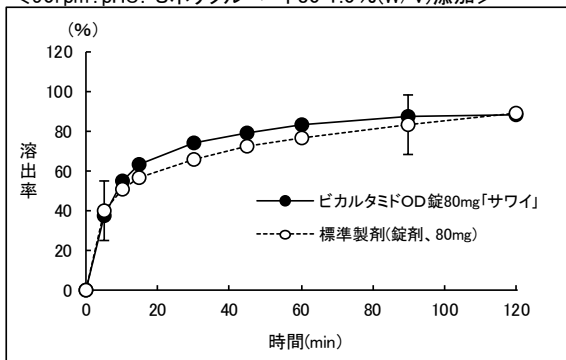
<50rpm: pH1. 2ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



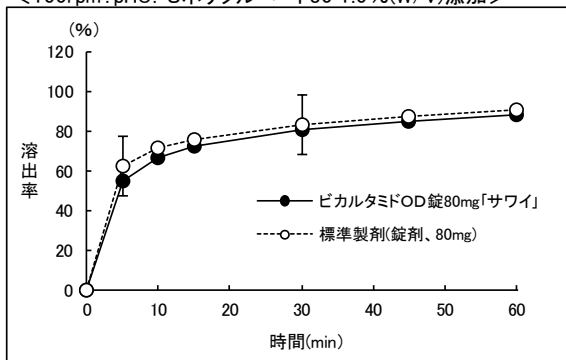
<50rpm: pH4. 0ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



<50rpm: pH6. 8ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



<100rpm: pH6. 8ポリソルベート80 1.0%(W/V)添加>



( I : 判定基準の適合範囲)

IV. 製剤に関する項目

8. 生物学的試験法 .....  
該当しない
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 .....  
紫外可視吸光度測定法
10. 製剤中の有効成分の定量法 .....  
液体クロマトグラフィー
11. 力価 .....  
該当しない
12. 混入する可能性のある夾雑物 .....  
該当資料なし
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 .....  
該当資料なし
14. その他 .....  
該当資料なし



---

## V. 治療に関する項目

---

### 1. 効能又は効果

前立腺癌

＜効能又は効果に関連する使用上の注意＞

- 1) 本剤による治療は、根治療法ではないことに留意し、本剤投与12週後を抗腫瘍効果観察のめどとして、本剤投与により期待する効果が得られない場合、あるいは病勢の進行が認められた場合には、手術療法等他の適切な処置を考慮すること。
- 2) 本剤投与により、安全性の面から容認し難いと考えられる副作用が発現した場合は、治療上の有益性を考慮の上、必要に応じ、休薬又は集学的治療法などの治療法に変更すること。

### 2. 用法及び用量

通常、成人にはピカルタミドとして80mgを1日1回、経口投与する。

＜用法及び用量に関連する使用上の注意＞

(OD錠のみ)

本剤は口腔内で崩壊するが、口腔の粘膜から吸収されることはないため、唾液又は水で飲み込むこと。「適用上の注意」の項参照

### 3. 臨床成績

#### 1) 臨床データパッケージ

該当しない

#### 2) 臨床効果

該当資料なし

#### 3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### 4) 探索的試験

該当資料なし

#### 5) 検証的試験

##### (1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

##### (2) 比較試験

該当資料なし

##### (3) 安全性試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

(4) 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・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

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試験の概要

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

抗アンドロゲン薬：フルタミド、エンザルタミド、クロルマジノン酢酸エステル等

### 2. 薬理作用

ビカルタミドの薬理作用について以下のとおり報告されている。

#### 1) 作用部位・作用機序

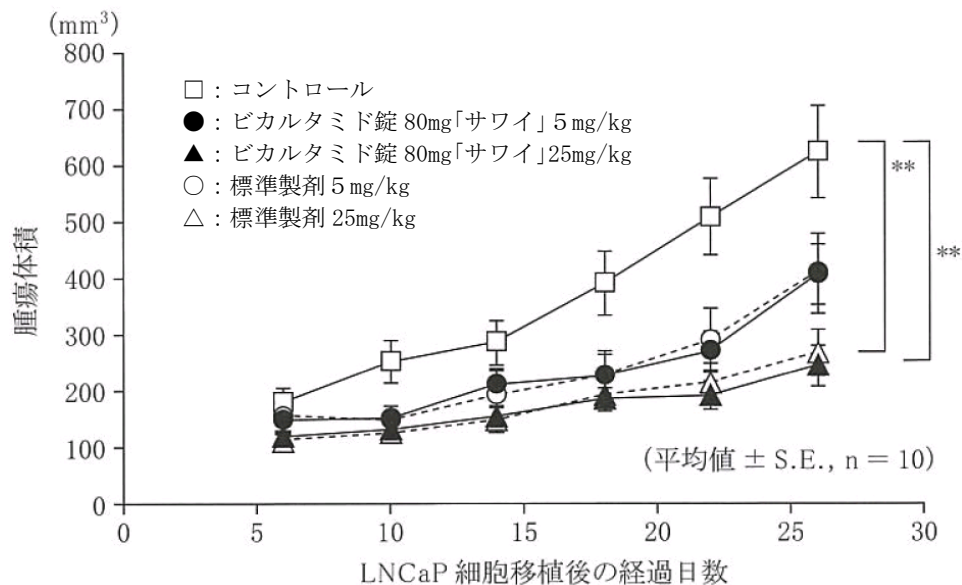
アンドロゲン受容体へのアンドロゲンの結合を競合的に阻害することにより、アンドロゲンによる前立腺細胞の増殖を抑制する。<sup>1)</sup>

#### 2) 薬効を裏付ける試験成績

ビカルタミド錠80mg「サワイ」及び標準製剤における前立腺癌に対する抗腫瘍作用を、ヒト前立腺癌由来細胞株であるLNCaP細胞を移植したSCIDマウス(雄性、7週齢)を用いて比較検討した。<sup>3)</sup>

##### 1) 移植と同時に投与開始したときの抗腫瘍効果

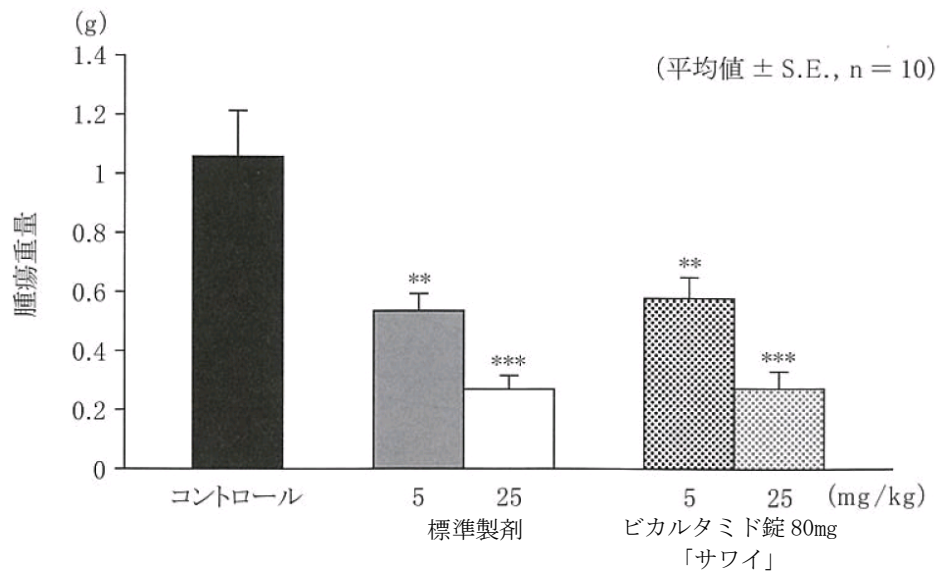
癌細胞の移植と同時に両製剤を2日に1回、25日間反復経口投与した結果、25mg/kgの用量では有意な腫瘍体積の増加抑制が認められ、また、腫瘍重量の増加及びPSA値の上昇に対しても、用量に依存した抑制作用を示した。いずれの検討においても両製剤間で有意な差は認められなかった。



<腫瘍体積の推移>

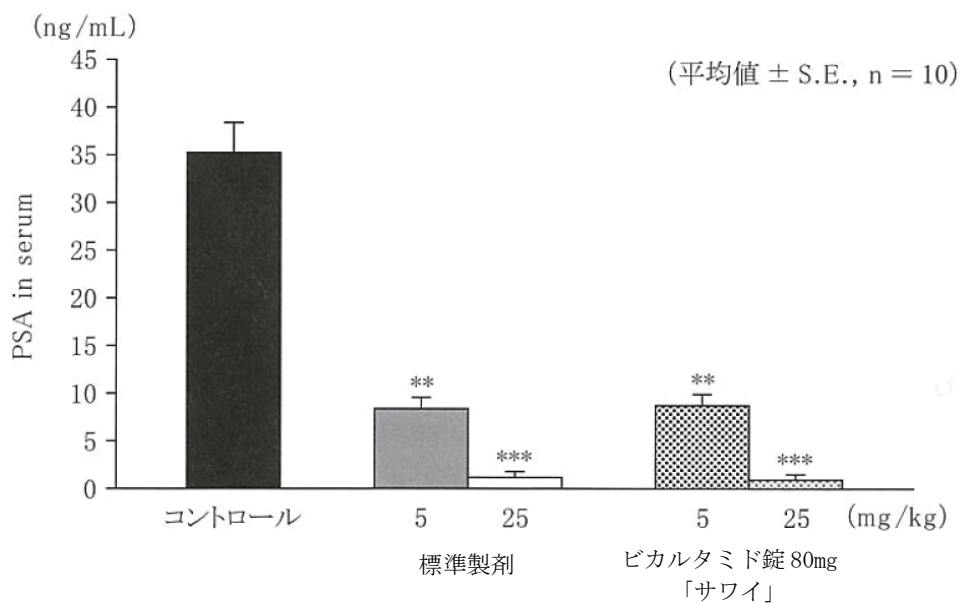
\*\* : コントロール群に対する有意差  $p < 0.01$  (経時型分散分析、有意水準 5%)

## VI. 薬効薬理に関する項目



<投与終了後の腫瘍重量に及ぼす影響>

\*\*、\*\*\* : コントロール群に対する有意差それぞれ  $p < 0.01$ 、 $0.001$   
(t 検定、有意水準 2.5%、片側)

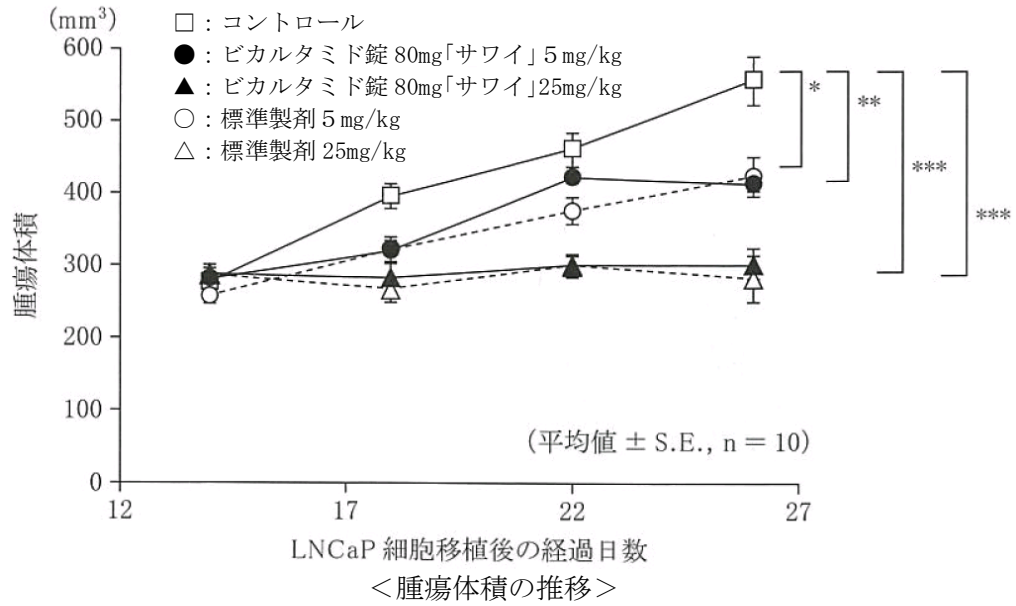


<投与終了後のPSA値に及ぼす影響>

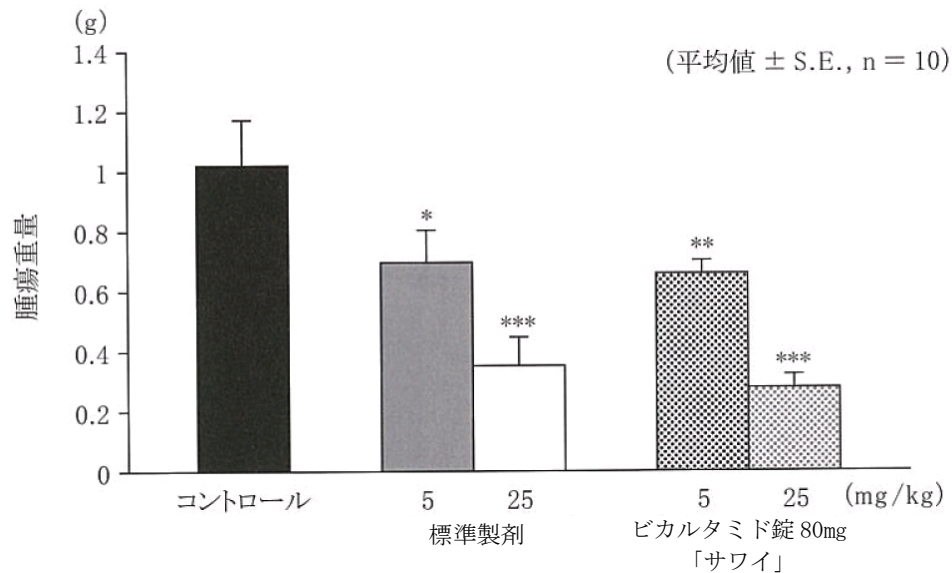
\*\*、\*\*\* : コントロール群に対する有意差それぞれ  $p < 0.01$ 、 $0.001$   
(t 検定、有意水準 2.5%、片側)

### 2) 治療的投与による抗腫瘍効果

腫瘍体積が顕著に増加し始める移植14日後から2日に1回、11日間治療的に投与した結果、25mg/kgの用量では有意な腫瘍体積の増加抑制が認められ、また、腫瘍重量の増加及びPSA値の上昇に対しても、用量に依存した抑制作用を示した。いずれの検討においても両製剤間で有意な差は認められなかった。



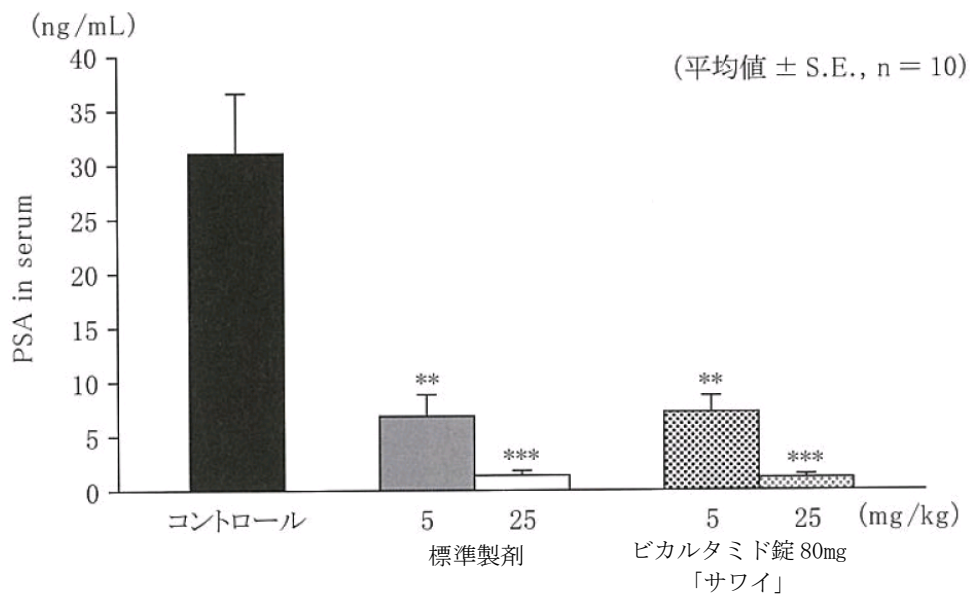
\*、\*\*及び\*\*\* : コントロール群に対する有意差それぞれ  $p < 0.05$ 、 $0.01$  及び  $0.001$   
(経時型分散分析、有意水準 5%)



< 投与終了後の腫瘍重量に及ぼす影響 >

\*、\*\*及び\*\*\* : コントロール群に対する有意差それぞれ  $p < 0.05$ 、 $0.01$  及び  $0.001$   
(t 検定、有意水準 2.5%、片側)

## VI. 薬効薬理に関する項目



<投与終了後のPSA値に及ぼす影響>

\*\*、\*\*\* : コントロール群に対する有意差それぞれ  $p < 0.01$ 、 $0.001$   
(t 検定、有意水準 2.5%、片側)

### 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

ビカルタミド錠の薬物動態について以下のとおり報告されている。

### 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

VII. -1. -3) 参照

#### 3) 臨床試験で確認された血中濃度

<生物学的同等性試験>

##### ●ビカルタミド錠80mg「サワイ」<sup>9, 12)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号
採血時点	0、1、3、6、12、24、36、48、72、168、336、504hr
休薬期間	42日間以上
測定方法	HPLC法

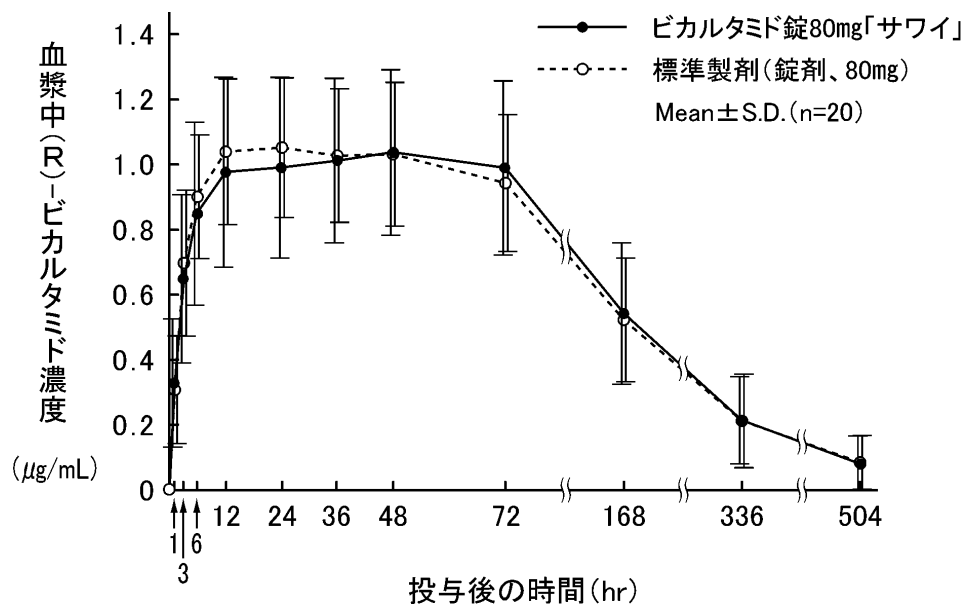
ビカルタミド錠80mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(ビカルタミドとして80mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、実質的な活性本体である(R)-ビカルタミドの血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C<sub>max</sub>)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	C <sub>max</sub> ( $\mu$ g/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>t</sub> ( $\mu$ g·hr/mL)
ビカルタミド錠 80mg「サワイ」	1.14±0.26	37.8±22.1	120.8±34.5	231.2±77.7
標準製剤 (錠剤、80mg)	1.12±0.22	27.6±17.0	126.0±36.1	227.6±70.8

(Mean±S.D.)

VII. 薬物動態に関する項目



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC <sub>t</sub>	log (1.00)	log (0.87) ~ log (1.15)
Cmax	log (1.00)	log (0.89) ~ log (1.12)

●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」<sup>13, 14)</sup>

通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号
採血時点	0、1、3、6、12、24、36、48、72、172、340、508hr
休薬期間	42日間以上
測定方法	LC/MS法

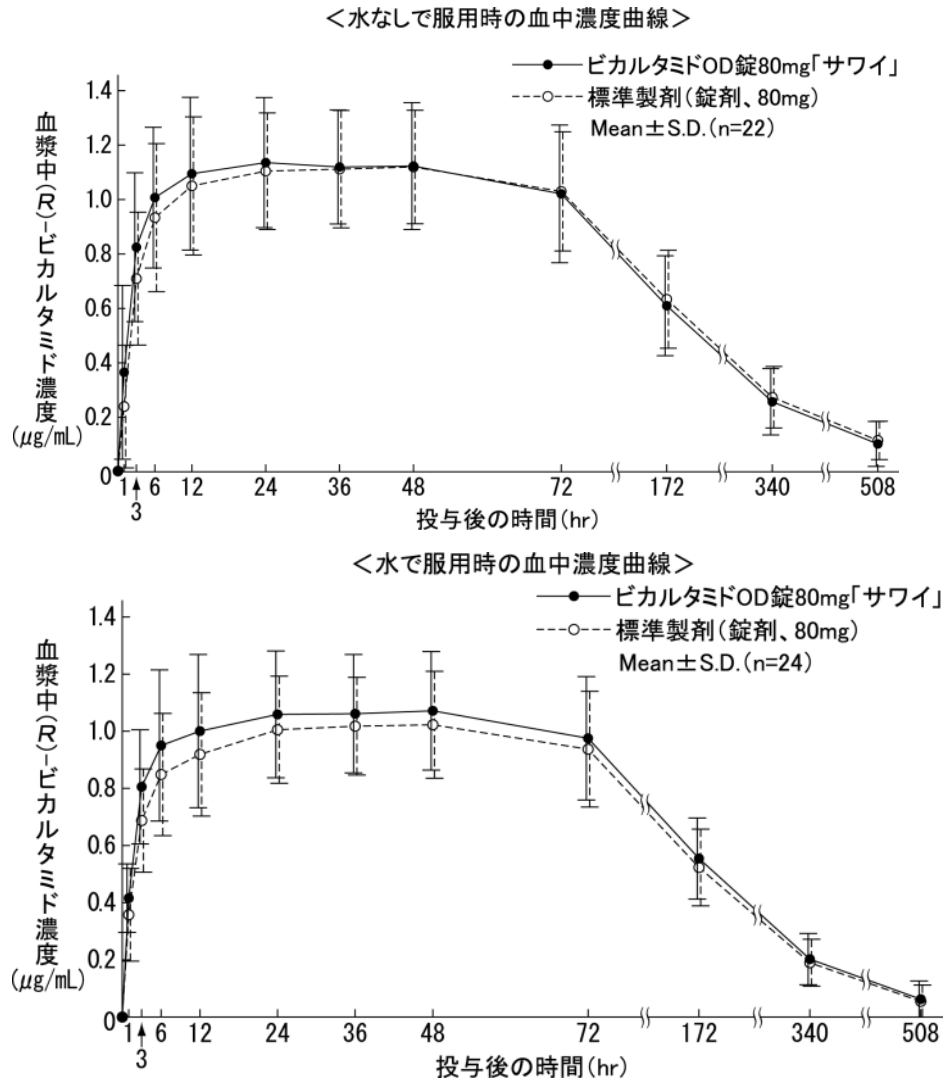
ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(ビカルタミドとして80mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、実質的な活性本体である(R)-ビカルタミドの血漿中濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (µg/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>t</sub> (µg·hr/mL)
水なし (n=22)	ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」	1.21±0.26	32.7±16.2	131.0±33.8	261.1±71.5
	標準製剤(錠剤、80mg)	1.19±0.22	37.1±19.6	134.5±30.5	267.0±65.2
水あり (n=24)	ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」	1.14±0.24	33.3±18.7	115.9±25.4	234.7±56.4
	標準製剤(錠剤、80mg)	1.09±0.19	35.5±18.2	115.1±22.3	221.8±51.0

(Mean±S.D.)





		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
水なし	AUC <sub>t</sub>	log (0.97)	log (0.92) ~ log (1.03)
	Cmax	log (1.02)	log (0.96) ~ log (1.08)
水あり	AUC <sub>t</sub>	log (1.05)	log (1.00) ~ log (1.11)
	Cmax	log (1.03)	log (0.99) ~ log (1.08)

血漿中濃度ならびに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。

4) 中毒域

該当資料なし

5) 食事・併用薬の影響

吸収速度や吸収量に対し、食事による臨床上的有意な影響はなかった。<sup>15)</sup>

VIII. -7. 参照

VII. 薬物動態に関する項目

6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

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) バイオアベイラビリティ

VII. -1. -3) 参照

4) 消失速度定数

●ビカルタミド錠80mg「サワイ」

ビカルタミド錠80mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(ビカルタミドとして80mg)空腹時単回経口投与した場合の、(R)-ビカルタミドの消失速度定数<sup>9,12)</sup>

$0.006 \pm 0.002 \text{hr}^{-1}$

●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」

ビカルタミド錠OD80mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(ビカルタミドとして80mg)空腹時単回経口投与した場合の、(R)-ビカルタミドの消失速度定数<sup>13,14)</sup>

[水なし] $0.006 \pm 0.001 \text{hr}^{-1}$ 、[水あり] $0.006 \pm 0.001 \text{hr}^{-1}$

5) クリアランス

該当資料なし

6) 分布容積

該当資料なし

7) 血漿蛋白結合率

約96%<sup>15)</sup>

3. 吸収

経口投与後、よく吸収される。<sup>15)</sup>

4. 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

5. 代謝 .....

1) 代謝部位及び代謝経路

肝臓でほぼ完全に代謝を受ける。

光学異性体R体(活性体)はグルクロン酸抱合されるが、大部分は酸化されて不活性な代謝物になった後、グルクロン酸抱合される。<sup>15)</sup>

2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

主として肝代謝酵素CYP3A4を阻害する。

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

VII. -5. -1) 参照

5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

6. 排泄 .....

1) 排泄部位及び経路

未変化体と代謝物のグルクロン酸抱合体が尿及び糞中に排泄される。<sup>15)</sup>

2) 排泄率

該当資料なし

3) 排泄速度

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

7. トランスポーターに関する情報.....

該当資料なし

8. 透析等による除去率.....

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……………  
該当しない

2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)……………

**【禁忌】(次の患者には投与しないこと)**

- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2) 小児[本剤の薬理作用に基づき、男子小児の生殖器官の正常発育に影響を及ぼす恐れがある。また、本剤の毒性試験(ラット)において、雌性ラットで子宮の腫瘍性変化が認められている。]
- 3) 女性[本剤の毒性試験(ラット)において、子宮の腫瘍性変化及び雄児の雌性化が報告されている。]

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由……………  
V. -1. 参照

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由……………  
V. -2. 参照

5. 慎重投与内容とその理由……………

**慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)**

肝障害のある患者[本剤は肝臓でほぼ完全に代謝を受けるため、定常状態時の血中濃度が高くなる可能性がある。]

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法……………

**重要な基本的注意**

- 1) 外国の臨床試験において、ビカルタミド投与例でビカルタミドとの関連性が否定できなかった前立腺癌以外の死亡例が報告されている。そのうち心・循環器系疾患による死亡は9%未満であり、その主な死因は心不全、心筋梗塞、脳血管障害等であった。これら外国の臨床試験で報告された心・循環器系疾患による死亡率は、対照の去勢術群(16%未満)より低く、高齢者で一般に予期される死亡率の範囲内であったが、本剤を投与する場合は十分に観察を行い、慎重に投与すること。
- 2) 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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

7. 相互作用

本剤は、主として肝代謝酵素CYP3A4を阻害する。

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

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
クマリン系抗凝血薬 ワルファリン等	クマリン系抗凝血薬の作用を増強するおそれがある。 プロトロンビン時間を測定する、又は、トロンボテストを実施するなど、血液凝固能検査等出血管理を十分に行いつつ、凝固能の変動に注意し、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。	<i>in vitro</i> 試験で蛋白結合部位においてワルファリンと置換するとの報告がある。
トルブタミド	トルブタミドの作用を増強するおそれがある。 但し、相互作用に関する報告症例はない。	本剤は、 <i>in vitro</i> 試験でトルブタミドの代謝を阻害した。
デキストロメトルファン	デキストロメトルファンの作用を増強するおそれがある。 但し、相互作用に関する報告症例はない。	本剤は、 <i>in vitro</i> 試験でデキストロメトルファンの代謝を阻害した。
主にCYP3A4によって代謝される薬物 カルバマゼピン シクロスポリン トリアゾラム 等	主にCYP3A4によって代謝される薬物の作用を増強するおそれがある。 但し、相互作用に関する報告症例はない。	本剤は、 <i>in vitro</i> 試験でCYP3A4によるテストステロン6β-水酸化酵素活性を阻害した。

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。

2) 重大な副作用と初期症状

1) 重大な副作用(頻度不明)  
 (1) 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸：劇症肝炎、AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、γ-GTP、LDHの上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、定期的な肝機能検査の実施を考慮するとともに、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。

(2)白血球減少、血小板減少：白血球減少、血小板減少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。
(3)間質性肺炎：間質性肺炎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。
(4)心不全、心筋梗塞：心不全、心筋梗塞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。

3) その他の副作用

2) その他の副作用	
	頻度不明
内 分 泌	乳房腫脹、乳房圧痛、ほてり
生 殖 器	勃起力低下
肝 臓	AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇、 $\gamma$ -GTP上昇、LDH上昇
泌 尿 器	腎機能障害(クレアチニン上昇、BUN上昇)、血尿、夜間頻尿
皮 膚	そう痒、発疹、発汗、皮膚乾燥、脱毛、多毛、光線過敏症
精 神 神 経 系	性欲減退、頭痛、めまい、不眠、抑うつ状態、傾眠
循 環 器	心電図異常
消 化 器	便秘、食欲不振、下痢、悪心、嘔吐、口渇、消化不良、鼓腸放屁、腹痛
筋・骨格系	胸痛、骨盤痛
過 敏 症	血管浮腫、蕁麻疹
そ の 他	貧血、浮腫、総コレステロール上昇、中性脂肪上昇、倦怠感、無力症、疲労、高血糖、体重増加・減少、さむけ

4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

ビカルタミド製剤の副作用が以下のとおり報告されている。

副作用発現率は24.2% (951/3,927)であり、主な副作用は乳房腫脹5.4%、乳房圧痛4.9%、AST(GOT)上昇4.1%、ALT(GPT)上昇3.8%等であった。<sup>2)</sup>

5) 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

6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

**【禁忌】(次の患者には投与しないこと)**

1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

副作用	
2) その他の副作用	
	頻度不明
皮 膚	そう痒、発疹、発汗、皮膚乾燥、脱毛、多毛、光線過敏症
過 敏 症	血管浮腫、蕁麻疹

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

9. 高齢者への投与

他社の臨床試験成績から、高齢者と非高齢者において血漿中濃度及び副作用の発現に差はみられていない。しかし、一般に高齢者では、心・循環器系の機能が低下していることが多く、心・循環器系の有害事象の発現頻度が若年層より高いため、高齢者への投与の際には患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

該当しない

11. 小児等への投与

該当しない

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

- 1) 服用時(OD錠のみ) :
- (1) OD錠は舌の上に乗せて唾液を浸潤させ舌で軽くつぶすことにより崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。
  - (2) OD錠は寝たまゝの状態では、水なしで服用させないこと。
- 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報告されている)

15. その他の注意

外国において、呼吸困難が発現したとの報告がある。

16. その他



---

## 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」参照)
  
  - 2) 副次的薬理試験  
該当資料なし
  
  - 3) 安全性薬理試験  
該当資料なし
  
  - 4) 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) 生殖発生毒性試験  
VIII. - 2. 参照
  
  - 4) 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

	規制区分
製剤	劇薬、処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
有効成分	劇薬

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年

3. 貯法・保存条件

- ビカルタミド錠80mg「サワイ」  
室温保存
- ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」  
室温保存  
開封後は湿気を避けて保存すること

4. 薬剤取扱い上の注意点

1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当しない

2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

くすりのしおり：有り

VIII. -14. 参照

### ビカルタミド錠80mg「サワイ」を お飲みになる患者さんへ

このお薬は、前立腺に対する男性ホルモンの働きをおさえる作用があります。

**飲み方について**


1日1回1錠を、決められた時間に、コップ1杯くらいの水またはぬるま湯で服用してください。

**？ 飲み忘れたときは**

気がついたときにできるだけ早く1回分を服用してください。次の服用時間が近い場合は、1回分とばして、次の時間に1回分を服用してください。2回分を一度に飲まないようにしてください。

**？ 間違っても多く飲んだときは**

すぐに医師または薬剤師にご相談ください。



自分の判断でお薬を飲むのを止めないようにしてください。

### 注意すべき副作用について

起こりやすい副作用として、「乳房の痛み」「ほてり」「性欲の低下」「勃起障害」などがあります。このような症状に気づいたら、医師または薬剤師にお知らせください。

まれに以下のような副作用が起きることがあります。症状があらわれたら、すぐに医師の診察を受けてください。

<p>からだがだるい、かゆみ、吐き気、食欲不振、発熱、発疹、皮膚や白目が黄色くなる</p> <p style="text-align: center;"><b>肝機能障害・黄疸</b></p> <p><small>※定期的に肝機能検査をする必要があります。</small></p> 	<p>のどの痛み、発熱、歯ぐきや鼻からの出血、手足の皮下出血(青あざ)</p> <p style="text-align: center;"><b>白血球や血小板の減少</b></p> 
<p>頭痛、息苦しい、発熱、から咳</p> <p style="text-align: center;"><b>間質性肺炎</b></p> 	<p>急激な胸の痛みや圧迫感、冷や汗、息切れ</p> <p style="text-align: center;"><b>心筋梗塞、心不全</b></p> 

GU492101PV01
2012年6月10日

**ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」**  
**をお飲みになる患者さんへ**

このお薬は、前立腺に対する男性ホルモンの働きをおさえる作用があります。

**飲み方について**  
 1日1回1錠を、決められた時間に服用してください。

**このお薬は、口の中で速やかに溶けます**

○水なしで飲むことができます。唾液を含ませ舌で軽く押しつぶして、唾液と一緒に飲みこんでください。ただし、寝たままの状態では、水なしでは飲まないようにしてください。  
 ○普通のお薬と同じように水またはぬるま湯で飲むこともできます。  
 ○どちらの飲み方でも、効きめは変わりません。

**? 飲み忘れたときは**  
 気がついたときにできるだけ早く1回分を服用してください。次の服用時間が近い場合は、1回分とはして、次の時間に1回分を服用してください。  
 2回分を一度に飲まないようにしてください。

**? 間違えて多く飲んだときは**  
 すぐに医師または薬剤師にご相談ください。

**自分の判断でお薬を飲むのを止めないようにしてください。**

**注意すべき副作用について**

起こりやすい副作用として、「乳房の痛み」「はてり」「性欲の低下」「勃起障害」などがあります。  
 このような症状に気づいたら、医師または薬剤師にお知らせください。

まれに以下のような副作用が起きることがあります。症状があらわれたら、すぐに医師の診察を受けてください。

からだがだるい、かゆみ、吐き気、食欲不振、発熱、発疹、皮膚や白目が黄色くなる <b>肝機能障害・黄疸</b> <small>*定期的に肝機能検査をする必要があります。</small>	のどの痛み、発熱、歯ぐきや鼻からの出血、手足の皮下出血(青あざ) <b>白血球や血小板の減少</b>
頭痛、息苦しい、発熱、から咳 <b>間質性肺炎</b>	急激な胸の痛みや圧迫感、冷や汗、息切れ <b>心筋梗塞、心不全</b>

GUBICA02PV01 沢井製薬株式会社 2016年6月9日

注)当説明書は変更・改訂される場合があります。

3) 調剤時の留意点について

ビカルタミドは、日本病院薬剤師会監修「抗悪性腫瘍剤の院内取扱い指針 抗がん薬調製マニュアル 第3版」の抗がん薬の取扱い基準により、「危険度 I」に分類されている。

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

- ビカルタミド錠80mg「サワイ」  
 PTP：30錠(10錠×3)、100錠(10錠×10)
- ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」  
 PTP：30錠(10錠×3)、100錠(10錠×10)

7. 容器の材質

- ビカルタミド錠80mg「サワイ」  
 PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔  
 [ピロー]ポリエチレンフィルム
- ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」  
 PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニリデンフィルム、アルミ箔  
 [ピロー]アルミラミネートフィルム

X. 管理的事項に関する項目

8. 同一成分・同効薬 .....  
同一成分：カソデックス錠80mg/OD錠80mg  
同効薬：フルタミド、エンザルタミド、クロルマジノン酢酸エステル等
9. 国際誕生年月日 .....  
該当しない
10. 製造販売承認年月日及び承認番号.....  
●ビカルタミド錠80mg「サワイ」  
製造販売承認年月日：2009年1月14日、承認番号：22100AMX00114000  
●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」  
製造販売承認年月日：2016年2月15日、承認番号：22800AMX00215000
11. 薬価基準収載年月日 .....  
●ビカルタミド錠80mg「サワイ」  
2009年5月15日  
●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」  
2016年6月17日
12. 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
13. 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
14. 再審査期間 .....  
該当しない
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 .....  
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。

## 16. 各種コード .....

品名	HOT番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算 コード
ビカルタミド錠80mg 「サワイ」	119176901	4291009F1136	620009416
ビカルタミドOD錠 80mg「サワイ」	124981101	4291009F2078	622498101

## 17. 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。

---

## XI . 文献

---

1. 引用文献 .....
- 1)高折修二他監訳, グッドマン・ギルマン薬理書, 第12版, 廣川書店, 2013, p. 2294-2301.
  - 2)JAPAN DRUGS編集委員会編, JAPAN DRUGS 日本医薬品総覧, 2008~2009年版, メディカルレビュー社, 2008, p. 1439-1441.
  - 3)田中祥之他, 医学と薬学, **63**(1), 45(2010).
  - 4)~7)沢井製薬 社内資料[安定性試験]
  - 8)沢井製薬(株) 社内資料[配合変化試験成績]
  - 9)水山和之他, 診療と新薬, **46**(3), 273(2009).
  - 10)~11)沢井製薬 社内資料[溶出試験]
  - 12)沢井製薬 社内資料[生物学的同等性試験]
  - 13)竹内譲他, 診療と新薬, **53**(4), 299(2016).
  - 14)沢井製薬 社内資料[生物学的同等性試験]
  - 15)PHYSICIANS' DESK REFERENCE, 60<sup>th</sup> EDITION, Thomson PDR, 2006, p. 670-672.
2. その他の参考文献 .....

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....
2. 海外における臨床支援情報 .....
- 該当資料なし

---

## XIII. 備考

---

その他の関連資料 .....

配合変化試験成績<sup>8)</sup>

●ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」

<配合方法>

ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」(以下、当社製剤)を食品・飲料と配合し、性状(外観、におい、再分散性)を観察し、含量を測定した。

含量は配合直後のビカルタミド量を100%とし、( )に表示量に対する含有率を%で示した。

(保存条件)貯法：プラスチック容器・密栓、25℃60%RH、散光下

期間：24時間

再分散性：試験液を入れたプラスチック容器を5秒間倒立させ、次いで5秒間正立する。この操作を1回として、懸濁液が均質に分散するまでの回数が9回までは良好、10回以上は不良とした。

※2016年6月作成の配合変化試験成績を掲載した。

# ビカルタミドOD錠80mg「サワイ」 配合変化試験成績

分類	配合品		当社製剤 配合量	試験項目	配合結果				
	品名 (配合前の外観、におい)	配合量			配合直後	1時間後	3時間後	6時間後	24時間後
食 品 ・ 飲 料	サントリー南アルプスの天然水  外観：無色澄明の液 におい：なし	10mL	1錠	外観	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁
				におい	なし	なし	なし	なし	なし
				再分散性	良好	良好	良好	良好	良好
				含量(%)	100.0(97.6)	-	-	-	100.6
	カルピスウォーター  外観：白色の液 におい：甘酸っぱいにおい	10mL	1錠	外観	白色	白色	白色	白色	白色
				におい	甘酸っぱいにおい	甘酸っぱいにおい	甘酸っぱいにおい	甘酸っぱいにおい	甘酸っぱいにおい
				再分散性	良好	良好	良好	良好	良好
				含量(%)	100.0(96.6)	-	-	-	102.2
	パンホーテンミルクココア  外観：茶褐色の液 におい：ココアのおい	10mL	1錠	外観	茶褐色	茶褐色	茶褐色	茶褐色	茶褐色
				におい	ココアのおい	ココアのおい	ココアのおい	ココアのおい	ココアのおい
				再分散性	良好	良好	良好	良好	良好
				含量(%)	100.0(98.5)	-	-	-	103.2
	ポカリスエット  外観：微白色の液 におい：芳香あり	10mL	1錠	外観	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁
				におい	芳香あり	芳香あり	芳香あり	芳香あり	芳香あり
				再分散性	良好	良好	良好	良好	良好
				含量(%)	100.0(98.2)	-	-	-	98.6
	Doleオレンジジュース100%  外観：黄色の液 におい：オレンジのおい	10mL	1錠	外観	黄色懸濁	黄色懸濁	黄色懸濁	黄色懸濁	黄色懸濁
				におい	オレンジのおい	オレンジのおい	オレンジのおい	オレンジのおい	オレンジのおい
再分散性				良好	良好	良好	良好	良好	
含量(%)				100.0(97.7)	-	-	-	101.4	
明治おいしい牛乳  外観：白色の液 におい：牛乳のおい	10mL	1錠	外観	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁	
			におい	牛乳のおい	牛乳のおい	牛乳のおい	牛乳のおい	牛乳のおい	
			再分散性	良好	良好	良好	良好	良好	
			含量(%)	100.0(97.0)	-	-	-	101.0	
らくらく服薬ゼリー  外観：無色のゼリー状 におい：レモン様のおい	10g	1錠	外観	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁	白色懸濁	
			におい	レモン様のおい	レモン様のおい	レモン様のおい	レモン様のおい	レモン様のおい	
			含量(%)	100.0(99.7)	-	-	-	97.3	









