

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2008に準拠して作成

前立腺癌治療剤

ビカルタミド錠 80mg「サンド」

Bicalutamide Tablets 80mg [SANDOZ]

剤形	フィルムコート錠
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	ビカルタミド錠80mg「サンド」： 1錠中にビカルタミド80mgを含有する。
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 薬価基準収載年月日：2009年 5月15日 発売年月日：2009年 5月15日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売：サンド株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	サンド株式会社 カスタマーケアグループ TEL 0120-982-001 FAX 03-6257-3633 受付時間：9：00～17：00（土・日・祝祭日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.sandoz.jp/medical/index.html

本 IF は 2020 年 3 月改訂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。

IF利用の手引きの概要 ー日本病院薬剤師会ー

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年が経過した現在、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新たなIF記載要領が策定された。

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2008」（以下、「IF記載要領2008」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2008」は、平成21年4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2008」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2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、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、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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があり、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、今後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。

(2008年9月)

目 次

I. 概要に関する項目	1
1. 開発の経緯	1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1
II. 名称に関する項目	2
1. 販売名	2
2. 一般名	2
3. 構造式又は示性式	2
4. 分子式及び分子量	2
5. 化学名（命名法）	3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3
7. CAS登録番号	3
III. 有効成分に関する項目	4
1. 物理化学的性質	4
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4
3. 有効成分の確認試験法	4
4. 有効成分の定量法	5
IV. 製剤に関する項目	6
1. 剤形	6
2. 製剤の組成	6
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6
4. 製剤の各種条件下における安定性	7
5. 調製法及び溶解後の安定性	8
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	8
7. 溶出性	8
8. 生物学的試験法	11
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	11
10. 製剤中の有効成分の定量法	11
11. 力価	11
12. 混入する可能性のある夾雑物	11
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報	11
14. その他	11

V. 治療に関する項目	12
1. 効能又は効果	12
2. 用法及び用量	12
3. 臨床成績	12
VI. 薬効薬理に関する項目	14
1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	14
2. 薬理作用	14
VII. 薬物動態に関する項目	15
1. 血中濃度の推移・測定法	15
2. 薬物速度論的パラメータ	17
3. 吸収	17
4. 分布	18
5. 代謝	18
6. 排泄	19
7. 透析等による除去率	19
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	20
1. 警告内容とその理由	20
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	20
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	20
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	20
5. 慎重投与内容とその理由	20
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	21
7. 相互作用	22
8. 副作用	23
9. 高齢者への投与	25
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	25
11. 小児等への投与	25
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	25
13. 過量投与	25
14. 適用上の注意	25
15. その他の注意	25
16. その他	25
IX. 非臨床試験に関する項目	26
1. 薬理試験	26
2. 毒性試験	26

X. 管理的事項に関する項目	27
1. 規制区分	27
2. 有効期間又は使用期限	27
3. 貯法・保存条件	27
4. 薬剤取扱い上の注意点	27
5. 承認条件等	27
6. 包装	27
7. 容器の材質	27
8. 同一成分・同効薬	28
9. 国際誕生年月日	28
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	28
11. 薬価基準収載年月日	28
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	28
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	28
14. 再審査期間	28
15. 投与期間制限医薬品に関する情報	28
16. 各種コード	29
17. 保険給付上の注意	29
X I. 文献	30
1. 引用文献	30
2. その他の参考文献	30
X II. 参考資料	31
1. 主な外国での発売状況	31
2. 海外における臨床支援情報	31
X III. 備考	32
その他の関連資料	32

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ビカルタミドは非ステロイド性で、標的臓器においてアンドロゲンの受容体への結合を競合的に阻害することで抗アンドロゲン作用を示し、前立腺癌に対する効果が認められている。一般に非ステロイド性抗アンドロゲン剤は抗ゴナドトロピン作用を持たないため、血清テストステロン濃度に対する影響が少なく、ステロイド性の薬剤に比べて性欲減退や性機能障害を引き起こしにくいとされている。

ビカルタミド錠 80mg「サンド」は、後発医薬品として開発を企画し、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を行い、平成 21 年 1 月に製造販売承認を取得し、平成 21 年 5 月に上市した。（薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき承認申請）

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- ・本剤はビカルタミドを有効成分とするフィルムコート錠である。
- ・本剤は 1 日 1 回 1 錠投与の非ステロイド性の抗アンドロゲン剤である。
- ・前立腺癌に対して有用性が認められている。
- ・主な副作用として、乳房腫脹、乳房圧痛、ほてり等が、また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、間質性肺炎が報告されている（頻度不明）。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ビカルタミド錠 80mg 「サンド」

(2) 洋名

Bicalutamide Tablets 80mg [SANDOZ]

(3) 名称の由来

成分名を名称の一部とした。

(一般名＋剤形＋含量＋「社名」)

2. 一般名

(1) 和名 (命名法)

ビカルタミド (JAN)

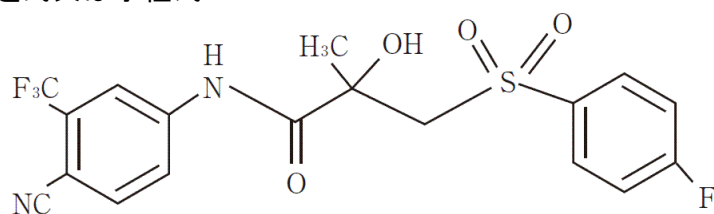
(2) 洋名 (命名法)

Bicalutamide (JAN)

(3) ステム

「不明」

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₁₈H₁₄F₄N₂O₄S

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

「該当資料なし」

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～灰白色の粉末である。

(2) 溶解性

ジメチルアセトアミドに極めて溶けやすく、アセトンに溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、水にほとんど溶けない。
アセトンに溶解した液は、旋光性を示さない。

(3) 吸湿性

「該当資料なし」

(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

「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

(1) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

(2) 粉末 X 線回折測定法

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、規格及び性状

ビカルタミド錠 80mg「サンド」：白色円形のフィルムコート錠である。

	外形			直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
	表面	裏面	側面			
ビカルタミド錠 80mg「サンド」				8.0	4.4	229

(2) 製剤の物性

「該当資料なし」

(3) 識別コード

(本体、PTP) SZ094

(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「サンド」：1錠中 ビカルタミド 80mg

(2) 添加物

乳糖水和物、デンプングリコール酸ナトリウム、ポビドン、トウモロコシデンプン、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、マクロゴール 400、ポリソルベート 80

(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

「該当資料なし」

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) PTP 包装品の安定性試験¹⁾

ビカルタミド錠 80mg「サンド」を PTP 包装（ポリクロロトリフルオロエチレン・ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔）したものについて、40℃75%RH の保存条件下で、6 ヶ月間保存し、安定性試験を行った。その結果、定量試験等全ての規格に適合し、通常の市場流通下において 3 年間安定な製剤であることが推測された。

ビカルタミド錠 80mg「サンド」PTP 包装品の安定性

[保存条件：40±1℃、75±5%RH、保存期間：6 ヶ月間、保存形態：PTP 包装]

試験項目	結果	
	イニシャル	6 ヶ月後
性状	白色円形のフィルムコート錠	適合
確認試験	適合	適合
純度試験	適合	適合
製剤均一性	適合	適合
溶出性	適合	適合
定量法	100.3%	100.4%

(2) 無包装下における安定性試験

ビカルタミド錠 80mg「サンド」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（定量、純度、質量、硬度、色調、溶出試験）を行った。その結果、いずれの条件下でも大きな変化は認められなかった。

ビカルタミド錠 80mg「サンド」無包装下の安定性

試験項目	イニシャル	温度 (40℃3 ヶ月)	湿度 (25℃75%RH 3 ヶ月)	光 (総照射量 60 万 lux・hr)
定量試験 (%)※	100.0	99.4	100.0	100.0
純度試験	適合	適合	適合	適合
質量 (mg)	227.0	226.2	236.0	230.5
硬度 (Kp)	10.7	11.0	13.0	10.9
溶出試験 (%)	適合	適合	適合	適合
色調	-	変化なし	変化なし	変化なし

※：イニシャルを 100 としたときの含有率 (%)

[定量試験において計算上 100%を超えるものは一律 100.0%と表記した]

5. 調製法及び溶解後の安定性

「該当資料なし」

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

「該当しない」

7. 溶出性

〈溶出挙動における同等性〉

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日付医薬審第487号」
（平成13年5月31日付医薬審発第786号及び平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号により一部改正）

〈試験方法及び判定基準〉

(1) 試験方法：日本薬局方（JP15）一般試験法溶出試験法第2法（パドル法）

(2) 試験条件

試験液量：900mL

温度：37℃±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方（JP15）溶出試験第1液

pH4.0 薄めた McIlvaine 緩衝液

pH6.8 日本薬局方（JP15）溶出試験第2液

※各 pH とも 1% Tween80 を添加した場合を含む

水 日本薬局方精製水

回転数：50回転（pH1.2、pH4.0、pH6.8 [各 pH とも 1% Tween80 を添加した場合を含む]、水）

100回転（pH6.8 [1% Tween80 添加]）

試験時間：標準製剤の平均溶出率が 85%以上の時点で終了とする。

(3) 判定基準

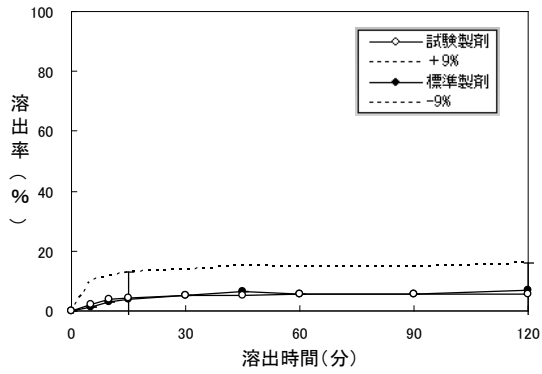
適合^{※1}：標準製剤の平均溶出率±9%（標準製剤の平均溶出率が規定時間以内に 85%に達しないため、標準製剤の平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点と規定された時点で判定）

適合^{※2}：標準製剤の平均溶出率±12%（標準製剤の平均溶出率が規定時間以内に 50%以上 85%に達しないため、標準製剤の平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す時点と規定された時点で判定）

適合^{※3}：標準製剤の平均溶出率±15%（標準製剤の平均溶出率が規定時間以内に 85%に達するため、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近で判定）

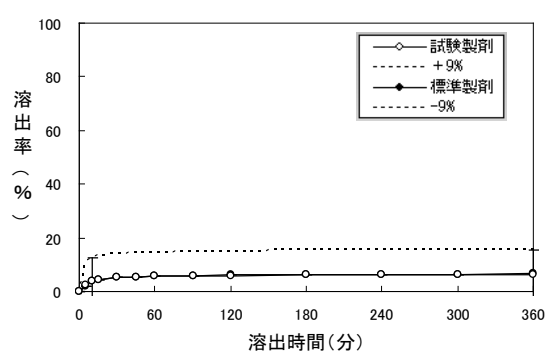
ビカルタミド錠 80mg 「サンド」 の溶出試験結果

50回転(pH1.2)



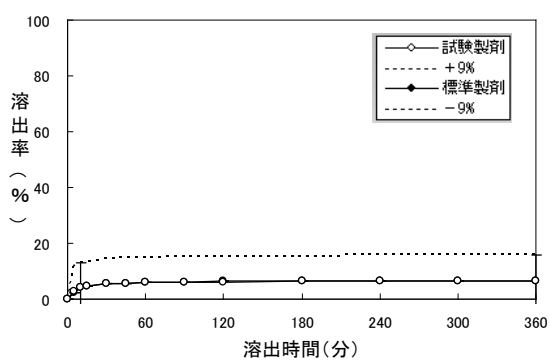
(n=12)

50回転(pH4.0)



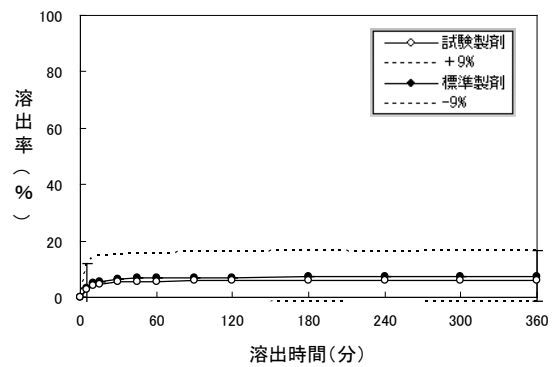
(n=12)

50回転(pH6.8)



(n=12)

50回転(水)



(n=12)

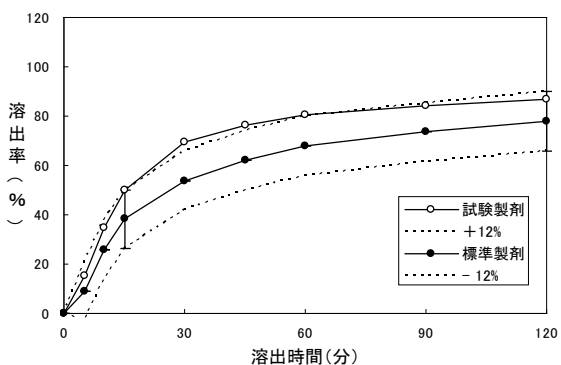
表 溶出挙動における類似性 (試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				標準製剤	ビカルタミド錠 80mg 「サンド」	判定
方法	回転数	試験液	採取時間	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
パドル法	50 回転	pH1.2	15 分	3.9	4.5	適合 ^{※1}
			120 分	7.1	5.8	適合 ^{※1}
		pH4.0	10 分	3.7	3.8	適合 ^{※1}
			360 分	6.6	6.2	適合 ^{※1}
		pH6.8	10 分	4.1	4.1	適合 ^{※1}
			360 分	6.7	6.5	適合 ^{※1}
		水	5 分	3.2	2.9	適合 ^{※1}
			360 分	7.5	6.2	適合 ^{※1}

(n=12)

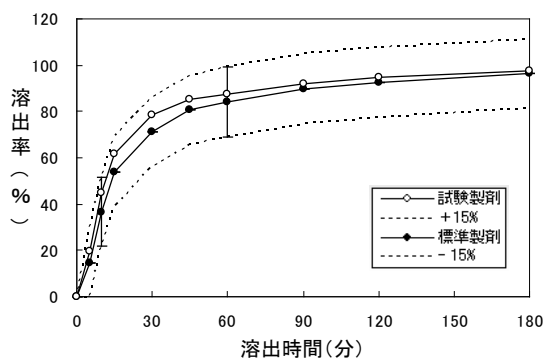
ビカルタミド錠 80mg 「サンド」の溶出試験結果 (1% Tween80 添加)

50回転 (pH1.2 (1% Tween80添加))



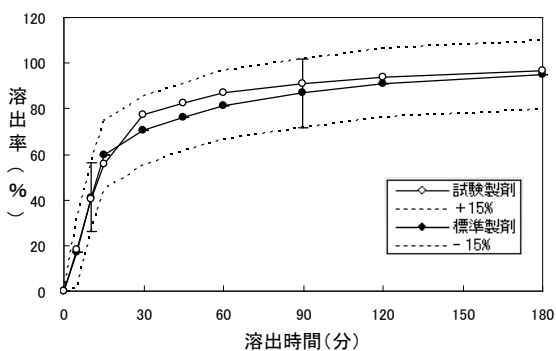
(n=12)

50回転 (pH4.0 (1% Tween80添加))



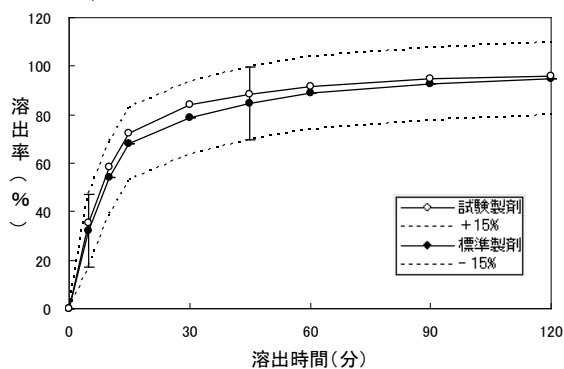
(n=12)

50回転 (pH6.8 (1% Tween80添加))



(n=12)

100回転 (pH6.8 (1% Tween80添加))



(n=12)

表 溶出挙動における類似性

(1% Tween80 を添加した試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				標準製剤	ビカルタミド錠 80mg 「サンド」	判定
方法	回転数	試験液	採取 時間	平均溶出率 (%)	平均溶出率 (%)	
パドル法	50 回転	pH1.2 (1% Tween80)	15 分	38.2	49.9	適合 ^{※2}
			120 分	78.0	86.9	適合 ^{※2}
		pH4.0 (1% Tween80)	10 分	36.7	44.9	適合 ^{※3}
			60 分	84.1	87.6	適合 ^{※3}
	pH6.8 (1% Tween80)	10 分	41.1	40.5	適合 ^{※3}	
		90 分	86.8	91.1	適合 ^{※3}	
100 回転	pH6.8 (1% Tween80)	5 分	32.1	35.1	適合 ^{※3}	
		45 分	84.9	88.4	適合 ^{※3}	

(n=12)

8. 生物学的試験法

「該当資料なし」

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

本剤は力価表示に該当しない。

12. 混入する可能性のある夾雑物

「該当資料なし」

13. 治療上注意が必要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、成人にはビカルタミドとして 80mg を 1 日 1 回、経口投与する。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ（2009 年 4 月以降承認品目）

「該当しない」

(2) 臨床効果

「該当資料なし」

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

「該当資料なし」

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

「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」

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）

「該当しない」

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

フルタミド（非ステロイド性抗アンドロゲン）

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

ビカルタミドは、アンドロゲン受容体（AR）の生理的リガンドを拮抗的に阻害する非ステロイド性抗アンドロゲンである。リガンドの結合とその結果起こる AR の細胞質から核への移行を阻害し、アンドロゲンの効果を抑制する。²⁾

(2) 薬効を裏付ける試験成績

「該当資料なし」

(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・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

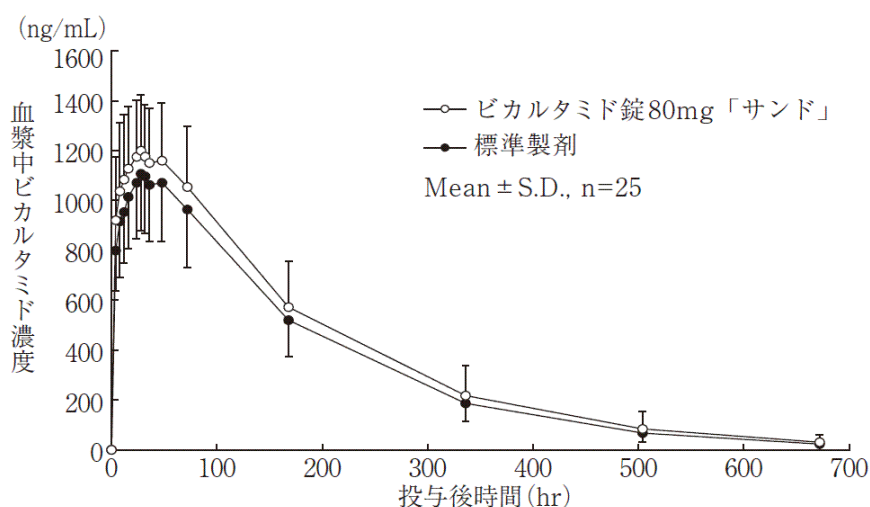
「該当資料なし」

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成 9 年 12 月 22 日付医薬審第 487 号」（平成 13 年 5 月 31 日付医薬審発第 786 号及び平成 18 年 11 月 24 日付薬食審査発第 1124004 号により一部改正）

ビカルタミド錠 80mg「サンド」と標準製剤を、並行群間比較試験法によりそれぞれ 1 錠（ビカルタミド 80mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して、LC/MS/MS 法にて血漿中未変化体濃度を測定し、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、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。³⁾

ビカルタミド錠 80mg「サンド」投与後の血漿中濃度推移



ビカルタミド錠 80mg「サンド」の血中濃度パラメータ

	AUC ₀₋₆₇₂ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	AUC _∞ (ng・hr/mL)	MRT (hr)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ビカルタミド錠 80mg「サンド」	256715.7 ±78161.5	1239.4 ±241.2	264249.3 ±84852.7	149.48 ±28.71	30.9 ±12.2	112.36 ±28.36
標準製剤 (錠剤、80mg)	230285.6 ±57708.8	1135.1 ±234.6	235133.3 ±60144.2	148.58 ±23.78	32.8 ±10.6	108.29 ±20.87

(平均値±標準偏差、n=25)

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。

(4) 中毒域

「該当資料なし」

(5) 食事・併用薬の影響

「該当資料なし」

(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) コンパートメントモデル

「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

「該当資料なし」

(4) 消失速度定数

「該当資料なし」

(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

「該当資料なし」

3. 吸収

「該当資料なし」

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

(2) 代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

「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比率

「該当資料なし」

(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²⁾

尿及び糞中

(2) 排泄率

「該当資料なし」

(3) 排泄速度

「該当資料なし」

7. 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おそれがある。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. 治療に関する項目」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「該当しない」

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、ビカルタミド製剤投与例でビカルタミド製剤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。

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。ただし、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。ただし、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。ただし、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

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

種 類	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、 γ -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	掻痒、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

「該当資料なし」

(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

1) 禁忌 (次の患者には投与しないこと)

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2) 副作用

その他の副作用

血管浮腫、蕁麻疹等の過敏症があらわれることがある。

9. 高齢者への投与

ビカルタミド製剤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

「該当資料なし」

11. 小児等への投与

「該当資料なし」

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

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。]

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

「該当資料なし」

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
「該当資料なし」

(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

製 剤：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）

有効成分：ピカルタミド 劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（包装に表示）

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 14. 適用上の注意」を参照すること

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 14. 適用上の注意」を参照すること

5. 承認条件等

「該当しない」

6. 包装

ピカルタミド錠 80mg 「サンド」：30錠（PTP）

100錠（PTP）

7. 容器の材質

PTP包装：ポリクロロトリフルオロエチレン・ポリ塩化ビニルフィルム-アルミニウム箔、紙箱

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：カソデックス錠 80mg（アストラゼネカ）

同 効 薬：フルタミド

9. 国際誕生年月日

「不明」

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

ビカルタミド錠 80mg 「サンド」

製造販売承認年月日：2009 年 1 月 14 日

承 認 番 号：22100AMX00282000

11. 薬価基準収載年月日

2009 年 5 月 15 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

本剤は厚生労働省告示第 97 号（平成 20 年 3 月 19 日付）による「投与期間に上限の設けられている医薬品」に該当しない。

16. 各種コード

販売名	包装単位	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 「サンド」	30錠 (PTP)	1191318010101	4291009F1012	622847300
	100錠 (PTP)	1191318010102	(4291009F1144)	(620009417)

※コードで二段記載の場合は、上段が統一銘柄コード、下段が個別銘柄コードを示す。

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) ビカルタミド錠 80mg 「サンド」の安定性試験に関する資料
(サンド株式会社社内資料)
- 2) グッドマン・ギルマン薬理書 [下] 第 12 版 (廣川書店) 2297 (2011)
- 3) ビカルタミド錠 80mg 「サンド」の生物学的同等性試験に関する資料
(サンド株式会社社内資料)

2. その他の参考文献

「特になし」

X II . 参考資料

1. 主な外国での発売状況

カナダ、ドイツ、イギリス等

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

製造販売

サンド株式会社

東京都港区虎ノ門1-23-1