2025 年 12 月改訂（第 2 版）

日本標準商品分類番号　874291

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「ニプロ」

Abiraterone Acetate Tablets

剤形	錠剤（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 250mg
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：2025 年 12 月 5 日 販売開始年月日：2025 年 12 月 5 日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：ニプロ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社　医薬品情報室 TEL:0120-226-898　FAX:050-3535-8939 医療関係者向けホームページ： https://www.nipro.co.jp/

本 IF は 2025 年 10 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

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。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要　―日本病院薬剤師会―

（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，IF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IFの位置付け，IF記載様式，IF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IF記載要領の改訂を行ってきた．

IF記載要領2008以降，IFはPDF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IFが速やかに提供されることとなった．最新版のIF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IF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・検討している．

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ，「IF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．ＩＦとは

IF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．

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF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，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．

IF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．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のIF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IFを作成・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利用者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，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，IF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

IF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. IF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IF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，IF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

略語表

略語	略語内容
ALP	alkaline phosphatase：アルカリホスファターゼ
ALT	alanine aminotransferase：アラニンアミノトランスフェラーゼ（=GPT）
AST	aspartate aminotransferase：アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ（=GOT）
AUC	area under curve：血中濃度－時間曲線下面積
CK（CPK）	creatine kinase：クレアチンキナーゼ （creatine phosphokinase：クレアチンホスホキナーゼ）
C_{max}	最高血漿中濃度
CYP	cytochrome P450（シトクロム P450）
LC/MS/MS	液体クロマトグラフィー/タンデムマススペクトロメトリー
LDH	lactate dehydrogenase：乳酸デヒドロゲナーゼ、乳酸脱水素酵素
OATP	organic anion transporting polypeptide：有機アニオントランスポーター
P-gp	p-glycoprotein（P 糖蛋白）
PSA	prostate-specific antigen：前立腺特異抗原
RMP	Risk Management Plan：医薬品リスク管理計画
S.D.	standard deviation：標準偏差
$t_{1/2}$	消失半減期
T_{max}	Time to reach maximum concentration in plasma：最高血漿中濃度到達時間

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製剤は、前立腺癌治療剤（CYP17 阻害剤）であり、本邦では 2014 年に上市されている。

1 錠中にアビラテロン酢酸エステルを 250mg 含有するアビラテロン酢酸エステル錠 250mg「ニプロ」は、ニプロ株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、長期保存試験、生物学的同等性試験を実施し、2023 年 8 月に承認を取得、2025 年 12 月に販売を開始した。

２．製品の治療学的特性

○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。

○臨床的には、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に有用性が認められている。

○重大な副作用としては、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．8．(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

○錠剤の両面には、「一般名」・「含量」・「屋号」の両面レーザー印字を施した。

○PTP シートの表面には、1 錠ごとに「一般名」・「含量」を表示し、裏面には、1 錠ごとに「一般名」・「含量」・「屋号」・「GS1 コード」を表示した。また、PTP シートの両面に「空腹時服用」を表示した。

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材、最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	無	
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無	
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

該当しない

（２）流通・使用上の制限事項

該当しない

６．ＲＭＰの概要

該当しない

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「ニプロ」

（２）洋　　　名：Abiraterone Acetate Tablets

（３）名称の由来：有効成分であるアビラテロン酢酸エステルに含量を記載し、社名である「ニプロ」を付した。

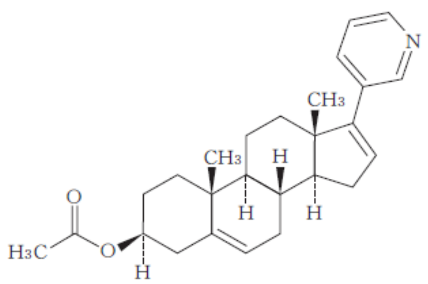
２．一般名

（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）

（３）ステム（stem）：antiandrogens：-terone

３．構造式又は示性式



４．分子式及び分子量

分子式：$C_{26}H_{33}NO_2$

分子量：391.55

５．化学名（命名法）又は本質

17-(Pyridin-3-yl)androsta-5,16-dien-3β-yl acetate（JAN）

６．慣用名，別名，略号，記号番号

該当資料なし

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～微黄白色の粉末である。

（２）溶解性

N-メチルピロリドンには溶けやすく、エタノール（99.5）にはやや溶けやすく、アセトニトリルにはやや溶けにくく、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

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)液体クロマトグラフィー

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

錠剤（フィルムコーティング錠）

（２）製剤の外観及び性状

販売名	性　　状	外形・大きさ		
		直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
アビラテロン酢酸エステル錠250mg「ニプロ」	ピンク色の楕円形のフィルムコーティング錠			
		(長径)15.5 (短径) 6.6	5.0	424

（３）識別コード

該当しない

（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

販売名	有効成分	添　加　剤
アビラテロン酢酸エステル錠250mg「ニプロ」	1錠中 アビラテロン酢酸エステル　250mg	結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ラウリル硫酸ナトリウム、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、マクロゴール4000、酸化チタン、タルク、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ

（２）電解質等の濃度

該当資料なし

（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)]

試験条件：40±1℃、75±5%RH

PTP 包装：包装形態（ポリプロピレン・アルミ箔、アルミピロー、脱酸素剤）

項目及び規格	開始時	1 カ月	3 カ月	6 カ月
性状（ピンク色の楕円形のフィルムコーティング錠である）	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	−	−	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験	適合	−	−	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合
含量（95.0～105.0%）	97.88 99.14 99.08	98.02 99.23 99.11	96.65 97.62 97.85	97.53 98.67 98.67

1 ロット（n=3）、3 ロット

長期保存試験[2)]

試験条件：25±2℃、60±5%RH

PTP 包装：包装形態（ポリプロピレン・アルミ箔、アルミピロー、脱酸素剤）

項目及び規格	開始時	3 カ月	6 カ月	9 カ月	12 カ月	18 カ月	21 カ月	24 カ月	30 カ月	36 カ月
性状（ピンク色の楕円形のフィルムコーティング錠である）	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	−	−	−	適合	適合	−	適合	適合*	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験	適合	−	−	−	−	適合	−	適合	−	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
含量（95.0～105.0%）	97.88 99.14 99.08	97.40 98.25 98.05	98.27 99.50 99.00	98.09 99.03 99.04	97.60 98.76 98.33	98.48 100.18 100.01	97.90 99.36 99.05	98.41 99.19 99.18	98.49 99.10 99.00	97.92 99.48 99.13

1 ロット（n=3）、3 ロット（＊2 ロット）

長期保存試験（25℃、相対湿度60%、36カ月）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確認された。

その他の安定性

『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）』における試験法を参考にし、同評価基準に従い評価した結果は以下の通りである。

なお、アビラテロン酢酸エステル製剤は、『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4版』の抗がん薬の取扱い基準により、「危険度Ⅱ」に分類されている。

（１）無包装状態での安定性[3)]

試験条件：①温度　40℃±2℃、3カ月（保存形態：遮光・気密容器）

②湿度　75%RH±5%RH/25℃±2℃、3カ月（保存形態：遮光・開放）

③光　　120万lx・hr（保存形態：透明・気密容器）

保存条件	外観	含量	硬度 (19.6N以上)	溶出性	参考 純度試験 (類縁物質)
＜開始時＞	ピンク色の楕円形のフィルムコーティング錠	99.64% (適合)	170N (適合)	適合	適合
①温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
②湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
③光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内

試験回数（溶出性：1回、外観・含量・純度試験（類縁物質）：3回、硬度：6回）

（２）アルミピロー開封後の安定性[4)]

試験条件：75%RH±5%RH/40℃±1℃、6カ月（保存形態：PTP包装）

保存条件	外観	含量	硬度 (19.6N以上)	溶出性	参考 純度試験 (類縁物質)
＜開始時＞	ピンク色の楕円形のフィルムコーティング錠	99.64% (適合)	170N (適合)	適合	適合
75%RH±5%RH/40℃±1℃	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	［1カ月］規格内 ［3カ月］規格内 ［4カ月］規格内

					［5カ月］ 規格内 ［6カ月］ 規格外

試験回数（溶出性：1回、外観・含量・純度試験（類縁物質）：3回、硬度：6回）

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（物理化学的変化）

該当資料なし

9．溶出性

溶出挙動における類似性[5)]

(「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日 医薬審第487号､平成13年5月31日一部改正 医薬審発第786号､平成18年11月24日一部改正 薬食審査発第1124004号､平成24年2月29日一部改正 薬食審査発0229第10号及び令和2年3月19日一部改正 薬生薬審発0319第1号」)

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

装置	回転数	試験液	試験液量	温度	製剤の投与数
パドル法	75rpm	pH1.2＝日本薬局方溶出試験第1液	900mL	37±0.5℃	1錠/1ベッセル
	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			
	100rpm	pH1.2＝薄めたMcIlvaineの緩衝液			

判定基準：試験製剤の平均溶出率を、標準製剤の平均溶出率と比較する。

すべての溶出試験条件において、以下の基準に適合するとき、溶出挙動が類似しているとする。

標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合：

以下のいずれかの基準に適合する。

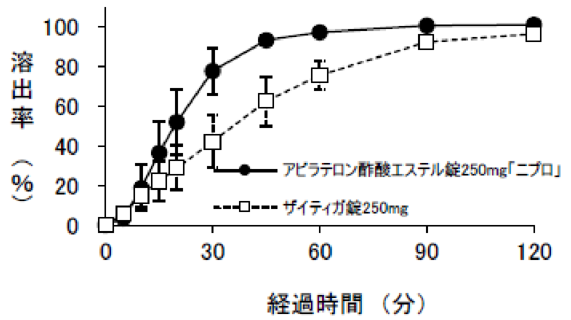
a.規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 85%以上となるとき､標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値は42以上である。

b.規定された試験時間において､標準製剤の平均溶出率が50%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤

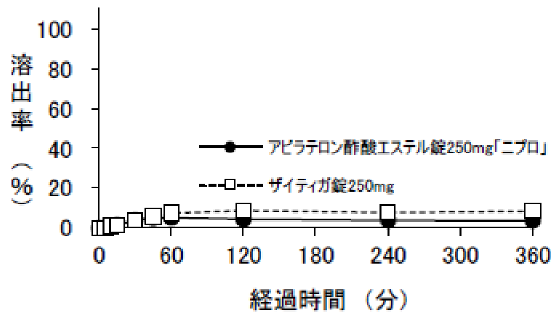
の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 53 以上である。ただし、規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 10%以下の場合、規定された試験時間でのみ評価し、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にある。

試験結果：同等性試験ガイドラインに従ってアビラテロン酢酸エステル錠 250mg「ニプロ」と標準製剤（ザイティガ錠 250mg）の溶出挙動を比較した。その結果、試験液 pH3.0、pH6.8 及び水（50 rpm）では溶出挙動における類似性の判定基準を満たしていたが、試験液 pH1.2（75rpm 及び 100 rpm）では類似性が認められなかった。なお、健康成人男子を対象とした生物学的同等性試験では、両製剤は生物学的に同等であることが確認されている。

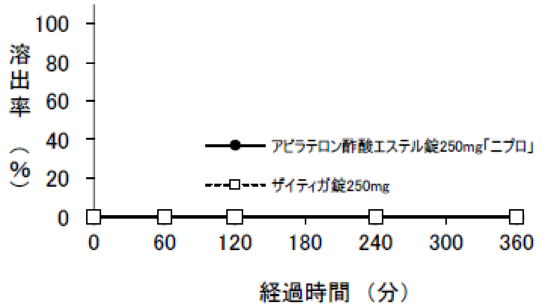
試験液 pH1.2（75rpm）における平均溶出曲線（mean±S.D.、n=12）



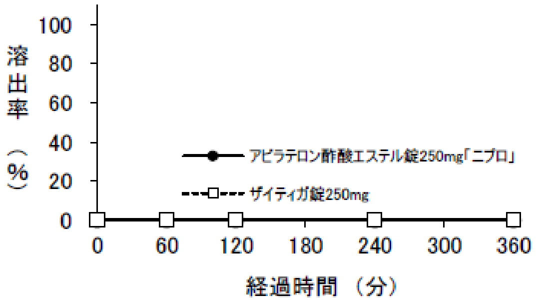
試験液 pH3.0（50rpm）における平均溶出曲線（mean±S.D.、n=12）



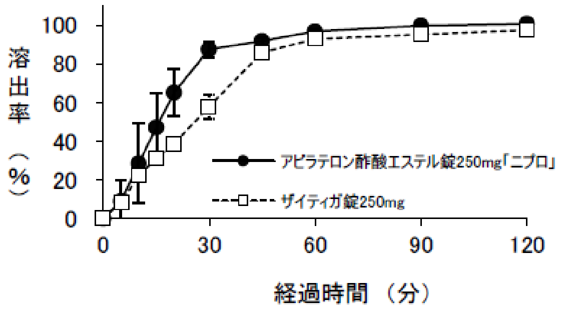
試験液 pH6.8（50rpm）における平均溶出曲線（mean±S.D.、n=12）



試験液 水（50rpm）における平均溶出曲線（mean±S.D.、n=12）



試験液 pH1.2（100rpm）における平均溶出曲線（mean±S.D.、n=12）



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

22. 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

PTP：ポリプロピレン、アルミニウム

アルミピロー：アルミニウム、ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

自動分包機への適合性確認試験[6)]

全ての試験条件において分包した錠剤に割れ欠けは認められなかった。

アビラテロン酢酸エステル製剤は、『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4版』の抗がん薬の取扱い基準により、「危険度Ⅱ」に分類されている。

Ⅴ．治療に関する項目

１．効能又は効果

4. 効能・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・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

6. 用法・用量
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・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。

検査項目	用法・用量変更の目安
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。

7.4 外科的又は内科的去勢術と併用しない場合の有効性及び安全性は確立していない。

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〉

17.1.1 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）[7]。

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。［5.、7.2 参照］

17.1.2 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）[8)]。

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。［5.、7.2参照］

17.1.3 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[9)]。

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。［5.、7.2 参照］

17.1.4 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[10)]。

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。[5.、7.2 参照]

〈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〉

17.1.5 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）。

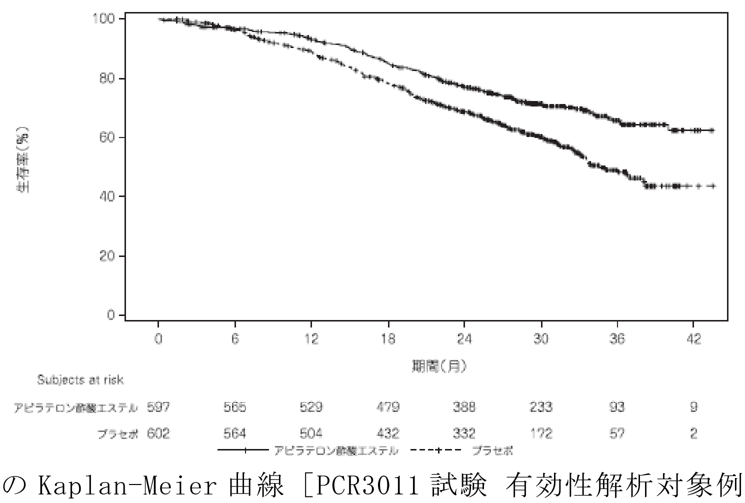
注 1）治験薬投与開始前 3 カ月以内のアンドロゲン除去療法の施行は許容された。

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。

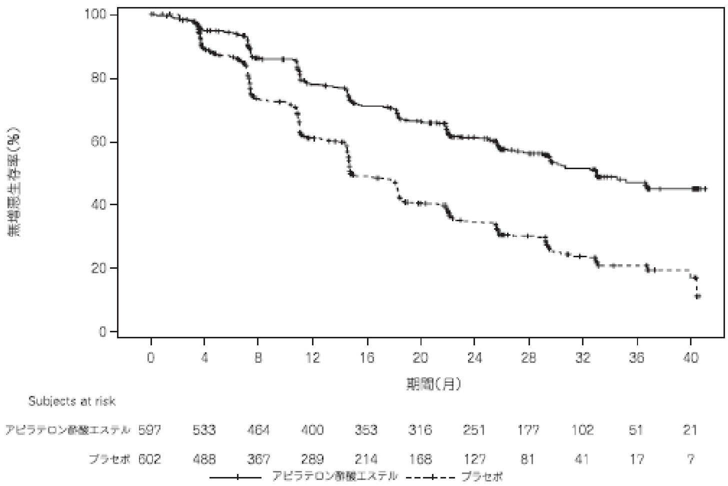
注 3）国内未承認

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

注 5）鉱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。［5.、7.2 参照］

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

該当資料なし

（７）その他

該当資料なし

Ⅵ．薬効薬理に関する項目

１．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

該当資料なし

２．薬理作用

（１）作用部位・作用機序

18.1 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[11)-15)]。

（２）薬効を裏付ける試験成績

18.2 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[16)]。

（３）作用発現時間・持続時間

該当資料なし

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

16.1 血中濃度

16.1.1 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 [17)]。

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･h/mL)	294（290）	494（434）	822（616）
t_{max} (h)	2.0［1.0-4.0］	2.0［1.0-4.0］	1.5［1.0-4.0］
$t_{1/2}$ (h)	14.2（5.1）	15.1（6.1）	16.6（6.9）

t_{max}：中央値［範囲］

16.1.2 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 [18)]。

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）］

<table>
<tr><td colspan="2">投与量（mg）</td><td>250</td><td>500</td><td>1,000</td><td>1,000</td></tr>
<tr><td colspan="2">投与時期</td><td colspan="2">食事の1時間以上前又は食事の2時間以上後</td><td>食事の1時間以上前</td><td>食事の2時間以上後</td></tr>
<tr><td colspan="2">n</td><td>9</td><td>6</td><td>6</td><td>6</td></tr>
<tr><td rowspan="3">C_{max}
(ng/mL)</td><td>1日目
（アビラテロン酢酸エステル単独）</td><td>121.3
(37.9)</td><td>385.7
(181.5)</td><td>185.7
(104.4)</td><td>788.8
(343.2)</td></tr>
<tr><td>7日目
（アビラテロン酢酸エステル単独）</td><td>183.6
(69.8)</td><td>625.5
(253.2)</td><td>205.4
(97.2)</td><td>949.5
(338.1)</td></tr>
<tr><td>15日目
（プレドニゾロン併用）</td><td>168.8
(83.0)</td><td>542.2
(231.4)</td><td>166.4
(70.9)</td><td>999.7
(386.2)</td></tr>
<tr><td rowspan="3">t_{max}
(h)</td><td>1日目
（アビラテロン酢酸エステル単独）</td><td>3.00
［1.97-5.92］</td><td>2.95
［2.00-3.95］</td><td>2.00
［0.57-2.95］</td><td>2.50
［0.98-3.97］</td></tr>
<tr><td>7日目
（アビラテロン酢酸エステル単独）</td><td>2.97
［1.77-3.05］</td><td>1.99
［1.98-5.98］</td><td>2.00
［1.03-4.05］</td><td>2.46
［1.98-3.25］</td></tr>
<tr><td>15日目
（プレドニゾロン併用）</td><td>2.08
［0.97-10.30］</td><td>2.46
［1.97-3.22］</td><td>1.98
［0.95-2.95］</td><td>2.97
［1.95-4.02］</td></tr>
<tr><td rowspan="3">AUC_{24}
(ng・h/mL)</td><td>1日目
（アビラテロン酢酸エステル単独）</td><td>516.0
(114.4)</td><td>1,698.0
(830.1)</td><td>869.7
(523.9)</td><td>2,724.7
(1109.8)</td></tr>
<tr><td>7日目
（アビラテロン酢酸エステル単独）</td><td>708.8
(164.7)</td><td>2,348.8
(774.8)</td><td>1,137.6
(524.4)</td><td>3,924.6
(1137.2)</td></tr>
<tr><td>15日目
（プレドニゾロン併用）</td><td>673.2
(131.7)</td><td>2,235.8
(1100.2)</td><td>964.8
(375.1)</td><td>3,955.7
(1260.0)</td></tr>
</table>

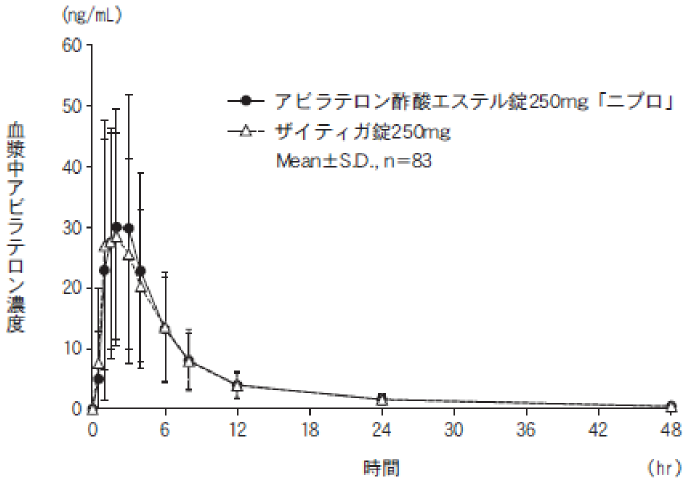
t_{max}：中央値［範囲］

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

生物学的同等性試験 [5)]

（「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 医薬審第 487 号、平成 13 年 5 月 31 日一部改正 医薬審発第 786 号、平成 18 年 11 月 24 日一部改正 薬食審査発第 1124004 号、平成 24 年 2 月 29 日一部改正 薬食審査発 0229 第 10 号及び令和 2 年 3 月 19 日一部改正 薬生薬審発 0319 第 1 号」）

アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「ニプロ」とザイティガ錠 250mg のそれぞれ 1 錠（アビラテロン酢酸エステルとして 250mg）を、2 剤 2 期のクロスオーバー法により健康成人男子に絶食単回経口投与して LC/MS/MS 法にて血漿中アビラテロン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（$AUC_{0\rightarrow48hr}$、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）～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。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\rightarrow48hr}$ (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「ニプロ」	229.732±126.722	39.833±23.815	1.95±0.88	12.20±3.73
ザイティガ錠 250mg	223.601±105.810	38.851±18.736	1.99±1.26	11.69±3.00

（Mean±S.D.，n=83）

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。

（３） 中毒域

該当資料なし

（４）食事・併用薬の影響

16.2 吸収

16.2.1 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）。[7.1参照]

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)]。[7.1参照]

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を空時に1日1回経口投与

16.7 薬物相互作用

16.7.1 デキストロメトルファン

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ルファンを併用投与したとき、デキストロメトルファン単剤投与時と比較して、デキストロメトルファンのAUC_{last}は200％増加した。また、デキストロメトルファンの活性代謝物であるデキストルファンのAUCは33％増加した[21)]（外国人データ）。[10.2参照]

16.7.2 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）。[10.2参照]

16.7.3 その他の薬剤

(1)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）。

(2)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）。

(3)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)。[10.2 参照]

16.7.4 *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)]。[10.参照]

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

健康成人単回経口投与

投与量	250mg（250mg×1錠、n=83）
kel(/hr)	0.0625±0.0223

(Mean±S.D.)

（４）クリアランス

該当資料なし

（５）分布容積

「Ⅶ.5.(6)血漿蛋白結合率」の項参照。

（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

該当しない

（３）乳汁への移行性

該当しない

（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

> 16.3 分布
>
> 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)。みかけの分布容積は 4,150L であった[27)、28)]。

６．代謝

（１）代謝部位及び代謝経路

> 16.4 代謝
>
> 健康成人に ^{14}C-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

「Ⅷ.7.相互作用」の項参照。

（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

> 16.5 排泄
>
> 健康成人に ^{14}C-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.1.(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

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 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）。［9.3.2 参照］

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} (h)	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・h/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）。［2.2、9.3.1 参照］

16.6.2 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）。

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

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.2.効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

４．用法及び用量に関連する注意とその理由

「Ⅴ.4.用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

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 デキストロメトルファン 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。
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	

	5%以上	5%未満 1%以上	1%未満	頻度不明
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. その他の注意

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「ニプロ」　　劇薬、処方箋医薬品[注)]

有効成分：アビラテロン酢酸エステル　　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

36 箇月

３．包装状態での貯法

室温保存

４．取扱い上の注意

20. 取扱い上の注意 脱酸素剤入りアルミピローで品質を保持しているため、調剤時にアルミピローを開封すること。

５．患者向け資材

患者向医薬品ガイド　：なし

くすりのしおり　　　：あり

その他の患者向け資材：○アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「ニプロ」を服用される患者さんへ

○アビラテロン「ニプロ」を服用される方へ

「ＸⅢ. 2. その他の関連資料」の項参照

６．同一成分・同効薬

同一成分薬：ザイティガ錠 250mg、同錠 500mg（ヤンセンファーマ）

同　効　薬：該当しない

７．国際誕生年月日

該当しない

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

製造販売承認年月日：2023 年 8 月 15 日
承認番号　　　　　：30500AMX00203000
薬価基準収載年月日：2025 年 12 月 5 日
販売開始年月日　　：2025 年 12 月 5 日

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「ニプロ」	4291033F1083	4291033F1083	130009301	623000901

14. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品に該当する。

XI．文献

1．引用文献

1)ニプロ㈱社内資料：加速安定性試験
2)ニプロ㈱社内資料：長期保存試験
3)ニプロ㈱社内資料：無包装状態での安定性試験
4)ニプロ㈱社内資料：アルミピロー開封後の安定性試験
5)ニプロ㈱社内資料：生物学的同等性試験（溶出、血漿中濃度測定）
6)ニプロ㈱社内資料：自動分包機適合性試験
7)Ryan CJ, et al.：N Engl J Med.2013；368：138-148（L20220055）
8)de Bono JS, et al.：N Engl J Med.2011；364：1995-2005（L20220056）
9)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、CTD2.7.3.2.1.2）（L20230126）
10)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、CTD2.7.3.2.2.1）（L20220057）
11)Potter GA, et al.：J Med Chem. 1995；38：2463-2471（L20220059）
12)Haidar S, et al.：J Steroid Biochem Mol Biol.2003；84：555-562（L20220060）
13)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、CTD2.6.2.2.1.1）（L20220061）
14)Barrie SE, et al.：J Steroid Biochem Mol Biol.1994；50：267-273（L20220062）
15)Duc I, et al.：J Steroid Biochem Mol Biol.2003；84：537-542（L20220063）
16)Mostaghel EA, et al.：Clin Cancer Res. 2011；17：5913-5925（L20220064）
17)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、CTD2.7.2.2.2.1）（L20220047）
18)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、CTD2.7.2.2.2.2、2.7.2.3.1.1）（L20230259）
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、CTD2.7.2.3.1.1）（L20220048）
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、CTD2.7.1.2.2）（L20230260）
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、CTD2.7.2.2.2.4、2.7.6.16.1.2）（L20230264）
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、CTD2.7.2.2.2.4）（L20220053）
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、CTD2.7.2.2.2.4）（L20220053）
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)(L20230265)
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、CTD2.6.4.7.1)(L20220054)
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)(L20230265)
27)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、CTD2.7.2.3.1.2)(L20220049)
28)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、CTD2.7.2.3.5.1)(L20220050)
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、CTD2.7.2.3.1.3、2.7.6.1.1.2)(L20230261)
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、CTD2.7.2.2.2.3)(L20220052)
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、CTD2.7.2.2.2.3、2.7.6.15.1.2)(L20230262)
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、CTD2.7.2.2.2.3、2.7.6.14.1.2)(L20230263)
33)ニプロ㈱社内資料:粉砕後の安定性試験
34)ニプロ㈱社内資料:崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

2. その他の参考文献

該当資料なし

ⅩⅡ．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

妊婦に関する海外情報（オーストラリア分類）

本邦における使用上の注意「妊婦、授乳婦等への投与」の項は設定されておらず、オーストラリア分類とは異なる。

	分類
オーストラリアの分類 （An Australian categorisation of risk of drug use in pregnancy）	D*

＊：Prescribing medicines in pregnancy database (Australian Government)
<https://www.tga.gov.au/australian-categorisation-system-prescribing-medicines-pregnancy>（2025年12月アクセス）

参考：分類の概要

オーストラリアの分類：

D：Drugs which have caused, are suspected to have caused or may be expected to cause, an increased incidence of human fetal malformations or irreversible damage. These drugs may also have adverse pharmacological effects. Accompanying texts should be consulted for further details.

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。

（掲載根拠：「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する Q&A について（その 3）」令和元年 9 月 6 日付 厚生労働省医薬・生活衛生局 監視指導・麻薬対策課 事務連絡）

アビラテロン酢酸エステル製剤は、『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 4 版』の抗がん薬の取扱い基準により、「危険度Ⅱ」に分類されており、粉砕不適な錠剤であるが、医療機関への情報提供のため、参考として実施することとした。

（1）粉砕[33)]

粉砕後の安定性

試験項目：外観、含量 残存率（%）、純度試験　類縁物質

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	0.5 カ月	1 カ月	2 カ月	3 カ月
温度	40±2℃ 遮光・ 気密容器	外観	ピンク色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
		含量 残存率（%）	100.00	99.62	98.64	97.85	97.52
		純度試験 類縁物質	適合	規格内	規格内	規格内	規格内
湿度	75±5%RH /25±2℃ 遮光・開放	外観	ピンク色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
		含量 残存率（%）	100.00	100.31	99.67	100.07	99.65
		純度試験 類縁物質	適合	規格内	規格内	規格内	規格内

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	30 万 lx・hr	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
光	120 万 lx・hr 透明・ 気密容器	外観	ピンク色のフィルムコーティング片を含む白色の粉末	ピンク色のフィルムコーティング片を含む微黄白色の粉末	ピンク色のフィルムコーティング片を含む黄白色の粉末	ピンク色のフィルムコーティング片を含む黄白色の粉末
		含量 残存率（%）	100.00	97.91	97.76	96.50
		純度試験 類縁物質	適合	規格内	規格内	規格外

1 ロット（n=3）

（２）崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性 [34)]

試験方法

(1)崩壊懸濁試験

注入器（シリンジ）のプランジャーを抜き取り、シリンジ内に錠剤 1 個を入れてプランジャーを戻し、約 55℃のお湯 20mL を吸い取った後、(シリンジ先端にキャップをして）5 分間自然放置した。

5 分後にシリンジを手で 180 度 15 往復横転して攪拌し崩壊・懸濁の状況を確認した。

5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分放置後にシリンジを手で 180 度 15 往復横転して攪拌し、崩壊・懸濁の状況を再度確認した。

10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、この方法を中止し、コーティングに亀裂を入れて、上記と同様の操作を行った。コーティングへの亀裂は錠剤 1 個を薬包紙に包み、薬包紙の上から錠剤を乳棒で数回（15 回）叩いて行った。

試験回数は 1 回とした。

(2)通過性試験

得られた懸濁液の入ったシリンジを 8Fr.経管チューブ（経管栄養用カテーテル）に接続し、懸濁液を約 2～3mL/sec の速度で注入して、通過性を観察した。

チューブはベッドの上の患者を想定し、体内挿入端から 3 分の 2 を水平にし、他端（注入端）を 30cm の高さにセットした。注入後に 20mL の水を同じシリンジで吸い取り、注入してチューブ内を洗うとき、シリンジ内、チューブ内に残留物がみられなければ、通過性に問題なしとした。また、得られた懸濁液について pH を測定した。試験回数は 1 回とした。

試験結果

試験条件	試験回数	放置時間	崩壊懸濁試験	通過性試験		pH
			観察結果	チューブサイズ	通過性及び残存	
水（約55℃）	1	5分	完全には崩壊せず、錠剤の形が残った	－	－	－
		10分	完全には崩壊せず、錠剤の形が残った	－	－	－
亀裂→水（約55℃）	1	5分	完全には崩壊せず、錠剤の形が残った	－	－	－
		10分	崩壊・懸濁した	8Fr.	残存ほとんどなし	7.66

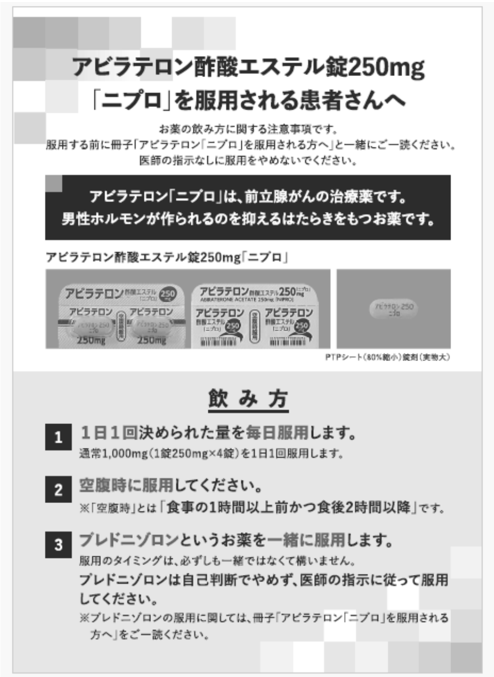
－：未実施

本試験は「内服薬 経管投与ハンドブック 第4版（株）じほう」に準じて実施。

２．その他の関連資料

患者向け資材

○アビラテロン酢酸エステル錠250mg「ニプロ」を服用される患者さんへ



○アビラテロン「ニプロ」を服用される方へ

【MEMO】

【MEMO】

ニプロ株式会社
大阪府摂津市千里丘新町3番26号

2512PI-2B