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

高血圧・狭心症治療薬
日本薬局方　アムロジピンベシル酸塩口腔内崩壊錠
アムロジピンOD錠2.5mg「科研」
アムロジピンOD錠5mg「科研」
アムロジピンOD錠10mg「科研」

Amlodipine Besilate O.D. Tablets「KAKEN」

剤形	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	アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」: 1 錠中日局アムロジピンベシル酸塩 3.47mg（アムロジピンとして 2.5mg） アムロジピン OD 錠 5mg「科研」: 1 錠中日局アムロジピンベシル酸塩 6.93mg（アムロジピンとして 5mg） アムロジピン OD 錠 10mg「科研」: 1 錠中日局アムロジピンベシル酸塩 13.87mg（アムロジピンとして 10mg）
一般名	和名：アムロジピンベシル酸塩（JAN） 洋名：Amlodipine Besilate（JAN, USAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」、アムロジピン OD 錠 5mg「科研」 製造販売承認年月日：2009 年 7 月 13 日 薬価基準収載年月日：2009 年 11 月 13 日 発　売　年　月　日：2009 年 11 月 13 日
	アムロジピン OD 錠 10mg「科研」 製造販売承認年月日：2013 年 8 月 15 日 薬価基準収載年月日：2013 年 12 月 13 日 発　売　年　月　日：2013 年 12 月 13 日
製造販売（輸入）・提携・販売会社名	発 売 元　：科研製薬株式会社 製造販売元：大興製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問合せ窓口	科研製薬株式会社　医薬品情報サービス室 フリーダイヤル：0120-519-874 受付時間：9:00～17:00（土、日、祝日、その他当社の休業日を除く） ホームページアドレス：https://www.kaken.co.jp/

本 IF は 2023 年 7 月改訂の添付文書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－

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・表現には薬機法の広告規則や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，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 を活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．

（2020 年 4 月改訂）

目　　次

I. 概要に関する項目 ･････････････････････････ 1
１．開発の経緯 ･････････････････････････････ 1
２．製品の治療学的特性 ･････････････････････ 1
３．製品の製剤学的特性 ･････････････････････ 1
４．適正使用に関して周知すべき特性 ･････････ 1
５．承認条件及び流通・使用上の制限事項 ･････ 1
（１）承認条件 ･････････････････････････････ 1
（２）流通・使用上の制限事項 ･･････････････ 2
６．RMP の概要･･････････････････････････････ 2
II. 名称に関する項目 ･･････････････････････ 3
１．販売名 ･････････････････････････････････ 3
（１）和名 ･････････････････････････････････ 3
（２）洋名 ･････････････････････････････････ 3
（３）名称の由来 ･･･････････････････････････ 3
２．一般名 ･････････････････････････････････ 3
（１）和名（命名法） ･･･････････････････････ 3
（２）洋名（命名法） ･･･････････････････････ 3
（３）ステム（stem） ･･･････････････････････ 3
３．構造式又は示性式 ･･･････････････････････ 3
４．分子式及び分子量 ･･･････････････････････ 3
５．化学名（命名法）又は本質 ･･････････････ 4
６．慣用名、別名、略号、記号番号 ･･･････････ 4
III. 有効成分に関する項目 ･･････････････････ 5
１．物理化学的性質 ･････････････････････････ 5
（１）外観・性状 ･･･････････････････････････ 5
（２）溶解性 ･･･････････････････････････････ 5
（３）吸湿性 ･･･････････････････････････････ 5
（４）融点（分解点）、沸点、凝固点 ･･･････ 5
（５）酸塩基解離定数 ･･･････････････････････ 5
（６）分配係数 ･････････････････････････････ 5
（７）その他の主な示性値 ･･･････････････････ 5
２．有効成分の各種条件下における安定性 ･････ 5
３．有効成分の確認試験法、定量法 ･･･････････ 5
IV. 製剤に関する項目 ･･････････････････････ 6
１．剤形 ･･･････････････････････････････････ 6
（１）剤形の区別 ･･･････････････････････････ 6
（２）製剤の外観及び性状 ･･･････････････････ 6
（３）識別コード ･･･････････････････････････ 6
（４）製剤の物性 ･･･････････････････････････ 6
（５）その他 ･･･････････････････････････････ 6
２．製剤の組成 ･････････････････････････････ 6
（１）有効成分（活性成分）の含量及び添加剤 ･･ 6
（２）電解質等の濃度 ･･･････････････････････ 7
（３）熱量 ･････････････････････････････････ 7
３．添付溶解液の組成及び容量 ･･･････････････ 7
４．力価 ･･･････････････････････････････････ 7
５．混入する可能性のある夾雑物･･････････････ 7
６．製剤の各種条件下における安定性･･････････ 7
７．調製法及び溶解後の安定性･････････････････ 7
８．他剤との配合変化（物理化学的変化）･･････ 7
９．溶出性 ･････････････････････････････････ 7
10. 容器・包装 ･････････････････････････････ 11
（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
（２）包装 ･････････････････････････････････ 11
（３）予備容量 ･････････････････････････････ 11
（４）容器の材質 ･･･････････････････････････ 11
11. 別途提供される資材類･････････････････････ 11
12. その他 ･････････････････････････････････ 11
V. 治療に関する項目･･････････････････････････ 12
１．効能又は効果 ･･･････････････････････････ 12
２．効能又は効果に関連する注意･･････････････ 12
３．用法及び用量 ･･･････････････････････････ 12
（１）用法及び用量の解説･････････････････････ 12
（２）用法及び用量の設定経緯・根拠･･････････ 12
４．用法及び用量に関連する注意･･････････････ 12
５．臨床成績 ･･･････････････････････････････ 12
（１）臨床データパッケージ･･･････････････････ 12
（２）臨床薬理試験･･･････････････････････････ 13
（３）用量反応探索試験･･･････････････････････ 13
（４）検証的試験 ･･･････････････････････････ 13
（５）患者・病態別試験･･･････････････････････ 13
（６）治療的使用 ･･･････････････････････････ 14
（７）その他 ･･･････････････････････････････ 14
VI. 薬効薬理に関する項目･････････････････････ 15
１．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群････ 15
２．薬理作用 ･･･････････････････････････････ 15
（１）作用部位・作用機序･････････････････････ 15
（２）薬効を裏付ける試験成績･････････････････ 15
（３）作用発現時間・持続時間･････････････････ 15
VII. 薬物動態に関する項目････････････････････ 16
１．血中濃度の推移･･･････････････････････････ 16
（１）治療上有効な血中濃度･･･････････････････ 16
（２）臨床試験で確認された血中濃度･･･････････ 16
（３）中毒域 ･･･････････････････････････････ 19
（４）食事・併用薬の影響･････････････････････ 19
２．薬物速度論的パラメータ･･･････････････････ 19
（１）解析方法 ･････････････････････････････ 19
（２）吸収速度定数･･･････････････････････････ 19
（３）消失速度定数･･･････････････････････････ 19
（４）クリアランス･･･････････････････････････ 19
（５）分布容積 ･････････････････････････････ 19

（6）その他 ･････････････････････････････ 19
3．母集団（ポピュレーション）解析 ･････････ 19
（1）解析方法 ･････････････････････････････ 19
（2）パラメータ変動要因 ･･････････････････ 19
4．吸収 ･････････････････････････････････ 20
5．分布 ･････････････････････････････････ 20
（1）血液－脳関門通過性 ･･････････････････ 20
（2）血液－胎盤関門通過性 ････････････････ 20
（3）乳汁への移行性 ･･････････････････････ 20
（4）髄液への移行性 ･･････････････････････ 20
（5）その他の組織への移行性 ･･････････････ 20
（6）血漿蛋白結合率 ･･････････････････････ 20
6．代謝 ･････････････････････････････････ 20
（1）代謝部位及び代謝経路 ････････････････ 20
（2）代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、
寄与率 ･････････････････････････････ 20
（3）初回通過効果の有無及びその割合 ･･････ 20
（4）代謝物の活性の有無及び活性比、存在比
率 ･････････････････････････････････ 20
7．排泄 ･････････････････････････････････ 20
8．トランスポーターに関する情報 ･･････････ 21
9．透析等による除去率 ････････････････････ 21
10．特定の背景を有する患者 ････････････････ 21
11．その他 ･･････････････････････････････ 22
VIII．安全性（使用上の注意等）に関する項目 ･ 23
1．警告内容とその理由 ････････････････････ 23
2．禁忌内容とその理由 ････････････････････ 23
3．効能又は効果に関連する注意とその理由 ･･･ 23
4．用法及び用量に関連する注意とその理由 ･･･ 23
5．重要な基本的注意とその理由 ････････････ 23
6．特定の背景を有する患者に関する注意 ･････ 23
（1）合併症・既往歴等のある患者 ･･････････ 23
（2）腎機能障害患者 ･･････････････････････ 23
（3）肝機能障害患者 ･･････････････････････ 23
（4）生殖能を有する者 ････････････････････ 24
（5）妊婦 ･･････････････････････････････ 24
（6）授乳婦 ････････････････････････････ 24
（7）小児等 ････････････････････････････ 24
（8）高齢者 ････････････････････････････ 24
7．相互作用 ･････････････････････････････ 24
（1）併用禁忌とその理由 ･･････････････････ 24
（2）併用注意とその理由 ･･････････････････ 24
8．副作用 ･･････････････････････････････ 25
（1）重大な副作用と初期症状 ･･････････････ 25
（2）その他の副作用 ･･････････････････････ 25
9．臨床検査結果に及ぼす影響 ･･････････････ 26
10．過量投与 ････････････････････････････ 26
11．適用上の注意 ････････････････････････ 27
12．その他の注意 ････････････････････････ 27
（1）臨床使用に基づく情報 ････････････････ 27
（2）非臨床試験に基づく情報 ･･････････････ 27
IX．非臨床試験に関する項目 ･･････････････ 28
1．薬理試験 ････････････････････････････ 28
（1）薬効薬理試験 ････････････････････････ 28
（2）安全性薬理試験 ･･････････････････････ 28
（3）その他の薬理試験 ････････････････････ 28
2．毒性試験 ････････････････････････････ 28
（1）単回投与毒性試験 ････････････････････ 28
（2）反復投与毒性試験 ････････････････････ 28
（3）遺伝毒性試験 ････････････････････････ 28
（4）がん原性試験 ････････････････････････ 28
（5）生殖発生毒性試験 ････････････････････ 28
（6）局所刺激性試験 ･･････････････････････ 28
（7）その他の特殊毒性 ････････････････････ 28
X．管理的事項に関する項目 ････････････････ 29
1．規制区分 ････････････････････････････ 29
2．有効期間 ････････････････････････････ 29
3．包装状態での貯法 ･･････････････････････ 29
4．取扱い上の注意 ････････････････････････ 29
5．患者向け資材 ････････････････････････ 29
6．同一成分・同効薬 ･･････････････････････ 29
7．国際誕生年月日 ････････････････････････ 29
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 ･････････ 29
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 ･･･････････････ 29
10．再審査結果、再評価結果公表年月日及びそ
の内容 ･････････････････････････････ 30
11．再審査期間 ･･････････････････････････ 30
12．投薬期間制限に関する情報 ･･････････････ 30
13．各種コード ･･････････････････････････ 30
14．保険給付上の注意 ･････････････････････ 30
XI．文献 ････････････････････････････････ 31
1．引用文献 ････････････････････････････ 31
2．その他の参考文献 ･･････････････････････ 31
XII．参考資料 ･･････････････････････････ 32
1．主な外国での発売状況 ･･････････････････ 32
2．海外における臨床支援情報 ･･････････････ 32
XIII．備考 ･･････････････････････････････ 33
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 ･･････････････････ 33
（1）粉砕 ･･････････････････････････････ 33
（2）崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通
過性 ･･････････････････････････････ 33
2．その他の関連資料 ･･････････････････････ 33
（1）提供用資料 ････････････････････････ 33
（2）GS1 コード ･･････････････････････････ 33

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

アムロジピンベシル酸塩はジヒドロピリジン系のカルシウム拮抗薬であり、本邦では 1993 年に上市され、高血圧症、狭心症の治療に広く使用されている。また、2006 年 7 月には口腔内崩壊錠が上市されている。
アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」及びアムロジピン OD 錠 5mg「科研」は、アムロジピンベシル酸塩を主成分とする口腔内崩壊錠の後発医薬品として大興製薬株式会社が開発を企画し、薬食発第 0331015 号（2005 年 3 月 31 日）に基づき、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実施し、2009 年 7 月に承認を取得、2009 年 11 月に発売に至った。
その後、2009 年 12 月に高血圧症の効能・効果について、「効果不十分な場合には 1 日 1 回 10mg まで増量することができる」こととする用法・用量の一部変更承認を、2012 年 11 月には小児（6 歳以上）の高血圧症に対する用法・用量を追加する一部変更承認を取得した。
また、「後発医薬品の必要な規格を揃えること等について（平成 18 年 3 月 10 日付医政発第 0310001 号）」に基づき、アムロジピンとして 10mg を含有する製剤（アムロジピン OD 錠 10mg「科研」）の承認申請を行い、2013 年 8 月に承認を取得、2013 年 12 月に発売に至った。

なお、アムロジピンベシル酸塩口腔内崩壊錠は第十六改正日本薬局方第一追補に収載された。

２．製品の治療学的特性

1）細胞膜の膜電位依存性カルシウムチャンネルに特異的に結合し、細胞内への Ca^{2+} の流入を減少させることにより、冠血管や末梢血管の平滑筋を弛緩させる。
カルシウム拮抗作用の発現は緩徐であり、持続的である[1)]。（**「VIII．２．（１）作用部位・作用機序」**の項参照）
2）重大な副作用として、劇症肝炎、肝機能障害、黄疸、無顆粒球症、白血球減少、血小板減少、房室ブロック、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

該当資料なし

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
医薬品リスク管理計画（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

アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」
アムロジピン OD 錠 5mg「科研」
アムロジピン OD 錠 10mg「科研」

（２）洋名

Amlodipine Besilate O.D. Tablets 2.5mg「KAKEN」
Amlodipine Besilate O.D. Tablets 5mg「KAKEN」
Amlodipine Besilate O.D. Tablets 10mg「KAKEN」

（３）名称の由来

「有効成分名」＋「剤形」＋「規格」＋「屋号」より命名。

２．一般名

（１）和名（命名法）

アムロジピンベシル酸塩（JAN）

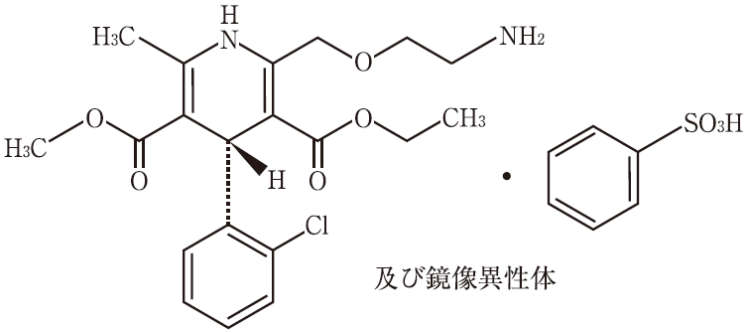
（２）洋名（命名法）

Amlodipine Besilate（JAN、USAN）、amlodipine（INN）

（３）ステム（stem）

-dipine（ニフェジピン系カルシウム拮抗薬）

３．構造式又は示性式



４．分子式及び分子量

分子式：$C_{20}H_{25}ClN_2O_5$・$C_6H_6O_3S$
分子量：567.05

５．化学名（命名法）又は本質

3-Ethyl 5-methyl (4*RS*)-2-[(2-aminoethoxy)methyl]-4-(2-chlorophenyl)- 6-methyl-1,4-dihydropyridine-3,5-dicarboxylate monobenzenesulfonate（IUPAC）

６．慣用名、別名、略号、記号番号

CAS 登録番号：111470-99-6（Amlodipine Besilate）、88150-42-9（amlodipine）

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～帯黄白色の結晶性の粉末である。

（２）溶解性

溶　　媒	1g を溶かすのに要する溶媒量	日本薬局方の溶解度表記
メタノール	1mL 以上　10mL 未満	溶けやすい
エタノール（99.5）	30mL 以上　100mL 未満	やや溶けにくい
水	100mL 以上　1000mL 未満	溶けにくい

（３）吸湿性

該当資料なし

（４）融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：約 198℃（分解）

（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

旋光度：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、定量法

確認試験法：
日本薬局方「アムロジピンベシル酸塩」の確認試験法による。
・紫外可視吸光度測定法
・赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）
・塩化バリウム試液による沈殿反応

定量法：
日本薬局方「アムロジピンベシル酸塩」の定量法による。
・液体クロマトグラフィー

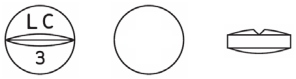
Ⅳ. 製剤に関する項目

１．剤形

（１）剤形の区別

素錠（口腔内崩壊錠）

（２）製剤の外観及び性状

販売名	アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」	アムロジピン OD 錠 5mg「科研」	アムロジピン OD 錠 10mg「科研」
剤形	素錠	片面 1／2 割線入りの素錠	
色	白色～微黄白色		
形状	表 裏 側面	表 裏 側面	表 裏 側面 
直径	6.0mm	8.0mm	10mm
厚さ	3.0mm	3.6mm	4.5mm
質量	90mg	180mg	360mg

（３）識別コード

表示部位：錠剤、PTP シート
表示内容：アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」　LC1
　　アムロジピン OD 錠 5mg「科研」　LC2
　　アムロジピン OD 錠 10mg「科研」　LC3

（４）製剤の物性

該当資料なし

（５）その他

該当資料なし

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	アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」	アムロジピン OD 錠 5mg「科研」	アムロジピン OD 錠 10mg「科研」
有効成分	1 錠中日局アムロジピンベシル酸塩 3.47mg（アムロジピンとして 2.5mg）	1 錠中日局アムロジピンベシル酸塩 6.93mg（アムロジピンとして 5mg）	1 錠中日局アムロジピンベシル酸塩 13.87mg（アムロジピンとして 10mg）
添加剤	D-マンニトール、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、無水リン酸水素カルシウム、タルク、酸化チタン、アルファー化デンプン、クロスポビドン、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、ステアリン酸マグネシウム、香料、l-メントール、その他 4 成分		D-マンニトール、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、無水リン酸水素カルシウム、タルク、酸化チタン、アルファー化デンプン、クロスポビドン、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、ステアリン酸マグネシウム、香料、l-メントール、タウマチン、その他 4 成分

（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[2)]

最終包装製品を用いた加速試験の結果、アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」、同 OD 錠 5mg「科研」及び同 OD 錠 10mg「科研」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。

製品名	保存条件	包装形態	保存期間	結果
アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」	40±1℃ 75±5%RH	アルミパックに封入した PTP 包装	6 ヵ月	適合※
アムロジピン OD 錠 5mg「科研」				
アムロジピン OD 錠 10mg「科研」		アルミパックに封入し紙箱に入れた PTP 包装		

※性状、確認試験、純度試験、製剤均一性試験（含量均一性試験）、崩壊性、溶出性、定量

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[3)]

（１）アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」

「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」(2001 年 5 月 31 日医薬審発第 786 号）に基づき実施

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

試験液量：900mL　測定方法：液体クロマトグラフィー

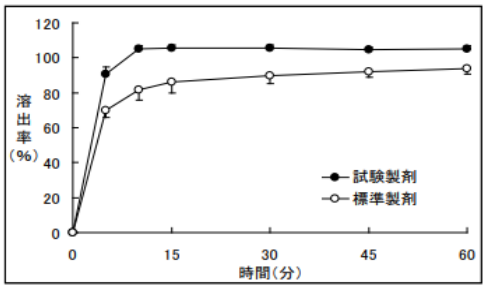
各種条件：

試験液	サンプリング時間（分）	回転数
pH1.2	5、10、15、30、45、60	50rpm
pH5.0	5、10、15、30、45、60、90	
pH6.8	5、10、15、30、45、60、90、120、180、240	
水	5、10、15、30、45、60、90、120	
pH6.8	5、10、15、30	100rpm
試験液温	37.0±0.5℃	
ベッセル数	12 ベッセル	

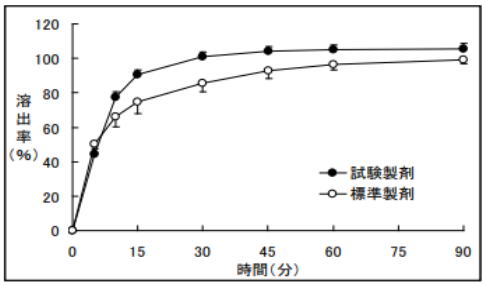
試験結果：5 条件中 3 条件（50rpm pH5.0・pH6.8・水）において基準に適合せず、同等ではないと判断された。なお、ガイドラインでは「本試験による同等性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものでない」とされている。

＜溶出曲線＞

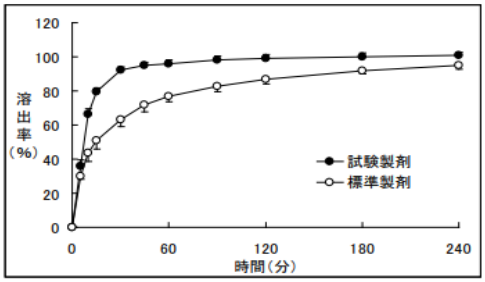
pH1.2、50rpm



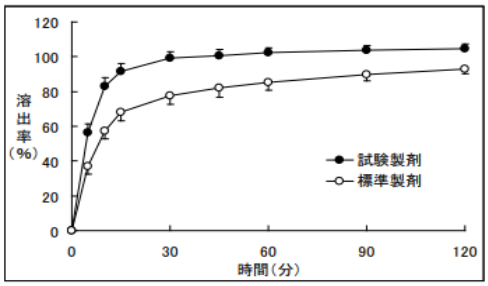
pH5.0、50rpm



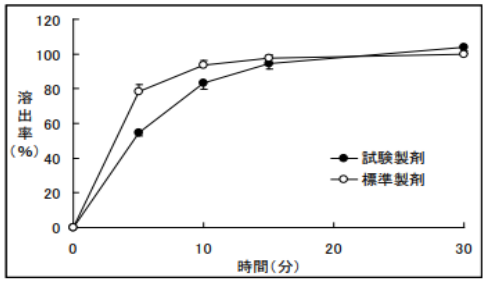
pH6.8、50rpm



水、50rpm



pH6.8、100rpm



（Mean±S.D., n＝12）

（２）アムロジピン OD 錠 5mg「科研」

「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」(2001 年 5 月 31 日医薬審発第 786 号）に基づき実施

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

試験液量：900mL　測定方法：液体クロマトグラフィー

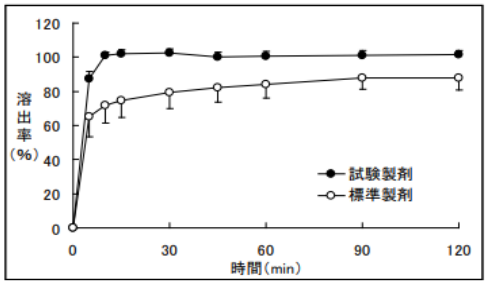
各種条件：

試験液	サンプリング時間（分）	回転数
pH1.2	5、10、15、30、45、60、90、120	50rpm
pH5.0	5、10、15、30、45、60、90、120	
pH6.8	5、10、15、30、45、60、90、120、180、240、300、360	
水	5、10、15、30、45、60、90、120、180、240	
pH6.8	5、10、15	100rpm
試験液温	37.0±0.5℃	
ベッセル数	12 ベッセル	

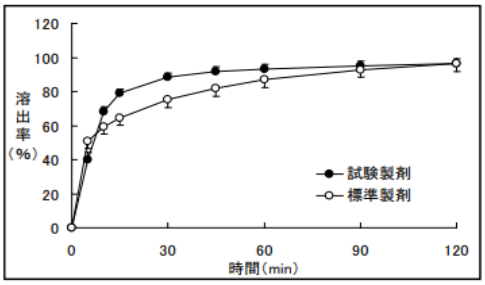
試験結果：5 条件中 2 条件（50rpm pH1.2・pH6.8）において基準に適合せず、同等ではないと判断された。なお、ガイドラインでは「本試験による同等性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものでない」とされている。

＜溶出曲線＞

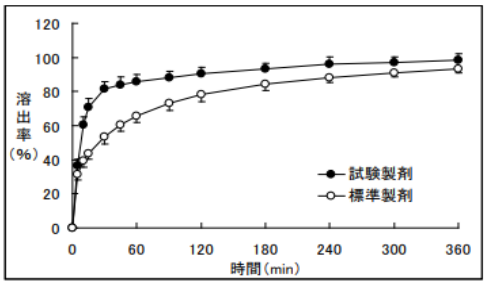
pH1.2、50rpm



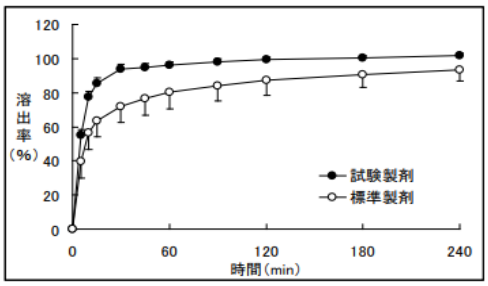
pH5.0、50rpm



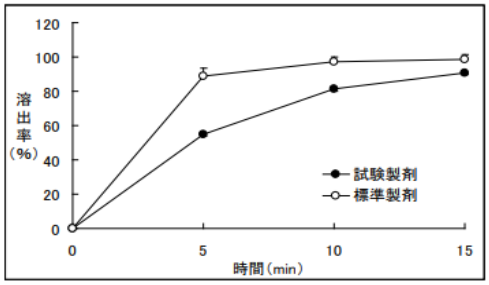
pH6.8、50rpm



水、50rpm



pH6.8、100rpm



(Mean±S.D., n＝12)

（３）アムロジピン OD 錠 10mg「科研」

「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」（2006 年 11 月 24 日　薬食審査発第 1124004 号）に基づき実施

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

試験液量：900mL　測定方法：液体クロマトグラフィー

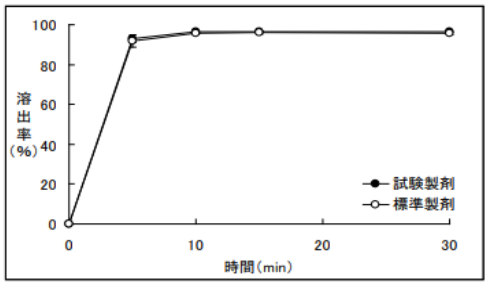
各種条件：

試験液	サンプリング時間（分）	回転数
pH1.2	5、10、15、30	50rpm
pH5.0		
pH6.8		
水		
pH6.8	5、10、15、30	100rpm
試験液温	37.0±0.5℃	
ベッセル数	12 ベッセル	

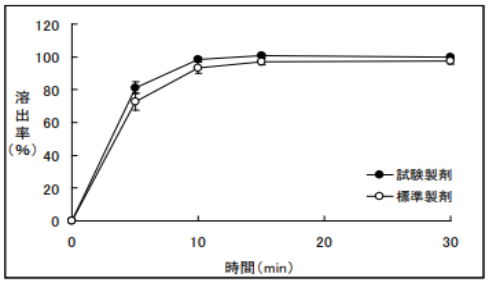
試験結果：全ての条件において判定基準に適合した。

＜溶出曲線＞

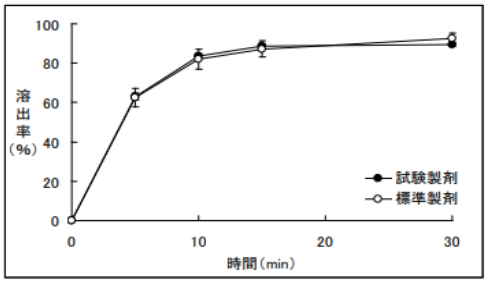
pH1.2、50rpm



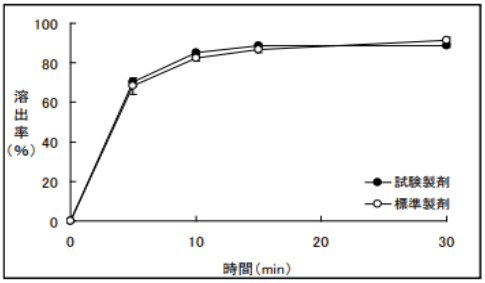
pH5.0、50rpm



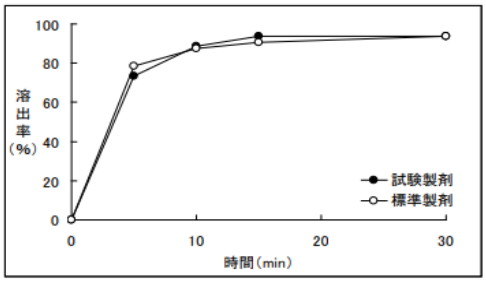
pH6.8、50rpm



水、50rpm



pH6.8、100rpm



（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

アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」
100 錠［10 錠（PTP）×10］
500 錠［10 錠（PTP）×50］
アムロジピン OD 錠 5mg「科研」
100 錠［10 錠（PTP）×10］
500 錠［10 錠（PTP）×50］
アムロジピン OD 錠 10mg「科研」
100 錠［10 錠（PTP）×10］

（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
ピロー：アルミニウム、ポリエチレン
個装箱：紙

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

12. 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

○高血圧症
○狭心症

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 本剤は効果発現が緩徐であるため、緊急な治療を要する不安定狭心症には効果が期待できない。

３．用法及び用量

（１）用法及び用量の解説

〈OD 錠 2.5mg、OD 錠 5mg〉

高血圧症

通常、成人にはアムロジピンとして 2.5～5mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、症状に応じ適宜増減するが、効果不十分な場合には 1 日 1 回 10mg まで増量することができる。

通常、6 歳以上の小児には、アムロジピンとして 2.5mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、年齢、体重、症状により適宜増減する。

狭心症

通常、成人にはアムロジピンとして 5mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、症状に応じ適宜増減する。

〈OD 錠 10mg〉

高血圧症

通常、成人にはアムロジピンとして 2.5～5mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、症状に応じ適宜増減するが、効果不十分な場合には 1 日 1 回 10mg まで増量することができる。

狭心症

通常、成人にはアムロジピンとして 5mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、症状に応じ適宜増減する。

（２）用法及び用量の設定経緯・根拠

＜副作用等による減量・中止規定＞

「VIII. ８．副作用」の項参照

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 〈OD 錠 2.5mg、OD 錠 5mg〉 6 歳以上の小児への投与に際しては、1 日 5mg を超えないこと。

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

有効性及び安全性に関する試験

〈高血圧症〉

①国内臨床試験

本態性高血圧症に対する有効率（「下降」以上、判定不能例は除く）は 85.8%（467/544 例）であり、二重盲検比較試験によってもアムロジピンの有用性が認められた[4-7]。また、腎障害を伴う高血圧症に対しては 80.0%（28/35 例）、重症高血圧症に対しては 88.9%（8/9 例）の有効率を示した[8,9]。

②国内第Ⅲ相試験

アムロジピンとして 5mg を 1 日 1 回 8 週間投与後に、収縮期血圧が 140mmHg 以上を示す患者 305 例を二群に分けて、アムロジピンとして 10mg 又は 5mg を 1 日 1 回 8 週間投与したときの収縮期血圧のベースラインからの変化量の平均値は、10mg 群で 13.7mmHg の低下、5mg 群で 7.0mmHg の低下であり、両群間に統計的に有意な差がみられた。

臨床検査値異常を含む副作用の発現率は、5mg 群では 3.9%（6/154 例）に、10mg 群では 9.9%（15/151 例）に認められた。

高用量（10mg）投与時に浮腫が高い頻度で認められ、5mg 群で 0.6%、10mg 群で 3.3%であった[10]。［11.2 参照］

さらに、継続試験として実施した長期投与試験でアムロジピンとして 10mg を 1 日 1 回通算して 52 週間投与した際、収縮期血圧のベースラインからの変化量の平均値は、15.6mmHg の低下を示した。

臨床検査値異常を含む副作用の発現率は 24.6%（33 例）に認められた。主な副作用は浮腫 10.4%、めまい・ふらつき 3.0%等であった[22]。

〈狭心症〉

①国内臨床試験

狭心症に対する有効率（「改善」以上、判定不能例は除く）は 74.0%（108/146 例）であった。病型別の有効率は労作性狭心症 82.0%（73/89 例）、労作兼安静狭心症 61.4%（35/57 例）であった[12-15]。

2）安全性試験

該当資料なし

（５）患者・病態別試験

〈効能共通〉

1）国内臨床試験

アムロジピンベシル酸塩錠を投与した高齢者（70 歳以上）における高血圧症に対する有効率は 86.5%（45/52 例）、狭心症に対する有効率は 82.8%（24/29 例）であった。

副作用の発現率は 3.8%（5/133 例）、臨床検査値異常は 3.0%（4/133 例）であった。主な副作用はめまい、ふらつきであり、臨床検査値の変動は AST、ALT 及び Al-P の上昇等であった。

2）糖代謝に及ぼす影響

糖尿病を合併する患者を含む本態性高血圧症患者 43 例にアムロジピンベシル酸塩錠 1 日 1 回 2.5～5mg（一部の症例には 7.5mg まで増量）を 12 週間投与しても糖代謝にはほと

んど影響を与えなかった[16)]。

（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

1,4-ジヒドロピリジン系カルシウム拮抗薬（ニカルジピン塩酸塩、ニフェジピン　等）
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

細胞膜の膜電位依存性カルシウムチャンネルに特異的に結合し、細胞内への Ca^{2+} の流入を減少させることにより、冠血管や末梢血管の平滑筋を弛緩させる。
カルシウム拮抗作用の発現は緩徐であり、持続的である[1)]。

（２）薬効を裏付ける試験成績

1）降圧作用

各種高血圧病態モデル（高血圧自然発症ラット、腎性高血圧イヌ）において、単回投与で血圧下降の発現が緩徐で作用持続時間が長いことが認められており、連続投与でも耐性の発現しないことが認められている[17)]。

2）高血圧に伴う心血管障害への作用

食塩感受性 Dahl ラットにアムロジピンを 10 週間以上連続投与することにより、加齢に伴う血圧上昇及び腸間膜動脈の石灰沈着、フィブリン沈着等の血管病変が抑制された。
脳卒中易発症高血圧ラットにアムロジピン 3mg/kg/日を連続投与することにより、血圧上昇の抑制及び延命効果が認められた。
また、心筋の線維化、腎の増殖性動脈炎、糸球基底膜肥厚、尿細管萎縮等の病変の発生も明らかに抑制された[18,19)]。

3）抗狭心症作用

アムロジピンは麻酔モルモットでのセファデックス冠動脈塞栓による心筋虚血性 ST 上昇を抑制した。摘出ラット心臓において、虚血/再灌流時の心筋保護作用を調べた結果、アムロジピン投与群では対照群に比べて心収縮力の回復が促進され、組織内 Ca^{2+} 量の増加が抑制された。組織内 ATP 量及びクレアチンリン酸量の回復も促進され、心筋保護作用が示された。
ネコ血液灌流摘出心臓において、左室 dp/dt 及び左室収縮期圧は低下し、心筋酸素消費量も減少した[20,21)]。

（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

1）単回投与

健康成人にアムロジピンベシル酸塩錠又は口腔内崩壊錠をクロスオーバー法にてアムロジピンとして 2.5mg 又は 5mg を単回経口投与したときの薬物動態パラメータは表の通りである。血清中アムロジピン濃度は用量に比例して推移し、いずれの投与量においても投与後約 6 時間で最高血清中濃度に達し、血清中濃度半減期は長かった。また、アムロジピン口腔内崩壊錠とアムロジピンベシル酸塩錠は生物学的に同等であることが確認された。

投与量	剤形	n	T_{max} (hr)	C_{max} (ng/mL)	AUC (ng・hr/mL)	$T_{1/2}$ (hr)
2.5mg	アムロジピン口腔内崩壊錠	24	6.0±0.8	1.13±0.25	37.1±10.2	37.8±6.8
	アムロジピン錠	24	5.8±1.0	1.23±0.26	38.0±10.1	36.5±4.2
5mg	アムロジピン口腔内崩壊錠	23	5.6±1.0	2.51±0.66	84.3±20.8	36.2±5.0
	アムロジピン錠	23	5.5±1.4	2.81±0.40	84.8±15.0	35.4±7.4

T_{max}：最高血清中濃度到達時間、C_{max}：最高血清中濃度、
AUC：血清中濃度－時間曲線下面積（0～72時間値）、$T_{1/2}$：血清中濃度半減期、Mean±S.D.

また、健康成人 20 例（平均年齢 32.1 歳）にアムロジピンとして 10mg を単回投与した時の血漿中濃度の T_{max}、C_{max}、$AUC_{0-\infty}$及び $T_{1/2}$ は、それぞれ 9.3 時間、5.84ng/mL、298ng・hr/mL 及び 35.1 時間であり、外国人と比較した結果、同様であった [22]。

2）反復投与

健康成人 6 例（平均年齢 33.5 歳）にアムロジピンとして 2.5mg を 1 日 1 回 14 日間反復投与した場合の血清中アムロジピン濃度は、投与 6～8 日後に定常状態に達し、以後の蓄積は認められなかった。最終投与日（14 日目）の C_{max} 及び $AUC_{0\sim24hr}$ はそれぞれ 3.5ng/mL 及び 61.8ng・hr/mL であり、初回投与時（1.4ng/mL 及び 19.3ng・hr/mL）の約 3 倍であった。投与中止後、血清中濃度は漸減し、投与中止 5 日目には 0.24ng/mL となった [23]。

3）生物学的同等性試験

〈アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」〉

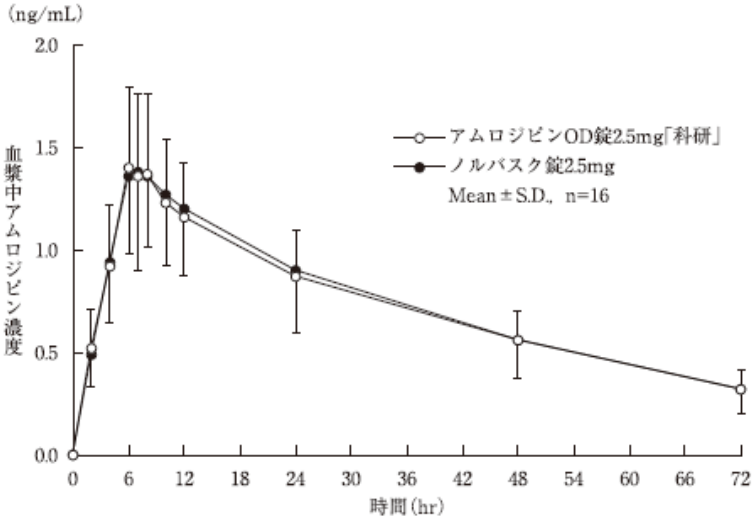
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」(2001 年 5 月 31 日　医薬審発第 786 号）に基づき実施

アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」とノルバスク錠 2.5mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（アムロジピンとして 2.5mg）健康成人男子に絶食後、水あり及び水なし単回経口投与して血漿中アムロジピン濃度を測定し、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）～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 [24]。

水あり服用

	n	AUC_{0-72} (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
アムロジピンOD錠2.5mg「科研」	16	51.8±12.3	1.47±0.38	7.1±1.1	33.6±6.7
ノルバスク錠2.5mg	16	52.8±15.9	1.48±0.44	7.6±1.5	32.6±5.5

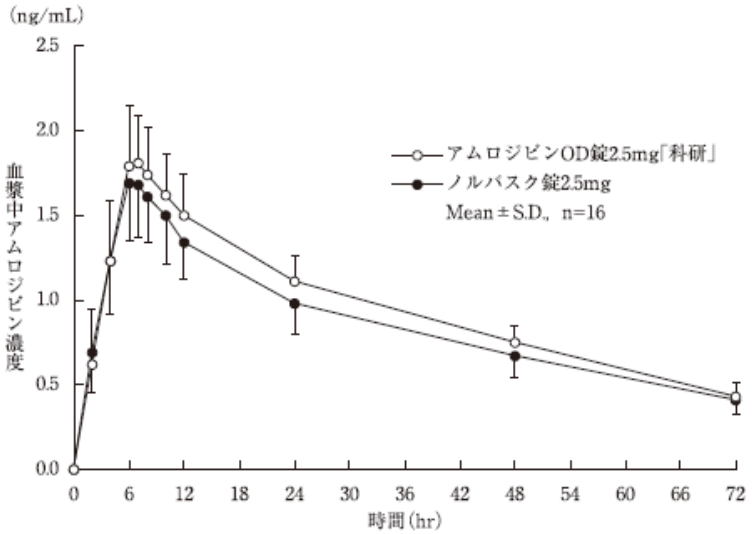
Mean±S.D.



水なし服用（ノルバスク錠2.5mgは水で服用）

	n	AUC_{0-72} (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
アムロジピンOD錠2.5mg「科研」	16	67.8±9.2	1.88±0.31	6.9±1.1	34.7±4.5
ノルバスク錠2.5mg	16	61.4±10.5	1.74±0.32	6.7±0.8	37.5±5.4

Mean±S.D.



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。

〈アムロジピン OD 錠 5mg「科研」〉

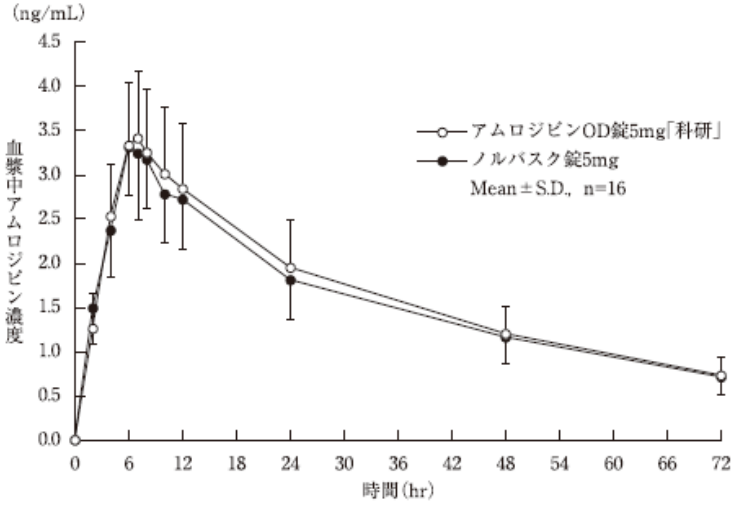
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」（2001 年 5 月 31 日　医薬審発第 786 号）に基づき実施

アムロジピン OD 錠 5mg「科研」とノルバスク錠 5mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（アムロジピンとして 5mg）健康成人男子に絶食後、水あり及び水なし単回経口投与して血漿中アムロジピン濃度を測定し、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）～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[24]。

水あり服用

	n	AUC_{0-72} (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
アムロジピンOD錠5mg「科研」	16	119.3±27.8	3.56±0.75	6.9±1.1	34.7±6.5
ノルバスク錠5mg	16	114.0±24.5	3.47±0.65	6.6±0.7	35.3±6.3

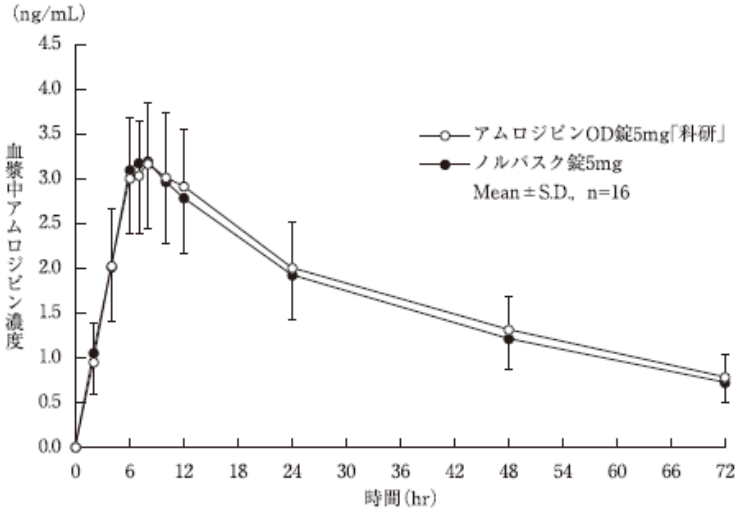
Mean±S.D.



水なし服用（ノルバスク錠5mgは水で服用）

	n	AUC_{0-72} (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)
アムロジピンOD錠5mg「科研」	16	121.3±28.0	3.30±0.67	7.8±1.5	36.6±11.7
ノルバスク錠5mg	16	116.4±28.1	3.36±0.77	7.3±0.9	34.0±6.5

Mean±S.D.



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。

〈アムロジピン OD 錠 10mg「科研」〉

アムロジピン OD 錠 10mg「科研」は、アムロジピン OD 錠 5mg「科研」と含量が異なる製剤として開発されたことから、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、溶出挙動を比較したところ同等と判断され、両剤は生物学的に同等とみなされた[24]。

（３）中毒域

該当資料なし

（４）食事・併用薬の影響

健康成人にアムロジピンとして 5mg をクロスオーバー法により空腹時又は食後に単回経口投与した場合の薬物動態パラメータに有意差は認められず、アムロジピンの吸収に及ぼす食事の影響は少ないものと考えられる[25]。

「VIII. ７．相互作用」の項参照

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[24]

投与量（アムロジピンとして）	消失速度定数（hr^{-1}）
2.5mg	0.0213±0.0035
5mg	0.0206±0.0035

試験製剤単回投与時（水あり服用）、平均±標準偏差、n=16

（４）クリアランス

該当資料なし

（５）分布容積

該当資料なし

（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

「VII．１．（４）食事・併用薬の影響」の項参照

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

ヒト母乳中へ移行することが報告されている。（「VIII．６．（６）授乳婦」の項参照）

（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

ヒト血漿蛋白との結合率は 97.1%（*in vitro*、平衡透析法）であった。

６．代謝

（１）代謝部位及び代謝経路

本剤は主に肝で代謝される。（「VIII．６．（３）肝機能障害患者」の項参照）
健康成人 16 例にアムロジピン 5mg を単回経口投与した場合、24 時間までに認められた主たる尿中代謝体はジヒドロピリジン環の酸化したピリジン環体及びその酸化的脱アミノ体であった。

（２）代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

本剤の代謝には主として薬物代謝酵素 CYP3A4 が関与していると考えられている。（「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

尿中排泄

健康成人 6 例にアムロジピンとして 2.5mg 又は 5mg を単回経口投与した場合、尿中に未変化体として排泄される割合は小さく、いずれの投与量においても尿中未変化体排泄率は投与後 24 時間までに投与量の約 3%、144 時間までに約 8%であった。また 2.5mg を 1 日 1 回 14 日間連続投与

した場合の尿中排泄率は投与開始 6 日目でほぼ定常状態に達し、6 日目以降の 1 日当たりの未変化体の尿中排泄率は 6.3～7.4%であった[23]。
健康成人 2 例に ^{14}C-標識アムロジピン 15mg を単回経口投与した場合、投与 12 日目までに投与放射能の 59.3%は尿中、23.4%は糞中に排泄され、投与後 72 時間までの尿中放射能の 9%が未変化体であった。その他に 9 種の代謝物が認められた[26]（外国人データ）。
なお、これら代謝物にはアムロジピンをしのぐ薬理作用は認められていない。

8．トランスポーターに関する情報

該当資料なし

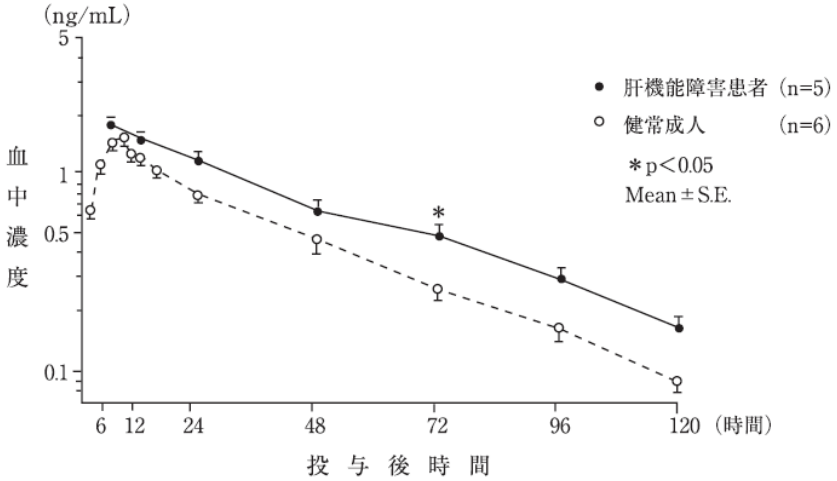
9．透析等による除去率

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

成人肝硬変患者（Child 分類 A、B）5 例にアムロジピンとして 2.5mg を単回投与した場合の血中濃度推移並びに薬物動態パラメータは図及び表の通りである。健康成人に比し、投与 72 時間後の血中濃度が有意に上昇し、$T_{1/2}$、AUC はやや高値を示したが有意差は認められなかった[27]。
［9.3 参照］



	T_{max} (hr)	C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ (ng・hr/mL)	$T_{1/2}$ (hr)
肝機能障害患者	7.2±1.2	1.9±0.2	104.0±15.5	43.0±8.0
健康成人[22]	7.3±0.4	1.64±0.07	68.1±5.4	33.3±2.2

有意差検定：n.s.
Mean±S.E.

（2）小児

高血圧症患者にアムロジピンとして 1 日 1.25～20mg を連続投与した母集団薬物動態試験の結果、クリアランス（平均値）は、6～12 歳（34 例）で 24.9L/hr、13～17 歳（28 例）で 27.9L/hr と推定され、成人における値と同様であった[28]（外国人データ）。
注）小児患者において本剤の承認された 1 日通常用量は 2.5mg である。

（3）高齢者

老年高血圧症患者 6 例（男 2、女 4、平均年齢 79.7 歳）にアムロジピンとして 5mg を単回、及び 8 日間反復投与した場合の薬物動態パラメータは表の通りである。単回投与した場合、若年健康成人（男 6、平均年齢 22.3 歳）に比し、C_{max}、AUC は有意に高値を示したが、$T_{1/2}$ に有意差は認められなかった。反復投与時には老年者の血清中アムロジピン濃度は若年者よりも高く

推移したが、そのパターンは若年者に類似しており、老年者でその蓄積が増大する傾向は認められなかった[29]。［9.8 参照］

	老年高血圧症患者		若年健康成人	
	単回投与時	反復投与時	単回投与時	反復投与時
C_{max}（ng/mL）	4.24±0.08[b]	14.9±2.2[a]	2.63±0.35	7.51±0.32
T_{max}（hr）	7.2±0.49	8.0±1.8	6.7±0.42	8.0±0.7
$T_{1/2}$（hr）	37.5±6.0	47.4±11.3	27.7±4.6	34.7±2.7
AUC（ng・hr/mL）	116.9±8.4[b]	—	63.2±5.5	—

Mean±S.E.、AUC：0～48時間値
[a] $p<0.05$、[b] $p<0.01$（vs健康者）

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）
ジヒドロピリジン系化合物に対し過敏症の既往歴のある患者

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 降圧作用に基づくめまい等があらわれることがあるので、高所作業、自動車の運転等危険を伴う機械を操作する際には注意させること。
8.2 本剤は血中濃度半減期が長く投与中止後も緩徐な降圧効果が認められるので、本剤投与中止後に他の降圧剤を使用するときは、用量並びに投与間隔に留意するなど慎重に投与すること。

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. 特定の背景を有する患者に関する注意
9.1 合併症・既往歴等のある患者
9.1.1 過度に血圧の低い患者
さらに血圧が低下するおそれがある。

（２）腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者
9.2.1 重篤な腎機能障害のある患者
降圧に伴い腎機能が低下することがある。

（３）肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者
増量時には慎重に投与すること。高用量（10mg）において副作用の発現率が高まるおそれがある。本剤は主に肝で代謝されるため、血中濃度半減期の延長及び血中濃度－時間曲線下面積（AUC）が増大することがある。［11.2、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

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性に投与する場合には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。動物実験で妊娠末期に投与すると妊娠期間及び分娩時間が延長することが認められている[30]。

（６）授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。ヒト母乳中へ移行することが報告されている[31]。

（７）小児等

9.7 小児等

低出生体重児、新生児、乳児又は6歳未満の幼児を対象とした臨床試験は実施していない。

（８）高齢者

9.8 高齢者

低用量（2.5mg/日）から投与を開始するなど慎重に投与すること。一般に過度の降圧は好ましくないとされている。体内動態試験で血中濃度が高く、血中濃度半減期が長くなる傾向が認められている[29]。［16.6.3 参照］

７．相互作用

10. 相互作用

本剤の代謝には主として薬物代謝酵素 CYP3A4 が関与していると考えられている。

（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
降圧作用を有する薬剤	降圧作用が増強されるおそれがある。	相互に作用を増強するおそれがある。
CYP3A4 阻害剤 エリスロマイシン ジルチアゼム リトナビル ニルマトレルビル・リトナビル イトラコナゾール等	エリスロマイシン及びジルチアゼムとの併用により、本剤の血中濃度が上昇したとの報告がある。	本剤の代謝が競合的に阻害される可能性が考えられる。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
CYP3A4 誘導剤 リファンピシン等	本剤の血中濃度が低下するおそれがある。	本剤の代謝が促進される可能性が考えられる。
グレープフルーツジュース	本剤の降圧作用が増強されるおそれがある。	グレープフルーツに含まれる成分が本剤の代謝を阻害し、本剤の血中濃度が上昇する可能性が考えられる。
シンバスタチン	シンバスタチン 80mg（国内未承認の高用量）との併用により、シンバスタチンの AUC が 77％上昇したとの報告がある。	機序は不明である。
タクロリムス	併用によりタクロリムスの血中濃度が上昇し、腎障害等のタクロリムスの副作用が発現するおそれがある。併用時にはタクロリムスの血中濃度をモニターし、必要に応じてタクロリムスの用量を調整すること。	本剤とタクロリムスは、主として CYP3A4 により代謝されるため、併用によりタクロリムスの代謝が阻害される可能性が考えられる。

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 劇症肝炎（頻度不明）、**肝機能障害、黄疸**（0.1％未満）

AST、ALT、γ-GTP の上昇等を伴う肝機能障害があらわれることがある。

11.1.2 無顆粒球症（頻度不明）、**白血球減少**（0.1％未満）、**血小板減少**（頻度不明）

11.1.3 房室ブロック（0.1％未満）

徐脈、めまい等の初期症状があらわれることがある。

11.1.4 横紋筋融解症（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK 上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等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。また、横紋筋融解症による急性腎障害の発症に注意すること。

（２）その他の副作用

11.2 その他の副作用

	0.1～1％未満[注2)]	0.1％未満[注2)]	頻度不明
肝臓	ALT、AST の上昇、肝機能障害、Al-P、LDH の上昇	γ-GTP 上昇、黄疸	腹水

	0.1～1%未満[注2)]	0.1%未満[注2)]	頻度不明
循環器	浮腫[注1)]、ほてり（熱感、顔面潮紅等）、動悸、血圧低下	胸痛、期外収縮、洞房又は房室ブロック、洞停止、心房細動、失神、頻脈	徐脈
精神・神経系	めまい・ふらつき、頭痛・頭重	眠気、振戦、末梢神経障害	気分動揺、不眠、錐体外路症状
消化器	心窩部痛、便秘、嘔気・嘔吐	口渇、消化不良、下痢・軟便、排便回数増加、口内炎、腹部膨満、胃腸炎	膵炎
筋・骨格系		筋緊張亢進、筋痙攣、背痛	関節痛、筋肉痛
泌尿・生殖器	BUN 上昇	クレアチニン上昇、頻尿・夜間頻尿、尿管結石、尿潜血陽性、尿中蛋白陽性	勃起障害、排尿障害
代謝異常		血清コレステロール上昇、CK 上昇、高血糖、糖尿病、尿中ブドウ糖陽性	
血液		赤血球、ヘモグロビン、白血球の減少、白血球増加、紫斑	血小板減少
過敏症	発疹	そう痒、じん麻疹、光線過敏症	多形紅斑、血管炎、血管浮腫
口腔		（連用により）歯肉肥厚	
その他	全身倦怠感	しびれ、脱力感、耳鳴、鼻出血、味覚異常、疲労、咳、発熱、視力異常、呼吸困難、異常感覚、多汗、血中カリウム減少	女性化乳房、脱毛、鼻炎、体重増加、体重減少、疼痛、皮膚変色

注 1）10mg への増量により高頻度に認められた［9.3、17.1.2 参照］。
注 2）発現頻度は使用成績調査を含む。

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

過度の末梢血管拡張により、ショックを含む著しい血圧低下と反射性頻脈を起こすことがある。

13.2 処置

特異的な解毒薬はない。本剤は蛋白結合率が高いため、透析による除去は有効ではない。
また、本剤服用直後に活性炭を投与した場合、本剤の AUC は 99%減少し、服用 2 時間後では 49%減少したことから、本剤過量投与時の吸収抑制処置として活性炭投与が有効であると報告されている[32)]。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

分割後は早めに使用すること。分割後やむを得ず保存する場合には、湿気、光を避けて保存すること。

14.2 薬剤交付時の注意

14.2.1 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。

14.2.2 本剤を PTP シートから取り出して保存する場合は、湿気、光を避けて保存するよう指導すること。

14.2.3 本剤は舌の上にのせて唾液を浸潤させると崩壊するため、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。

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

因果関係は明らかでないが、本剤による治療中に心筋梗塞や不整脈（心室性頻拍を含む）がみられたとの報告がある。

（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：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：毒薬

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

20. 取扱い上の注意
アルミピロー開封後は湿気を避けて保存すること。

５．患者向け資材

くすりのしおり：あり
患者向医薬品ガイド：あり

６．同一成分・同効薬

同一成分薬：ノルバスク錠 2.5mg/5mg/10mg、ノルバスク OD 錠 2.5mg/5mg/10mg、アムロジン錠 2.5mg/5mg/10mg、アムロジン OD 錠 2.5mg/5mg/10mg
同　効　薬：ニカルジピン塩酸塩、ニフェジピン等

７．国際誕生年月日

1989 年 3 月 8 日

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

製品名	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
アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」	2009 年 7 月 13 日	22100AMX02201000	2009 年 11 月 13 日	2009 年 11 月 13 日
アムロジピン OD 錠 5mg「科研」	2009 年 7 月 13 日	22100AMX02202000	2009 年 11 月 13 日	2009 年 11 月 13 日
アムロジピン OD 錠 10mg「科研」	2013 年 8 月 15 日	22500AMX01680000	2013 年 12 月 13 日	2013 年 12 月 13 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

○承認時（2009 年 7 月 13 日承認）
【効能・効果】高血圧症、狭心症
【用法・用量】

・高血圧症：通常、成人にはアムロジピンとして 2.5～5mg を 1 日 1 回経口投与する。
なお、症状に応じ適宜増減する。
・狭 心 症 ：通常、成人にはアムロジピンとして 5mg を 1 日 1 回経口投与する。
なお、症状に応じ適宜増減する。

○用法・用量の一部変更（下線部、2009 年 12 月 15 日承認）
【効能・効果】変更なし
【用法・用量】
・高血圧症：通常、成人にはアムロジピンとして 2.5～5mg を 1 日 1 回経口投与する。
なお、症状に応じ適宜増減するが、効果不十分な場合には 1 日 1 回 10mg まで増量することができる。
・狭 心 症 ：変更なし

○小児（6 歳以上）の高血圧症に対する用法・用量の追加（下線部、2012 年 11 月 1 日承認）
【効能・効果】変更なし
【用法・用量】
小児への投与〔アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」、アムロジピン OD 錠 5mg「科研」〕
・高血圧症：通常、6 歳以上の小児には、アムロジピンとして 2.5mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、年齢、体重、症状により適宜増減する。

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、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

製品名	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 番号	レセプト電算処理システム用コード
アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」	2171022F3013	2171022F3153	119573601	621957301
アムロジピン OD 錠 5mg「科研」	2171022F4010	2171022F4150	119574301	621957401
アムロジピン OD 錠 10mg「科研」	2171022F6217	2171022F6217	122985101	622298501

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。

XI. 文献

１．引用文献

1) 山中教造、他. 日本薬理学雑誌. 1991；97（3）：167-78
2) 社内資料：安定性試験（アムロジピン OD 錠「科研」）
3) 社内資料：溶出試験（アムロジピン OD 錠「科研」）
4) 増山善明、他. 薬理と治療. 1991；19（7）：2853-71
5) 増山善明、他. 薬理と治療. 1991；19（7）：2873-93
6) 増山善明、他. 薬理と治療. 1991；19（7）：2895-908
7) 増山善明、他. 臨床評価. 1991；19（2）：213-41
8) 猿田享男、他. 薬理と治療. 1993；21（2）：505-26
9) 山田和生、他. 薬理と治療. 1991；19（8）：3189-203
10) Fujiwara T, et al. J Hum Hypertens. 2009；23（8）：521-9
11) アムロジピン 5mg で効果不十分な患者に対するアムロジピン 10mg の長期投与時の安全性及び有効性（ノルバスク錠/OD 錠 2.5/5mg、アムロジン錠/OD 錠 2.5/5mg：2009 年 2 月 23 日承認、審査報告書）
12) 加藤和三、他. 基礎と臨床. 1992；26（2）：683-702
13) 加藤和三、他. 臨床評価. 1991；19（3）：355-78
14) 加藤和三、他. 臨床評価. 1991；19（3）：379-404
15) 渡邊賢一、他. 薬理と治療. 1991；19（7）：2909-22
16) 中島譲、他. 薬理と治療. 1991；19（8）：3205-19
17) 山中教造、他. 日本薬理学雑誌. 1991；97（2）：115-26
18) Fleckenstein A, et al. Am J Cardiol. 1989；64（17）：21 I-34 I
19) Suzuki M. et al. Eur J Pharmacol. 1993；228（5-6）：269-74
20) Nayler W G, et al. Am J Cardiol. 1989；64（17）：65 I-75 I
21) 田村裕男、他. 薬理と治療. 1990；18（Suppl.2）：S339-45
22) 健康成人におけるアムロジピン 10mg 単回投与時の安全性と薬物動態（ノルバスク錠/OD 錠 2.5/5mg、アムロジン錠/OD 錠 2.5/5mg：2009 年 2 月 23 日承認、審査報告書）
23) 中島光好、他. 臨床医薬. 1991；7（7）：1407-35
24) 社内資料：生物学的同等性試験（アムロジピン OD 錠「科研」）
25) 浦江隆次、他. 薬理と治療. 1991；19（7）：2933-42
26) Beresford A P, et al. Xenobiotica. 1988；18（2）：245-54
27) 足立幸彦、他. 薬理と治療. 1991；19（7）：2923-32
28) Flynn JT, et al. J Clin Pharmacol. 2006；46：905-16
29) 桑島巌、他. Geriatric Medicine. 1991；29（6）：899-902
30) 堀本政夫、他. 応用薬理. 1991；42（2）：167-76
31) Naito T, et al. J Hum Lact. 2015；31（2）：301-6
32) Laine K,et al. Br J Clin Pharmacol. 1997；43（1）：29-33

２．その他の参考文献

特になし

XII. 参考資料

１．主な外国での発売状況

海外で発売されていない（2023 年 7 月時点）

２．海外における臨床支援情報

該当しない

XIII. 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

（１）粉砕

個別に照会すること
［問合せ］
科研製薬株式会社　医薬品情報サービス室
フリーダイヤル：0120-519-874

（２）崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

個別に照会すること
［問合せ］
科研製薬株式会社　医薬品情報サービス室
フリーダイヤル：0120-519-874

２．その他の関連資料

（１）提供用資料

該当資料なし

（２）GS1 コード

製品名	包装	GS1 コード	
		調剤包装単位	販売包装単位
アムロジピン OD 錠 2.5mg「科研」	100 錠 PTP	(01) 04987042 352419	(01) 14987042 352508
	500 錠 PTP	(01) 04987042 352419	(01) 14987042 352522
アムロジピン OD 錠 5mg「科研」	100 錠 PTP	(01) 04987042 352464	(01) 14987042 352706
	500 錠 PTP	(01) 04987042 352464	(01) 14987042 352720
アムロジピン OD 錠 10mg「科研」	100 錠 PTP	(01) 04987042 352617	(01) 14987042 352911