

## 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  
ビカルタミド錠・口腔内崩壊錠  
ビカルタミド錠 80mg 「日医工」  
ビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」  
Bicalutamide Tablets, OD Tablets

剤形	錠：フィルムコーティング錠 OD錠：素錠（口腔内崩壊錠）		
製剤の規制区分	劇薬、処方箋医薬品 <sup>注</sup> 注）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・販売開始 年月日		錠	OD錠
	製造販売承認	2009年1月14日	2016年2月15日
	薬価基準収載	2009年5月15日	2016年6月17日
	販売開始	2009年5月15日	2016年6月17日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：日医工株式会社		
医薬情報担当者の連絡先			
問い合わせ窓口	日医工株式会社 お客様サポートセンター TEL：0120-517-215 FAX：076-442-8948 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.nichiiko.co.jp/">https://www.nichiiko.co.jp/</a>		

本IFは2023年11月改訂（第1版）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—

(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て、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。

# 目 次

<b>I. 概要に関する項目</b> .....	<b>1</b>	<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b> .....	<b>17</b>
1. 開発の経緯.....	1	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群 ...	17
2. 製品の治療学的特性.....	1	2. 薬理作用.....	17
3. 製品の製剤学的特性.....	1	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b> .....	<b>18</b>
4. 適正使用に関して周知すべき特性.....	1	1. 血中濃度の推移.....	18
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項.....	1	2. 薬物速度論的パラメータ.....	21
6. RMP の概要.....	1	3. 母集団（ポピュレーション）解析.....	22
<b>II. 名称に関する項目</b> .....	<b>2</b>	4. 吸収.....	22
1. 販売名.....	2	5. 分布.....	22
2. 一般名.....	2	6. 代謝.....	22
3. 構造式又は示性式.....	2	7. 排泄.....	22
4. 分子式及び分子量.....	2	8. トランスポーターに関する情報.....	23
5. 化学名（命名法）又は本質.....	2	9. 透析等による除去率.....	23
6. 慣用名、別名、略号、記号番号.....	2	10. 特定の背景を有する患者.....	23
<b>III. 有効成分に関する項目</b> .....	<b>3</b>	11. その他.....	23
1. 物理化学的性質.....	3	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b> .....	<b>24</b>
2. 有効成分の各種条件下における安定性.....	3	1. 警告内容とその理由.....	24
3. 有効成分の確認試験法、定量法.....	3	2. 禁忌内容とその理由.....	24
<b>IV. 製剤に関する項目</b> .....	<b>4</b>	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 ...	24
1. 剤形.....	4	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 ...	24
2. 製剤の組成.....	5	5. 重要な基本的注意とその理由.....	24
3. 添付溶解液の組成及び容量.....	5	6. 特定の背景を有する患者に関する注意.....	24
4. 力価.....	5	7. 相互作用.....	25
5. 混入する可能性のある夾雑物.....	5	8. 副作用.....	26
6. 製剤の各種条件下における安定性.....	6	9. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	27
7. 調製法及び溶解後の安定性.....	9	10. 過量投与.....	28
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化）.....	9	11. 適用上の注意.....	28
9. 溶出性.....	9	12. その他の注意.....	28
10. 容器・包装.....	13	<b>IX. 非臨床試験に関する項目</b> .....	<b>29</b>
11. 別途提供される資材類.....	13	1. 薬理試験.....	29
12. その他.....	13	2. 毒性試験.....	29
<b>V. 治療に関する項目</b> .....	<b>14</b>	<b>X. 管理的事項に関する項目</b> .....	<b>30</b>
1. 効能又は効果.....	14	1. 規制区分.....	30
2. 効能又は効果に関連する注意.....	14	2. 有効期間.....	30
3. 用法及び用量.....	14	3. 包装状態での貯法.....	30
4. 用法及び用量に関連する注意.....	14	4. 取扱い上の注意点.....	30
5. 臨床成績.....	14	5. 患者向け資材.....	30

## 略語表

6.	同一成分・同効薬.....	30
7.	国際誕生年月日 .....	30
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.....	30
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.....	30
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 .....	31
14.	保険給付上の注意 .....	31
<b>X I.</b>	<b>文献</b> .....	<b>32</b>
1.	引用文献 .....	32
2.	その他の参考文献.....	32
<b>X II.</b>	<b>参考資料</b> .....	<b>33</b>
1.	主な外国での発売状況.....	33
2.	海外における臨床支援情報 .....	33
<b>X III.</b>	<b>備考</b> .....	<b>34</b>
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.....	34
2.	その他の関連資料.....	37

略語	略語内容
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
Cmax	最高血中濃度
tmax	最高血中濃度到達時間
t <sub>1/2</sub>	消失半減期
S.D.	標準偏差
HR	ハザード比

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

本剤は、ビカルタミドを有効成分とする前立腺癌治療剤である。

「ビカルタミド錠 80mg「日医工）」は、日医工株式会社が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、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2009年1月14日に承認を取得し、2009年5月15日に販売を開始した。(薬食発第0331015号(平成17年3月31日)に基づき承認申請)

「ビカルタミドOD錠 80mg「日医工）」は、日医工株式会社が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、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2016年2月15日に承認を取得し、2016年6月17日に販売を開始した。(薬食発第0331015号(平成17年3月31日)に基づき承認申請)

### 2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、ビカルタミドを有効成分とする前立腺癌治療剤である。
- (2) 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。(「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

- (1) OD錠は香料としてオレンジフレーバーを使用している。
- (2) PTPシートはピッチコントロールを行い、1錠ごとに成分名、含量、屋号、「1日1回」を表示した。
- (3) OD錠の個装箱は、販売名、使用期限、製造番号、GS1データバーを記載した切り取りタグ付きである。

### 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料、 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 作成されている資料	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

ビカルタミド錠 80mg 「日医工」

ビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」

#### (2) 洋名

Bicalutamide Tablets

Bicalutamide OD Tablets

#### (3) 名称の由来

一般名より

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

ビカルタミド (JAN)

#### (2) 洋名 (命名法)

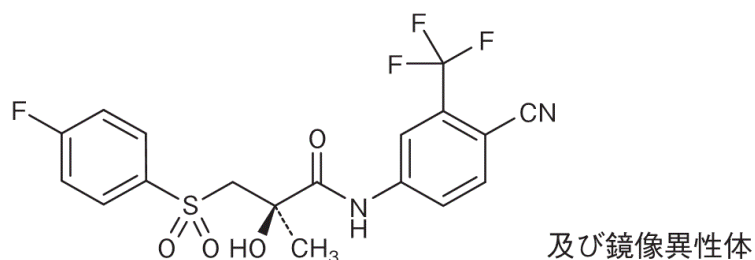
Bicalutamide (JAN)

#### (3) ステム (stem)

不明

### 3. 構造式又は示性式

化学構造式：



### 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) 又は本質

(2*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

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

白色の粉末又は結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

アセトンに溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、エタノール（99.5）に溶けにくく、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

融 点：192～197℃

##### (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

アセトン溶液（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

##### (1) 確認試験法

###### 1) 紫外可視吸光度測定法

本品のメタノール溶液につき、吸収スペクトルを測定し、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。

###### 2) 赤外吸収スペクトル測定法

臭化カリウム錠剤法により試験を行い、本品のスペクトルと本品の参照スペクトルを比較するとき、両者のスペクトルは同一波数のところに同様の強度の吸収を認める。

##### (2) 定量法

液体クロマトグラフィー

検出器：紫外吸光光度計

移動相 A：トリフルオロ酢酸試液

移動相 B：アセトニトリル



#### IV. 製剤に関する項目







##### 1. 剤形

###### (1) 剤形の区別

錠：フィルムコーティング錠

OD錠：素錠（口腔内崩壊錠）

###### (2) 製剤の外観及び性状

販売名		ビカルタミド錠 80mg「日医工」	ビカルタミド OD錠 80mg「日医工」
剤形		フィルムコーティング錠	素錠 (口腔内崩壊錠)
色調		白色	白色～微黄白色
外形	表面		
	裏面		
	側面		
直径 (mm)		7.6	10
厚さ (mm)		4.3	2.9
質量 (mg)		210	300
本体コード		<i>n</i> 057 80	<i>n</i> 712 OD 80
包装コード		Ⓝ 057	Ⓝ 712

###### (3) 識別コード

〔IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状〕の項参照

###### (4) 製剤の物性

〔IV. 6. 製剤の各種条件下における安定性〕の項参照

###### (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	ビカルタミド錠 80mg「日医工」	ビカルタミド OD 錠 80mg「日医工」
有効成分	1錠中 ビカルタミド 80mg	1錠中 ビカルタミド 80mg
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、デンプン、グリコール酸ナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース、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6000、タルク、酸化チタン、カルナウバロウ	無水リン酸水素カルシウム、結晶セルロース、カルメロースカルシウム、ヒプロメロース、カルメロース、軽質無水ケイ酸、アセスルファムカリウム、アスパルテーム（L-フェニルアラニン化合物）、香料、フマル酸ステアリルナトリウム

### (2) 電解質等の濃度

該当資料なし

### (3) 熱量

該当資料なし

## 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<sup>1)</sup>

### (1) 加速試験

試験実施期間：2006/12/26～2007/10/3

◇ビカルタミド錠 80mg「日医工」 加速試験 40℃・75%RH [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 ＜白色のフィルム コーティング錠＞	BIC80T-1 BIC80T-2 BIC80T-3	適合	適合	適合	適合
確認試験 (紫外可視吸光度測定法)	BIC80T-1 BIC80T-2 BIC80T-3	適合	適合	適合	適合
含量均一性試験 (%) ＜15%以下＞	BIC80T-1 BIC80T-2 BIC80T-3	1.2～2.4 1.2～1.9 1.0～1.9	— — —	— — —	1.7～1.9 1.2～1.9 1.4～1.7
溶出性 (%) ＜45 分、80%以上＞	BIC80T-1 BIC80T-2 BIC80T-3	93.7～95.9 94.4～94.6 94.2～94.7	92.9～93.7 94.0～94.6 93.3～94.3	93.0～93.9 92.2～92.8 92.2～92.8	92.2～92.9 92.2～92.4 92.7～93.4
含量 (%) ※ ＜95.0～105.0%＞	BIC80T-1 BIC80T-2 BIC80T-3	99.5～100.2 100.3～100.7 100.1～100.7	100.4～100.7 100.4～100.5 99.7～100.4	99.6～100.1 99.8～100.1 99.7～100.5	100.2～101.7 99.9～100.9 100.7～101.5

※：表示量に対する含有率 (%)

試験実施期間：2014/6/27～2015/1/6

◇ビカルタミド OD 錠 80mg「日医工」 加速試験 40℃・75%RH [最終包装形態 (PTP 包装)]

測定項目 ＜規格＞	ロット 番号	保存期間			
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状 ＜白色～微黄白色の素錠 (口腔内崩壊錠)＞	BCA4F01 BCA4F02 BCA4F03	適合	適合	適合	適合
確認試験 (紫外可視吸光度測定法)	BCA4F01 BCA4F02 BCA4F03	適合	適合	適合	適合
含量均一性試験 ＜15.0%以下＞	BCA4F01 BCA4F02 BCA4F03	1.5～2.4 1.4～2.5 1.8～2.3	—	—	1.2～2.6 1.4～2.9 1.7～2.7
崩壊試験 (秒) ＜60 秒以内＞	BCA4F01 BCA4F02 BCA4F03	26～33 28～35 27～36	24～29 25～29 23～29	20～25 20～25 20～24	18～21 18～23 18～23
溶出性 (%) ＜60 分、70%以上＞	BCA4F01 BCA4F02 BCA4F03	88.6～90.8 88.8～91.2 88.6～90.5	87.4～90.4 88.8～92.2 86.8～91.8	83.7～87.9 84.5～87.9 83.6～87.1	81.5～84.7 81.6～84.5 81.4～84.4
含量 (%) ※ ＜95.0～105.0%＞	BCA4F01 BCA4F02 BCA4F03	99.7～100.7 99.6～100.6 100.1～100.3	99.7～100.1 99.5～100.1 99.9～100.2	100.2～100.7 100.2～100.6 100.1～100.3	99.9～100.9 100.1～100.6 100.3～101.3

※：表示量に対する含有率 (%)

(2) 無包装状態の安定性

試験実施期間：2008/12/16～2009/3/25

◇ビカルタミド錠 80mg「日医工」 無包装 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=10 <白色のフィルム コーティング錠>	HU080	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
溶出性 (%) n=6 <45 分、80%以上>	HU080	89.0～93.7	92.0～93.9	89.4～93.8	91.4～94.6	92.5～94.9
含量 (%) ※ n=3 <95.0～105.0%>	HU080	99.2～99.4	100.0～100.9	99.2～99.7	99.9～100.5	99.6～100.9
(参考値) 硬度 (N) n=10	HU080	124～136	121～131	123～135	120～137	120～131

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ビカルタミド錠 80mg「日医工」 無包装 25℃・75%RH [遮光、開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=10 <白色のフィルム コーティング錠>	HU080	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
溶出性 (%) n=6 <45 分、80%以上>	HU080	89.0～93.7	89.3～91.9	91.3～94.2	91.1～92.9	91.5～93.9
含量 (%) ※ n=3 <95.0～105.0%>	HU080	99.2～99.4	100.0～101.2	99.1～99.6	98.4～100.2	99.9～101.2
(参考値) 硬度 (N) n=10	HU080	124～136	90～98	94～101	99～106	91～99

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ビカルタミド錠 80mg「日医工」 無包装 室温、曝光 [D65 光源、気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量			
		開始時	40 万 Lx・hr	80 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 n=10 <白色のフィルム コーティング錠>	HU080	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠	白色のフィルム コーティング錠
溶出性 (%) n=6 <45 分、80%以上>	HU080	89.0～93.7	93.1～95.0	92.8～94.1	90.4～93.7
含量 (%) ※ n=3 <95.0～105.0%>	HU080	99.2～99.4	100.0～100.8	99.7～100.3	99.9～100.5
(参考値) 硬度 (N) n=10	HU080	124～136	125～134	124～135	127～139

※：表示量に対する含有率 (%)

試験実施期間：2015/9/25～2016/1/14

◇ビカルタミド OD錠 80mg「日医工」 無包装 40℃ [遮光、気密容器]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間		
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月
性状 <白色～微黄白色の素錠 (口腔内崩壊錠)>	508010	白色の素錠	白色の素錠	白色の素錠
崩壊性 (秒) n=6 <60 秒以内>	508010	29～38	31～39	33～35
溶出性 (%) n=6 <60 分、70%以上>	508010	87.6～88.5	87.4～89.8	85.6～87.3
含量 (%) ※ <95.0～105.0%>	508010	100.1	99.9	100.7
(参考値) 硬度 (N)	508010	97	92	95

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ビカルタミド OD錠 80mg「日医工」 無包装 25℃・75%RH [遮光、開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間		
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月
性状 <白色～微黄白色の素錠 (口腔内崩壊錠)>	508010	白色の素錠	白色の素錠	白色の素錠
崩壊性 (秒) n=6 <60 秒以内>	508010	29～38	18～24	19～20
溶出性 (%) n=6 <60 分、70%以上>	508010	87.6～88.5	83.8～86.3	82.8～84.7
含量 (%) ※ <95.0～105.0%>	508010	100.1	100.2	100.3
(参考値) 硬度 (N)	508010	97	51	52

※：表示量に対する含有率 (%)

◇ビカルタミド OD錠 80mg「日医工」 無包装 室温、曝光 [D65 光源 (1,000Lx)、シャーレをラップで覆う]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間		
		開始時	60 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状 <白色～微黄白色の素錠 (口腔内崩壊錠)>	508010	白色の素錠	白色の素錠	白色の素錠
崩壊性 (秒) n=6 <60 秒以内>	508010	29～38	34～39	32～35
溶出性 (%) n=6 <60 分、70%以上>	508010	87.6～88.5	87.2～88.6	87.1～88.8
含量 (%) ※ <95.0～105.0%>	508010	100.1	99.4	100.2
(参考値) 硬度 (N)	508010	97	96	91

※：表示量に対する含有率 (%)

## 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（物理化学的变化）

該当しない

## 9. 溶出性

溶出試験<sup>2)</sup>

### 〈ピカルタミド錠 80mg 「日医工」〉

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（平成 13 年 5 月 31 日 医薬審発第 786 号）

試験条件

装置：日本薬局方溶出試験法 パドル法

回転数及び試験液：

50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）

50rpm（pH1.2、pH4.0、pH6.8：ポリソルベート 80 1.0%添加）

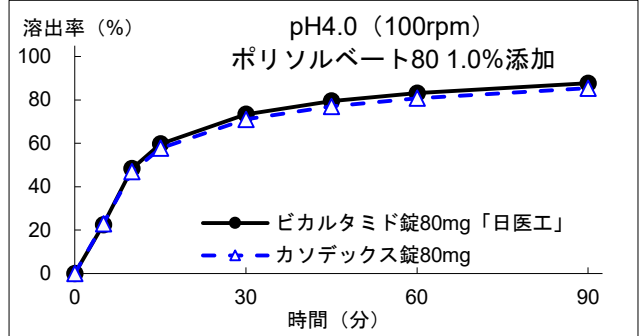
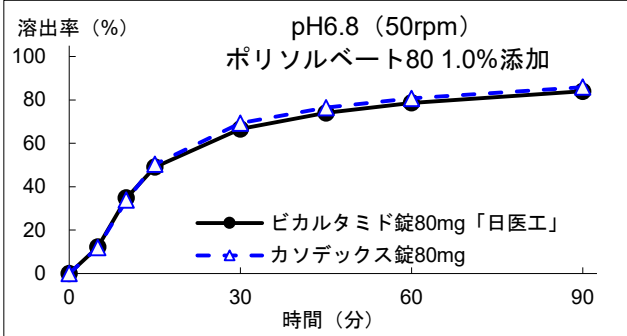
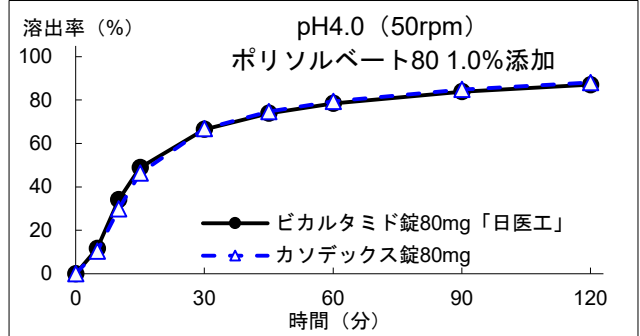
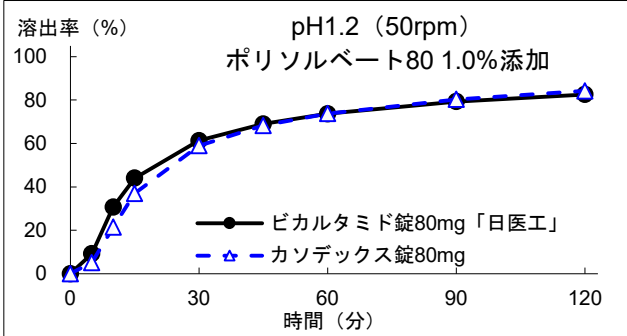
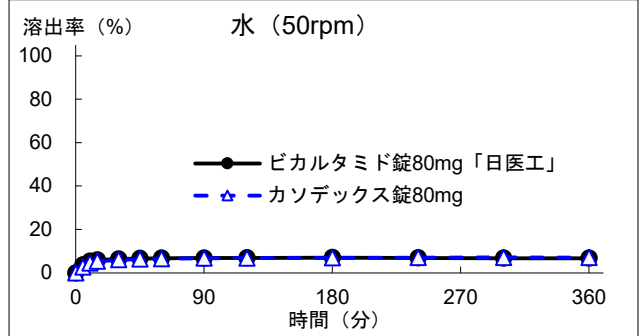
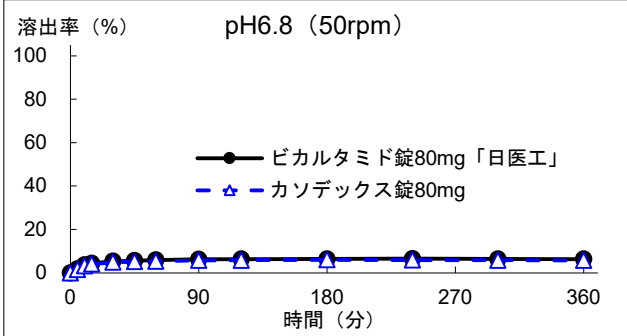
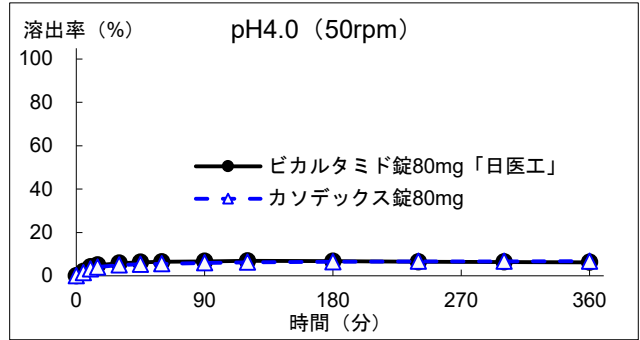
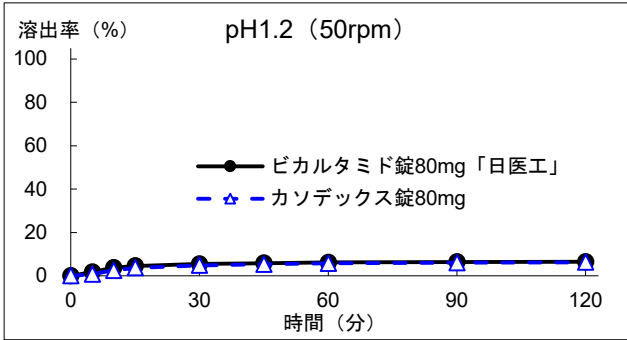
100rpm（pH4.0：ポリソルベート 80 1.0%添加）

[判定]

- ・ pH1.2（50rpm）では、標準製剤が 120 分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 120 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。
- ・ pH4.0（50rpm）では、標準製剤が 360 分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 360 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。
- ・ pH6.8（50rpm）では、標準製剤が 360 分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 360 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。
- ・ 水（50rpm）では、標準製剤が 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及び 360 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあった。
- ・ pH1.2（ポリソルベート 80 1.0%添加、50rpm）では、標準製剤が 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及び 120 分において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±8%及び±15%の範囲にあった。
- ・ pH4.0（ポリソルベート 80 1.0%添加、50rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品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。
- ・ pH6.8（ポリソルベート 80 1.0%添加、50rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品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。
- ・ pH4.0（ポリソルベート 80 1.0%添加、100rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品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、本品の溶出挙動を標準製剤（カゾデックス錠 80mg）と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

(溶出曲線)



(n=12)

## 〈ビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」〉

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（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査 発 0229 第 10 号）

### 試験条件

回転数及び試験液：

75rpm\*（pH1.2、pH4.0、pH6.8、水）

75rpm\*（pH1.2、pH4.0、pH6.8：ポリソルベート 80 1.0%添加）

100rpm（pH4.0：ポリソルベート 80 1.0%添加）

※ガイドラインに従い、「難溶性薬物を含む製剤」のパドル法 50rpm における溶出試験条件でカソデックス OD 錠 80mg とビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」の溶出試験を実施したところ、崩壊物がベッセル底部に堆積する現象が認められたため、溶出挙動の比較に用いる試験方法としてパドル法 50rpm に替えてパドル法 75rpm にて行うこととした。

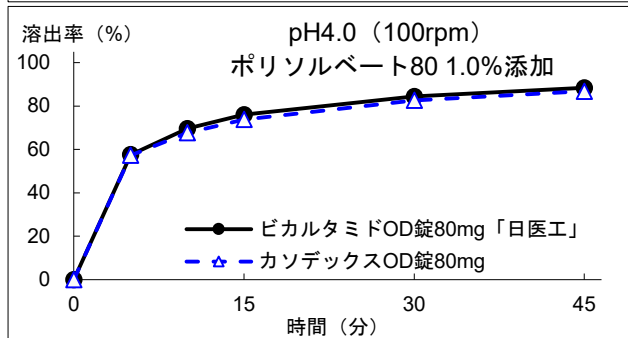
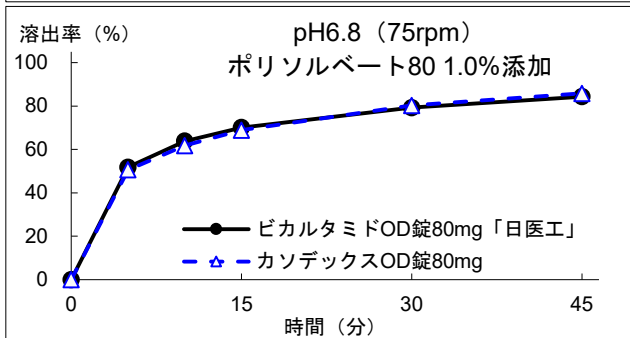
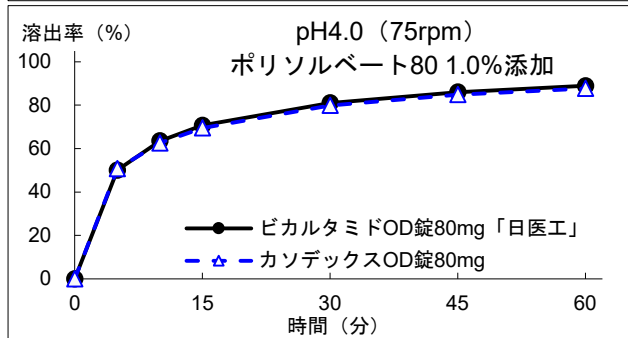
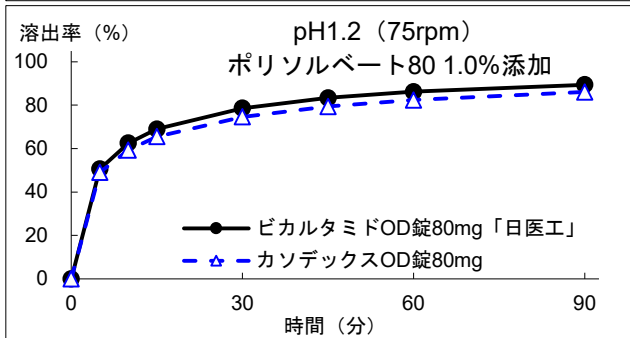
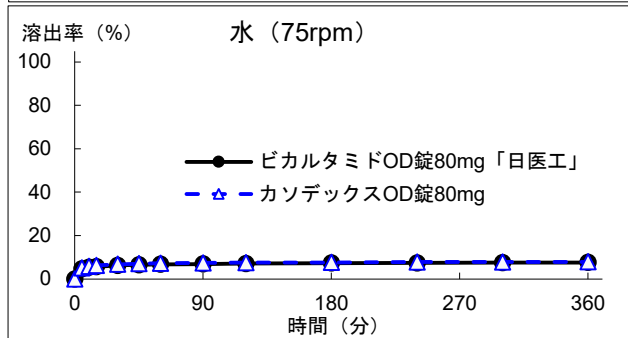
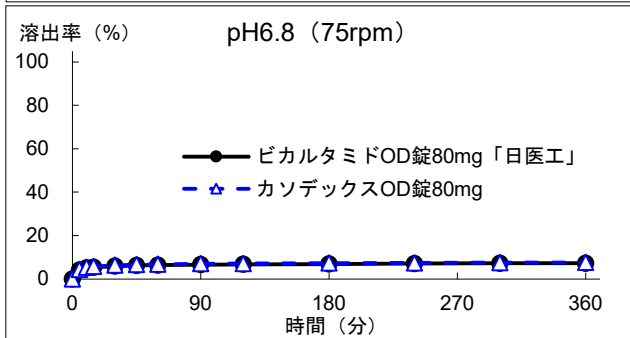
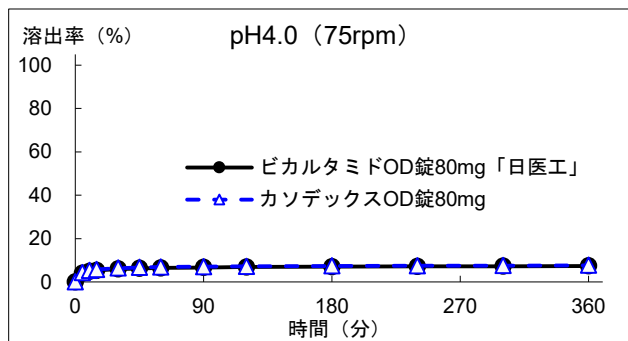
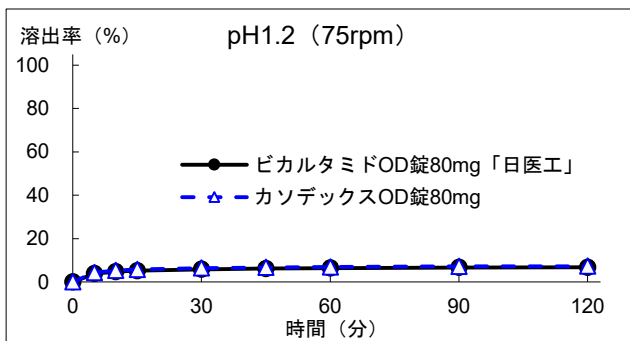
### [判定]

- ・ pH1.2（75rpm）では、120 分における本品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。
- ・ pH4.0（75rpm）では、360 分における本品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。
- ・ pH6.8（75rpm）では、360 分における本品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。
- ・ 水（75rpm）では、360 分における本品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。
- ・ pH1.2（ポリソルベート 80 1.0%添加、75rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品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。
- ・ pH4.0（ポリソルベート 80 1.0%添加、75rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品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。
- ・ pH6.8（ポリソルベート 80 1.0%添加、75rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品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。
- ・ pH4.0（ポリソルベート 80 1.0%添加、100rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品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、本品の溶出挙動を標準製剤（カソデックス OD 錠 80mg）と比較した結果、全ての試験液において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。



(溶出曲線)



(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

#### 〈ビカルタミド錠 80mg 「日医工」〉

30 錠 [10 錠×3 ; PTP]

100 錠 [10 錠×10 ; PTP]

#### 〈ビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」〉

30 錠 [10 錠×3 ; PTP]

100 錠 [10 錠×10 ; PTP]

### (3) 予備容量

該当しない

### (4) 容器の材質

販売名	PTP 包装
ビカルタミド錠 80mg 「日医工」	PTP : ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔 ピロー : ポリプロピレン
ビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」	PTP : ポリプロピレン・環状ポリオレフィンフィルム、アルミニウム箔

## 11. 別途提供される資材類

該当資料なし

## 12. その他

該当記載事項なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

前立腺癌

### 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

**5.1** 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。

**5.2** 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。

(解説)

5.1 一般に前立腺癌に対する内分泌療法は高い奏効率を示すが、もともと内分泌療法に抵抗性を有する前立腺癌が約 20%存在するといわれている。また、本剤 80mg/日投与時の前立腺癌患者に対する奏効率は、前期第Ⅱ相試験では 61.0%、後期第Ⅱ相試験では 64.4%であった。<sup>4) 5)</sup>

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、他の適切な処置を考慮する必要がある。なお、抗腫瘍効果の観察時期は、本剤の国内外の臨床試験及び他の前立腺癌治療薬の臨床試験の投与期間を参考に 12 週後とした。

5.2 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、休薬又は集学的治療など治療法を変更する必要がある。なお、国内での承認時までの臨床試験における副作用による投与中止例は、197 例中 2 例であった。その内訳は、息切れ 1 例、乳房圧痛 1 例であり、これらの例ではそれぞれ投与中止後、消失又は軽快が認められた。<sup>3) 6)</sup>

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

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。

#### (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

設定されていない

### 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

###### 17.1.1 国内臨床試験

承認時までには前立腺癌患者（病期 C/D）を対象として国内で総計 197 例について実施された二重盲検比較試験を含む臨床試験<sup>3)・6)</sup>の概要は次のとおりである。

試験名	投与量	投与期間	症例数	有効率 (部分奏効以上)
第 I 相試験	80mg/日	12 週間	3	66.7% (2/3)
前期第 II 相試験	80mg/日	12 週間	41	61.0% (25/41)
後期第 II 相試験	80mg/日	12 週間	59	64.4% (38/59)
長期投与試験	80mg/日	48 週間	26	76.9% (20/26)

副作用は、ビカルタミド錠の承認用量（80mg/日）において、第 I 相試験で 3 例中 3 例（100.0%）に認められ、主な副作用は、乳房圧痛（66.7%）、乳房腫脹（33.3%）、ほてり（33.3%）であった。前期第 II 相試験では 41 例中 25 例（61.0%）に認められ、主な副作用は、乳房圧痛（41.5%）、乳房腫脹（36.6%）、ほてり（12.2%）等であった。後期第 II 相試験では 59 例中 38 例（64.4%）に認められ、主な副作用は、乳房圧痛（33.9%）、乳房腫脹（33.9%）、性欲減退（11.9%）等であった。（承認時）

また、未治療進行前立腺癌患者（病期 C/D）を対象としたビカルタミド錠と LH-RH アゴニストとの併用療法と LH-RH アゴニスト単独療法を比較した国内第 III 相二重盲検比較試験<sup>7)・8)</sup>の成績は次のとおりである。

	ビカルタミド錠及び LH-RH アゴニスト 併用	LH-RH アゴニスト 単独	P 値 (95%信頼区間)	ハザード比
PSA 正常化 <sup>注1)</sup> 率 (投与 12 週時)	79.4% (81/102 例)	38.6% (39/101 例)	<0.001 (27.6-52.0)	—
PSA 正常化 <sup>注1)</sup> までの期間 (中央値)	8.1 週	24.1 週	<0.001 (2.77-5.66)	3.96
奏効率 (投与 12 週時)	77.5% (79/102 例)	65.3% (66/101 例)	0.063 (-0.3-24.1)	—
TTTF <sup>注2)</sup> (中央値)	117.7 週	60.3 週	<0.001 (0.38-0.77)	0.54
TTP <sup>注3)</sup> (中央値)	未到達	96.9 週	<0.001 (0.26-0.63)	0.40

注 1) PSA ≤ 4ng/mL

注 2) TTTF : Time to treatment failure (治療成功期間)

注 3) TTP : Time to progression (無増悪期間)

本試験において、副作用はビカルタミド錠及び LH-RH アゴニスト併用療法群で 66.7%に認められ、主な副作用は、ほてり（16.7%）、血中アルカリフォスファターゼ増加（10.8%）、貧血（8.8%）等であった。

### 17.1.2 海外臨床試験

海外において、標準治療として経過観察又は根治的治療（放射線療法、前立腺全摘除術）を施行した早期前立腺癌患者 8,113 例を対象としたビカルタミド錠 150mg/日<sup>注4)</sup>による無作為化プラセボ対照二重盲検比較臨床試験<sup>9)</sup>が実施されている。ビカルタミド錠投与群全体で無増悪生存率は有意に改善した（HR=0.79、95%信頼区間 0.73-0.85、P<0.001）が、全生存率についてはプラセボ群との差は認めなかった（HR=0.99、95%信頼区間 0.91-1.09、P=0.89）。病期別解析において、限局性前立腺癌の経過観察を行った患者におけるビカルタミド錠投与群では、統計学的な有意差はないもののプラセボ群と比較して全生存率の減少傾向が認められた（HR=1.16、95%信頼区間 0.99-1.37）（追跡期間中央値 7.4 年時点）。ビカルタミド錠投与群で認められた主な有害事象は、乳房痛（73.6%、2962/4022 例）及び女性化乳房（68.8%、2766/4022 例）等であった。

注 4) 本邦における承認用法用量は 80mg/日である。

#### 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

該当しない

#### (7) その他

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

トリフルオロメチルフェニル系

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

ビカルタミドは、前立腺腫瘍組織のアンドロゲン受容体に対するアンドロゲンの結合を阻害し、抗腫瘍効果を発揮する。なお、ビカルタミドの抗アンドロゲン活性は実質的に R 体によるものであった<sup>10)</sup>。

なお、臨床上、ビカルタミドの投与の中止により一部の患者で AWS (antiandrogen withdrawal syndrome) をみることがある<sup>11)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 抗腫瘍効果

*In vitro* 試験において、アンドロゲン刺激によるヒト前立腺腫瘍細胞 (LNCaP) 及びマウス乳腺腫瘍細胞 (Shionogi S115) の増殖を抑制した<sup>12)、13)</sup>。一方、*in vivo* 試験 (ラット) において、移植されたアンドロゲン依存性ラット前立腺腫瘍 (Dunning R3327) の増殖を抑制し、ラットの生存期間を延長させた。また、血清中テストステロン及び LH の上昇の程度はごく僅かであった<sup>14)</sup>。

##### 18.3 アンドロゲン受容体との結合能

ラット及びヒト前立腺アンドロゲン受容体に対する結合能は、ジヒドロテストステロンの約 2% であった<sup>15)</sup>。

#### (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

##### 16.1.1 単回投与

###### ①健康成人

健康成人男子にビカルタミド錠 80mg 又はビカルタミド OD 錠 80mg (水なし) をクロスオーバー法にて空腹時に単回経口投与した。R-ビカルタミド (活性体) の血漿中濃度は投与後 36 時間に最高値を示し、消失半減期は 4.9~5.2 日であった。また、ビカルタミド錠と OD 錠は生物学的に同等であった<sup>16)</sup>。

表 1 ビカルタミド錠 80mg 及びビカルタミド OD 錠 80mg (水なし) を単回経口投与したときの R-ビカルタミドの薬物動態パラメータ

	n	C <sub>max</sub> ( $\mu$ g/mL)	t <sub>max</sub> (h)	AUC <sub>∞</sub> ( $\mu$ g·h/mL)	t <sub>1/2</sub> (日)
ビカルタミド錠 80mg	23	1.21±0.23	36.0 (24.0~72.0)	280±80	5.2±1.5
ビカルタミド OD 錠 80mg	21	1.26±0.21	36.0 (15.0~72.0)	286±69	4.9±1.1

平均値±標準偏差 [t<sub>max</sub>は中央値 (範囲)]

健康成人男子にビカルタミド OD 錠 80mg を水とともに空腹時単回経口投与し、クロスオーバー法にてビカルタミド錠 80mg と比較したところ、両製剤は生物学的に同等であった<sup>16)</sup>。

表 2 ビカルタミド錠 80mg 及びビカルタミド OD 錠 80mg (水と服用) を単回経口投与したときの R-ビカルタミドの薬物動態パラメータ

	n	C <sub>max</sub> ( $\mu$ g/mL)	t <sub>max</sub> (h)	AUC <sub>∞</sub> ( $\mu$ g·h/mL)	t <sub>1/2</sub> (日)
ビカルタミド錠 80mg	22	1.25±0.27	36.0 (9.0~72.0)	262±78	4.6±0.7
ビカルタミド OD 錠 80mg	22	1.29±0.25	36.0 (5.0~72.0)	277±86	4.8±1.2

平均値±標準偏差 [t<sub>max</sub>は中央値 (範囲)]

###### ②前立腺癌患者

前立腺癌患者にビカルタミド 80mg を単回経口投与したとき、投与後 6、12 及び 24 時間の血漿中 R-ビカルタミド (活性体) 濃度はほぼ一定 (1.5~1.7  $\mu$ g/mL, n=3) であった<sup>3)</sup>。

##### 16.1.2 反復投与

前立腺癌患者にビカルタミド 80mg を 1 日 1 回反復経口投与したとき、血漿中 R-ビカルタミド濃度は約 8 週で定常状態 (18  $\mu$ g/mL, n=37) に達した<sup>4)</sup>。さらに、反復投与時の血漿中濃度推移から推定したみかけの消失半減期は 8.4 日であった<sup>3)</sup>。

### 16.1.3 生物学的同等性試験

#### ①ビカルタミド錠 80mg「日医工」

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（平成 13 年 5 月 31 日 医薬審発第 786 号）

ビカルタミド錠 80mg「日医工」及びカソデックス錠 80mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ビカルタミドとして 80mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して活性体である R-ビカルタミドの血漿中濃度を測定し、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<sup>17)</sup>。

表 3 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-336</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr/mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g/mL}$ )	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ビカルタミド錠 80mg 「日医工」	210.5±33.8	1.27±0.18	29.3±19.6	100.2±16.0
カソデックス錠 80mg	211.2±59.7	1.19±0.24	31.7±19.3	111.6±23.3

(1 錠投与, Mean±S.D., n=15)

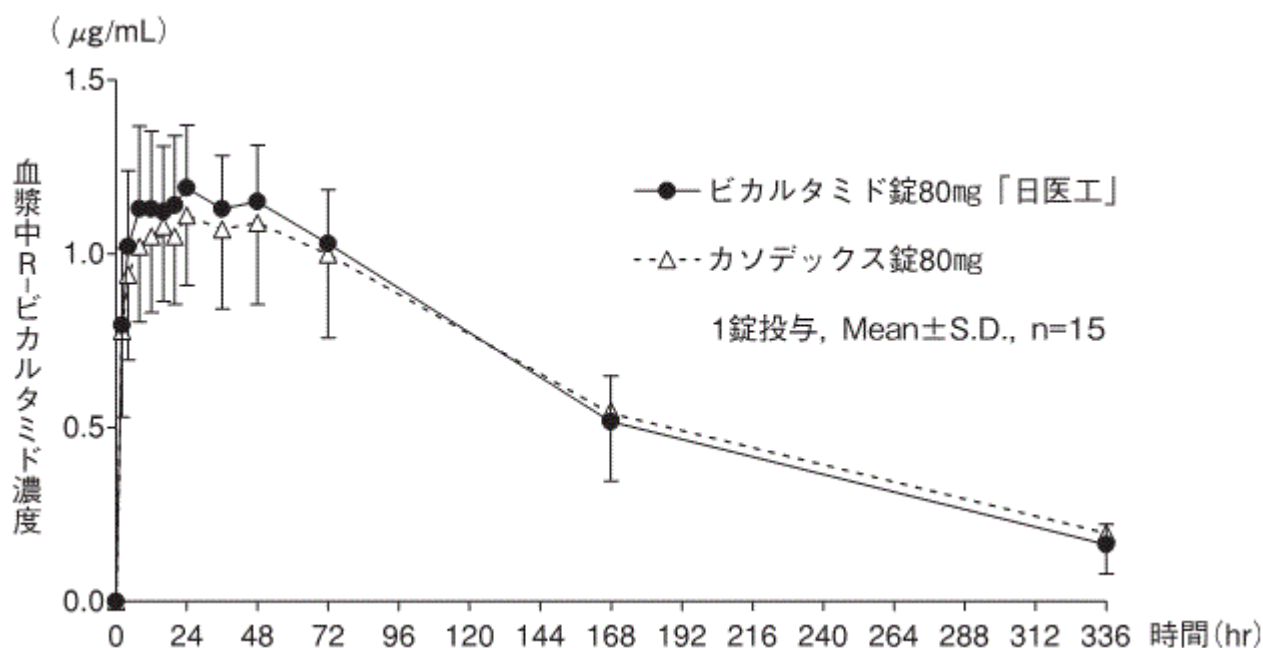


図 1 血漿中薬物濃度推移

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。



## ②ビカルタミド OD錠 80mg 「日医工」

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（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）

ビカルタミド OD錠 80mg 「日医工」及びカソデックス OD錠 80mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1錠（ビカルタミドとして 80mg）健康成人男子に絶食単回経口投与（水で服用及び水なしで服用）して活性体である R-ビカルタミドの血漿中濃度を測定し、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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>18)</sup>。

表 4 薬物動態パラメータ（水あり）

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-504</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ビカルタミド OD錠 80mg 「日医工」	237.54 ± 65.16	1.1746 ± 0.2271	27.8 ± 13.1	118.67 ± 30.45
カソデックス OD錠 80mg	227.64 ± 55.20	1.1333 ± 0.2010	28.5 ± 15.7	117.64 ± 34.57

(1錠投与, Mean ± S.D., n=23)

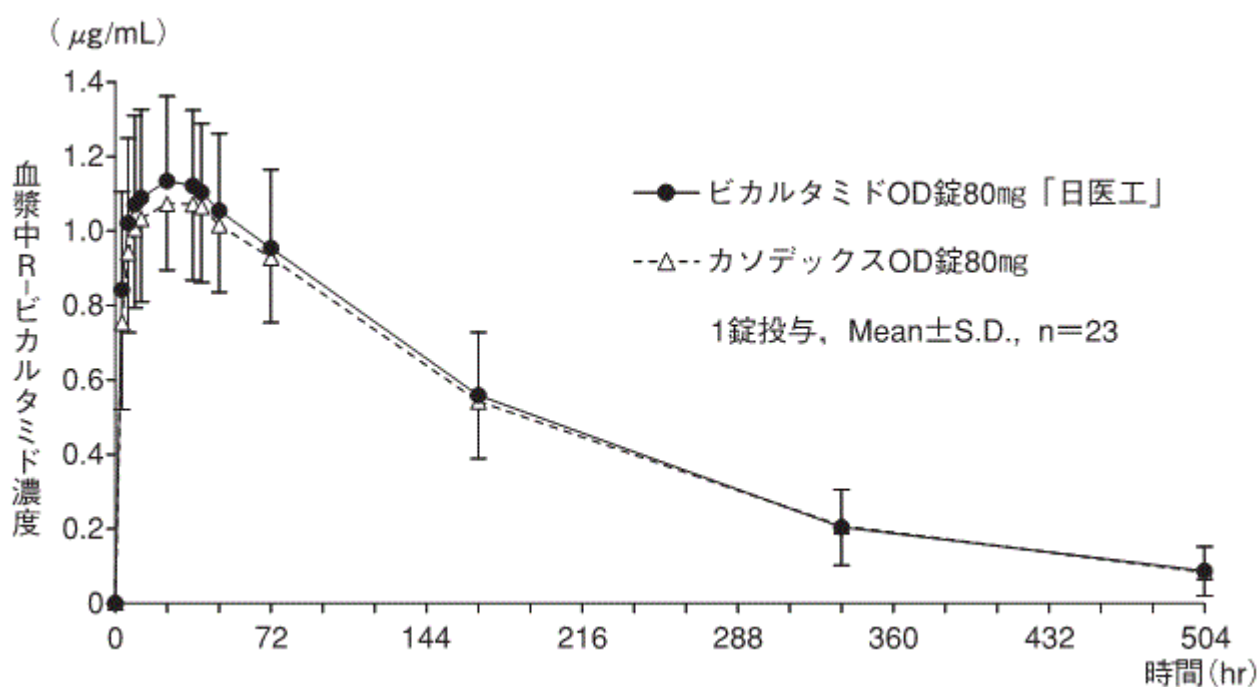


図 2 血漿中薬物濃度推移（水あり）

表5 薬物動態パラメータ (水なし)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-504</sub> ( $\mu\text{g} \cdot \text{hr/mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g/mL}$ )	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
ビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」	246.38 ± 60.56	1.2106 ± 0.2130	27.2 ± 12.2	123.63 ± 46.11
カソデックス OD 錠 80mg	240.84 ± 61.83	1.2051 ± 0.1901	28.1 ± 12.4	118.28 ± 42.60

(1錠投与, Mean ± S.D., n=22)

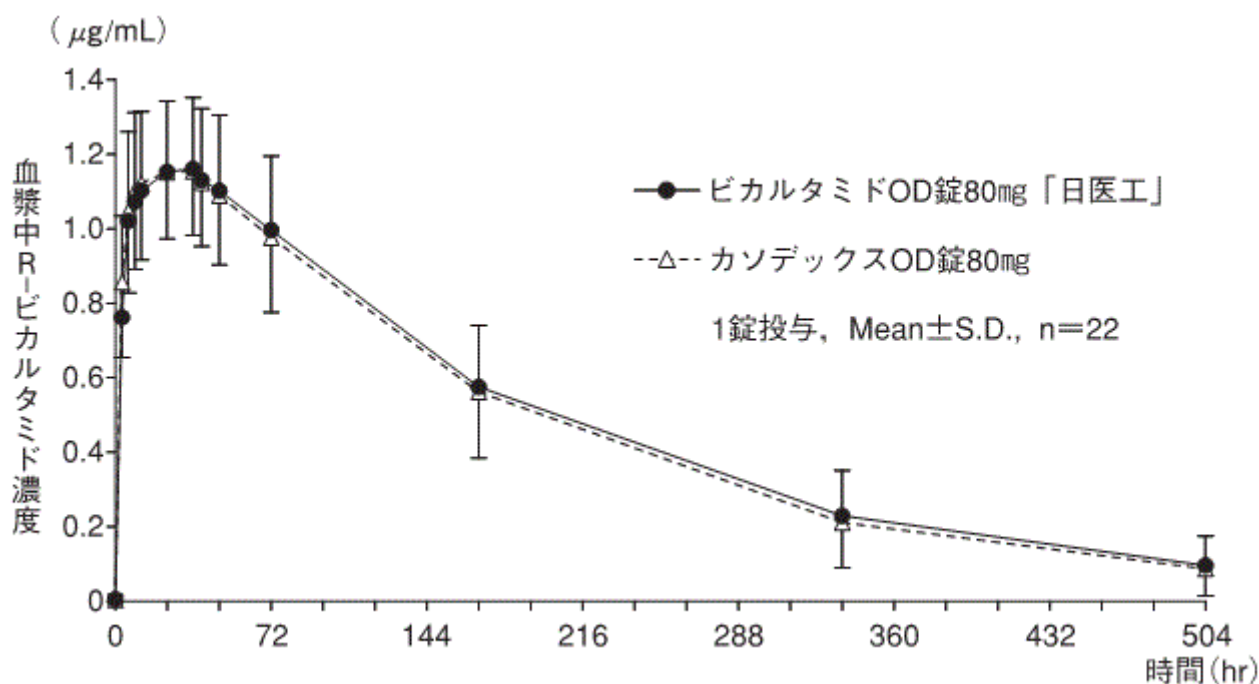


図3 血漿中薬物濃度推移 (水なし)

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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

(「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

該当資料なし

(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

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

### (6) 血漿蛋白結合率

*In vitro* におけるヒト血漿蛋白結合率（ラセミ体）は 96%であった<sup>19)</sup>。

## 6. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

ヒトにおけるビカルタミドの代謝は、水酸化及びグルクロン酸抱合であった。血漿中には未変化体が、尿中には未変化体のグルクロン酸抱合体及び水酸化体のグルクロン酸抱合体が、糞中には未変化体及び水酸化体が認められた<sup>20)</sup>（外国人データ）。

### (2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

ビカルタミドは *in vitro* 試験で、チトクローム P450 酵素（CYP3A4）を阻害し、またそれより程度は低いですが、他のチトクローム P450 酵素（CYP2C9、2C19、2D6）に対しても阻害作用を示すとの報告がある<sup>21)</sup>。海外臨床試験において、ビカルタミド 150mg まで投与された患者で、アンチピリン代謝に関与するチトクローム P450 酵素に対しほとんど影響は認められていない。ビカルタミドは臨床の場で通常併用される薬剤とは相互作用を示す可能性は低いと考えられる<sup>22)</sup>。[10.参照]

### (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

健康成人男子にビカルタミド 50mg を経口投与後 9 日目までの累積尿中及び糞中排泄率は、それぞれ 36%及び 43%であった<sup>20)</sup>（外国人データ）。

## 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

### 16.6.1 年齢及び腎機能の影響

反復投与時の血漿中濃度は、年齢あるいはクレアチニンクリアランスとの間に相関関係を示さなかった<sup>23)</sup> (外国人データ)。

### 16.6.2 肝機能障害患者

肝機能障害患者では、R-ビカルタミドの消失半減期が長くなる傾向が認められている<sup>24)</sup> (外国人データ)。

[9.3 参照]

## 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 小児 [本薬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、本薬の毒性試験（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。]

2.3 女性 [本薬の毒性試験（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。]

（解説）

2.1 本剤の投与により過敏症状を呈した患者では再投与により症状が再発するおそれがある。

2.2 本剤は、小児に対して使用経験がなく、安全性は確立していない。本剤は、抗アンドロゲン作用により、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。

本剤の毒性試験では、雄ラットの投与試験において生殖器の萎縮が認められている。また、雌ラットの2年間の経口投与試験においては、子宮に腫瘍性変化が認められている。<sup>25)</sup>

2.3 本剤は、女性に対して使用経験がなく、安全性は確立していない。

本剤の毒性試験では、雌ラットの2年間の経口投与試験において、子宮に腫瘍性変化が認められている。また、ラット周産期及び授乳期投与試験において、雄出生児の雌性化が認められている。<sup>25)</sup>

### 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

設定されていない

### 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 外国の臨床試験において、本剤投与例で本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。

8.2 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。

8.3 劇症肝炎、肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、本剤投与中は定期的に肝機能検査を行うなど、患者の状態を十分に観察すること。[11.1.1 参照]

### 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

設定されていない

#### (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

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。  
[16.6.2 参照]

(解説)

本剤は主に肝臓で代謝される<sup>20)</sup>ため、肝障害患者に対して投与した場合、代謝の遅延により、血中濃度が高くなる可能性がある。

海外における臨床報告では、軽度から中等度の肝障害を有する患者（肝硬変、脂肪肝など）にビカルタミド 50mg<sup>注)</sup>を単回経口投与したところ、対照群（肝障害なし）と比較して、消失半減期などの薬物動態に差は認められなかったとの報告があるが<sup>26)</sup>、一方、肝障害の患者 14 例（重度の肝障害患者 4 例を含む）に、ビカルタミド 150mg<sup>注)</sup>を投与したところ、対照群と比較して消失半減期が 1.75 倍に延長したと報告されている。<sup>9)</sup>

注) 本剤の前立腺癌に対する承認されている用法・用量は 1 日 1 回 80mg である。

### (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

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。本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が、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。

## 7. 相互作用

#### 10. 相互作用

本剤は、主として肝代謝酵素 CYP3A4 を阻害する。[16.7 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
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。

(解説)

クマリン系抗凝血薬：

本剤の血漿蛋白結合率は高く、約 96%と報告されている (*in vitro*)。<sup>19)</sup>また、*in vitro* 試験で本剤は蛋白結合部位においてワルファリンと置換すると報告がある。このため、本剤が血漿蛋白と結合したワルファリンと置換し、遊離のワルファリンを増加させ、抗凝血作用を増強させる可能性が考えられる。<sup>27)</sup>

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、肝機能障害、黄疸（いずれも頻度不明）

劇症肝炎、AST、ALT、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。[8.3 参照]

11.1.2 白血球減少（1.0%）、血小板減少（1.9%）

11.1.3 間質性肺炎（頻度不明）

11.1.4 心不全、心筋梗塞（いずれも頻度不明）

(解説)

11.1.1 劇症肝炎、AST、ALT、AIP、 $\gamma$ -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。

初期症状：食欲不振、悪心・嘔吐、全身倦怠感、そう痒、発疹、黄疸等

本剤投与後は、定期的な肝機能検査の実施を考慮するとともに、観察を十分に行うこと。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。

11.1.2 白血球減少の初期症状：のどの痛み、発熱、口内炎、からだがだるい等

血小板減少の初期症状：出血しやすい（歯ぐきの出血・鼻血など）、出血が止まりにくい、あおあざができる等

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。

11.1.3 初期症状：呼吸困難、乾性咳嗽、発熱等

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。

11.1.4 心不全、心筋梗塞があらわれることがある。

初期症状：労作時の息切れ、易疲労感、下腿浮腫等の全身うっ血症状、胸痛、ショック等

本剤投与後は、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) その他の副作用

11.2 その他の副作用				
	5%以上	1～5%未満	1%未満	頻度不明
内分泌	乳房腫脹 (44.7%)、乳房圧痛 (46.6%)、ほてり			
生殖器	勃起力低下			
肝臓		AST 上昇、ALT 上昇、AIP 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		傾眠	頭痛、めまい、不眠、抑うつ状態
循環器			心電図異常	
消化器		便秘	口渇	食欲不振、下痢、悪心、嘔吐、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		総コレステロール上昇、中性脂肪上昇	さむけ	貧血、浮腫、倦怠感、無力症、疲労、高血糖、体重増加・減少

注) 副作用頻度は承認時までの国内臨床試験を基に集計した。

## 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

設定されていない

<参考>

<DailyMed (USA)、2023年12月検索>

国名	米国
会社名	ANI Pharmaceuticals, Inc.
販売名	CASODEX- bicalutamide tablet
剤形・規格	50mg

**10. OVERDOSAGE**

Long-term clinical trials have been conducted with dosages up to 200 mg of CASODEX daily and these dosages have been well tolerated. A single dose of CASODEX that results in symptoms of an overdose considered to be life threatening has not been established.

There is no specific antidote; treatment of an overdose should be symptomatic.

In the management of an overdose with CASODEX, vomiting may be induced if the patient is alert. It should be remembered that, in this patient population, multiple drugs may have been taken. Dialysis is not likely to be helpful since CASODEX is highly protein bound and is extensively metabolized. General supportive care, including frequent monitoring of vital signs and close observation of the patient, is indicated.

## 11. 適用上の注意

### 14.適用上の注意

#### 14.1 薬剤交付時の注意

<製剤共通>

**14.1.1** 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。

<OD錠>

**14.1.2** 本剤は舌の上の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。

**14.1.3** 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

#### 15.1 臨床使用に基づく情報

外国において、呼吸困難が発現したとの報告がある。

### (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	ビカルタミド錠 80mg 「日医工」 ビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」	劇薬、処方箋医薬品 <sup>注)</sup> 注) 注意—医師等の処方箋により使用すること
有効成分	ビカルタミド	劇薬

### 2. 有効期間

3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意点

設定されていない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：無

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：有（「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：カソデックス錠 80mg、カソデックス OD 錠 80mg

### 7. 国際誕生年月日

不明

### 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

販売名	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
ビカルタミド錠 80mg 「日医工」	2009年1月14日	22100AMX00117000	2009年5月15日	2009年5月15日
ビカルタミドOD錠 80mg 「日医工」	2016年2月15日	22800AMX00259000	2016年6月17日	2016年6月17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
ビカルタミド錠 80mg 「日医工」	4291009F1160	4291009F1160	119177601	620009421
ビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」	4291009F2086	4291009F2086	125015201	622501501

**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。

## X I. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 社内資料：安定性試験
- 2) 社内資料：溶出試験
- 3) 古武敏彦 他：泌尿器科紀要. 1996 ; 42 (2) : 143-153
- 4) 古武敏彦 他：泌尿器科紀要. 1996 ; 42 (2) : 155-168
- 5) 古武敏彦 他：泌尿器外科. 1996 ; 9 (3) : 243-256
- 6) 古武敏彦 他：泌尿器外科. 1996 ; 9 (4) : 343-355
- 7) Usami M., et al. : Prostate Cancer Prostatic Dis. 2007 ; 10 (2) : 194-201 (PMID : 17199134)
- 8) Akaza H., et al. : Jpn. J. Clin. Oncol. 2004 ; 34 (1) : 20-28 (PMID : 15020659)
- 9) McLeod D. G., et al. : BJU Int. 2006 ; 97 (2) : 247-254 (PMID : 16430622)
- 10) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店 2021 ; C4254-C4262
- 11) 赤倉功一郎：排尿障害プラクティス. 2011 ; 19 (2) : 173-177
- 12) Veldscholte J., et al. : Biochemistry. 1992 ; 31 : 2393-2399 (PMID : 1540595)
- 13) Darbre P. D., et al. : J. Steroid Biochem. 1990 ; 36 (5) : 385-389 (PMID : 2214758)
- 14) Furr B. J. A., et al. : Excerpta Med. Int. Cong. Series. 1994 ; 1064 : 157-175
- 15) Furr B. J. A. : Eur. Urol. 1996 ; 29 (Suppl 2) : 83-95
- 16) 鷲尾兼寿 他：医学と薬学. 2013 ; 70 (2) : 277-284
- 17) 中道昇 他：診療と新薬. 2009 ; 46 (4) : 400-406
- 18) 社内資料：生物学的同等性試験 (OD錠 80mg)
- 19) Cockshott I. D., et al. : Xenobiotica. 1991 ; 21 (10) : 1347-1355 (PMID : 1796611)
- 20) McKillop D., et al. : Xenobiotica. 1993 ; 23 (11) : 1241-1253 (PMID : 8310708)
- 21) Cockshott I. D. : Clin Pharmacokinet. 2004 ; 43 (13) : 855-878 (PMID : 15509184)
- 22) Kaisary A., et al. : Anti-Cancer Drugs. 1996 ; 7 : 54-59 (PMID : 8742099)
- 23) Cockshott I. D., et al. : Eur. Urol. 1990 ; 18 (Suppl 3) : 10-17
- 24) Furr B. J. A., et al. : Hormone Dependent Cancer. Pasqualini, JR, Katzenellenbogen BS, (Eds). Marcel Dekker, New York. 1996 : 397-424
- 25) Iswaran TJ, et al. : J Toxicol Sci. 1997 ; 22(2) : 75-88 (PMID : 9198005)
- 26) Cockshott ID, et al. : Br J Clin Pharmacol. 1993 ; 36(4) : 339-343 (PMID : 12959312)
- 27) Blackledge GRP. : European Urology. 1997 ; 31(Suppl.2) : 30-39 (PMID : 9074908)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

本邦における効能又は効果、用法及び用量は以下のとおりであり、外国での承認状況とは異なる。

効能又は効果	用法及び用量
前立腺癌	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。

<DailyMed (USA)、2023年12月検索>

国名	米国
会社名	ANI Pharmaceuticals, Inc.
販売名	CASODEX- bicalutamide tablet
剤形・規格	50mg
<b>INDICATIONS AND USAGE</b> CASODEX 50 mg daily is indicated for use in combination therapy with a luteinizing hormone-releasing hormone (LHRH) analog for the treatment of Stage D2 metastatic carcinoma of the prostate. CASODEX 150 mg daily is not approved for use alone or with other treatments.	
<b>DOSAGE AND ADMINISTRATION</b> <b>2.1. Recommended Dose and Schedule</b> The recommended dose for CASODEX therapy in combination with an LHRH analog is one 50 mg tablet once daily (morning or evening), with or without food. It is recommended that CASODEX be taken at the same time each day. Treatment with CASODEX should be started at the same time as treatment with an LHRH analog. If a dose of CASODEX is missed, take the next dose at the scheduled time. Do not take the missed dose and do not double the next dose. <b>2.2. Dosage Adjustment in Renal Impairment</b> No dosage adjustment is necessary for patients with renal impairment. <b>2.3. Dosage Adjustment in Hepatic Impairment</b> No dosage adjustment is necessary for patients with mild to moderate hepatic impairment. In patients with severe liver impairment (n=4), although there was a 76% increase in the half-life (5.9 and 10.4 days for normal and impaired patients, respectively) of the active enantiomer of bicalutamide no dosage adjustment is necessary.	

### 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の項の記載とオーストラリア分類とは異なる。

（「VIII. 6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照）

	Drug Name	Category
オーストラリアの分類	Bicalutamide	D

(2021年4月検索)

参考：分類の概要

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

Category 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.

### 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

##### 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。

#### (1) 粉砕

##### 粉砕物の安定性試験

##### ビカルタミド錠 80mg 「日医工」

粉砕物の安定性を 25℃・75%RH の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末であり、含量は規格内であった。

検体作成：試験製剤を乳鉢で粉砕した。

試験実施期間：2008/12/16～2009/3/25

#### ●粉砕物 25℃・75%RH [遮光・開放]

(最小値～最大値)

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間				
		開始時	2 週	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状 n=10	HU080	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量 (%) ※ n=3 <95.0～105.0%>	HU080	99.2～99.4	100.6～101.9	99.1～100.0	99.7～100.5	99.2～100.5
(参考値) 重量変化 (%)	HU080	—	1.9	1.1	1.5	1.4

※：表示量に対する含有率 (%)

##### 【注意】

本剤の有効成分は、曝露によって健康への有害な影響をもたらす恐れがあります。粉砕を行う場合は、手袋やガウンといった个人防护具を用いるなど、曝露対策を行うことを推奨します。

**ビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」**

粉碎物の安定性を 25℃・75%RH 及び 120 万 Lx・hr の保存条件で検討した結果、性状は白色の粉末又は塊であり、含量は規格内であった。

検体作成：Labo Milser (LM-PLUS、OSAKA CHEMICAL CO.,LTD.製) にて粉碎した。

試験実施期間：2015/9/29～2016/1/14

● 粉碎物 25℃・75%RH [遮光・開放]

試験項目 <規格>	ロット 番号	保存期間		
		開始時	1 ヶ月	3 ヶ月
性状	508010	白色の粉末又は塊	白色の粉末又は塊	白色の粉末又は塊
含量 (%) ※ <95.0～105.0%>	508010	102.1	101.9	102.3

※：表示量に対する含有率 (%)

● 粉碎物 曝光量 120 万 Lx・hr [D65 光源 (約 1000Lx) ・シャーレをラップで覆う]

試験項目 <規格>	ロット 番号	総曝光量		
		開始時	60 万 Lx・hr	120 万 Lx・hr
性状	508010	白色の粉末又は塊	白色の粉末又は塊	白色の粉末又は塊
含量 (%) ※ <95.0～105.0%>	508010	102.1	101.4	101.7

※：表示量に対する含有率 (%)

**【注意】**

本剤の有効成分は、曝露によって健康への有害な影響をもたらす恐れがあります。粉碎を行う場合は、手袋やガウンといった個人防護具を用いるなど、曝露対策を行うことを推奨します。



## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブ通過性試験

### ビカルタミド錠 80mg 「日医工」

#### 1) 試験方法

##### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55°C の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

##### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、注入した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

試験実施日：2009/5/11

ロット番号：BC10A1

#### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
ビカルタミド錠 80mg 「日医工」	5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

#### 【注意】

本剤の有効成分は曝露によって健康への有害な影響をもたらす恐れがあります。崩壊・懸濁あるいは粉碎を行う場合は、手袋やガウンといった個人防護具を用いるなど、曝露対策を行うことを推奨します。

## ビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」

### 1) 試験方法

#### [崩壊懸濁試験]

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、検体 1 個をディスペンサー内に入れてピストンを戻し、約 55°C の温湯 20mL を吸い取った。ディスペンサーに蓋をして 5 分間放置後、ディスペンサーを手で 15 往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察した。十分な崩壊が認められない場合は、更に 5 分間放置後、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

上記の操作で十分な崩壊懸濁が認められない場合は、検体 1 個を分包し、上から乳棒で数回軽く叩いて検体を破壊し、同様の操作を行い、崩壊懸濁の状況を観察した。

#### [通過性試験]

懸濁液の入ったディスペンサーを経管チューブに接続し、約 2~3mL/秒の速度で注入した。チューブは体内挿入端から約 3 分の 2 を水平にし、注入端をその約 30cm 上の高さに固定した。懸濁液を注入後に適量の常水を注入してチューブ内を濯ぐとき、チューブ内に残存物が認められなければ通過性に問題なしとした。

### 2) 試験結果

	崩壊懸濁試験	通過性試験
ビカルタミド OD 錠 80mg 「日医工」	5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

本試験は、「内服薬 経管投与ハンドブック ((株) じほう)」に準じて実施しました。

#### 【注意】

本剤の有効成分は曝露によって健康への有害な影響をもたらす恐れがあります。崩壊・懸濁あるいは粉碎を行う場合は、手袋やガウンといった个人防护具を用いるなど、曝露対策を行うことを推奨します。

## 2. その他の関連資料

患者向け小冊子

ビカルタミド錠・OD 錠「日医工」を服用される方へ

