2024 年 9 月改訂（第 8 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

アロマターゼ阻害剤／閉経後乳癌治療剤
エキセメスタン錠
エキセメスタン錠 25mg「NIG」
Exemestane Tablets

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品[注)] 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：エキセメスタン 25.000mg 含有
一般名	和　名：エキセメスタン 洋　名：Exemestane
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：2012 年 2 月 15 日 薬価基準収載：2023 年 5 月 24 日 販 売 開 始：2012 年 6 月 22 日
開発・製造販売（輸入）・提携・販売会社名	製造販売元：日医工岐阜工場株式会社 発　売　元：日医工株式会社 販　　売：武田薬品工業株式会社
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　https://www.nichiiko.co.jp/

本 IF は 2024 年 3 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、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

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
6．RMP の概要……1

Ⅱ．名称に関する項目……2

1．販売名……2
2．一般名……2
3．構造式又は示性式……2
4．分子式及び分子量……2
5．化学名（命名法）又は本質……2
6．慣用名、別名、略号、記号番号……2

Ⅲ．有効成分に関する項目……3

1．物理化学的性質……3
2．有効成分の各種条件下における安定性……3
3．有効成分の確認試験法、定量法……3

Ⅳ．製剤に関する項目……4

1．剤形……4
2．製剤の組成……4
3．添付溶解液の組成及び容量……4
4．力価……4
5．混入する可能性のある夾雑物……4
6．製剤の各種条件下における安定性……5
7．調製法及び溶解後の安定性……6
8．他剤との配合変化（物理化学的変化）……6
9．溶出性……6
10．容器・包装……7
11．別途提供される資材類……7
12．その他……7

Ⅴ．治療に関する項目……8

1．効能又は効果……8
2．効能又は効果に関連する注意……8
3．用法及び用量……8
4．用法及び用量に関連する注意……8
5．臨床成績……8

Ⅵ．薬効薬理に関する項目……9

1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群……9
2．薬理作用……9

Ⅶ．薬物動態に関する項目……10

1．血中濃度の推移……10
2．薬物速度論的パラメータ……11
3．母集団（ポピュレーション）解析……11
4．吸収……11
5．分布……11
6．代謝……11
7．排泄……12
8．トランスポーターに関する情報……12
9．透析等による除去率……12
10．特定の背景を有する患者……12
11．その他……12

Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目……13

1．警告内容とその理由……13
2．禁忌内容とその理由……13
3．効能又は効果に関連する注意とその理由……13
4．用法及び用量に関連する注意とその理由……13
5．重要な基本的注意とその理由……13
6．特定の背景を有する患者に関する注意……14
7．相互作用……15
8．副作用……15
9．臨床検査結果に及ぼす影響……16
10．過量投与……16
11．適用上の注意……16
12．その他の注意……16

Ⅸ．非臨床試験に関する項目……17

1．薬理試験……17
2．毒性試験……17

Ⅹ．管理的事項に関する項目……18

1．規制区分……18
2．有効期間……18
3．包装状態での貯法……18
4．取扱い上の注意点……18
5．患者向け資材……18

６．同一成分・同効薬 18
７．国際誕生年月日 18
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 18
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 18
10．再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 18
11．再審査期間 18
12．投薬期間制限に関する情報 18
13．各種コード 19
14．保険給付上の注意 19

ＸＩ．文献 20

１．引用文献 20
２．その他の参考文献 20

ＸⅡ．参考資料 21

１．主な外国での発売状況 21
２．海外における臨床支援情報 22

ＸⅢ．備考 23

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 23
２．その他の関連資料 24

略 語 表

略語	略語内容
HPLC	高速液体クロマトグラフィー
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
$t_{1/2}$	消失半減期
S.D.	標準偏差
CL/F	見かけの全身クリアランス
ED_{50}	50%有効率

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

本剤は、エキセメスタンを有効成分とするアロマターゼ阻害剤／閉経後乳癌治療剤である。

「エキセメスタン錠 25mg「テバ」」は、武田テバファーマ株式会社（旧大洋薬品工業株式会社）が開発を企画し、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、2012 年 2 月 15 日に承認を取得、2012 年 6 月 22 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）

2023 年 5 月 1 日、武田テバファーマ株式会社から日医工岐阜工場株式会社に製造販売承認が承継され、その際に販売名の屋号を「テバ」から「NIG」に変更した。
2023 年 5 月 24 日に薬価収載され、日医工株式会社が販売を開始した。

２．製品の治療学的特性

（１）本剤は、エキセメスタンを有効成分とするアロマターゼ阻害剤／閉経後乳癌治療剤である。
（２）重大な副作用として、肝炎、肝機能障害、黄疸が報告されている。（「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）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、「1 日 1 回 1 錠」を表示した。
（２）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

エキセメスタン錠 25mg「NIG」

（２）洋名

Exemestane Tablets

（３）名称の由来

一般名より

２．一般名

（１）和名（命名法）

エキセメスタン（JAN）

（２）洋名（命名法）

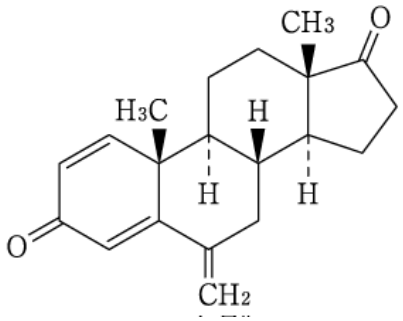
Exemestane（JAN、INN）

（３）ステム（stem）

アロマターゼ阻害剤：-mestane

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：$C_{20}H_{24}O_2$

分子量：296.40

５．化学名（命名法）又は本質

化学名：（＋）-6-Methyleneandrosta-1,4-diene-3,17-dione（IUPAC）

６．慣用名、別名、略号、記号番号

略号：EXE

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～黄白色の粉末である。

（２）溶解性

N,N-ジメチルホルムアミド及びテトラヒドロフランに溶けやすく、メタノール又はエタノール（95）にやや溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けにくく、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

旋光度［α］$^{20}_{D}$：＋282～＋300°（脱水物に換算したもの 0.25g、エタノール（95）、25mL、100mm）

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

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：水、アセトニトリル混液

Ⅳ．製剤に関する項目

１．剤形

（１）剤形の区別

フィルムコーティング錠

（２）製剤の外観及び性状

販売名	エキセメスタン錠 25mg「NIG」
色・剤形	白色～微灰白色のフィルムコーティング錠
外形	直径：6.0mm 厚さ：4.2mm 質量：103mg
識別コード （PTP）	t EX

（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	エキセメスタン錠 25mg「NIG」
有効成分	1 錠中：エキセメスタン　25.000mg
添加剤	クロスポビドン、軽質無水ケイ酸、結晶セルロース、コポビドン、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、デンプングリコール酸ナトリウム、ヒプロメロース、マクロゴール 400、D-マンニトール

（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[1)]

（１）加速試験

試験実施期間：2010/2/11～2011/1/31

◇エキセメスタン錠25mg「NIG」　加速試験　40℃・75%RH［最終包装形態（PTP包装＋紙箱）］

試験項目 ＜規格＞	ロット番号	保存期間			
		開始時	2ヵ月	4ヵ月	6ヵ月
性状 n=3 ＜白色～微灰白色のフィルムコーティング錠＞	S0027 S0028 S0029	適合	適合	適合	適合
確認試験 n=3 （紫外可視吸光度測定法）	S0027 S0028 S0029	適合	適合	適合	適合
純度試験（HPLC） n=3 ＜※1＞	S0027 S0028 S0029	適合	適合	適合	適合
溶出性（%） n=18 ＜30分、60%以上＞	S0027 S0028 S0029	92.4～100.6 93.3～102.8 95.0～101.7	91.9～101.2 90.5～103.3 85.8～ 99.1	94.7～102.8 93.4～102.5 96.5～103.7	95.9～101.8 94.2～103.4 92.9～101.4
含量（%）※2 n=3 ＜95.0～105.0%＞	S0027 S0028 S0029	99.9±1.0※3 97.6±0.3※3 98.5±0.6※3	98.6±0.2※3 96.7±0.3※3 97.4±0.0※3	97.3±0.7※3 96.1±0.5※3 96.6±0.7※3	97.0±0.5※3 96.9±0.2※3 95.8±0.3※3

※1：トリケトン体類縁物質：0.5%以下、エポキサイド体類縁物質：0.5%以下、左記以外の個々の類縁物質：0.2%以下、総類縁物質：2.0%以下

※2：表示量に対する含有率（%）

※3：平均値±標準偏差（S.D.）

（２）無包装状態の安定性

◇エキセメスタン錠25mg「NIG」　無包装　40℃　［遮光、気密容器］

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3ヵ月
性状 ＜白色～微灰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（%） ＜30分、60%以上＞	84～87	83～84
残存率（%）	100	99

◇エキセメスタン錠25mg「NIG」　無包装　25℃・75%RH　［遮光、開放］

試験項目 ＜規格＞	保存期間	
	開始時	3ヵ月
性状 ＜白色～微灰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（%） ＜30分、60%以上＞	84～87	84～89
残存率（%）	100	100

◇エキセメスタン錠25mg「NIG」　無包装　曝光　［散光、気密容器］

試験項目 ＜規格＞	総曝光量	
	開始時	60 万 Lx・hr
性状 ＜白色～微灰白色の 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	わずかに黄色味を帯びた 白色のフィルムコーティング錠
溶出性（%） ＜30 分、60%以上＞	84～87	80～84
残存率（%）	100	99

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）

該当しない

９．溶出性

（１）溶出試験[2)]

＜エキセメスタン錠 25mg「NIG」＞

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 18 年 11 月 24 日　薬食審査発第 1124004 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、pH5.0、pH6.8、水）、100rpm（pH5.0）

［判定］

・pH1.2（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。

・pH5.0（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。

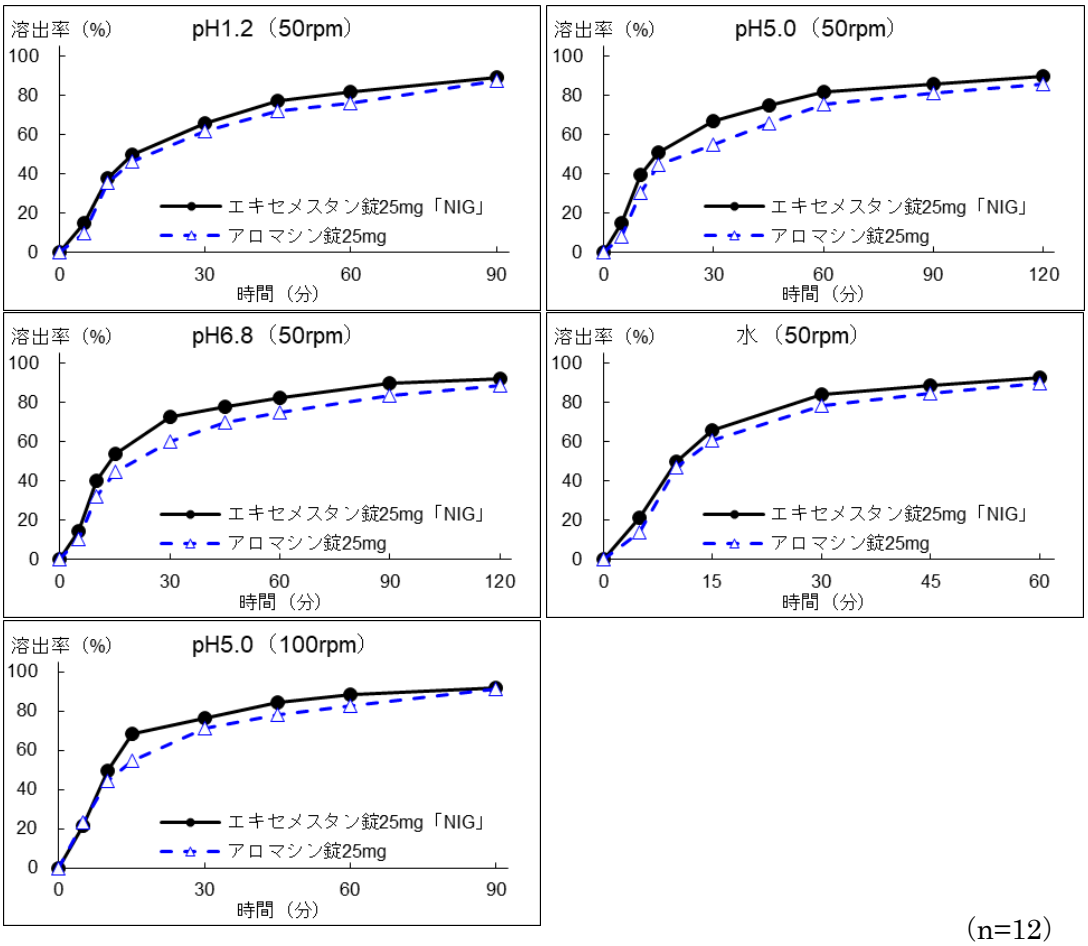
・pH6.8（50rpm）では、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の 2 時点において、本品の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

・水（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。

・pH5.0（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（アロマシン錠 25mg）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

28 錠［14 錠（PTP）×2］、140 錠［14 錠（PTP）×10］

（３）予備容量

該当しない

（４）容器の材質

PTP：褐色透明ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

ピロー：ポリプロピレンフィルム

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

閉経後乳癌

２．効能又は効果に関連する注意

設定されていない

３．用法及び用量

（１）用法及び用量の解説

通常、成人にはエキセメスタンとして１日１回 25mg を食後に経口投与する。

（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

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

該当資料なし

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．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

アロマターゼ阻害剤

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

18.1.1 アロマターゼ阻害作用

エキセメスタンはアンドロゲンをエストロゲンに変換する酵素であるアロマターゼを非可逆的に阻害することにより、血中エストロゲン濃度を抑制し、エストロゲン依存性の乳癌の増殖を阻害する[3)]。

1）*in vivo* 試験

妊馬血清ゴナドトロピン刺激ラットにおいて、エキセメスタンの単回経口投与は卵巣アロマターゼ活性を用量依存的に減少させ、その ED_{50} 値は 3.7mg/kg であった[4)]。

2）*in vitro* 試験

エキセメスタンは、他のステロイド合成系酵素にはほとんど影響を与えることなく、アロマターゼを選択的に不活性化した[5)]。

（２）薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

（３）作用発現時間・持続時間

該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

１．血中濃度の推移

（１）治療上有効な血中濃度

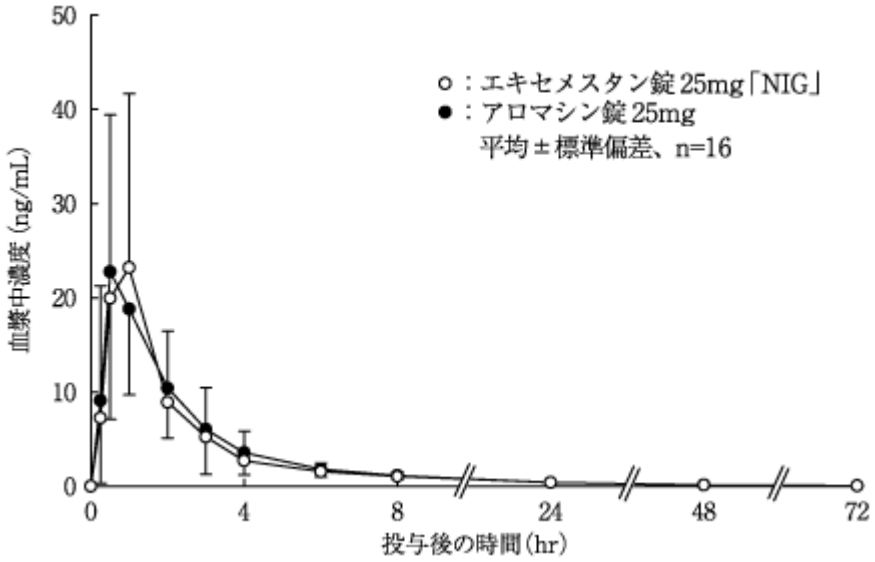
該当資料なし

（２）臨床試験で確認された血中濃度

16.1.1 生物学的同等性試験

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 18 年 11 月 24 日　薬食審査発第 1124004 号）

エキセメスタン錠 25mg「NIG」とアロマシン錠 25mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（エキセメスタンとして 25mg）閉経後健康成人女性に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log（0.80）～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[6)]。



薬物動態パラメータ

	投与量 （mg）	$AUC_{0\text{-}72}$ （ng・hr/mL）	Cmax （ng/mL）	Tmax （hr）	$T_{1/2}$ （hr）
エキセメスタン錠 25mg「NIG」	25	69.458 ±21.296	27.913 ±17.043	1.13 ±0.83	16.4 ±6.7
アロマシン錠 25mg	25	72.234 ±21.956	26.219 ±14.062	1.16 ±0.93	15.4 ±6.8

（平均±標準偏差、n＝16）

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

（「Ⅷ．6.（5）妊婦」の項参照）

（３）乳汁への移行性

（「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

該当資料なし

６．代謝

（１）代謝部位及び代謝経路

該当資料なし

（２）代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

該当資料なし

（３）初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

（４）代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

７．排泄

該当資料なし

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

該当資料なし

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 妊婦又は妊娠している可能性のある女性［9.5 参照］

2.2 授乳婦［9.6 参照］

2.3 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

（解説）

2.3 については、海外における添付文書を参考に一般的留意事項として設定した。

国内･海外の臨床試験において発疹等の過敏症が発現しており、過敏症の既往歴のある患者では、さらに重篤な過敏症が発現するおそれがある。

３．効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

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 本剤はホルモン療法剤であり、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。

8.2 本剤は末梢アロマターゼを阻害することにより治療効果を発揮するものであり、活発な卵巣機能を有する閉経前の患者ではアロマターゼを阻害する効果は不十分であると予想されること、並びに閉経前の患者では使用経験がないことを考慮して、閉経前患者に対し使用しないこと。

8.3 本剤の投与によって、骨粗鬆症、骨折が起こりやすくなるので、骨密度等の骨状態を定期的に観察することが望ましい。

8.4 本剤の使用による嗜眠、傾眠、無力（症）及びめまいが報告されており、このような症状がある場合、機械操作や自動車の運転はさせないよう十分注意すること。

（解説）

8.2 本剤は、副腎由来のアンドロゲンを脂肪組織等でエストロゲンに変換する酵素であるアロマターゼを不活性化させることにより、治療効果を発揮する。活発な卵巣機能を有する閉経前の患者では、アロマターゼ阻害剤の効果が不十分になることが予想されること、並びに閉経前の患者では使用経験がないことを考慮して設定した。

8.3 海外で実施した多施設共同二重盲検比較試験において、術後補助療法としてタモキシフェンを2～3 年投与した閉経後乳癌患者を対象とし、本剤に切り替えた群とタモキシフェン継続群について、骨に関するサブスタディを実施した結果、本剤に切り替えた群でより骨密度が低下したとの報告があることから設定した[7)]。

8.4 本剤との関連性は明確ではないが、上記のような症状が報告されていること、並びに海外の添付文書を参考にして、安全性を考慮して設定した。

国内における臨床試験において、めまいが認められた。また、海外における臨床試験において、傾眠、無力（症）、めまいが認められた。

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

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重度の腎障害のある患者

本剤の重度の腎障害患者における長期安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

（解説）

本剤の重度の腎障害患者における長期安全性は確立していないことから、注意喚起のため設定した。腎機能障害（中等度、重度）のある患者 13 例を対象とした臨床試験（単回投与）において、因果関係の否定できない有害事象として頭痛 1 例（グレード 1）が認められた。薬物動態では、健康成人と比較して Cmax に有意差はなかったが、$AUC_{0\text{-}\infty}$が約 2～3 倍に増加し、CL/F が低下した[8)]。

（３）肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重度の肝障害のある患者

本剤の重度の肝障害患者における長期安全性を指標とした臨床試験は実施していない。

（解説）

本剤の重度の肝障害患者における長期安全性は確立していないことから、注意喚起のため設定した。

（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は投与しないこと。本剤は、閉経後の患者を対象とするため、妊婦に対する投与は想定されていないが、妊婦への投与の安全性については次の知見がある。動物実験（ラット）で、分娩障害、妊娠期間の延長、吸収胚数の増加及び生存胎児数の減少が認められている。また動物実験（ウサギ）で、流産、吸収胚数の増加及び胎児体重の低下が認められている。しかし両種による動物実験で、催奇形性は認められてはいない。本剤の妊婦又は妊娠している可能性のある女性における臨床使用経験はない。［2.1 参照］

（解説）

閉経後の患者を対象とする薬剤であることから、妊婦、授乳婦に対する投与は想定されておらず、これらを対象とした臨床使用経験がない。しかし、動物実験において、上記の知見が報告されていることから設定した。

（６）授乳婦

9.6 授乳婦

投与しないこと。本剤は、閉経後の患者を対象とするため、授乳婦に対する投与は想定されていないが、授乳婦への投与の安全性については次の知見がある。動物実験（ラット）で乳汁中への移行が認められている。本剤の授乳中の女性における臨床使用経験はない。［2.2 参照］

（７）小児等

設定されていない

（８）高齢者

設定されていない

７．相互作用

（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
エストロゲン含有製剤	本剤の効果を減弱させる可能性がある。	本剤の薬理作用はエストロゲン合成阻害によるものであるため。

（解説）

本剤の海外における添付文書を参考に設定した。

本剤の薬理作用がエストロゲン合成阻害によるものであるため、エストロゲン含有製剤との併用は、本剤の効果を減弱させる可能性があることから併用注意とした。

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 肝炎（頻度不明）**、肝機能障害**（頻度不明）**、黄疸**（頻度不明）

肝炎、AST、ALT、Al-P、γ-GTP 等の上昇を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

（２）その他の副作用

11.2 その他の副作用

	5%以上	0.1～5%未満	頻度不明
精神神経系	多汗、めまい	しびれ（感）、頭痛、知覚障害、ふらつき（感）、不眠（症）、抑うつ、不安、手根管症候群	傾眠
消化器	悪心	食欲不振、腹痛、嘔吐、腸管閉塞、のどの通過障害感、胃もたれ感、心窩部痛（心窩部の疼痛）、下痢	
肝臓			肝機能異常、Al-P 上昇
皮膚		発疹、脱毛（症）、爪の変化	蕁麻疹、そう痒症
筋骨格系		関節痛、筋骨格痛	骨折、骨粗鬆症、弾発指、狭窄性腱鞘炎
循環器	高血圧	動悸、低血圧	
呼吸器		鼻出血、かぜ症候群、肺炎	
泌尿器		膀胱炎、尿検査異常	
生殖器		不正（子宮）出血、帯下	
その他	ほてり、疲労	疼痛、体重減少、倦怠（感）、体臭、浮腫、味覚異常、嗅覚障害	過敏症

（解説）

CCDS（Company Core Data Sheet：企業中核データシート）*との整合性及び国内外の症例報告の集積状況に基づき、「弾発指」「狭窄性腱鞘炎」を分類「筋骨格系」に追加し、注意喚起を行った。また、併せて「関節痛」「筋骨格痛」「骨折」「骨粗鬆症」を分類「その他」から「筋骨格系」へ移動し、記載整備を行った。

＊CCDS：安全性情報に加えて、効能又は効果、用法及び用量、薬理学及び製品に関するその他の情報が含まれている米国ファイザー社が作成する文書

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＞

本剤の 25mg を超える用量の使用経験については、欧米人の閉経後乳癌患者を対象として、本剤の 5～600mg を反復投与した第Ⅰ相臨床試験が実施されているが、25mg を超える投与例においてグレード 2 以上の有害事象は 18 例中 5 例に認められ、ほてり 2 件、発熱、発汗、感情不安定、嘔吐が各 1 件ずつであった[9)]。本剤の過量投与による臨床上問題となる有害事象は特に認められていないが、誤って過量摂取した場合には、患者を注意深く観察し、必要に応じて対症療法を行う。

注）本剤の閉経後乳癌に対して承認されている用法及び用量は、1 日 1 回 25mg である。

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

設定されていない

（２）非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

24 ヵ月間のマウスがん原性試験において、中用量（150mg/kg/日）、高用量（450mg/kg/日）で雌雄において肝細胞腺腫及び肝細胞癌の発生率の上昇が認められた。また、雄の高用量群で腎腺腫の発生の上昇がみられた。これらの腫瘍はマウス特有なものである可能性が高くヒトにおける臨床的な安全性との関連は低いと考えられる。

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	エキセメスタン錠 25mg「NIG」	処方箋医薬品[注)] 注）注意－医師等の処方箋により使用すること
有効成分	エキセメスタン	なし

２．有効期間

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：アロマシン錠 25mg

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

履歴	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
販売開始	エキセメスタン錠 25mg「テバ」	2012 年 2 月 15 日	22400AMX00594000	2012 年 6 月 22 日	2012 年 6 月 22 日
承継	エキセメスタン錠 25mg「NIG」	〃	〃	2023 年 5 月 24 日	2023 年 5 月 24 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
エキセメスタン錠25mg「NIG」	4291012F1014	4291012F1073	121583003	622158303

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) 社内資料：安定性試験
2) 社内資料：溶出試験
3) 薬理作用（アロマシン錠；2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ホ.）
4) 卵巣アロマターゼ阻害作用（アロマシン錠；2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ホ.1.2.1）
5) ステロイド合成系酵素に対する作用（アロマシン錠；2002 年 7 月 5 日承認、申請資料概要ホ.1.3.2）
6) 社内資料：生物学的同等性試験
7) Coleman, R. E. et al.：Lancet Oncol.2007；8（2）：119-127（PMID：17267326）
8) Jannuzzo Maria Gabriella et al.：Cancer Chemother Pharmacol.2004；53（6）：475-481（PMID：15014897）
9) Paridaens, R. et al.：Anticancer Drugs.1998；9（8）：675-683（PMID：9823425）

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

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
閉経後乳癌	通常、成人にはエキセメスタンとして1日1回25mgを食後に経口投与する。

＜DailyMed（USA）、2023 年 3 月検索＞

国　名	米国
会社名	Cipla USA Inc.
販売名	EXEMESTANE tablet
剤形・規格	25mg

INDICATIONS AND USAGE

1.1 Adjuvant Treatment of Postmenopausal Women

Exemestane tablets, USP are indicated for adjuvant treatment of postmenopausal women with estrogen-receptor positive early breast cancer who have received two to three years of tamoxifen and are switched to exemestane tablets, USP for completion of a total of five consecutive years of adjuvant hormonal therapy.

1.2 Advanced Breast Cancer in Postmenopausal Women

Exemestane tablets, USP are indicated for the treatment of advanced breast cancer in postmenopausal women whose disease has progressed following tamoxifen therapy.

DOSAGE AND ADMINISTRATION

2.1 Recommended Dose

The recommended dose of exemestane tablet in early and advanced breast cancer is one 25 mg tablet once daily after a meal.

- adjuvant treatment of postmenopausal women with estrogen-receptor positive early breast cancer who have received two to three years of tamoxifen and are switched to exemestane tablets for completion of a total of five consecutive years of adjuvant hormonal therapy.
- the treatment of advanced breast cancer in postmenopausal women whose disease has progressed following tamoxifen therapy.

2.2 Dose Modifications

Concomitant use of strong CYP 3A4 inducers decreases exemestane exposure. For patients receiving exemestane tablets with a strong CYP 3A4 inducer such as rifampicin or phenytoin, the recommended dose of exemestane tablet is 50 mg once daily after a meal.

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	exemestane	C

（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 C：

Drugs which, owing to their pharmacological effects, have caused or may be suspected of causing, harmful effects on the human fetus or neonate without causing malformations. These effects may be reversible. 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

該当資料なし

【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

エキセメスタン錠 25mg「NIG」

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℃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。充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。
上記の操作で充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
エキセメスタン錠 25mg「NIG」	5 分以内に崩壊・懸濁した。	8Fr.チューブを通過した。

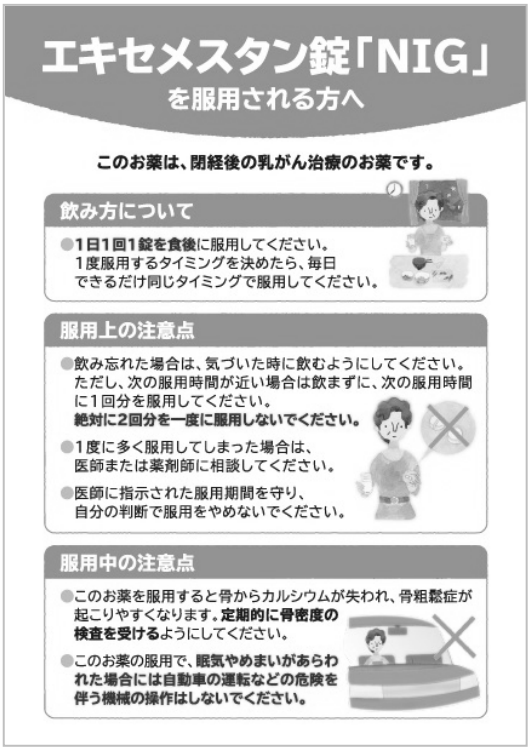
【注意】
本剤の有効成分は曝露によって健康への有害な影響をもたらす恐れがあります。崩壊・懸濁あるいは粉砕を行う場合は、手袋やガウンといった個人防護具を用いるなど、曝露対策を行うことを推奨します。

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。

２．その他の関連資料

患者向け資材

エキセメスタン錠「NIG」を服用される方へ



エキセメスタン錠「NIG」
を服用される方へ

このお薬は、閉経後の乳がん治療のお薬です。

飲み方について

- **1日1回1錠を食後**に服用してください。
  1度服用するタイミングを決めたら、毎日
  できるだけ同じタイミングで服用してください。

服用上の注意点

- 飲み忘れた場合は、気づいた時に飲むようにしてください。
  ただし、次の服用時間が近い場合は飲まずに、次の服用時間
  に1回分を服用してください。
  絶対に2回分を一度に服用しないでください。
- 1度に多く服用してしまった場合は、
  医師または薬剤師に相談してください。
- 医師に指示された服用期間を守り、
  自分の判断で服用をやめないでください。

服用中の注意点

- このお薬を服用すると骨からカルシウムが失われ、骨粗鬆症が
  起こりやすくなります。**定期的に骨密度の
  検査を受ける**ようにしてください。
- このお薬の服用で、**眠気やめまいがあらわ
  れた場合には自動車の運転などの危険を
  伴う機械の操作はしないでください。**