2023年7月改訂（第9版）

日本標準商品分類番号　872171

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2013に準拠して作成

高血圧症・狭心症治療剤
持続性Ca拮抗剤
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「イセイ」
アムロジピンＯＤ錠 5mg「イセイ」
アムロジピンＯＤ錠 10mg「イセイ」

AMLODIPINE　OD　Tablets 2.5mg・5mg・10mg

剤形	錠剤（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	OD錠2.5mg：1錠中にアムロジピンベシル酸塩（日局）3.47mg（アムロジピンとして2.5mg）含有 OD錠5mg　：1錠中にアムロジピンベシル酸塩（日局）6.93mg（アムロジピンとして5mg）含有 OD錠10mg　：1錠中にアムロジピンベシル酸塩（日局）13.87mg（アムロジピンとして10mg）含有	
一般名	和名：アムロジピンベシル酸塩 洋名：Amlodipine Besilate	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日		アムロジピン OD 錠 2.5mg/5mg/10mg「イセイ」
	製造販売承認年月日	2014 年 2 月 14 日
	薬価基準収載年月日	2014 年 6 月 20 日
	発売年月日	2014 年 6 月 20 日
開発・製造販売（輸入）・提携・販売会社名	製造販売元：コーアイセイ株式会社	
医薬情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	コーアイセイ株式会社　くすり相談窓口 TEL：023-666-5797　FAX:023-624-4717 医療関係者向けホームページ http://www.isei-pharm.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。
最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ
https://www.pmda.go.jp/にてご確認ください。

IF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として医療用医薬品添付文書(以下、添付文書と略す)がある。医療現場で医師、薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和63年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第2小委員会が「医薬品インタビューフォーム」(以下、IFと略す)の位置付け並びにIF記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成10年9月に日病薬学術第3小委員会においてIF記載要領の改訂が行われた。

更に10年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成20年9月に日病薬医薬情報委員会においてIF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（http：//www.info.pmda.go.jp）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

２．IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製薬企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

［IFの様式］

①規格はA4版、横書きとし、原則として9ポイント以上の字体（図表は除く）記載し，一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

②IF記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。

③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2頁にまとめる。

［IFの作成］

①IFは原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。

②IFに記載する項目及び配列は日病薬が策定したＩＦ記載要領に準拠する。

③添付文書の内容を補完するとのIFの主旨に沿って必要な情報が記載される。

④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。

⑤「IF記載要領2013」（以下、「IF記載要領2013」と略す）により作成されたIFは、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

［IFの発行］

①「IF記載要領2013」は、平成25年10月以降に承認された新医薬品から適用となる。

②上記以外の医薬品については、「IF記載要領2013」による作成・提供は強制されるものではない。

③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合にはIFが改訂される。

３．IFの利用にあたって

「IF記載要領2013」においては、PDFファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体のIFについては、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより薬剤師等自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることがあり、その取扱いには十分留意すべきである。

４．利用に際しての留意点

IFを薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IFは日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IFがあくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後のインタビューフォームでの公開等を踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

（2013年4月改訂）

目　　次

Ⅰ．概要に関する項目
１．開発の経緯 …… 1
２．製品の治療学的・製剤学的特性 …… 1
Ⅱ．名称に関する項目
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） …… 2
６．慣用名，別名，略号，記号番号 …… 2
７．ＣＡＳ登録番号 …… 2
Ⅲ．有効成分に関する項目
１．物理化学の性質 …… 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 …… 3
４．有効成分の定量法 …… 3
Ⅳ．製剤に関する項目
１．剤形 …… 4
２．製剤の組成 …… 5
３．懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意 …… 5
４．製剤の各種条件下における安定性 …… 5
５．調製法及び溶解後の安定性 …… 5
６．他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 5
７．溶出性 …… 6
８．生物学的試験法 …… 9
９．製剤中の有効成分の確認試験法 …… 9
10．製剤中の有効成分の定量法 …… 9
11．力価 …… 9
12．混入する可能性のある夾雑物 …… 9
13．注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報 …… 9
14．その他 …… 9
Ⅴ．治療に関する項目
１．効能又は効果 …… 10
２．用法及び用量 …… 10
３．臨床成績 …… 10
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 …… 12
２．薬理作用 …… 12
Ⅶ．薬物動態に関する項目
１．血中濃度の推移・測定法 …… 13
２．薬物速度論的パラメータ …… 16
３．吸収 …… 16
４．分布 …… 16
５．代謝 …… 17
６．排泄 …… 17
７．トランスポーターに関する情報 …… 17
８．透析等による除去率 …… 17

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 …… 18
２．禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） …… 18
３．効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 …… 18
４．用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 …… 18
５．慎重投与内容とその理由 …… 18
６．重要な基本的注意とその理由及び処置方法 …… 18
７．相互作用 …… 18
８．副作用 …… 19
９．高齢者への投与 …… 20
10．妊婦，産婦，授乳婦等への投与 …… 21
11．小児等への投与 …… 21
12．臨床検査結果に及ぼす影響 …… 21
13．過量投与 …… 21
14．適用上の注意 …… 21
15．その他の注意 …… 21
16．その他 …… 21
Ⅸ．非臨床試験に関する項目
１．薬理試験 …… 22
２．毒性試験 …… 22
Ⅹ．管理的事項に関する項目
１．規制区分 …… 23
２．有効期間又は使用期限 …… 23
３．貯法・保存条件 …… 23
４．薬剤取扱い上の注意点 …… 23
５．承認条件等 …… 23
６．包装 …… 23
７．容器の材質 …… 23
８．同一成分・同効薬 …… 24
９．国際誕生年月日 …… 24
10．製造販売承認年月日及び承認番号 …… 24
11．薬価基準収載年月日 …… 24
12．効能又は効果追加，用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容 …… 24
13．再審査結果，再評価結果公表年月日及びその内容 …… 24
14．再審査期間 …… 24
15．投薬期間制限医薬品に関する情報 …… 24
16．各種コード …… 24
17．保険給付上の注意 …… 24
ⅩⅠ．文献
１．引用文献 …… 25
２．その他の参考文献 …… 25
ⅩⅡ．参考資料
１．主な外国での発売状況 …… 25
２．海外における臨床支援情報 …… 25
ⅩⅢ．備考
その他の関連資料 …… 25

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

本剤は、安定した降圧作用と抗狭心症作用を示すアムロジピンベシル酸塩を主成分とする持続性 Ca 拮抗剤の口腔内崩壊錠（OD 錠）である。
アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」、アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」及びアムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」はいずれも 2014 年 2 月 14 日製造販売承認を取得し、2014 年 6 月 20 日に薬価基準追補収載され、同年 6 月 20 日に発売を開始した。

２．製品の治療学的・製剤学的特性

（１）アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」、アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」及びアムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」は、1 錠中にアムロジピンベシル酸塩をそれぞれ 3.47mg、6.97mg 及び 13.87mg（アムロジピンとして 2.5mg、5mg 及び 10mg）含有する淡橙色の素錠である（OD 錠 5mg、OD 錠 10mg は割線入り）。
（２）本剤は水なしでも服用できる口腔内崩壊錠（OD 錠）である。
（３）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（頻度不明）。
（詳細は、Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 を参照）

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「イセイ」
アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」
アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」

（２）洋名

AMLODIPINE OD Tablets2.5mg
AMLODIPINE OD Tablets5mg
AMLODIPINE OD Tablets10mg

（３）名称の由来

「主成分の一般的名称」＋「剤形」＋「含量」＋「屋号」

２．一般名

（１）和名（命名法）

アムロジピンベシル酸塩(JAN)

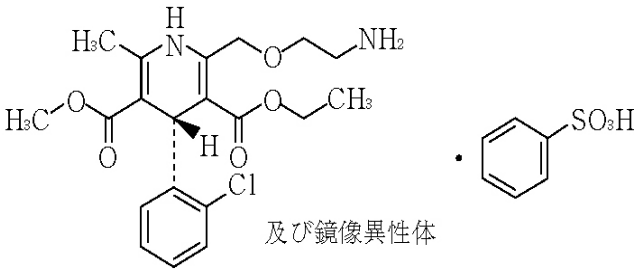
（２）洋名（命名法）

Amlodipine Besilate(JAN)

（３）ステム

ニフェジピン系カルシウムチャネル拮抗薬：「dipine」

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）

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

６．慣用名，別名，略号，記号番号

特になし

７．ＣＡＳ登録番号

111470-99-6

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

メタノールに溶けやすく、エタノール（99.5）にやや溶けにくく、水に溶けにくい。

（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 [1)]

pKa＝8.85（中和滴定法）

（６）分配係数

該当資料なし

（７）その他の主な示性値

水分：0.5%以下（1g、容量滴定法、直接滴定）[2)]
強熱残分：0.2%以下（1g）[2)]
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

日局「アムロジピンベシル酸塩」の確認試験法による [2)]

（１）紫外可視吸光度測定法
（２）赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）
（３）塩化バリウム試液による沈殿反応

４．有効成分の定量法

日局「アムロジピンベシル酸塩」の定量法による [2)]

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、外観及び性状

販　売　名	外　　形			色　調 剤　形	識　別 コード
	直径(mm)	厚さ(mm)	重量(mg)		
アムロジピンOD錠 2.5mg「イセイ」	 7.0	 2.15	 100	淡橙色 素錠	IC 536
アムロジピンOD錠 5 mg「イセイ」	 8.0	 3.35	 200	淡橙色 素錠 (割線入り)	IC 537
アムロジピンOD錠 10mg「イセイ」	 8.5	 4.7	 250	淡橙色 素錠 (割線入り)	IC 538

（２）製剤の物性

該当資料なし

（３）識別コード

・アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」：IC536
製剤本体及び PTP シートに記載

・アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」：IC537
製剤本体及び PTP シートに記載

・アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」：IC538
製剤本体及び PTP シートに記載

（４）pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

２．製剤の組成

（１）有効成分（活性成分）の含量

・アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」：
1 錠中アムロジピンベシル酸塩(日局)3.47mg(アムロジピンとして 2.5mg)含有

・アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」：
1 錠中アムロジピンベシル酸塩(日局)6.93mg(アムロジピンとして 5mg)含有

・アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」：
1 錠中アムロジピンベシル酸塩(日局)13.87mg(アムロジピンとして 10mg)含有

（２）添加物

D-マンニトール、結晶セルロース、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）、l-メントール、ステアリン酸マグネシウム、黄色 5 号

（３）その他

該当資料なし

３．懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意

該当しない

４．製剤の各種条件下における安定性

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヵ月）の結果、アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」、アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」及びアムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」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。[3)]

５．調製法及び溶解後の安定性

該当しない

６．他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当資料なし

７．溶出性[4)]

【溶出挙動における類似性】

●アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」

（2006 年 11 月 24 日付　薬食審査発第 1124004 号）に基づき、溶出挙動の類似性を評価した。

（方法）日本薬局方溶出試験法パドル法

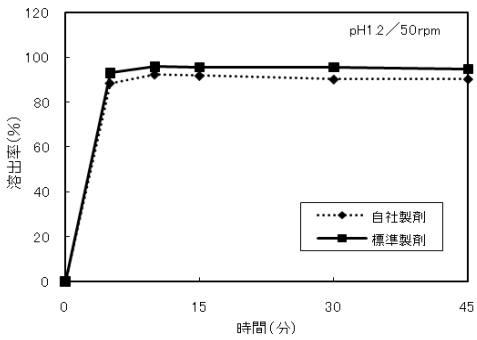
条件：回転数　　50rpm

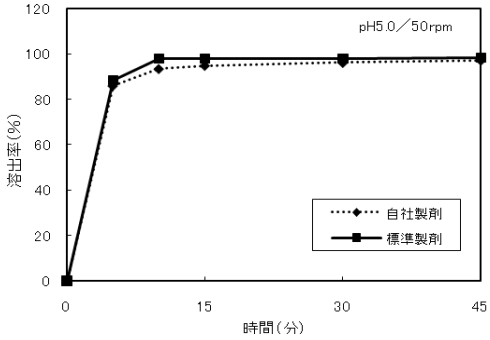
試験液　　①pH1.2：日本薬局方溶出試験液第 1 液

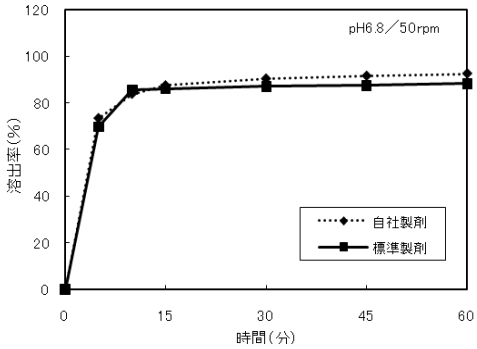
②pH5.0：0.05mol/L リン酸水素ニナトリウム溶液と 0.025mol/L クエン酸溶液を用いて調製した液

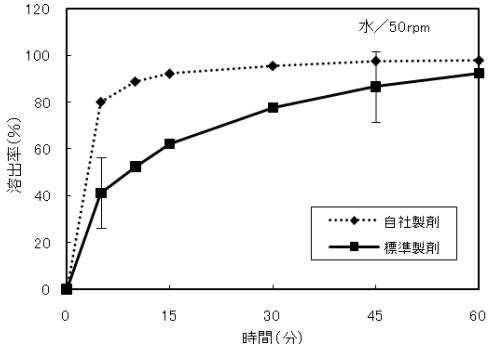
③pH6.8：日本薬局方溶出試験第 2 液

④水：日本薬局方精製水







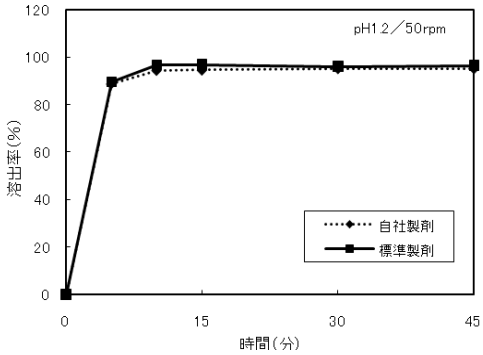


以上の結果より、水以外の各試験液ではいずれも標準製剤と試験製剤の溶出挙動には類似性が認められたが、水では類似性が認められなかった。これは、標準製剤では水での溶出が著しく遅れたことが原因であるが、試験製剤では他の液性同様に速やかな溶出を示し、試験液の条件の影響を受けにくいといえる。

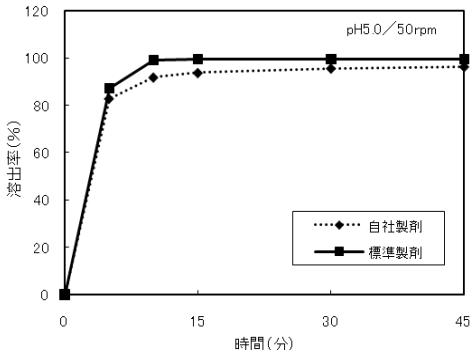
水以外の試験液は服用後の消化管の環境を反映しており、これらの液性では両製剤の溶出挙動の類似性が認められていることから、水での溶出挙動の差は生物学的同等性試験の実施に大きな影響がないと判断できる。したがってヒトでの生物学的同等性試験において、生体内での溶出性に関しては標準製剤と試験製剤間には差がないと考えられる。

●アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」
（2006 年 11 月 24 日付　薬食審査発第 1124004 号）に基づき、溶出挙動の類似性を評価した。

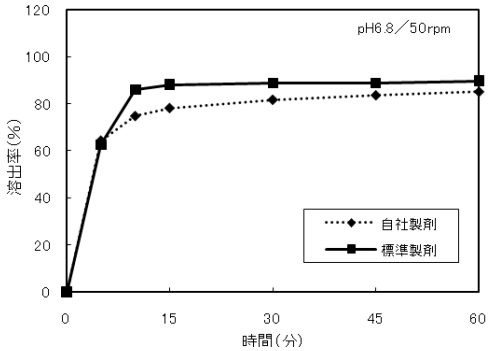
（方法）日本薬局方溶出試験法パドル法
条件：回転数　　50rpm
試験液　　①pH1.2：日本薬局方溶出試験液第 1 液
②pH5.0：0.05mol/L リン酸水素ニナトリウム溶液と 0.025mol/L クエン酸溶液を用いて調製した液
③pH6.8：日本薬局方溶出試験第 2 液
④水：日本薬局方精製水



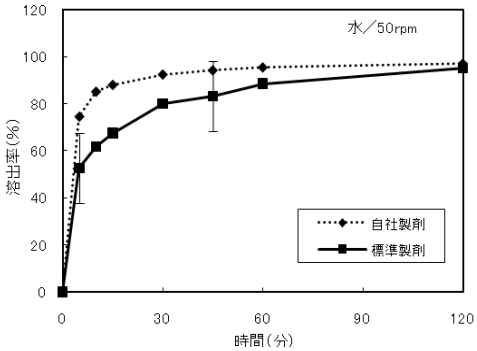
n＝12



n＝12



n＝12

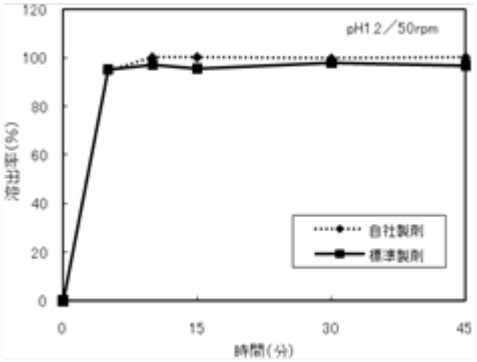


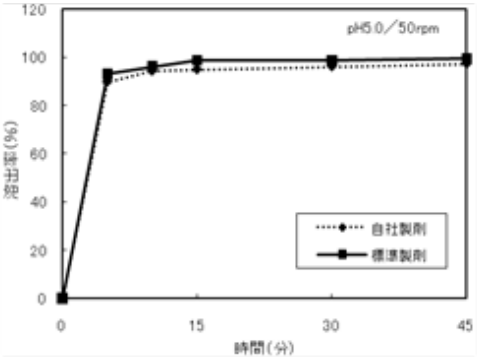
n＝12

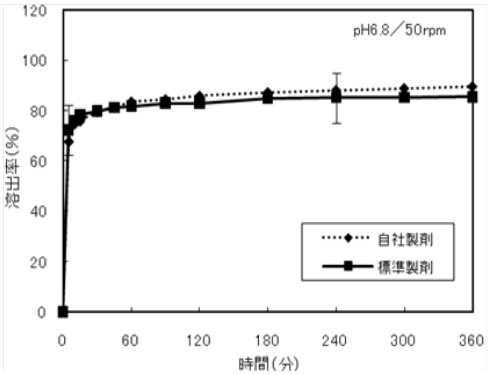
以上の結果より、水以外の各試験液ではいずれも標準製剤と試験製剤の溶出挙動には類似性が認められたが、水では類似性が認められなかった。これは、標準製剤では水での溶出が著しく遅れたことが原因であるが、試験製剤では他の液性同様に速やかな溶出を示し、試験液の条件の影響を受けにくいといえる。
水以外の試験液は服用後の消化管の環境を反映しており、これらの液性では両製剤の溶出挙動の類似性が認められていることから、水での溶出挙動の差は生物学的同等性試験の実施に大きな影響がないと判断できる。したがってヒトでの生物学的同等性試験において、生体内での溶出性に関しては標準製剤と試験製剤間には差がないと考えられる。

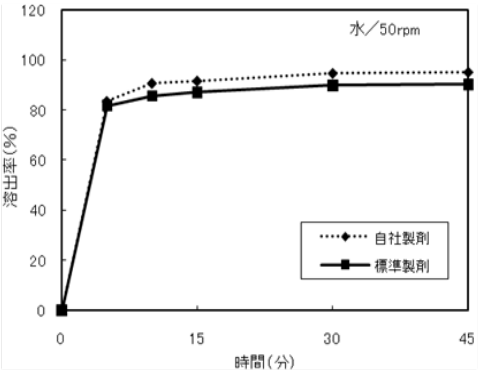
●アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」
（2006 年 11 月 24 日付　薬食審査発第 1124004 号）に基づき、溶出挙動の類似性を評価した。

（方法）日本薬局方溶出試験法パドル法
条件：回転数　　50rpm
試験液　　①pH1.2：日本薬局方溶出試験液第 1 液
②pH5.0：0.05mol/L リン酸水素ニナトリウム溶液と 0.025mol/L クエン酸溶液を用いて調製した液
③pH6.8：日本薬局方溶出試験第 2 液
④水：日本薬局方精製水









８．生物学的試験法

該当しない

９．製剤中の有効成分の確認試験法

日局「アムロジピンベシル酸塩口腔内崩壊錠」の確認試験法による[5)]

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

日局「アムロジピンベシル酸塩口腔内崩壊錠」の定量法による[5)]

液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当しない

14. その他

該当しない

Ⅴ．治療に関する項目

１．効能又は効果

高血圧症、狭心症

＜効能又は効果に関連する使用上の注意＞

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。**

２．用法及び用量

成人への投与

○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。

小児への投与（アムロジピン OD 錠 2.5 mg／OD 錠 5 mg「イセイ」）

○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。

＜用法及び用量に関連する使用上の注意＞

［アムロジピン OD 錠 2.5mg、OD 錠 5mg「イセイ」］

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。

［アムロジピン OD 錠 2.5mg、OD 錠 5mg、OD 錠 10mg「イセイ」］

本剤は口腔内で崩壊するが、口腔粘膜から吸収されることはないため、唾液又は水で飲み込むこと。（「適用上の注意」の項参照）

３．臨床成績

（１）臨床データパッケージ

該当しない

（２）臨床効果

該当資料なし

（３）臨床薬理試験

該当資料なし

（４）探索的試験

該当資料なし

（５）検証的試験

１）無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

２）比較試験

該当資料なし

３）安全性試験

該当資料なし

４）患者・病態別試験

該当資料なし

（６）治療的使用

１）使用成績調査・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

該当資料なし

２）承認条件として実施予定の内容又は実施した試験の概要

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

1，4-ジヒドロピリジン系Ｃａ拮抗薬(ニフェジピン、ニカルジピン等)

２．薬理作用

（１）作用部位・作用機序[2)]

ジヒドロピリジン系カルシウム拮抗薬としての作用を示すが、作用の発現が緩徐で持続的であるという特徴を有する。

ジヒドロピリジン系カルシウム拮抗薬は膜電位依存性Ｌ型カルシウムチャネルに特異的に結合し、細胞内へのカルシウム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。非ジヒドロピリジン系カルシウム拮抗薬（ベラパミルやジルチアゼム）と比較すると、血管選択性が高く、心収縮力や心拍数に対する抑制作用は弱い。

（２）薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

（３）作用発現時間・持続時間

該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

１．血中濃度の推移・測定法

（１）治療上有効な血中濃度

該当資料なし

（２）最高血中濃度到達時間

「Ⅶ.薬物動態に関する項目 1.（３）臨床試験で確認された血中濃度」の項を参照

（３）臨床試験で確認された血中濃度

【生物学的同等性試験】[6)]

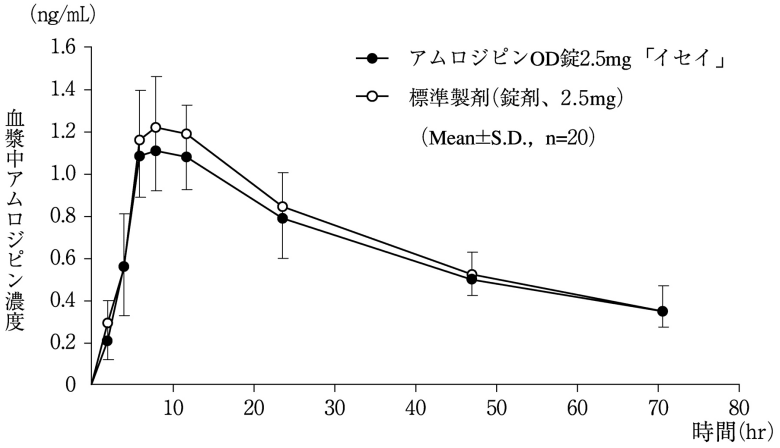
●アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」

アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」と標準製剤を、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）健康成人男子に空腹時水なし及び空腹時水ありで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。

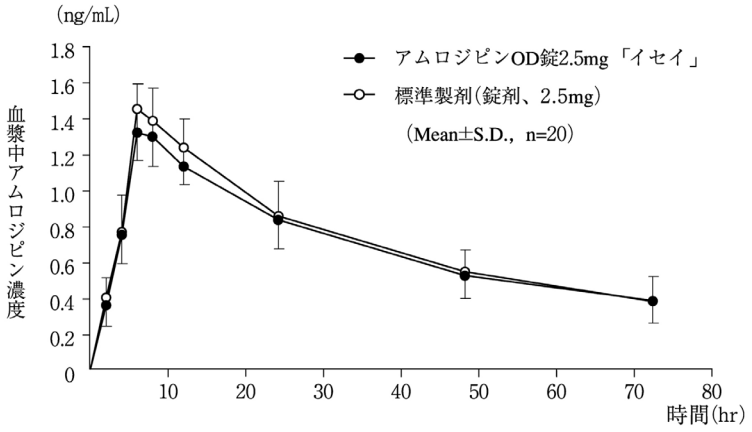
製剤名		判定パラメータ		参考パラメータ	
		$AUC_{0\to72hr}$ (ng･hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
水なし投与	アムロジピンOD錠 2.5mg「イセイ」	45.5±11.1	1.19±0.29	8.8±2.9	43.2±14.1
水なし投与	標準製剤 (錠剤、2.5mg)	48.4±9.9	1.27±0.32	9.3±2.4	40.9±9.6
水あり投与	アムロジピンOD錠 2.5mg「イセイ」	50.6±12.1	1.40±0.25	7.1±1.5	41.9±7.0
水あり投与	標準製剤 (錠剤、2.5mg)	53.0±10.6	1.51±0.24	7.0±1.9	41.5±9.9

（水なし投与：Mean±S.D., n＝20）
（水あり投与：Mean±S.D., n＝20）

水なし経口投与後の血漿中濃度



水あり経口投与後の血漿中濃度



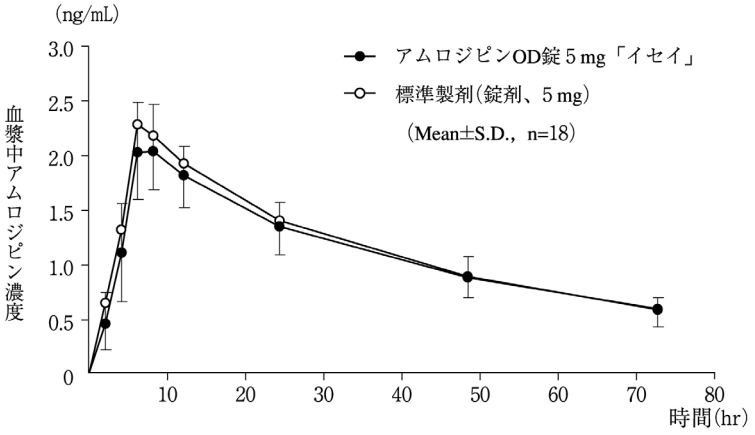
●アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」

アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」と標準製剤を、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）健康成人男子に空腹時水なし及び空腹時水ありで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。

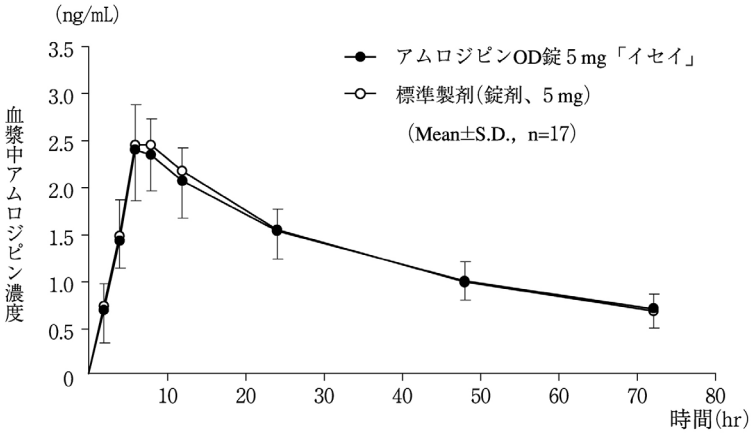
製剤名		判定パラメータ		参考パラメータ	
		$AUC_{0\to72hr}$ (ng･hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
水なし投与	アムロジピンOD錠 5 mg「イセイ」	80.4±13.4	2.12±0.41	7.7±1.8	39.2±5.4
水なし投与	標準製剤 (錠剤、5 mg)	84.1±18.2	2.38±0.61	7.8±2.5	38.3±7.3
水あり投与	アムロジピンOD錠 5 mg「イセイ」	93.9±14.5	2.54±0.45	7.2±1.6	43.3±9.9
水あり投与	標準製剤 (錠剤、5 mg)	95.1±18.1	2.61±0.54	7.6±1.9	41.6±7.5

（水なし投与：Mean±S.D., n＝18）
（水あり投与：Mean±S.D., n＝17）

水なし経口投与後の血漿中濃度



水あり経口投与後の血漿中濃度



●アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」

アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」は「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性ガイドライン（平成 18 年 11 月 24 日薬食審査発第 1124004 号）」に基づき、アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

（４）中毒域

該当資料なし

（５）食事・併用薬の影響

「Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目 7．相互作用」の項を参照

（６）母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

２．薬物速度論的パラメータ

（１）解析方法

該当資料なし

（２）吸収速度定数

該当資料なし

（３）バイオアベイラビリティ

該当資料なし

（４）消失速度定数

該当資料なし

（５）クリアランス

該当資料なし

（６）分布容積

該当資料なし

（７）血漿蛋白結合率

該当資料なし

３．吸収

該当資料なし

４．分布

（１）血液－脳関門通過性

該当資料なし

（２）血液－胎盤関門通過性

該当資料なし

（３）乳汁への移行性

「Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目 10．妊娠、産婦、授乳婦等への投与」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

５．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（ＣＹＰ４５０等）の分子種

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。

（３）初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

（４）代謝物の活性の有無及び比率

該当資料なし

（５）活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

６．排泄

（１）排泄部位及び経路

該当資料なし

（２）排泄率

該当資料なし

（３）排泄速度

該当資料なし

７．トランスポーターに関する情報

該当資料なし

８．透析等による除去率

該当資料なし

Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目

１．警告内容とその理由

該当しない

２．禁忌内容とその理由　（原則禁忌を含む）

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】

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使用上の注意とその理由

「Ⅴ．治療に関する項目 1．効能又は効果」の項参照

４．用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「Ⅴ．治療に関する項目 2．用法及び用量」の項参照

５．慎重投与内容とその理由

慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）

（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）肝機能障害のある患者［本剤は主として肝臓で代謝されるため、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。高用量（10mg）において副作用の発現率が高まる可能性があるので、増量時には慎重に投与すること。］

（３）高齢者（「高齢者への投与」の項参照）

（４）重篤な腎機能障害のある患者［一般的に腎機能障害のある患者では、降圧に伴い腎機能が低下することがある。］

６．重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

（１）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。

（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患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

７．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

該当しない

（２）併用注意とその理由

併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
降圧作用を有する薬剤	相互に作用を増強するおそれがある。慎重に観察を行うなど注意して使用する。	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。
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。同時服用をしないように注意すること。	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。	機序不明。
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

（１）副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

（２）重大な副作用（頻度不明）と初期症状

１）**劇症肝炎、肝機能障害、黄疸**：劇症肝炎、AST(GOT)、ALT(GPT)、γ-GTP の上昇等を伴う肝機能障害や黄疸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し、適切な処置を行うこと。

２）**無顆粒球症、白血球減少、血小板減少**：無顆粒球症、白血球減少、血小板減少があらわれることがあるので、検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

３）**房室ブロック**：房室ブロック（初期症状：徐脈、めまい等）があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

４）**横紋筋融解症**：横紋筋融解症があらわれることがあるので、観察を十分に行い、筋肉痛、脱力感、CK(CPK)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。

（３）その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。

分　類	頻　度　不　明
肝臓	ALT(GPT)、AST(GOT)の上昇、肝機能障害、AL-P、LDH の上昇、γ-GTP 上昇、黄疸、腹水
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	眩暈・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(CPK)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[注2)]	発疹、瘙痒、蕁麻疹、光線過敏症、多形紅斑、血管炎、血管浮腫
口腔[注2)]	（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との報告がある。
注２）発現した場合には投与を中止すること。

（４）項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

（５）基礎疾患，合併症，重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

（６）薬物アレルギーに対する注意及び試験法

「Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目 2.禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）、8.副作用（３）その他の副作用の項」参照

９．高齢者への投与

高齢者では一般に過度の降圧は好ましくないとされていること及び高齢者での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ので、低用量（2.5mg／日）から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与

（１）妊婦又は妊娠している可能性のある婦人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。］[7)]

（２）授乳中の婦人への投与は避けることが望ましいが、やむを得ず投与する場合は、授乳を避けさせること。（ヒトで母乳中へ移行することが報告されている。］[8)]

11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児又は 6 歳未満の幼児に対する安全性は確立していない。（使用経験が少ない）

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

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。

処置：心・呼吸機能のモニターを行い、頻回に血圧を測定する。著しい血圧低下が認められた場合は、四肢の挙上、輸液の投与等、心血管系に対する処置を行う。症状が改善しない場合は、循環血液量及び排尿量に注意しながら昇圧剤の投与を考慮する。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、本剤過量投与時の呼吸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。

14. 適用上の注意

（１）分割後：

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。

（２）薬剤交付時：

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、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。）

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。

（３）服用時：

本剤は舌の上にのせ唾液を湿潤させ、唾液のみで服用可能である。また、水で服用することもできる。

15. その他の注意

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。

16. その他

該当しない

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」参照）

該当資料なし

（２）副次的薬理試験

該当資料なし

（３）安全性薬理試験

該当資料なし

（４）その他の薬理試験

該当資料なし

２．毒性試験

（１）単回投与毒性試験

該当資料なし

（２）反復投与毒性試験

該当資料なし

（３）生殖発生毒性試験

該当資料なし

（４）その他の特殊毒性

該当資料なし

Ⅹ．管理的事項に関する項目

１．規制区分

製剤：アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」：劇薬、処方箋医薬品[注)]
アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」　：劇薬、処方箋医薬品[注)]
アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」　：劇薬、処方箋医薬品[注)]
注意―医師等の処方箋により使用すること

有効成分：アムロジピンベシル酸塩　　：毒薬、処方箋医薬品

２．有効期間又は使用期限

使用期限：3 年（安定性試験結果に基づく）

３．貯法・保存条件

気密容器・室温保存

４．薬剤取扱い上の注意点

（１）薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

（２）薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ．安全性（使用上の注意等）に関する項目 14．適用上の注意」の項参照

くすりのしおり：有り
患者向医薬品ガイド：有り

（３）調剤時の留意点について

特になし

５．承認条件等

該当しない

６．包装

アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」　：PTP100 錠（10 錠×10）
アムロジピン OD 錠 5mg　「イセイ」　：PTP100 錠（10 錠×10）
PTP500 錠（10 錠×50）
アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」　：PTP100 錠（10 錠×10）

７．容器の材質

アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」
PTP 包装：ポリプロピレン、アルミ箔
アルミ袋、紙箱
アムロジピン OD 錠 5mg　「イセイ」
PTP 包装：ポリプロピレン、アルミ箔
アルミ袋、紙箱
アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」
PTP 包装：ポリプロピレン、アルミ箔
アルミ袋、紙箱

８．同一成分・同効薬

（１）同一成分薬：

ノルバスク OD 錠 2.5mg、OD 錠 5mg、OD 錠 10mg
アムロジン OD 錠 2.5mg、OD 錠 5mg、OD 錠 10mg

（２）同　効　薬：

ニカルジピン塩酸塩、ベニジピン塩酸塩、マニジピン塩酸塩等

９．国際誕生年月日

不明

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」	2014 年 2 月 14 日	22600AMX00435000
アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」	2014 年 2 月 14 日	22600AMX00436000
アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」	2014 年 2 月 14 日	22600AMX00437000

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日
アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」	2014 年 6 月 20 日
アムロジピン OD 錠 5mg「イセイ」	2014 年 6 月 20 日
アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」	2014 年 6 月 20 日

12. 効能又は効果追加，用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販　売　名	厚生労働省薬価基準収載コード	レセプト電算コード	HOT 番号
アムロジピン OD 錠 2.5mg「イセイ」	2171022F3013	622360701	123607101
アムロジピン OD 錠 5 mg「イセイ」	2171022F4010	622360801	123608801
アムロジピン OD 錠 10mg「イセイ」	2171022F6268	622360901	123609501

17. 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）第十八改正日本薬局方医薬品情報 JPDI 2021, 46, (2021), じほう
２）第十八改正日本薬局方解説書 C-306, (2021), 廣川書店
３）コーアイセイ株式会社：社内資料（加速試験）
４）コーアイセイ株式会社：社内資料（溶出試験）
５）第十八改正日本薬局方解説書 C-313, (2021), 廣川書店
６）コーアイセイ株式会社：社内資料（生物学的同等性試験）
７）堀本政夫ほか：応用薬理. 1991；42（2）：167-176
８）Naito T, et al.：J Hum Lact 31(2)：301, 2015.

２．その他の参考文献

該当資料なし

ＸⅡ．参考資料

１．主な外国での発売状況

該当しない

２．海外における臨床支援情報

該当しない

ＸⅢ．備考

その他の関連資料

該当資料なし