

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018(2019 年更新版)に準拠して作成

前立腺癌治療剤（CYP17 阻害剤）
アビラテロン酢酸エステル錠

アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「トーフ」

ABIRATERONE ACETATE TABLETS 250mg “TOWA”

剤 形	フィルムコーティング錠
製 剤 の 規 制 区 分	劇薬、処方箋医薬品 ^{注)} 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 アビラテロン酢酸エステル 250mg 含有
一 般 名	和名：アビラテロン酢酸エステル（JAN） 洋名：Abiraterone Acetate（JAN）
製 造 販 売 承 認 年 月 日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2023 年 8 月 15 日 薬価基準収載年月日：2026 年 6 月 12 日 販 売 開 始 年 月 日：
製 造 販 売 （ 輸 入 ） ・ 提 携 ・ 販 売 会 社 名	製造販売元： 東和薬品株式会社
医 薬 情 報 担 当 者 の 連 絡 先	
問 い 合 わ せ 窓 口	東和薬品株式会社 学術部 DI センター TEL 0120-108-932 FAX 06-7177-7379 https://med.towayakuhin.co.jp/medical/

本 IF は 2026 年 7 月作成の電子添文の記載に基づき作成した。

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。

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、I F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I Fの位置付け、I F記載様式、I F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I F記載要領の改訂を行ってきた。

I F記載要領2008以降、I FはP D F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I Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI F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（<http://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I F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I F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、I F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. I Fとは

I F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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F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I F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I F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。

I F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. I Fの利用にあたって

電子媒体のI F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I Fを作成・提供するが、I Fの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やI F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、I F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、I F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、I F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

I F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。I F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I F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、I F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	9. 透析等による除去率	19
1. 開発の経緯	1	10. 特定の背景を有する患者	19
2. 製品の治療学的特性	1	11. その他	20
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	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	21
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1. 警告内容とその理由	21
6. RMP の概要	1	2. 禁忌内容とその理由	21
		3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	21
II. 名称に関する項目	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	21
1. 販売名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	21
2. 一般名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	21
3. 構造式又は示性式	2	7. 相互作用	22
4. 分子式及び分子量	2	8. 副作用	23
5. 化学名（命名法）又は本質	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	24
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	10. 過量投与	24
		11. 適用上の注意	24
III. 有効成分に関する項目	3	12. その他の注意	24
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	IX. 非臨床試験に関する項目	25
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 薬理試験	25
		2. 毒性試験	25
IV. 製剤に関する項目	4		
1. 剤形	4	X. 管理的事項に関する項目	26
2. 製剤の組成	4	1. 規制区分	26
3. 添付溶解液の組成及び容量	4	2. 有効期間	26
4. 力価	4	3. 包装状態での貯法	26
5. 混入する可能性のある夾雑物	4	4. 取扱い上の注意	26
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	5. 患者向け資材	26
7. 調製法及び溶解後の安定性	6	6. 同一成分・同効薬	26
8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	6	7. 国際誕生年月日	26
9. 溶出性	6	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	26
10. 容器・包装	8	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	26
11. 別途提供される資材類	8	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	26
12. その他	8	11. 再審査期間	26
		12. 投薬期間制限に関する情報	26
V. 治療に関する項目	9	13. 各種コード	26
1. 効能又は効果	9	14. 保険給付上の注意	27
2. 効能又は効果に関連する注意	9		
3. 用法及び用量	9	XI. 文献	28
4. 用法及び用量に関連する注意	9	1. 引用文献	28
5. 臨床成績	9	2. その他の参考文献	29
VI. 薬効薬理に関する項目	13	XII. 参考資料	29
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	13	1. 主な外国での発売状況	29
2. 薬理作用	13	2. 海外における臨床支援情報	29
VII. 薬物動態に関する項目	14	XIII. 備考	30
1. 血中濃度の推移	14	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	30
2. 薬物速度論的パラメータ	17	2. その他の関連資料	31
3. 母集団（ポピュレーション）解析	18		
4. 吸収	18		
5. 分布	18		
6. 代謝	18		
7. 排泄	19		
8. トランスポーターに関する情報	19		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

アビラテロン酢酸エステルは前立腺癌治療薬（CYP17 阻害薬）であり、本邦では 2014 年から製造販売されている。

東和薬品株式会社が後発医薬品として、アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「トローワ」の開発を企画し、薬食発第 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2023 年 8 月に承認を取得した。

2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、アビラテロン酢酸エステルを有効成分とする前立腺癌治療剤（CYP17 阻害剤）であり「去勢抵抗性前立腺癌、内分泌療法未治療のハイリスクの予後因子を有する前立腺癌」の効能又は効果を有する。（「V. 1. 効能又は効果」の項参照）
- (2) 重大な副作用として心障害、劇症肝炎、肝不全、肝機能障害、低カリウム血症、血小板減少、横紋筋融解症が報告されている。（「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

- ・錠剤両面に製品名と含量を印刷
（「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照）
- ・「8 錠シート」の認識しやすさを考慮した PTP デザイン
- ・PTP シートに 1 スリットごとに服用時の注意点〔空腹時に服用〕を表示
- ・PTP シートに 1 錠ごとに GS1 コードを表示（裏面）。専用アプリ「添文ナビ」で読み取ること
で、最新の電子添文等を参照可能

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
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMP の概要

該当しない

Ⅱ．名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和 名

アビラテロン酢酸エステル錠 250mg 「トローワ」

(2) 洋 名

ABIRATERONE ACETATE TABLETS 250mg “TOWA”

(3) 名称の由来

一般名＋剤形＋規格（含量）＋「屋号」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」（平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号）に基づく〕

2. 一般名

(1) 和 名（命名法）

アビラテロン酢酸エステル（JAN）

(2) 洋 名（命名法）

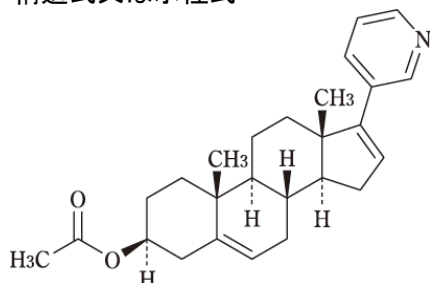
Abiraterone Acetate（JAN）

abiraterone（INN）

(3) ステム

抗アンドロゲン剤：-terone

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₆H₃₃NO₂

分子量：391.55

5. 化学名（命名法）又は本質

17-(Pyridin-3-yl)androst-5,16-dien-3 β -yl acetate（IUPAC）

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の粉末である。

(2) 溶解性

メタノール又はエタノール（99.5）にやや溶けやすく、アセトニトリルにやや溶けにくく、水に極めて溶けにくい。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法、定量法

確認試験法

赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

定量法

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観及び性状

性状	ピンク色の楕円形のフィルムコーティング錠		
本体表示	アビラテロン 250 トーワ		
外形	表 	裏 	側面 
錠径 (mm)	16.2/9.6 (長径/短径)		
厚さ (mm)	6.5		
質量 (mg)	約 750		

(3) 識別コード

該当しない

(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）の含量および添加剤

1 錠中の有効成分	アビラテロン酢酸エステル…250mg
添加剤	乳糖水和物、結晶セルロース、クロスカルメロースナトリウム、ポビドン、ラウリル硫酸ナトリウム、軽質無水ケイ酸、タルク、ステアリン酸マグネシウム、マクロゴール 4000、酸化チタン、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、その他 1 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

(1) 加速試験²⁸⁾

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	ピンク色の楕円形の フィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	73.5～90.1*	80.0～87.6
含量(%)	99.4～100.8	98.0～99.4

*：12 錠中 10 錠以上の個々の溶出率が規定する値であり、適合した。(3 ロット(n=1))

最終包装製品を用いた加速試験の結果、アピラテロン酢酸エステル錠 250mg「トーワ」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。

(2) 無包装状態における安定性²⁹⁾

《試験条件》

温度：40℃、遮光、気密容器

湿度：25℃、75%RH、遮光、シャーレ（ラップで覆う）

光：25℃、60%RH、4000lx、シャーレ（ラップで覆う）

試験項目	開始時	温度	光
		3 箇月	120 万 lx・hr
外観	ピンク色の楕円形の フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし
含量	規格内	変化なし	変化なし
規格:95.0～105.0%	100.0%	99.1%	99.9%
硬度	規格内	変化なし	変化なし
規格（参考値）： 20N 以上	339N	414N	333N
溶出性	規格内	変化なし	変化なし
純度試験	規格内	変化なし	変化なし

試験項目	開始時	湿度
		3 箇月
外観	ピンク色の楕円形の フィルムコーティング錠	変化なし
含量	規格内	変化なし
規格:95.0～105.0%	98.8%	98.5%
硬度	規格内	変化あり (規格内)
規格（参考値）： 20N 以上	326N	176N
溶出性	規格内	変化なし
純度試験	規格内	変化なし

注)「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)、平成 11 年 8 月 20 日」を参考に評価した。

【評価基準】

分類	外観	含量	硬度	崩壊性 溶出性 純度試験
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	含量低下が 3%未満の場合	硬度変化が 30%未満の場合	規格値内の場合
変化あり (規格内)	わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合	含量低下が 3%以上で、規格値内の場合	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kgf (20N) 以上の場合	
変化あり (規格外)	形状変化や著しい色調変化等を認め、規格を逸脱している場合	規格値外の場合	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kgf (20N) 未満の場合	

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）

服薬補助ゼリーとの配合変化³⁰⁾

■方法

(1)配合方法

アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「トーワ」(1錠)と服薬補助ゼリー(大さじ 1(約 15mL))を配合した。

(2)保存条件

条件：25℃、60%RH、1000lx

保存形態：無色ガラス製容器（密栓）

■結果

服薬補助ゼリー (メーカー名)	測定項目	配合前 (試験製剤)	配合直後	3 時間後
らくらく服薬 ゼリー (龍角散)	外観	ピンク色の楕円形のフィルム コーティング錠	微黄白色のゼリーに錠剤が 包まれていた	微黄白色のゼリーに膨潤した 錠剤が包まれていた
	におい		レモン様のにおい	同左
	含量 (%)	99.5	97.3	99.1

9. 溶出性

(1) 規格及び試験方法

アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「トーワ」は、設定された溶出規格に適合していることが確認されている。

方 法：日局溶出試験法（パドル法）

試験液：溶出試験第 1 液 900mL

回転数：75rpm

測定法：液体クロマトグラフィー

規 格：60 分間の溶出率が 75%以上のときは適合とする。

(2) 溶出挙動における同等性³¹⁾

アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「トーワ」について、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」（令和2年3月19日 薬生薬審発 0319 第1号）（以下、ガイドライン）に従い、溶出試験を行った。

<測定条件>

試験液： pH1.2、pH3.0、pH6.8、水

回転数： 75rpm、100rpm

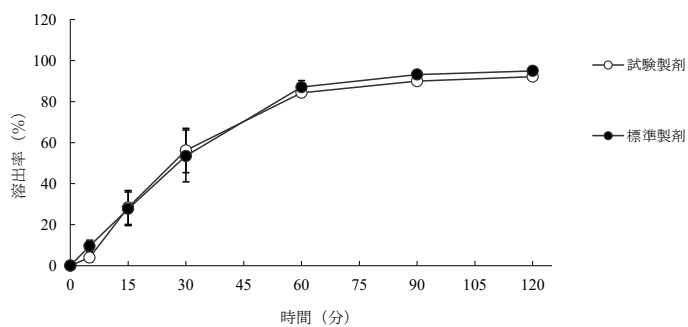
試験製剤：アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「トーワ」

検体数： n=12

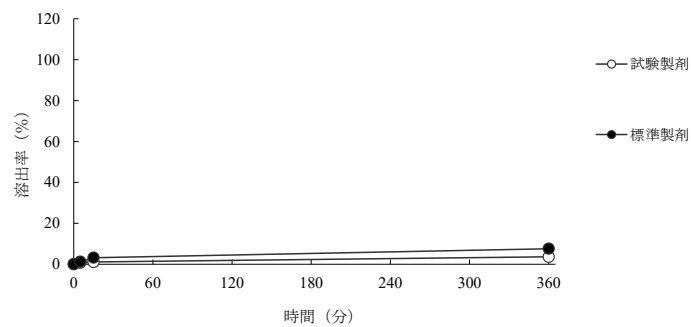
試験法：パドル法

標準製剤：ザイティガ錠 250mg

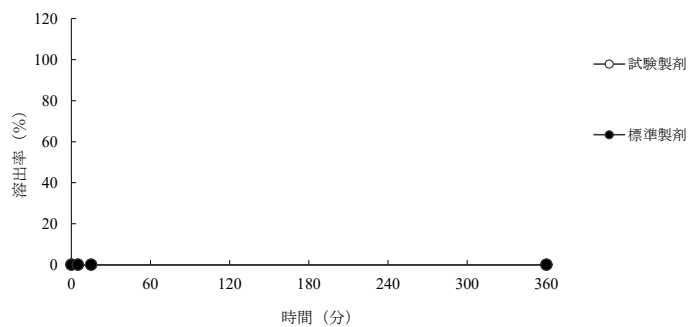
pH1.2, 75rpm, パドル法



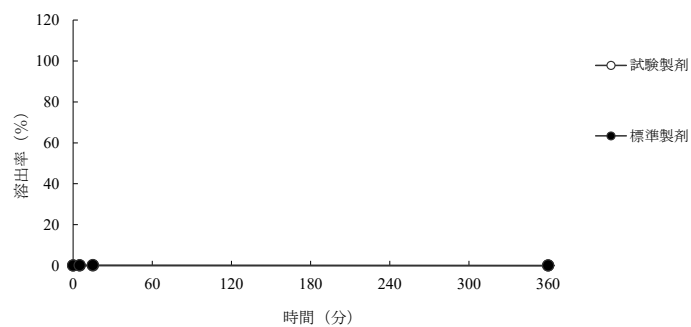
pH3.0, 75rpm, パドル法



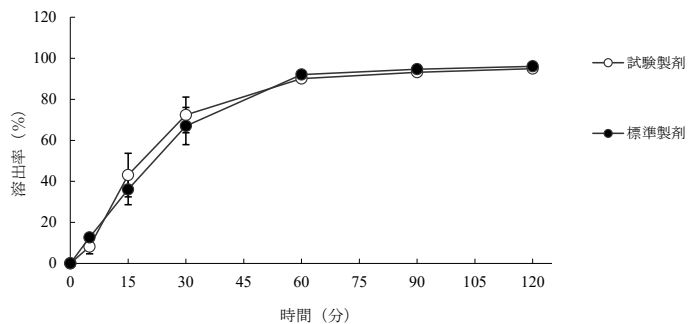
pH6.8, 75rpm, パドル法



水, 75rpm, パドル法



pH1.2, 100rpm, パドル法



平均溶出率(%)±S.D.

類似性の判定基準及び判定結果

試験条件		判定時間 (分)	平均溶出率(%)		溶出率 の差(%)	類似性の判定基準	判定
			試験 製剤	標準 製剤			
パドル法 75rpm	pH1.2	15	28.4	27.7	0.7	標準製剤の平均溶 出率の±15%以内	適
		60	84.3	87.1	−2.8		
	pH3.0	360	3.6	7.6	−4.0	標準製剤の平均溶 出率の±9%以内	適
	pH6.8	360	0.0	0.0	0.0		適
	水	360	0.0	0.0	0.0		適
パドル法 100rpm	pH1.2	15	43.1	36.1	7.0	標準製剤の平均溶 出率の±15%以内	適
		60	90.1	92.1	−2.0		

上記の結果より、すべての試験条件でガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合し、アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「トーワ」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。従って、ヒトにおける生物学的同等性試験を行い、アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「トーワ」は標準製剤との生物学的同等性が確認された。

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
56 錠 [8 錠×7 : PTP]

(3) 予備容量
該当しない

(4) 容器の材質
PTP：ポリ塩化ビニル、アルミニウム

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

4. 効能又は効果

○去勢抵抗性前立腺癌

○内分泌療法未治療のハイリスクの予後因子を有する前立腺癌

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能又は効果に関連する注意

ハイリスクの予後因子を有する患者の定義等について、「17.臨床成績」の項の内容を熟知し、本剤の有効性及び安全性を十分に理解した上で適応患者の選択を行うこと。[17.1.1-17.1.5 参照]

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

プレドニゾロンとの併用において、通常、成人にはアビラテロン酢酸エステルとして1日1回1,000mgを空腹時に経口投与する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意

7.1 本剤は食事の影響により C_{max} 及び AUC が上昇するため、食事の1時間前から食後2時間までの間の服用は避けること。[16.2.1 参照]

7.2 プレドニゾロンの投与に際しては、「17.臨床成績」の項の内容を熟知し、投与すること。[17.1.1-17.1.5 参照]

7.3 本剤投与中に肝機能検査値の上昇が認められた場合は、以下の基準を参考に、休薬、減量又は中止すること。[8.2、11.1.2 参照]

検査項目	用法・用量変更の目安
ALT、AST 値>施設正常値上限の5倍 又は ビリルビン値>施設正常値上限の3倍	検査値が投与前値若しくはALT、AST 値が施設正常値上限の2.5倍以下かつビリルビン値が施設正常値上限の1.5倍以下に回復するまで休薬する。回復後は750mgに減量して投与を再開する。 肝機能検査値異常が再発した場合、検査値が投与前値若しくはALT、AST 値が施設正常値上限の2.5倍以下かつビリルビン値が施設正常値上限の1.5倍以下に回復するまで休薬する。回復後は500mgに減量して投与を再開する。検査値が再度悪化した場合は投与を中止する。
ALT、AST 値>施設正常値上限の20倍 又は ビリルビン値>施設正常値上限の10倍	投与を中止する。

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

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

〈去勢抵抗性前立腺癌〉

17.1.1 海外第Ⅲ相臨床試験 (COU-AA-302 試験)

無症候性又は軽度の症状^{注1)}を伴う化学療法歴のない転移性去勢抵抗性前立腺癌患者^{注2)}を対象に、プレドニゾン^{注3)}5mg の1日2回経口投与との併用下で、プラセボを対照として、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を1日1回食事の1時間以上前又は食事の2時間以上後に連日経口投与した (有効性解析対象例は 1,088 例)。主要評価項目は、画像判定 (中央判定) による無増悪生存期間 (radiographic progression free survival、rPFS) 及び全生存期間 (OS) と設定された。rPFS の中央値は、アビラテロン酢酸エステル群では推定不能、プラセボ群では 8.3 カ月であり、アビラテロン酢酸エステル群のプラセボ群に対する優越性が示された (ハザード比 0.425、95%信頼区間 : 0.347-0.522、p 値<0.0001、層別ログランク検定)。また、OS に関する中間解析 (目標イベント数である 773 イベントの 43% のイベントが発生した時点) の結果、中央値は、アビラテロン酢酸エステル群では推定不能、プラセボ群では 27.2 カ月であった (ハザード比 0.752、95%信頼区間 : 0.606-0.934、p 値=0.0097、層別ログランク検定)。¹⁸⁾

注 1) Brief Pain Inventory-Short Form (BPI-SF) の項目 3 のスコアが 0~1 (無症候性) 又は 2~3 (軽度の症状)

注 2) 肝臓等の実質臓器への転移を有する患者は除外された。

注 3) 国内未承認

安全性評価対象例 542 例中 402 例 (74.2%) に副作用が認められた。主なものは、疲労 124 例 (22.9%)、ほてり 92 例 (17.0%)、低カリウム血症 78 例 (14.4%)、高血圧 69 例 (12.7%)、末梢性浮腫 66 例 (12.2%) であった。[5.、7.2 参照]

17.1.2 海外第Ⅲ相臨床試験 (COU-AA-301 試験)

2 レジメン以内で、かつ少なくとも一つはドセタキセル水和物による化学療法歴を有する転移性去勢抵抗性前立腺癌患者を対象に、プレドニゾン^{注3)}5mg の1日2回経口投与との併用下で、プラセボを対照として、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を1日1回食事の1時間以上前又は食事の2時間以上後に連日経口投与した (有効性解析対象例は 1,195 例)。主要評価項目である OS の中間解析 (目標イベント数である 797 イベントの 69% のイベントが発生した時点) の結果、中央値は、アビラテロン酢酸エステル群で 14.8 カ月、プラセボ群で 10.9 カ月であり、アビラテロン酢酸エステル群のプラセボ群に対する優越性が示された (ハザード比 0.646、95%信頼区間 : 0.543-0.768、p 値<0.0001、層別ログランク検定)。¹⁹⁾

注) 国内未承認

安全性評価対象例 791 例中 589 例 (74.5%) に副作用が認められた。主なものは、疲労 204 例 (25.8%)、悪心 129 例 (16.3%)、低カリウム血症 110 例 (13.9%)、ほてり 110 例 (13.9%)、末梢性浮腫 94 例 (11.9%) であった。[5.、7.2 参照]

〈内分泌療法未治療のハイリスクの予後因子を有する前立腺癌〉

17.1.5 国際共同第Ⅲ相試験 (PCR3011 試験)

内分泌療法未治療^{注1)}のハイリスクの予後因子を有する^{注2)}前立腺癌患者を対象に、アビラテロン酢酸エステル及びプレドニゾン^{注3)}の併用投与 (アビラテロン酢酸エステル群) とプラセボ^{注4)} (プラセボ群) を比較する二重盲検ランダム化試験を実施した (有効性解析対象例 1,199 例、日本人 70 例を含む)。アビラテロン酢酸エステル群では、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を1日1回食事の1時間以上前又は食事の2時間以上後に連日経口投与し、プレドニゾン 5mg を1日1回連日経口投与^{注5)}した。主要評価項目は、OS 及び rPFS と設定された。OS の中間解析 (目標イベント数である 852 イベントの 48% のイベントが発生した時点) の結果、中央値は、アビラテロン酢酸エステル群では推定不能、プラセボ群では 34.73 カ月であり、アビラ

テロン酢酸エステル群のプラセボ群に対する優越性が示された（ハザード比 0.621、95%信頼区間：0.509-0.756、p 値<0.0001、層別ログランク検定）。また、rPFS の解析の結果、中央値は、アビラテロン酢酸エステル群では 33.02 カ月、プラセボ群では 14.78 カ月であり、アビラテロン酢酸エステル群のプラセボ群に対する優越性が示された（ハザード比 0.466、95%信頼区間：0.394-0.550、p 値<0.0001、層別ログランク検定）。

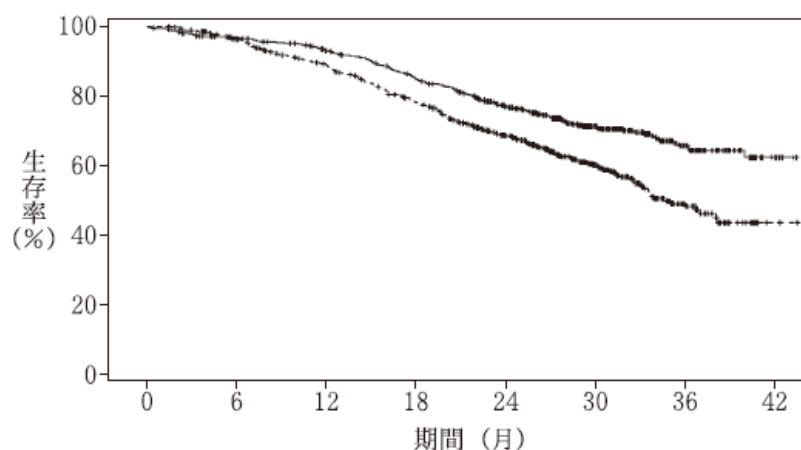
注 1) 治験薬投与開始前 3 カ月以内のアンドロゲン除去療法の施行は許容された。

注 2) 3 つの予後因子（(1) Gleason スコアが 8 以上、(2) 骨スキャンで 3 カ所以上の骨病変あり、(3) 内臓転移あり（リンパ節転移を除く））のうち、2 つ以上を有する。

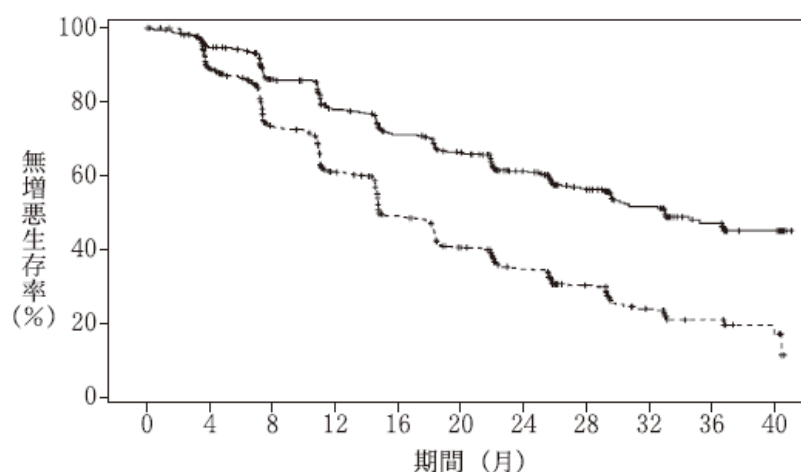
注 3) 国内未承認

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

注 5) 鉍質コルチコイド過剰による有害事象が発現した際には、5mg/日ずつ増量可能とされた。



OS の Kaplan-Meier 曲線 [PCR3011 試験 有効性解析対象例]



rPFS の Kaplan-Meier 曲線 [PCR3011 試験 有効性解析対象例]

安全性評価対象例 597 例（日本人 35 例を含む）中 336 例（56.3%）に副作用が認められた。主なものは、高血圧 110 例（18.4%）、低カリウム血症 83 例（13.9%）、ALT 増加 70 例（11.7%）、AST 増加 60 例（10.1%）、ほてり 41 例（6.9%）、末梢性浮腫 25 例（4.2%）であった。[5、7.2 参照]

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

〈去勢抵抗性前立腺癌〉

17.1.3 国内第Ⅱ相臨床試験（JPN-201 試験）

化学療法歴のない転移性去勢抵抗性前立腺癌患者を対象に、プレドニゾロン 5mg の 1 日 2 回経口投与との併用下で、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を 1 日 1 回、食事の 1 時間以上前又は食事の 2 時間以上後に連日経口投与した。治療開始 12 週時点までの PSA 奏効率（PSA 値がベースラインから 50%以上低下し、その時点から 4 週間以降の測定においても PSA 値の 50%以上低下が確認された患者の割合）（12 週時の PSA 奏効率）は 60.4%（29/48 例、90%信頼区間：47.5%-72.3%）であった。²⁰⁾

安全性評価対象例 48 例中 37 例（77.1%）に副作用が認められた。主なものは、糖尿病 11 例（22.9%）、ALT 増加 9 例（18.8%）、AST 増加 9 例（18.8%）、低カリウム血症 8 例（16.7%）、高脂血症 6 例（12.5%）、高血圧 5 例（10.4%）であった。[5.、7.2 参照]

17.1.4 国内第Ⅱ相臨床試験（JPN-202 試験）

ドセタキセル水和物による化学療法歴を有する転移性去勢抵抗性前立腺癌患者を対象に、プレドニゾロン 5mg の 1 日 2 回経口投与との併用下で、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を 1 日 1 回、食事の 1 時間以上前又は食事の 2 時間以上後に連日経口投与した。12 週時の PSA 奏効率は 28.3%（13/46 例、90%信頼区間：17.6%-41.1%）であり、90%信頼区間の下限値は閾値奏効率（20%）を下回った。²¹⁾

安全性評価対象例 47 例中 28 例（59.6%）に副作用が認められた。主なものは、糖尿病 6 例（12.8%）、低カリウム血症 5 例（10.6%）、高脂血症 5 例（10.6%）、AST 増加 5 例（10.6%）、高血圧 4 例（8.5%）であった。[5.、7.2 参照]

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

該当薬剤なし

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

アビラテロン酢酸エステルは生体内で速やかにアビラテロンへ加水分解され、アンドロゲン合成酵素である 17α -hydroxylase/C_{17,20}-lyase (CYP17) 活性を阻害する。

In vitro において、アビラテロンはヒト副腎皮質由来腫瘍細胞株 (NCI-H295R) におけるテストステロンの合成を阻害した。マウス及びラットにおいてアビラテロン酢酸エステル (反復腹腔内又は経口投与) は血漿中テストステロン濃度を低下させた。^{22)~26)}

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 抗腫瘍効果

ヒト去勢抵抗性前立腺癌患者由来の腫瘍組織片 (LuCaP23CR 及び LuCaP35CR) を移植した去勢マウスにおいて、アビラテロン酢酸エステルの反復腹腔内投与は腫瘍内のテストステロン及びジヒドロテストステロン含量を低下させ、腫瘍の増殖を抑制し、無増悪生存期間を延長した。²⁷⁾

(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

健康成人にアビラテロン酢酸エステル 250mg、500mg 及び 1,000mg^{注)}を絶食下で単回経口投与したとき、アビラテロンの血漿中濃度は投与後 1.5～2.0 時間（中央値）に最高濃度に達し、14.2～16.6 時間（平均値）の消失半減期で消失した。血漿中アビラテロンの C_{max} 及び AUC_{∞} は、用量比を若干下回る増加を示した。¹⁾

健康成人にアビラテロン酢酸エステル 250mg～1,000mg を単回経口投与したときの
血漿中アビラテロンの薬物動態パラメータ [平均値（標準偏差）]

薬物動態 パラメータ	250mg	500mg	1,000mg
n	30	30	30
C_{max} (ng/mL)	53.2 (48.6)	90.5 (75.0)	172.1 (150.4)
AUC_{∞} (ng・h/mL)	294 (290)	494 (434)	822 (616)
t_{max} (h)	2.0 [1.0-4.0]	2.0 [1.0-4.0]	1.5 [1.0-4.0]
$t_{1/2}$ (h)	14.2 (5.1)	15.1 (6.1)	16.6 (6.9)

t_{max} : 中央値 [範囲]

注) 承認用法・用量はプレドニゾロンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

16.1.2 反復投与

前立腺癌患者に、アビラテロン酢酸エステル 250mg、500mg 及び 1,000mg^{注)}を食事の 1 時間以上前又は食事の 2 時間以上後に反復経口投与したとき、血漿中アビラテロン濃度は用量によらず、投与後 7 日目までに定常状態に達した。反復経口投与による累積率は用量によらず 1.3～1.7 であった。また、プレドニゾロン併用投与時の血漿中アビラテロンの C_{max} 及び AUC_{24} は、用量によらず、アビラテロン酢酸エステル単剤投与時と大きく異ならなかった。²⁾

前立腺癌患者にアビラテロン酢酸エステル 250mg～1,000mg を反復経口投与したときの血漿中アビラテロンの薬物動態パラメータ [平均値 (標準偏差)]

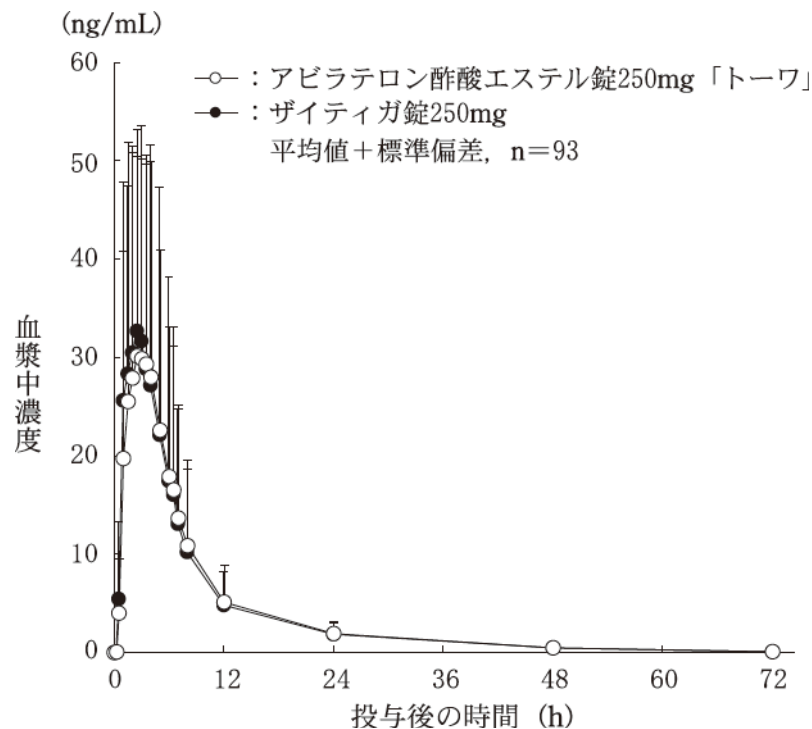
投与量 (mg)		250	500	1,000	1,000
投与時期		食事の 1 時間以上前又は 食事の 2 時間以上後		食事の 1 時間 以上前	食事の 2 時間 以上後
n		9	6	6	6
C_{max} (ng/mL)	1 日目 (アビラテロン 酢酸エステル 単独)	121.3 (37.9)	385.7 (181.5)	185.7 (104.4)	788.8 (343.2)
	7 日目 (アビラテロン 酢酸エステル 単独)	183.6 (69.8)	625.5 (253.2)	205.4 (97.2)	949.5 (338.1)
	15 日目 (プレドニゾロン 併用)	168.8 (83.0)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

t_{max} : 中央値 [範囲]

注) 承認用法・用量はプレドニゾロンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

16.1.3 生物学的同等性試験

アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「トーフ」とザイティガ錠 250mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠^{注)} (アビラテロン酢酸エステルとして 250mg) 健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中アビラテロン濃度を測定し、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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。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 ₇₂ (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	t_{max} (h)	$t_{1/2}$ (h)
アビラテロン酢酸エステル錠 250mg「トーフ」	273 ± 170	44.4 ± 28.4	2.42 ± 1.22	12.02 ± 3.85
ザイティガ錠 250mg	275 ± 176	48.0 ± 28.8	2.15 ± 1.20	12.06 ± 3.78

(平均値 ± 標準偏差, n=93)

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。

注) 承認用法・用量はプレドニゾンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び 90%信頼区間

パラメータ	AUC ₇₂	C_{max}
平均値の差	$\log(0.9736)$	$\log(0.9098)$
平均値の差の 90%信頼区間	$\log(0.9096) \sim \log(1.0420)$	$\log(0.8405) \sim \log(0.9849)$

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

16.2.1 食事の影響

健康成人にアビラテロン酢酸エステル 1,000mg¹²⁾を食後（低脂肪食又は高脂肪食）に単回経口投与したとき、絶食時投与と比較して、血漿中アビラテロンの C_{max} 及び AUC_{∞} は、それぞれ 7 倍及び 5 倍（低脂肪食）、17 倍及び 10 倍（高脂肪食）増加した（外国人データ）。⁴⁾ [7.1 参照]

日本人及び外国人健康成人にアビラテロン酢酸エステル 1,000mg を、食事 1 時間前（投与法 B：投与 4 時間後に食事摂取）及び食事の 2 時間後（投与法 C：投与 2 時間後に食事摂取、投与法 D：投与 4 時間後に食事摂取）に単回経口投与したとき、空腹時投与（投与法 A）と比較して、血漿中アビラテロンの C_{max} 及び AUC_{∞} は、それぞれ 2 及び 1.6 倍、12 及び 7.5 倍、10 及び 7 倍増加した。⁵⁾ [7.1 参照]

注) 承認用法・用量はプレドニゾンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

16.7 薬物相互作用

16.7.1 デキストロメトルフアン

転移性去勢抵抗性前立腺癌（mCRPC）患者にアビラテロン酢酸エステル 1,000mg（プレドニゾン併用）と CYP2D6 の基質であるデキストロメトルフアンを併用投与したとき、デキストロメトルフアン単剤投与時と比較して、デキストロメトルフアンの AUC_{last} は 200%増加した。また、デキストロメトルフアンの活性代謝物であるデキストルフアンの AUC は 33%増加した（外国人データ）。¹²⁾ [10.2 参照]

16.7.2 リファンピシン

健康成人に CYP3A4 の誘導作用を有するリファンピシンを 6 日間反復投与後、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を単回経口投与したとき、アビラテロンの AUC_{∞} は 55%減少した（外国人データ）。¹³⁾ [10.2 参照]

16.7.3 その他の薬剤

(1) テオフィリン

mCRPC 患者にアビラテロン酢酸エステル 1,000mg（プレドニゾン併用）と CYP1A2 の基質であるテオフィリンを併用投与したとき、テオフィリンの C_{max} 及び AUC_{last} はテオフィリン単剤投与時と同様であった（外国人データ）。¹²⁾

(2) ケトコナゾール

健康成人に CYP3A4 の阻害作用を有するケトコナゾールをアビラテロン酢酸エステル 1,000mg と併用投与したとき、アビラテロンの C_{max} 及び AUC_{last} はアビラテロン酢酸エステル単剤投与時と同様であった（外国人データ）。¹⁴⁾

(3) ピオグリタゾン

健康成人に CYP2C8 の基質であるピオグリタゾンをアビラテロン酢酸エステル 1,000mg と併用投与したとき、ピオグリタゾンの AUC は 46%増加し、その活性代謝物である M-III、M-IV の AUC はそれぞれ 10%減少した（外国人データ）。¹⁵⁾ [10.2 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³⁾

kel : $0.0634 \pm 0.0207 \text{ hr}^{-1}$ （健康成人男子、絶食単回経口投与）

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

16.3 分布

アビラテロンの血漿蛋白結合率は 99.8%であった (*in vitro*、平衡透析法)。みかけの分布容積は 4,150L であった。^{6),7)}

(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

「Ⅶ. 2. (5) 分布容積」の項参照

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

健康成人に ¹⁴C-アビラテロン酢酸エステルを単回経口投与^{注)}したとき、アビラテロン酢酸エステルは速やかにアビラテロンに加水分解された。アビラテロンは主として肝臓で代謝され、血漿中総放射能の 92%はアビラテロンの代謝物であった。血漿中の主要な代謝物は、アビラテロン硫酸抱合体及び N-オキシドアビラテロン硫酸抱合体であり、それぞれ血漿中総放射能の 43%を占めた（外国人データ）。⁸⁾

注) 承認用法・用量はプレドニゾロンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照

(3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

(4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

「Ⅵ. 2. (1) 作用部位・作用機序」の項参照

7. 排泄

16.5 排泄

健康成人に ^{14}C -アビラテロン酢酸エステルを単回経口投与^{注)}したとき、投与後 264 時間までに投与した放射能の 88%が糞中に、5%が尿中に排泄された。糞中には、主にアビラテロン酢酸エステル及びアビラテロンとして排泄され、それぞれ投与量の 55%及び 22%を占めた（外国人データ）。⁸⁾

注) 承認用法・用量はプレドニゾロンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

8. トランスポーターに関する情報

16.7.4 *In vitro*

アビラテロン酢酸エステルは P-gp を阻害し、アビラテロン及びその主要代謝物は肝取り込みトランスポーターである OATP1B1 を阻害した。^{16),17)} [10.参照]

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

16.6.1 肝機能障害患者

軽度（Child-Pugh スコア A）及び中等度（Child-Pugh スコア B）の肝機能障害患者に、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を単回経口投与したとき、血漿中アビラテロンの AUC は、肝機能正常被験者と比較してそれぞれ 11%及び 260%増加した（外国人データ）。⁹⁾ [9.3.2 参照]

肝機能正常被験者並びに軽度及び中等度肝機能障害患者にアビラテロン酢酸エステル 1,000mg を単回経口投与したときの血漿中アビラテロンの薬物動態パラメータ
[平均値（標準偏差）]

薬物動態 パラメータ	肝機能正常 被験者	軽度 肝機能障害患者	中等度 肝機能障害患者
n	8	8	8
t _{max} (h)	1.75 [1.0-3.0]	2.0 [0.5-3.0]	1.5 [1.0-2.0]
C _{max} (ng/mL)	85.7 (46.6)	71.9 (40.2)	297 (258)
AUC _{last} (ng・h/mL)	321 (166)	355 (191)	1,530 (1,350)

t_{max}：中央値 [範囲]

重度（Child-Pugh スコア C）の肝機能障害患者に、アビラテロン酢酸エステル懸濁液 125mg（錠剤 62.5mg に相当）^{注)}を単回経口投与したとき、肝機能正常被験者 [懸濁液 2,000mg（錠剤 1,000mg に相当）]^{注)}と比較して、用量で規格化した血漿中アビラテロンの AUC_∞は 597%増加した（外国人データ）。¹⁰⁾ [2.2、9.3.1 参照]

注) 承認用法・用量はプレドニゾロンとの併用において、本剤 1,000mg を空腹時に 1 日 1 回経口投与

16.6.2 腎機能障害患者

血液透析を受けている末期腎疾患を有する被験者に、アビラテロン酢酸エステル 1,000mg を単回経口投与したとき、血漿中アビラテロンの $C_{\max}$ 及び AUC_{last} は腎機能正常被験者と比較して増加しなかった（外国人データ）。¹¹⁾

11. その他

該当資料なし

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由
設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
2.2 重度の肝機能障害患者（Child-Pugh スコア C）[9.3.1、16.6.1 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

「V. 2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

- 8.1 血圧の上昇、低カリウム血症、体液貯留があらわれることがあるので、下記の点に留意すること。[9.1.1、9.1.2、10.2、11.1.3 参照]
8.1.1 本剤投与開始前に血清カリウム値等の血清電解質濃度を測定し、低カリウム血症が認められた場合には、血清カリウム値を補正した後に、本剤の投与を開始すること。定期的に血清カリウム値等の血清電解質濃度の測定を行うこと。
8.1.2 本剤投与中は定期的に血圧測定、血液検査、体重の測定等を行い、患者の状態を十分に観察すること。必要に応じて降圧剤の投与、カリウムの補給を行うなど、適切な処置を行うこと。
8.2 劇症肝炎があらわれることがあり、また、肝機能障害があらわれ、肝不全に至ることがあるので、本剤投与中は定期的（特に投与初期は頻回）に肝機能検査を行い、患者の状態を十分に観察すること。[7.3、11.1.2 参照]
8.3 本剤は内分泌療法剤であり、がんに対する薬物療法について十分な知識・経験を持つ医師のもとで、本剤による治療が適切と判断される患者についてのみ使用すること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 心血管疾患のある患者又はその既往歴のある患者

本剤の 17α -hydroxylase/C_{17,20}-lyase (CYP17) 阻害作用に伴う鉱質コルチコイド濃度の上昇により、高血圧、低カリウム血症及び体液貯留があらわれる可能性がある。[8.1 参照]

9.1.2 低カリウム血症の患者又は合併症等により低カリウム血症を起こすおそれのある患者

低カリウム血症が発現、又は増悪するおそれがある。[8.1、10.2 参照]

(2) 腎機能障害患者

設定されていない

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重度の肝機能障害患者（Child-Pugh スコア C）

投与しないこと。[2.2、16.6.1 参照]

9.3.2 中等度の肝機能障害患者（Child-Pugh スコア B）

血漿中濃度が上昇するおそれがある。[16.6.1 参照]

- (4) 生殖能を有する者
設定されていない
- (5) 妊婦
設定されていない
- (6) 授乳婦
設定されていない
- (7) 小児等
設定されていない
- (8) 高齢者

9.8 高齢者

患者の状態を観察しながら投与すること。一般に高齢者では生理機能が低下していることが多い。

7. 相互作用

10. 相互作用

アビラテロンは CYP3A4 の基質である。また、*in vitro* 試験において、アビラテロン酢酸エステルは P-gp を阻害し、アビラテロンは CYP2C8、CYP2D6 及び OATP1B1 を阻害することが示されている。[16.7.4 参照]

- (1) 併用禁忌とその理由
設定されていない

- (2) 併用注意とその理由

10.2 併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
CYP2D6 基質 デキストロメトर्फアン プロパフェノン フレカイニド ハロペリドール等 [16.7.1 参照]	CYP2D6 により代謝される薬剤と併用する場合は、これらの薬剤の血中濃度が上昇する可能性がある。	本剤の CYP2D6 阻害作用により、これらの薬剤の代謝が阻害される。
CYP3A4 誘導剤 リファンピシン フェニトイン カルバマゼピン リファブチン フェノバルビタール等 [16.7.2 参照]	本剤の血漿中濃度が低下し、本剤の有効性が減弱する可能性がある。CYP3A4 誘導作用のない又は弱い薬剤への代替を考慮すること。	これらの薬剤の CYP3A4 誘導作用により、本剤の代謝が促進される。
低カリウム血症を起こすおそれのある薬剤 [8.1、9.1.2 参照]	低カリウム血症が発現、又は増悪するおそれがある。	本剤及びこれらの薬剤は、低カリウム血症をおこすおそれがある。
ピオグリタゾン レパグリニド [16.7.3 参照]	ピオグリタゾン又はレパグリニドと併用する場合は、これらの薬剤の血中濃度が上昇し、低血糖が発現するおそれがあるため、患者の状態を十分に観察すること。	本剤の CYP2C8 阻害作用により、これらの薬剤の代謝が阻害される。

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 心障害

心不全（0.5%）等の重篤な心障害があらわれることがある。

11.1.2 劇症肝炎、肝不全、肝機能障害

劇症肝炎（頻度不明）があらわれることがある。また、AST 増加（7.1%）、ALT 増加（7.4%）、ビリルビン上昇（1.4%）等を伴う肝機能障害があらわれ、肝不全に至ることがある。[7.3、8.2 参照]

11.1.3 低カリウム血症（14.0%）

痙攣、筋力低下等の症状を伴う低カリウム血症があらわれることがあり、QT 延長、Torsade de Pointes を含む不整脈に至った例が報告されている。異常が認められた場合にはカリウムの補給や本剤の休薬等、適切な処置を行うこと。[8.1 参照]

11.1.4 血小板減少（0.8%）

11.1.5 横紋筋融解症（頻度不明）

筋力低下、筋肉痛、CK 上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇に注意し、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	5%以上	5%未満 1%以上	1%未満	頻度不明
感染症		尿路感染		
血液			リンパ球減少症、白血球減少	発熱性好中球減少症
内分泌			副腎不全	
代謝・栄養		糖尿病、高脂血症	高アミラーゼ血症、脱水、低アルブミン血症	
電解質			高カリウム血症、高マグネシウム血症	
精神神経系		浮動性めまい、頭痛、味覚異常		
眼			眼精疲労、羞明	
循環器	高血圧		心房細動、頻脈、狭心症、不整脈、徐脈、右脚ブロック、心室性頻脈	
呼吸器			胸膜炎	アレルギー性胞隔炎
消化器	悪心、便秘、下痢	嘔吐、消化不良	胃潰瘍、膵炎	
肝臓		ALP 増加	LDH 増加	
皮膚				皮疹
筋骨格			骨折、骨粗鬆症	
腎臓・泌尿器		血尿		
生殖器			精巣上体炎	
全身	疲労、末梢性浮腫		浮腫、顔面浮腫、倦怠感	

その他	ほてり	体重増加	血中尿酸減少、高比重リ ポ蛋白増加、膵管内乳頭 粘液性腫瘍	
-----	-----	------	-------------------------------------	--

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

過量投与により、低カリウム血症及びそれに伴う無力症、悪心、嘔吐等の症状が発現することがある。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

15.1.1 スピロノラクトン併用時に、PSA の上昇が認められた症例が報告されている。スピロノラクトンは、アンドロゲン受容体と結合し PSA を上昇させる可能性がある。

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「VI. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製剤：劇薬、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：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

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：

アビラテロン錠「トーワ」を服用される患者さんご家族の方へ

アビラテロン酢酸エステル錠「トーワ」を服用される患者さんご家族へ

(「XⅢ. 2. その他の関連資料」の項参照)

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ザイティガ錠 250mg/500mg

7. 国際誕生年月日

2011 年 4 月 28 日 (米国)

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
2023 年 8 月 15 日	30500AMX00232000	2026 年 6 月 12 日	

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬（あるいは投与）期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

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
4291033F1091	4291033F1091	130170001	623017001

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

電子添文の主要文献

- 1) 健康成人におけるアビラテロンの薬物動態の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 2) 患者におけるアビラテロンの薬物動態の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.2.3）
- 3) 社内資料：生物学的同等性試験
- 4) アビラテロンの薬物動態に対する食事の影響の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.3）
- 5) アビラテロンの薬物動態に対する食事のタイミングの影響の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.1.2）
- 6) アビラテロンの血漿蛋白結合の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.3）
- 7) アビラテロンの母集団薬物動態解析による検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.3）
- 8) アビラテロンのマスバランスの検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.3、2.7.6.1）
- 9) 軽度及び中等度肝機能障害患者におけるアビラテロンの薬物動態の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 10) 重度肝機能障害患者におけるアビラテロンの薬物動態の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.15）
- 11) 腎機能障害患者におけるアビラテロンの薬物動態の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.14）
- 12) テオフィリン又はデキストロメトルファンとアビラテロンの相互作用の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.16）
- 13) リファンピシンとアビラテロンの相互作用の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 14) ケトコナゾールとアビラテロンの相互作用の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 15) ピオグリタゾンとアビラテロンの相互作用の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、審査報告書）
- 16) アビラテロンの排出トランスポーターを介した相互作用の検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.6.4.7）
- 17) アビラテロンの OATP1B1 阻害に関する検討（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、審査報告書）
- 18) Ryan CJ, et al. : N Engl J Med. 2013 ; 368 : 138-148
- 19) de Bono JS, et al. : N Engl J Med. 2011 ; 364 : 1995-2005
- 20) 化学療法未治療患者を対象とした国内第Ⅱ相臨床試験成績（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.3.2）
- 21) ドセタキセルを含む化学療法既治療患者を対象とした国内第Ⅱ相臨床試験成績（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.7.3.2）
- 22) Potter GA, et al. : J Med Chem. 1995 ; 38 : 2463-2471
- 23) Haidar S, et al. : J Steroid Biochem Mol Biol. 2003 ; 84 : 555-562
- 24) 細胞内ステロイド合成阻害作用（ザイティガ錠：2014年7月4日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
- 25) Barrie SE, et al. : J Steroid Biochem Mol Biol. 1994 ; 50 : 267-273
- 26) Duc I, et al. : J Steroid Biochem Mol Biol. 2003 ; 84 : 537-542
- 27) Mostaghel EA, et al. : Clin Cancer Res. 2011 ; 17 : 5913-5925

その他の引用文献

28) 社内資料：加速試験

29) 社内資料：無包装状態における安定性試験

30) 社内資料：配合変化試験（服薬補助ゼリーとの配合変化）

31) 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験

32) 社内資料：粉碎後の安定性試験

33) 社内資料：崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性試験

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

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

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。

掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関する Q&A について(その3)」
(令和元年9月6日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡)

(1) 粉碎³²⁾

■ 保存条件

粉碎した検体を以下の条件で保存した。

・ 散光

条件：25℃、60%RH、1000lx

(累積照度は1箇月時点で40万lx・hr以上、3箇月時点で120万lx・hr以上)

保存形態：シャーレ（ラップで覆う）

(累積照度に到達後は、遮光状態で保存した。)

・ 防湿

条件：25℃、1000lx

(累積照度は1箇月時点で40万lx・hr以上、3箇月時点で120万lx・hr以上)

保存形態：無色ガラス製容器（密栓）

(累積照度に到達後は、遮光状態で保存した。)

■ 結果

保存条件	試験項目	粉碎直後	1箇月後	3箇月後
散光	外観	白色の粉状*	同左	白色の粉状* 一部だまになっており、触っても崩れなかった。ほとんどの粉がシャーレ底面に固着していた。
	含量(%)	97.9	97.1	96.4
防湿	外観	白色の粉状*	同左	同左
	含量(%)	97.9	97.1	97.6

*：ピンク色のフィルムコーティング片が混在

(備考)

NIOSH（米国国立安全衛生研究所）から NIOSH 基準の1つ以上をみたす HD* のリストが公表されており、アビラテロンが含まれています。錠剤を粉碎する場合は曝露の危険性が増加するといわれています。ご留意頂きますようお願いいたします。

※HD（Hazardous Drugs）：曝露によって健康障害をもたらすか、または疑われる薬品

(参考資料)

NIOSH List of Hazardous Drugs in Healthcare Settings, 2024

<https://www.cdc.gov/niosh/docs/2025-103/pdfs/2025-103.pdf>

がん薬物療法における職業性曝露対策ガイドライン 2019 年版 編集：日本がん看護学会，日本臨床腫瘍学会，日本臨床腫瘍薬学会，金原出版

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性³³⁾

■ 方法

- ① シリンジのプランジャーを抜き取り、シリンジ内に製剤 1 個を入れてプランジャーを戻し、お湯（55℃）を 20mL 吸い取る。
- ② 5 分間放置後、シリンジを手で 180 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察する。崩壊不良の場合は再度 5 分間放置し、同様の操作を行う。
- ③ 崩壊しない場合は、製剤に亀裂を入れたものについて①～②の作業を行う。
- ④ チューブに取り付け、流速約 2～3mL/秒で懸濁液を全て押し込んだ後、さらに水 20mL をシリンジで注入し洗いこみ後の残存物の有無を確認する。

■ 試験器具・機器

チューブ：トップ栄養カテーテル（長さ：120cm）

シリンジ：ネオフィードシリンジ 30mL サイズ

■ 結果

試験項目	水（55℃）		
	製剤そのまま	亀裂を入れたもの	追加検討 ^{*2}
崩壊性	完全崩壊しなかった	完全崩壊しなかった	完全崩壊しなかった
通過性	8Fr チューブ：通過抵抗を感じた（全量を押し出せた）		
残存	シリンジ及びチューブに顕著に認められた（残存量が多く、製剤投与量に影響を与える可能性があった） ^{*1}		シリンジ及びチューブにわずかに認められた（目視で残存物が確認できるが微量であった） ^{*3}
懸濁液 pH	—	—	pH 6.25

*1：追加洗いこみ（20mL）2 回目終了後、チューブに残存がわずかに認められ、シリンジの残存は洗いこみ前と変わらなかった

*2：乳棒で 15 回たたいて製剤を粗粉碎したもので試験を行った

*3：追加洗いこみ（20mL）2 回目終了後、残存はほとんどなかった

2. その他の関連資料

東和薬品株式会社 医療関係者向けサイト

<https://med.towayakuhin.co.jp/medical/>

製造販売元

東和薬品株式会社

大阪府門真市新橋町2番11号