

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領 2018（2019年更新版）に準拠して作成

高血圧症・狭心症治療剤（持続性Ca拮抗薬）

日本薬局方 **アムロジピンベシル酸塩錠**

アムロジピン錠 2.5mg[CH]

アムロジピン錠 5mg[CH]

アムロジピン錠 10mg[CH]

Amlodipine Tablets

劇薬
処方箋医薬品^注

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) 注意－医師等の処方箋により使用すること	
規格・含量	錠 2.5mg：1錠中 日局 アムロジピンベシル酸塩 3.47mg を含有 (アムロジピンとして 2.5mg) 錠 5mg：1錠中 日局 アムロジピンベシル酸塩 6.93mg を含有 (アムロジピンとして 5mg) 錠 10mg：1錠中 日局 アムロジピンベシル酸塩 13.87mg を含有 (アムロジピンとして 10mg)	
一般名	和名：アムロジピンベシル酸塩 洋名：Amlodipine Besilate	
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	錠 2.5mg 錠 5mg	製造販売承認年月日：2008年3月14日 薬価基準収載年月日：2008年7月4日 販売開始年月日：2008年7月4日
	錠 10mg	製造販売承認年月日：2013年2月15日 薬価基準収載年月日：2013年6月21日 販売開始年月日：2013年6月21日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	販売元：日本ジェネリック株式会社 製造販売元：長生堂製薬株式会社	
医薬情報担当者の連絡先		
問い合わせ窓口	日本ジェネリック株式会社 お客様相談室 TEL 0120-893-170 FAX 0120-893-172 医療関係者向けホームページ： https://medical.nihon-generic.co.jp/medical/	

本IFは2025年12月改訂の電子添文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。

(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、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（<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て、「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・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性
及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、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を利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	8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	11
1. 開発の経緯	1	9. 溶出性	11
2. 製品の治療学的特性	1	10. 容器・包装	19
3. 製品の製剤学的特性	1	(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	19
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	(2)包装	19
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	(3)予備容量	19
(1)承認条件	1	(4)容器の材質	19
(2)流通・使用上の制限事項	2	11. 別途提供される資材類	19
6. RMPの概要	2	12. その他	19
II. 名称に関する項目	3	V. 治療に関する項目	20
1. 販売名	3	1. 効能又は効果	20
(1)和名	3	2. 効能又は効果に関連する注意	20
(2)洋名	3	3. 用法及び用量	20
(3)名称の由来	3	(1)用法及び用量の解説	20
2. 一般名	3	(2)用法及び用量の設定経緯・根拠	20
(1)和名（命名法）	3	4. 用法及び用量に関連する注意	20
(2)洋名（命名法）	3	5. 臨床成績	21
(3)ステム（stem）	3	(1)臨床データパッケージ	21
3. 構造式又は示性式	3	(2)臨床薬理試験	21
4. 分子式及び分子量	3	(3)用量反応探索試験	21
5. 化学名（命名法）又は本質	3	(4)検証的試験	21
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	1)有効性検証試験	21
III. 有効成分に関する項目	5	2)安全性試験	21
1. 物理化学的性質	5	(5)患者・病態別試験	21
(1)外観・性状	5	(6)治療的使用	21
(2)溶解性	5	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	21
(3)吸湿性	5	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	21
(4)融点（分解点）、沸点、凝固点	5	(7)その他	22
(5)酸塩基解離定数	5	VI. 薬効薬理に関する項目	23
(6)分配係数	5	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	23
(7)その他の主な示性値	5	2. 薬理作用	23
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	(1)作用部位・作用機序	23
3. 有効成分の確認試験法、定量法	5	(2)薬効を裏付ける試験成績	23
IV. 製剤に関する項目	6	(3)作用発現時間・持続時間	23
1. 剤形	6	VII. 薬物動態に関する項目	24
(1)剤形の区別	6	1. 血中濃度の推移	24
(2)製剤の外観及び性状	6	(1)治療上有効な血中濃度	24
(3)識別コード	6	(2)臨床試験で確認された血中濃度	24
(4)製剤の物性	6	(3)中毒域	26
(5)その他	6	(4)食事・併用薬の影響	26
2. 製剤の組成	7	2. 薬物速度論的パラメータ	26
(1)有効成分（活性成分）の含量及び添加剤	7	(1)解析方法	26
(2)電解質等の濃度	7	(2)吸収速度定数	26
(3)熱量	7	(3)消失速度定数	27
3. 添付溶解液の組成及び容量	7		
4. 力価	7		
5. 混入する可能性のある夾雑物	7		
6. 製剤の各種条件下における安定性	8		
7. 調製法及び溶解後の安定性	11		

(4)クリアランス	27	(1)臨床使用に基づく情報	35
(5)分布容積	27	(2)非臨床試験に基づく情報	35
(6)その他	27		
3. 母集団（ポピュレーション）解析	27	IX. 非臨床試験に関する項目	36
(1)解析方法	27	1. 薬理試験	36
(2)パラメータ変動要因	27	(1)薬効薬理試験	36
4. 吸収	27	(2)安全性薬理試験	36
5. 分布	27	(3)その他の薬理試験	36
(1)血液－脳関門通過性	27	2. 毒性試験	36
(2)血液－胎盤関門通過性	27	(1)単回投与毒性試験	36
(3)乳汁への移行性	27	(2)反復投与毒性試験	36
(4)髄液への移行性	27	(3)遺伝毒性試験	36
(5)その他の組織への移行性	28	(4)がん原性試験	36
(6)血漿蛋白結合率	28	(5)生殖発生毒性試験	36
6. 代謝	28	(6)局所刺激性試験	36
(1)代謝部位及び代謝経路	28	(7)その他の特殊毒性	36
(2)代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率	28	X. 管理的事項に関する項目	37
(3)初回通過効果の有無及びその割合	28	1. 規制区分	37
(4)代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率	28	2. 有効期間	37
7. 排泄	28	3. 包装状態での貯法	37
8. トランスポーターに関する情報	28	4. 取扱い上の注意	37
9. 透析等による除去率	28	5. 患者向け資材	37
10. 特定の背景を有する患者	29	6. 同一成分・同効薬	37
11. その他	30	7. 国際誕生年月日	37
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	31	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	37
1. 警告内容とその理由	31	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	38
2. 禁忌内容とその理由	31	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	38
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	31	11. 再審査期間	38
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	31	12. 投薬期間制限に関する情報	38
5. 重要な基本的注意とその理由	31	13. 各種コード	38
6. 特定の背景を有する患者に関する注意	31	14. 保険給付上の注意	38
(1)合併症・既往歴等のある患者	31	X I. 文献	39
(2)腎機能障害患者	31	1. 引用文献	39
(3)肝機能障害患者	32	2. その他の参考文献	40
(4)生殖能を有する者	32	X II. 参考資料	41
(5)妊婦	32	1. 主な外国での発売状況	41
(6)授乳婦	32	2. 海外における臨床支援情報	41
(7)小児等	32	X III. 備考	42
(8)高齢者	32	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	42
7. 相互作用	32	(1)粉碎	42
(1)併用禁忌とその理由	32	(2)崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性	45
(2)併用注意とその理由	33	2. その他の関連資料	45
8. 副作用	33		
(1)重大な副作用と初期症状	33		
(2)その他の副作用	34		
9. 臨床検査結果に及ぼす影響	34		
10. 過量投与	35		
11. 適用上の注意	35		
12. その他の注意	35		

略語表

略語	略語内容
AUC	血漿中濃度－時間曲線下面積 (Area under the plasma concentration-time curve)
AUC _{0-last}	最終測定可能時点までの AUC (AUC from zero to last)
AUC _{0-24hr}	投与 24 時間後までの AUC (AUC from zero to 24 hours)
AUC ₀₋₇₂	投与 72 時間後までの AUC (AUC from zero to 72 hours)
AUC _{0-∞}	無限大時間までの AUC (AUC from zero to infinity)
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (Aspartate aminotransferase)
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ (Alanine aminotransferase)
ALP	アルカリホスファターゼ (Alkaline phosphatase)
BUN	血中尿素窒素 (Blood urea nitrogen)
Cmax	最高血漿中濃度 (Maximum plasma concentration)
CK	クレアチンキナーゼ (Creatine kinase)
CYP	チトクローム P450 (Cytochrome P450)
γ-GTP	γ-グルタミルトランスぺプチターゼ (γ-Glutamyl transpeptidase)
kel	消失速度定数 (Elimination rate constant)
LDH	乳酸脱水素酵素 (Lactate dehydrogenase)
RH	相対湿度 (Relative humidity)
S.D.	標準偏差 (Standard deviation)
S.E.	標準誤差 (Standard error)
T _{1/2}	消失半減期 (Elimination half-life)
Tmax	最高血漿中濃度到達時間 (Time to maximum plasma concentration)

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

本剤は、アムロジピンベシル酸塩を有効成分とする高血圧症・狭心症治療剤（持続性 Ca 拮抗薬）である。

アムロジピン錠 2.5mg「CH」及びアムロジピン錠 5mg「CH」は、長生堂製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2008 年 3 月に承認を得て、2008 年 7 月発売に至った。

その後、2009 年 10 月に一部変更承認され、高血圧症に対し、効果不十分な場合における用法・用量が追加された。

また、2012 年 10 月に一部変更承認され、小児の高血圧症における用法・用量が追加された。

更に、医政発第 0310001 号（平成 18 年 3 月 10 日）に基づき先発医薬品が有する規格を揃えるため、2013 年 2 月にアムロジピン錠 10mg「CH」の承認を取得、2013 年 6 月に発売した。

2. 製品の治療学的特性

- (1) 本剤は、ジヒドロピリジン系の高血圧症・狭心症治療剤（持続性 Ca 拮抗薬）で、高血圧症、狭心症に対し効果が認められている。（〔V.1.効能又は効果〕の項参照）
- (2) 1 日 1 回投与で効果が得られる。（〔V.3.用法及び用量〕の項参照）
- (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、横紋筋融解症があらわれることがある。（〔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

本剤は、錠剤本体の両面に成分名、含量及び屋号を印字し、識別性を向上させている。（〔IV.1.（2）製剤の外観及び性状〕の項参照）

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

アムロジピン錠 2.5mg 「CH」

アムロジピン錠 5mg 「CH」

アムロジピン錠 10mg 「CH」

(2) 洋名

Amlodipine Tablets 2.5mg “CH”

Amlodipine Tablets 5mg “CH”

Amlodipine Tablets 10mg “CH”

(3) 名称の由来

一般的名称+剤形+含量+「CH」

〔「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)

アムロジピンベシル酸塩 (JAN)

(2) 洋名 (命名法)

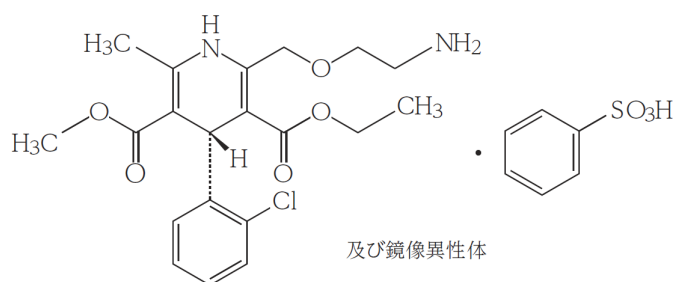
Amlodipine Besilate (JAN)

Amlodipine (INN)

(3) ステム (stem)

ニフェジピン系の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: $C_{20}H_{25}ClN_2O_5 \cdot C_6H_6O_3S$

分子量: 567.05

5. 化学名 (命名法) 又は本質

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

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～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。

溶解度 (37℃) : pH1.2 : 2.402mg/mL、pH3.0 : 2.445mg/mL、
pH4.0 : 2.952mg/mL、pH5.0 : 1.805mg/mL、
pH6.8 : 1.325mg/mL、水 : 2.501mg/mL

(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 (アミノ基、滴定法)

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

旋光性 : メタノール溶液 (1→100) は旋光性を示さない。

吸光度 $E_{1\text{cm}}^{1\%}$ (237nm) : 約 342 (0.01mol/L 塩酸・メタノール試液溶液
(1→40000))

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

有効成分の確認試験法

日局「アムロジピンベシル酸塩」の確認試験による。

- (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

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。

液体クロマトグラフィー

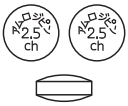
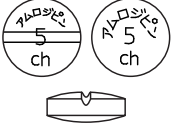
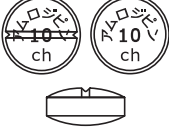
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

〔1. (2) 製剤の外観及び性状〕の項参照

(2) 製剤の外観及び性状

販売名		アムロジピン錠 2.5mg「CH」	アムロジピン錠 5mg「CH」	アムロジピン錠 10mg「CH」
色調・剤形		白色のフィルム コーティング錠	白色の片面割線入りの フィルムコーティング錠	白色の割線入りの フィルムコーティング錠
外形				
大きさ	直径	6.1mm	8.6mm	8.6mm
	厚さ	2.9mm	3.3mm	4.1mm
重量		100mg	200mg	258mg

(3) 識別コード

錠 2.5mg

錠剤本体：アムロジピン 2.5 ch

錠 5mg

錠剤本体：アムロジピン 5 ch

錠 10mg

錠剤本体：アムロジピン 10 ch

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(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

有効成分（活性成分）の含量

錠 2.5mg : 1 錠中 日局 アムロジピンベシル酸塩 3.47mg 含有
(アムロジピンとして 2.5mg)

錠 5mg : 1 錠中 日局 アムロジピンベシル酸塩 6.93mg 含有
(アムロジピンとして 5mg)

錠 10mg : 1 錠中 日局 アムロジピンベシル酸塩 13.87mg 含有
(アムロジピンとして 10mg)

添加剤

錠 2.5mg	錠 5mg	錠 10mg
結晶セルロース、リン酸水素カルシウム水和物、ヒプロメロース、ステアリン酸マグネシウム、酸化チタン、タルク		結晶セルロース、無水リン酸水素カルシウム、デンプン、グリコール酸ナトリウム、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、酸化チタン、カルナウバロウ

(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

錠 2.5mg²⁾

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、通常の流通下において 3 年間安定であることが推測された。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
PTP 包装	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	含量 均一性試験	適合	—	—	適合
	溶出試験	99.1%	98.5%	97.8%	97.7%
	定量試験	100.5%	100.5%	99.3%	99.0%
	純度試験	0.03%	0.03%	0.06%	0.21%
バラ包装	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	含量 均一性試験	適合	—	—	適合
	溶出試験	99.1%	98.2%	98.3%	97.4%
	定量試験	100.5%	100.3%	99.5%	99.6%
	純度試験	0.03%	0.03%	0.06%	0.10%

錠 5mg³⁾

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、通常の流通下において 3 年間安定であることが推測された。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
PTP 包装	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	含量 均一性試験	適合	—	—	適合
	溶出試験	98.9%	98.6%	98.5%	97.8%
	定量試験	100.6%	100.7%	99.6%	99.1%
	純度試験	0.03%	0.03%	0.06%	0.18%

錠 10mg⁴⁾

加速試験（40℃、 相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、通常の流通下において 3 年間安定であることが推測された。

保存形態	試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
PTP 包装 + アルミピロー	性状	適合	適合	適合	適合
	確認試験	適合	適合	適合	適合
	含量 均一性試験	適合	適合	適合	適合
	溶出試験	99.0%	99.9%	95.5%	97.5%
	定量試験	100.1%	98.6%	99.1%	98.6%
	純度試験	開始時から 6 ヶ月後までほとんど変化を認めず			

(2) 長期保存試験

錠 2.5mg⁵⁾

長期保存試験（室温保存、3 年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における 3 年間の安定性が確認された。

保存形態	試験項目	開始時	3 年
PTP 包装	性状	適合	適合
	確認試験	適合	適合
	含量 均一性試験	適合	適合
	溶出試験	97.7%	92.7%
	定量試験	100.7%	100.2%
バラ包装	性状	適合	適合
	確認試験	適合	適合
	含量 均一性試験	適合	適合
	溶出試験	95.0%	94.1%
	定量試験	100.5%	99.9%

錠 5mg⁶⁾

長期保存試験（室温保存、3年）の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における3年間の安定性が確認された。

保存形態	試験項目	開始時	3年
PTP 包装	性状	適合	適合
	確認試験	適合	適合
	含量 均一性試験	適合	適合
	溶出試験	93.8%	92.9%
	定量試験	98.4%	98.0%

(3) 無包装状態での安定性試験

錠 2.5mg⁷⁾

保存条件	保存期間	結果
温度（40℃、遮光・気密容器）	3ヵ月	変化なし（◎）
湿度（30℃、75%RH、遮光・開放）	3ヵ月	変化なし（◎）
光（120万 lux・hr、気密容器）	50日	変化なし（◎）

錠 5mg⁸⁾

保存条件	保存期間	結果
温度（40℃、遮光・気密容器）	3ヵ月	変化なし（◎）
湿度（30℃、75%RH、遮光・開放）	3ヵ月	変化あり※1（規格内）（○）
光（120万 lux・hr、気密容器）	50日	変化なし（◎）

※1 硬度

錠 10mg⁹⁾

保存条件	保存期間	結果
温度（40℃、遮光・気密容器）	3ヵ月	変化なし（◎）
湿度（25℃、75%RH、遮光・開放）	3ヵ月	変化あり※1（規格内）（○）
光（60万 lux・hr、気密容器）	25日	変化なし（◎）

※1 含量、硬度

試験項目：外観、含量、硬度、崩壊性、溶出性（錠 2.5mg、錠 5mg）

試験項目：外観、含量、硬度、溶出性（錠 10mg）

「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（社）日本病院薬剤師会学術第 5 小委員会）の評価分類基準（下記）に準じる。

◎：すべての測定項目において変化を認めなかった。

（外観：変化をほとんど認めない。含量：3%未満の低下。硬度：30%未満の変化。崩壊性・溶出性：規格値内。）

○：いずれかの測定項目で「規格内」の変化を認めた。

（外観：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。含量：3%以上の低下で、規格値内。硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf 以上。）

△：いずれかの測定項目で「規格外」の変化を認めた。

（外観：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。含量：規格値外。硬度：30%以上の変化で、硬度が 2.0kgf 未満。崩壊性・溶出性：規格値外。）

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）

該当資料なし

9. 溶出性

(1) 溶出規格

錠 2.5mg

日本薬局方外医薬品規格第 3 部 アムロジピンベシル酸塩 2.5mg 錠溶出規格に適合する。

試験法：日局溶出試験法（パドル法）

条 件：回転数 75rpm

試験液 水

結 果：30 分間 75%以上

錠 5mg

日本薬局方外医薬品規格第 3 部 アムロジピンベシル酸塩 5mg 錠溶出規格に適合する。

試験法：日局溶出試験法（パドル法）

条 件：回転数 75rpm

試験液 水

結 果：45 分間 70%以上

錠 10mg

試験法：日局溶出試験法（パドル法）

条 件：回転数 75rpm

試験液 水

結 果：45 分間 70%以上

(2) 生物学的同等性試験における溶出試験結果

錠 2.5mg¹⁰⁾

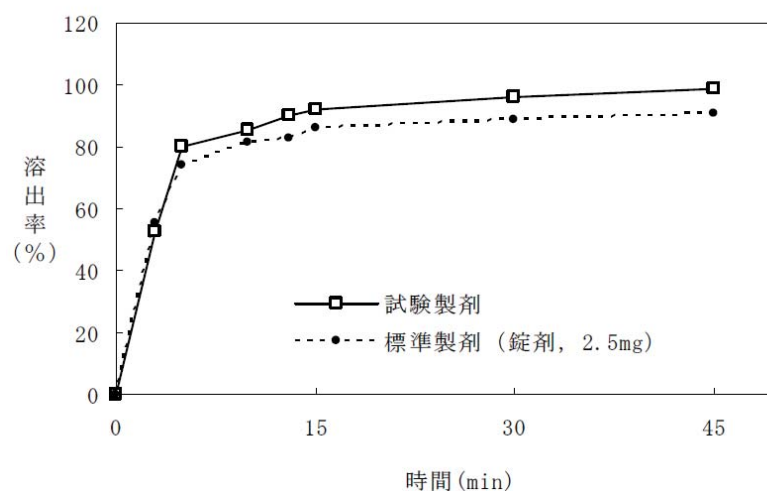
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 13 年 5 月 31 日医薬審発第 786 号）」に従い、ノルバスク錠 2.5mg を標準製剤として溶出挙動の同等性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH5.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm ⑤pH6.8/100rpm

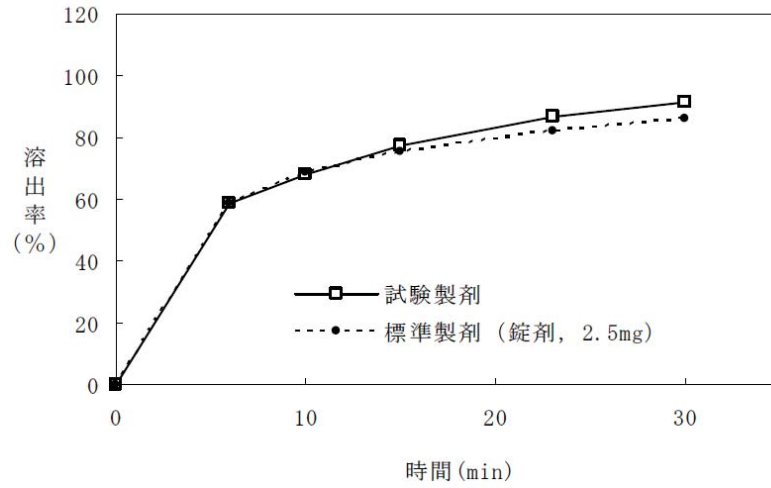
[判定基準]

- ①⑤：試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出する。又は、15 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
- ②：標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。又は f 2 関数の値は 45 以上である。
- ③④：標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。又は f 2 関数の値は 45 以上である。

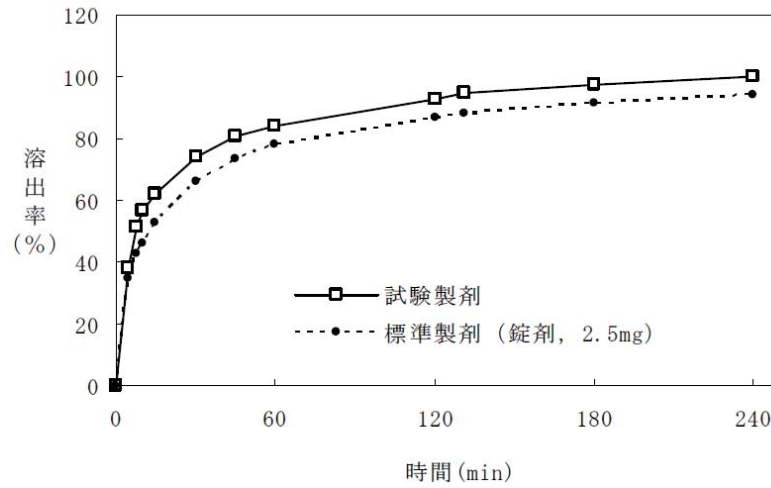
①pH1.2、50rpm



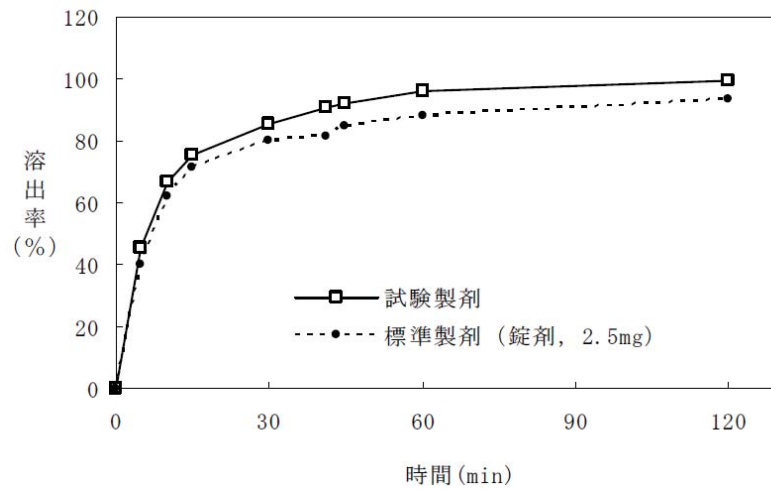
②pH5.0、50rpm



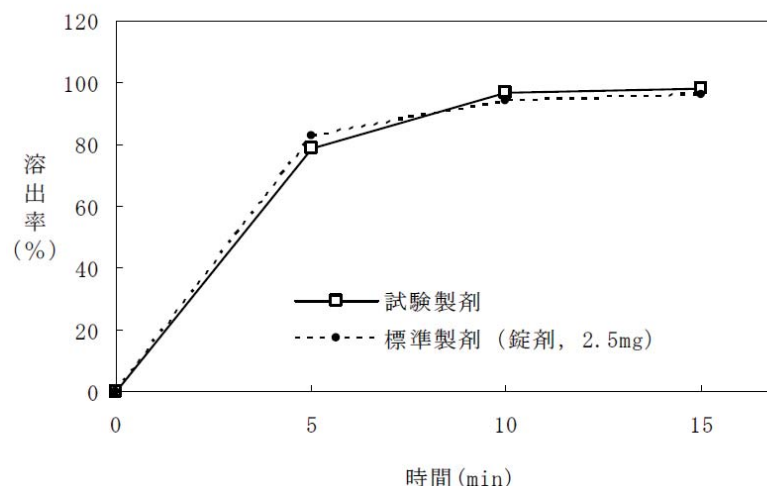
③pH6.8、50rpm



④水、50rpm



⑤pH6.8、100rpm



錠 5mg¹¹⁾

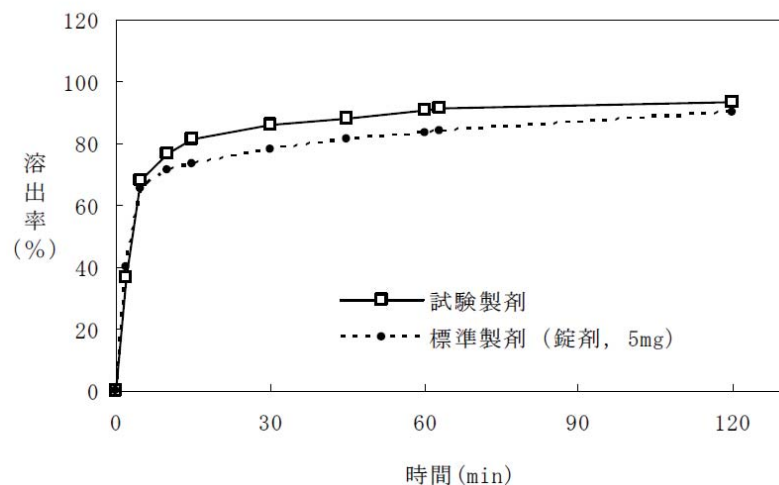
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 13 年 5 月 31 日医薬審発第 786 号）」に従い、ノルバスク錠 5mg を標準製剤として溶出挙動の同等性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は同等であった。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH5.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm ⑤pH6.8/100rpm

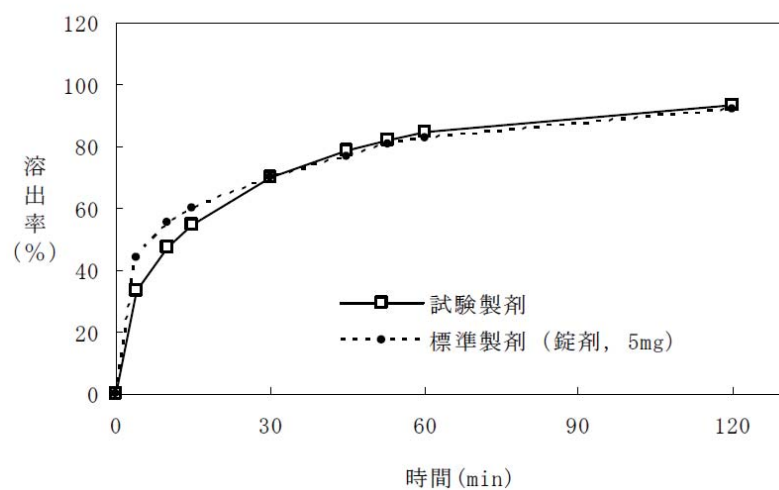
[判定基準]

- ①～④：標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。又は f 2 関数の値は 45 以上である。
- ⑤：試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出する。又は、15 分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

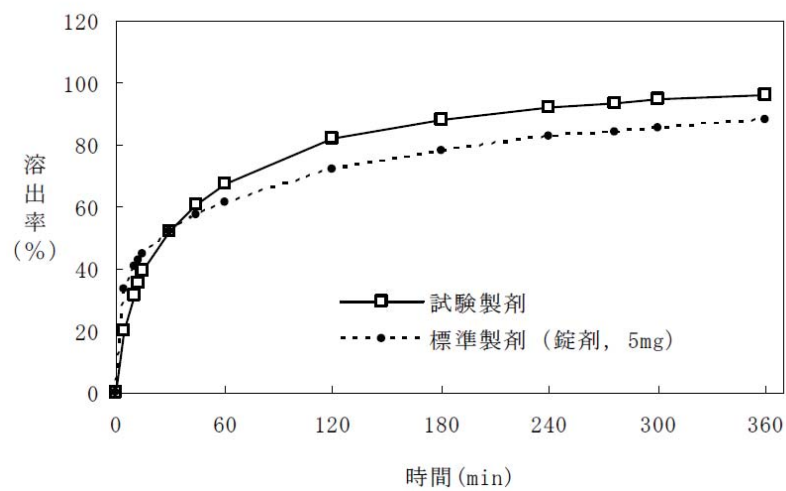
①pH1.2、50rpm



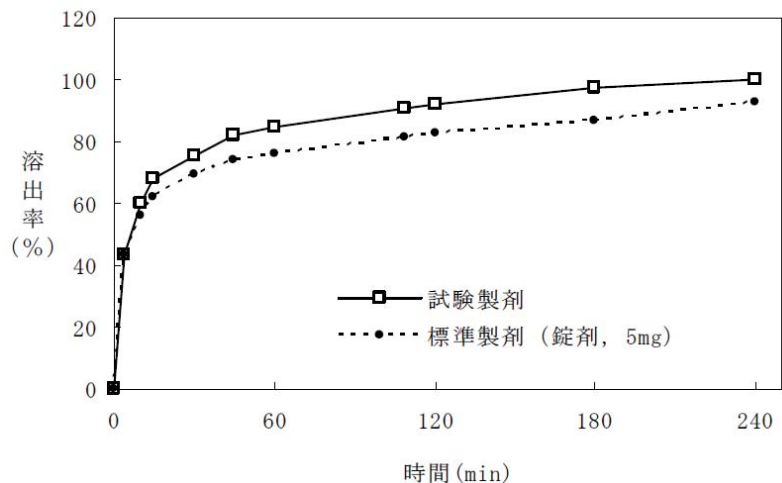
②pH5.0、50rpm



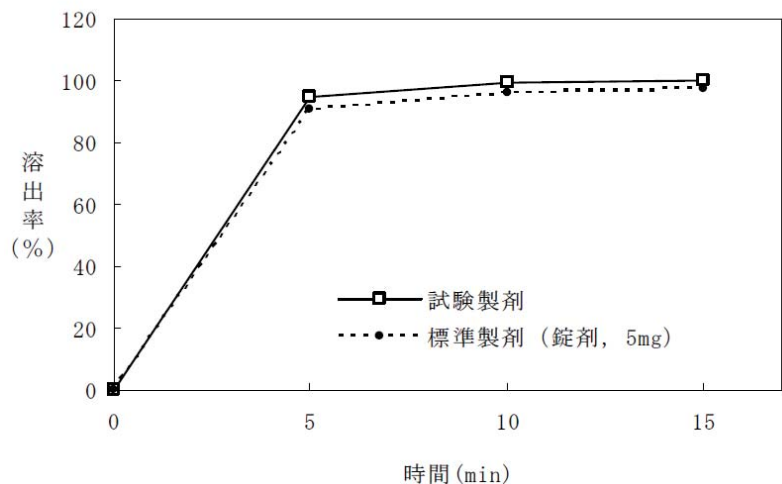
③pH6.8、50rpm



④水、50rpm



⑤pH6.8、100rpm



錠 10mg¹²⁾

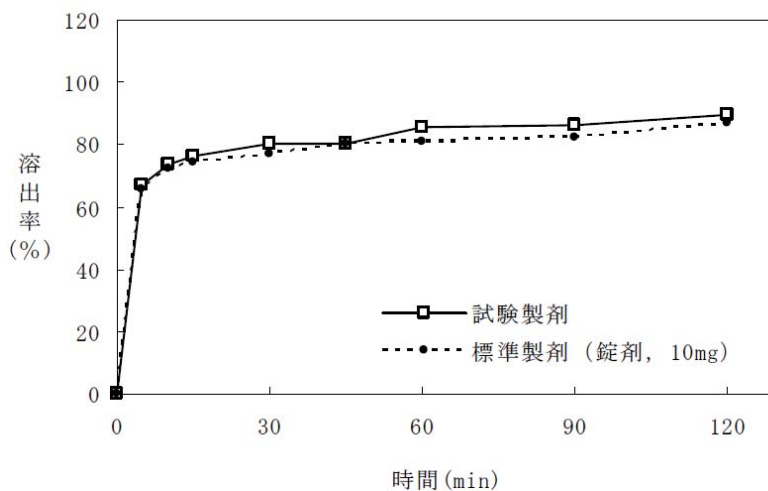
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 18 年 11 月 24 日薬食審査発第 1124004 号）」に従い、ノルバスク錠 10mg を標準製剤として溶出挙動の類似性を判定した結果、両製剤の溶出挙動は類似していると判断された。

試験法	パドル法
試験液/回転数	①pH1.2/50rpm ②pH5.0/50rpm ③pH6.8/50rpm ④水/50rpm ⑤pH6.8/100rpm

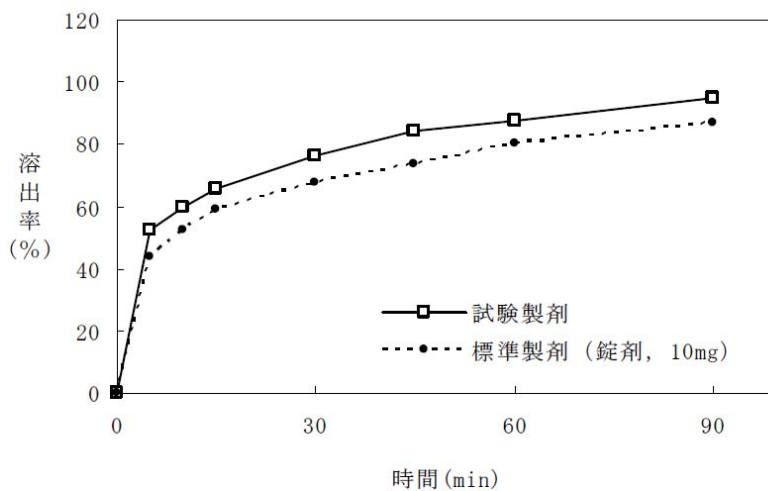
[判定基準]

- ①～④：標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあるか、又はf2関数の値は42以上である。
- ⑤：試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にある。

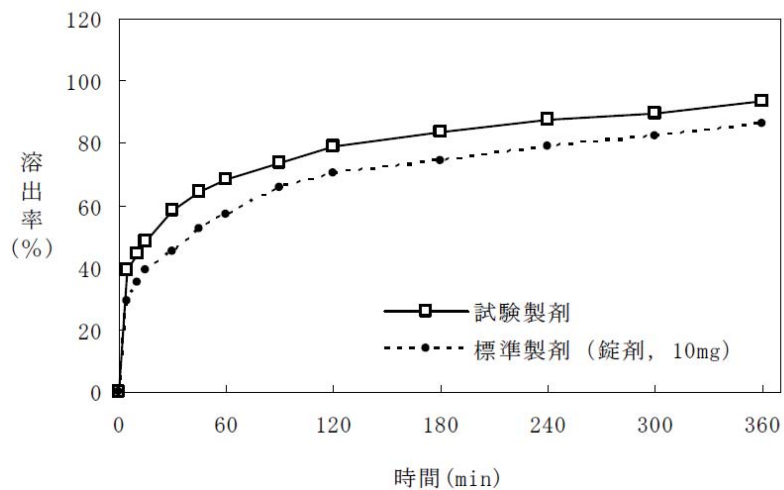
①pH1.2、50rpm



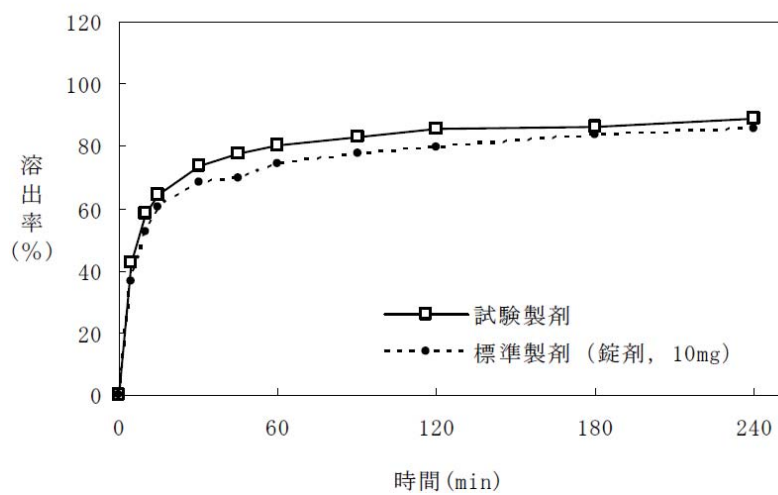
②pH5.0、50rpm



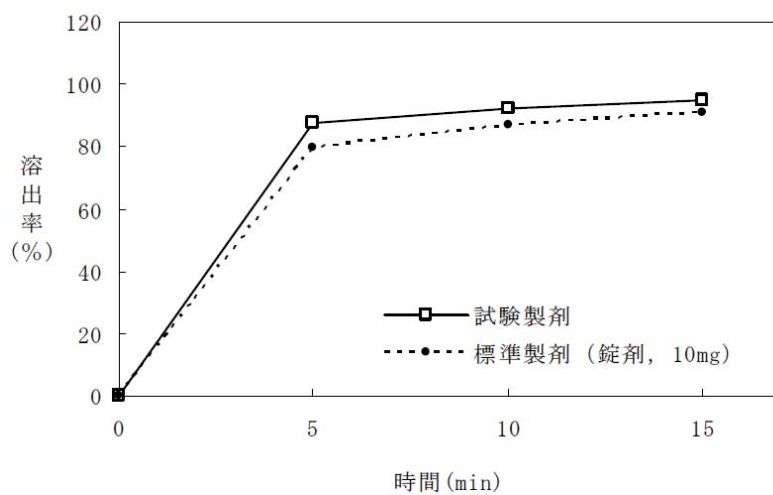
③pH6.8、50rpm



④水、50rpm



⑤pH6.8、100rpm



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

22. 包装

<アムロジピン錠 2.5mg 「CH」>

100 錠 [10 錠 (PTP) ×10]

500 錠 [10 錠 (PTP) ×50]

500 錠 [瓶、バラ]

<アムロジピン錠 5mg 「CH」>

100 錠 [10 錠 (PTP) ×10]

500 錠 [10 錠 (PTP) ×50]

<アムロジピン錠 10mg 「CH」>

100 錠 [10 錠 (PTP) ×10]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

錠 2.5mg

PTP : PTP (ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔)、紙箱

バラ : ポリエチレン製容器、ポリプロピレン製キャップ、紙箱

錠 5mg

PTP : PTP (ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔)、紙箱

錠 10mg

PTP : PTP (ポリプロピレンフィルム、アルミニウム箔)、ピロー (アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム)、紙箱

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当しない

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

- 高血圧症
- 狭心症

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能又は効果に関連する注意

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

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

<錠 2.5mg、錠 5mg>

高血圧症

通常、成人にはアムロジピンとして 2.5 ～ 5mg を 1 日 1 回経口投与する。

なお、症状に応じ適宜増減するが、効果不十分な場合には 1 日 1 回 10mg まで増量することができる。

通常、6 歳以上の小児には、アムロジピンとして 2.5mg を 1 日 1 回経口投与する。

なお、年齢、体重、症状により適宜増減する。

狭心症

通常、成人にはアムロジピンとして 5mg を 1 日 1 回経口投与する。

なお、症状に応じ適宜増減する。

<錠 10mg>

高血圧症

通常、成人にはアムロジピンとして 2.5 ～ 5mg を 1 日 1 回経口投与する。

なお、症状に応じ適宜増減するが、効果不十分な場合には 1 日 1 回 10mg まで増量することができる。

狭心症

通常、成人にはアムロジピンとして 5mg を 1 日 1 回経口投与する。

なお、症状に応じ適宜増減する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

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

<錠 2.5mg、錠 5mg>

6 歳以上の小児への投与に際しては、1 日 5mg を超えないこと。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(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

〈高血圧症〉

17.1.2 国内第Ⅲ相試験

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

臨床検査値異常を含む副作用の発現率は、5mg群では3.9% (6/154例) に、10mg群では9.9% (15/151例) に認められた。高用量 (10mg) 投与時に浮腫が高い頻度で認められ、10mg群で3.3%であった¹³⁾。[11.2 参照]

さらに、継続試験として実施した長期投与試験でアムロジピンとして10mgを1日1回通算して52週間投与した際、収縮期血圧のベースラインからの変化量の平均値は、15.6mmHgの低下を示した¹⁴⁾。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

〈効能共通〉

17.1.3 国内臨床試験

アムロジピンベシル酸塩錠を投与した高齢者 (70歳以上) における高血圧症に対する有効率は86.5% (45/52例) であった¹⁵⁾。

17.3.1 糖代謝に及ぼす影響

糖尿病合併例を含む本態性高血圧症患者43例 (39歳以下から70歳以上) にアムロジピンとして1日1回2.5～5mg (一部の症例には7.5mgまで増量) を12週間投与しても糖代謝にはほとんど影響を与えなかった¹⁶⁾。

(6) 治療的使用

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

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

(7) その他

〈高血圧症〉

17.1.1 国内臨床試験

高血圧症に対する有効率（「下降」以上）は85.5%（503/588例）であり、二重盲検比較試験によってもアムロジピンの有用性が認められた。また、腎障害を伴う高血圧症に対しては80.0%（28/35例）、重症高血圧症に対しては88.9%（8/9例）の有効率を示した^{15,17~22}。

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

ジヒドロピリジン系 Ca 拮抗薬

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

細胞膜の電位依存性カルシウムチャンネルに選択的に結合し、細胞内への Ca^{2+} の流入を減少させて冠血管や末梢血管の平滑筋を弛緩させる。そのカルシウム拮抗作用は緩徐に発現するとともに持続性を示し、また心抑制作用が弱く血管選択性を示すことが認められている^{23, 24)}。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 降圧作用

各種高血圧病態モデル（高血圧自然発症ラット、腎性高血圧イヌ）において、単回投与で血圧下降の発現が緩徐で作用持続時間が長いことが認められており、連続投与でも耐性の発現しないことが認められている²⁵⁾。

18.3 高血圧に伴う心血管障害への作用

食塩感受性 Dahl ラットにアムロジピンを 10 週間以上連続投与することにより、加齢に伴う血圧上昇及び腸間膜動脈の石灰沈着、フィブリン沈着等の血管病変が抑制された。

脳卒中易発症高血圧ラットにアムロジピン 3mg/kg/日 を連続投与することにより、血圧上昇の抑制及び延命効果が認められた。また、心筋の線維化、腎の増殖性動脈炎、糸球基底膜肥厚、尿細管萎縮等の病変の発生も明らかに抑制された^{26, 27)}。

18.4 抗狭心症作用

摘出ラット心臓において、虚血/再灌流時の心筋保護作用を調べた結果、アムロジピン投与群では対照群に比べて心収縮力の回復が促進され、組織内 Ca^{2+} 量の増加が抑制された。組織内 ATP 量及びクレアチンリン酸量の回復も促進され、心筋保護作用が示された。

ネコ血液灌流摘出心臓において、左室 dp/dt 及び左室収縮期圧は低下し、心筋酸素消費量も減少した^{28, 29)}。

(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 20 例にアムロジピンとして 10mg を単回投与した時の血漿中濃度の Tmax、Cmax、AUC_{0-last} 及び T_{1/2} は、それぞれ 8.0 時間（中央値）、5.84ng/mL（平均値）、278ng・hr/mL（平均値）及び 35.1 時間（平均値）であり、外国人と比較した結果、同様であった³⁰⁾。

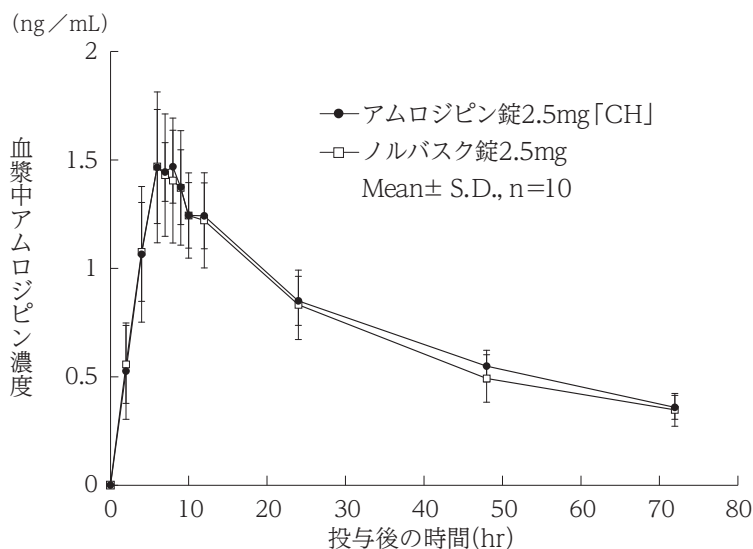
16.1.2 反復投与

健康成人 6 例（平均年齢 33.5 歳）にアムロジピンとして 2.5mg を 1 日 1 回 14 日間反復投与した場合の血清中アムロジピン濃度は、投与 6～8 日後に定常状態に達し、以後の蓄積は認められなかった。最終投与日（14 日目）の Cmax 及び AUC_{0~24hr} はそれぞれ 3.5ng/mL 及び 61.8ng・hr/mL であり、初回投与時（1.4ng/mL 及び 19.3ng・hr/mL）の約 3 倍であった。投与中止後、血清中濃度は漸減し、投与中止 5 日目には 0.24ng/mL となった³¹⁾。

生物学的同等性試験

錠 2.5mg

アムロジピン錠 2.5mg「CH」とノルバスク錠 2.5mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（アムロジピンとして 2.5mg）健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中アムロジピン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、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³²⁾。



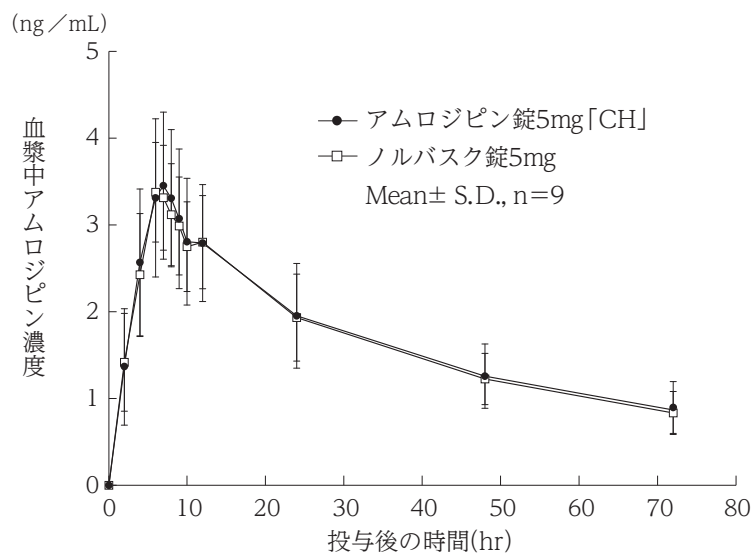
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
アムロジピン錠 2.5mg「CH」	53.0±5.8	1.6±0.3	7±1.5	38.6±9.3
ノルバスク錠 2.5mg	51.1±8.4	1.5±0.3	6.5±0.7	38.1±8.5

(Mean±S.D., n = 10)

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。

錠 5mg

アムロジピン錠 5mg「CH」とノルバスク錠 5mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (アムロジピンとして 5mg) 健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中アムロジピン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、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³³⁾。



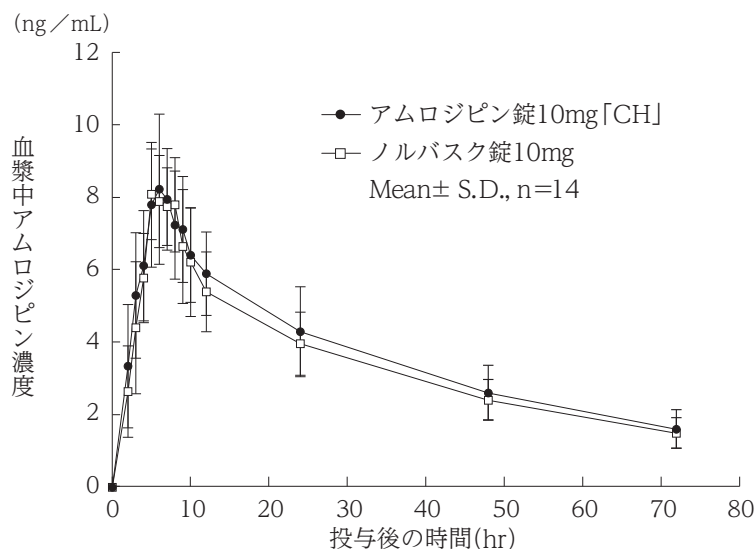
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
アムロジピン錠 5mg「CH」	122.5±33.4	3.5±0.8	6.6±1.1	42.5±4.8
ノルバスク錠 5mg	120.0±25.4	3.4±0.6	6.4±0.5	39.1±8.2

(Mean±S.D., n = 9)

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。

錠 10mg

アムロジピン錠 10mg「CH」とノルバスク錠 10mg 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 10mg）健康成人男子に空腹時単回経口投与して血漿中アムロジピン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、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³⁴⁾。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₇₂ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
アムロジピン錠 10mg「CH」	264.4±59.0	8.9±1.8	5.9±1.0	33.8±6.9
ノルバスク錠 10mg	246.1±44.6	8.8±1.1	5.9±1.1	34.1±7.6

(Mean±S.D., n = 14)

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

〔4.吸収〕、〔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

錠 2.5mg

健康成人男子空腹時単回経口投与 (1 錠、n = 10)

kel (hr⁻¹) : 0.01873±0.00359

錠 5mg

健康成人男子空腹時単回経口投与 (1 錠、n = 9)

kel (hr⁻¹) : 0.0165±0.00193

錠 10mg

健康成人男子空腹時単回経口投与 (1 錠、n = 14)

kel (hr⁻¹) : 0.0211±0.0035

(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

16.2.1 食事の影響

健康成人にアムロジピンとして 5mg をクロスオーバー法により空腹時又は食後に単回経口投与した場合の薬物動態パラメータに有意差は認められず、アムロジピンの吸収に及ぼす食事の影響は少ないものと考えられる³⁵⁾。

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

〔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

16.3.1 血漿蛋白結合率

ヒト血漿蛋白との結合率は 97.1% (*in vitro*、平衡透析法) であった³⁶⁾。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

主たる尿中代謝体はジヒドロピリジン環の酸化したピリジン環体及びその酸化的脱アミノ体であった³⁷⁾。

(2) 代謝に関する酵素 (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

該当資料なし

7. 排泄

16.5.1 尿中排泄

健康成人 6 例にアムロジピンとして 2.5mg 又は 5mg を単回経口投与した場合、尿中に未変化体として排泄される割合は小さく、いずれの投与量においても尿中未変化体排泄率は投与後 24 時間までに投与量の約 3%、144 時間までに約 8%であった。また 2.5mg を 1 日 1 回 14 日間連続投与した場合の尿中排泄率は投与開始 6 日目ではほぼ定常状態に達し、6 日目以降の 1 日当たりの未変化体の尿中排泄率は 6.3 ~ 7.4%であった^{31, 37)}。

健康成人 2 例に ¹⁴C-標識アムロジピン 15mg を単回経口投与した場合、投与 12 日目までに投与放射能の 59.3%は尿中、23.4%は糞中に排泄され、投与後 72 時間までの尿中放射能の 9%が未変化体であった。その他に 9 種の代謝物が認められた³⁷⁾ (外国人データ)。

なお、これら代謝物にはアムロジピンをしのぐ薬理作用は認められていない。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

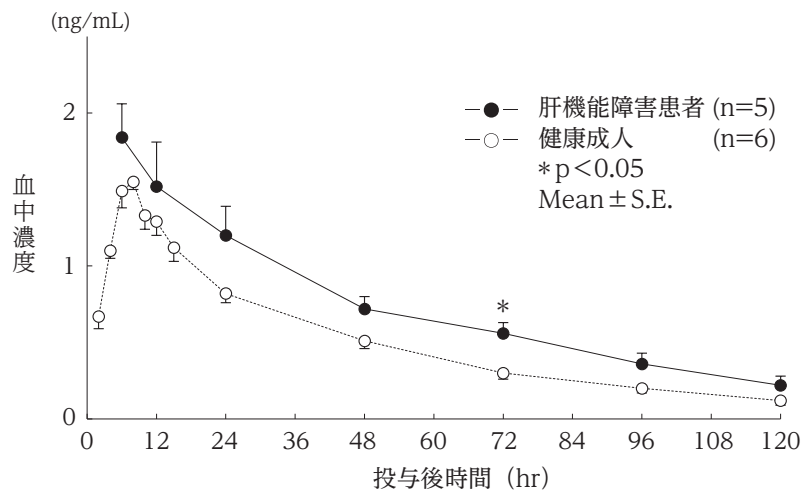
9. 透析等による除去率

[VIII.10.過量投与] の項参照

10. 特定の背景を有する患者

16.6.1 肝機能障害患者

成人肝硬変患者（Child 分類 A、B）5 例にアムロジピンとして 2.5mg を単回投与した場合の血中濃度推移並びに薬物動態パラメータは図及び表の通りである。健康成人に比し、投与 72 時間後の血中濃度が有意に上昇し、 $T_{1/2}$ 、AUC はやや高値を示したが有意差は認められなかった³⁸⁾。[9.3 参照]



	T_{max} (hr)	C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0\sim\infty}$ (ng · hr/mL)	$T_{1/2}$ (hr)
肝機能障害患者	7.2±1.2	1.9±0.2	104.0±15.5	43.0±8.0
健康成人 ³¹⁾	7.3±0.4	1.64±0.07	68.1±5.4	33.3±2.2

有意差検定：n. s.

Mean±S.E.

16.6.2 小児

高血圧症患者にアムロジピンとして 1 日 1.3 ~ 20mg を連続投与した母集団薬物動態試験の結果、クリアランス（平均値）は、6 ~ 12 歳（34 例）で 24.9L/hr、13 ~ 17 歳（28 例）で 27.9L/hr と推定され、成人における値と同様であった³⁹⁾（外国人データ）。

注）小児患者において本剤の承認された 1 日通常用量は 2.5mg である。

16.6.3 高齢者

老年高血圧症患者 6 例（男 2、女 4、平均年齢 79.7 歳）にアムロジピンとして 5mg を単回、及び 8 日間反復投与した場合の薬物動態パラメータは表の通りである。単回投与した場合、若年健康成人（男 6、平均年齢 22.3 歳）に比し、 C_{max} 、AUC は有意に高値を示したが、 $T_{1/2}$ に有意差は認められなかった。反復投与時には老年者の血清中アムロジピン濃度は若年者よりも高く推移したが、そのパターンは若年者に類似しており、老年者でその蓄積が増大する傾向は認められなかった⁴⁰⁾。[9.8 参照]

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

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

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

1. 警告内容とその理由

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

ジヒドロピリジン系化合物に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

〔V.2.効能又は効果に関連する注意〕を参照すること

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

〔V.4.用法及び用量に関連する注意〕を参照すること

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

8.1 降圧作用に基づくめまい等があらわれることがあるので、高所作業、自動車の運転等危険を伴う機械を操作する際には注意させること。

8.2 本剤は血中濃度半減期が長く投与中止後も緩徐な降圧効果が認められるので、本剤投与中止後に他の降圧剤を使用するときは、用量並びに投与間隔に留意するなど慎重に投与すること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 過度に血圧の低い患者

さらに血圧が低下するおそれがある。

9.1.2 心不全のある患者

非虚血性心筋症による重度心不全患者^{注)}を対象とした海外臨床試験において、プラセボ群と比較して本剤投与群で肺水腫の発現頻度が高かったとの報告がある⁴¹⁾。

注) 本剤の承認された効能又は効果は「高血圧症」及び「狭心症」である。

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重篤な腎機能障害のある患者

降圧に伴い腎機能が低下することがある。

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

増量時には慎重に投与すること。高用量（10mg）において副作用の発現頻度が高くなる可能性がある。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。[11.2、16.6.1 参照]

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性に投与する場合には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。動物実験で妊娠末期に投与すると妊娠期間及び分娩時間が延長することが認められている⁴²⁾。

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。ヒト母乳中へ移行することが報告されている⁴³⁾。

(7) 小児等

9.7 小児等

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

(8) 高齢者

9.8 高齢者

低用量（2.5mg/日）から投与を開始するなど慎重に投与すること。一般に過度の降圧は好ましくないとされている。体内動態試験で血中濃度が高く、血中濃度半減期が長くなる傾向が認められている⁴⁰⁾。[16.6.3 参照]

7. 相互作用

10. 相互作用

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

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 併用注意（併用に注意すること）		
薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
降圧作用を有する薬剤	降圧作用が増強されるおそれがある。	相互に作用を増強するおそれがある。
CYP3A4 阻害剤 エリスロマイシン ジルチアゼム リトナビル 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。	グレープフルーツに含まれる成分が本剤の代謝を阻害し、本剤の血中濃度が上昇する可能性が考えられる。
シンバスタチン	シンバスタチン 80mg（国内未承認の高用量）との併用により、シンバスタチンのAUCが77%上昇したとの報告がある。	機序は不明である。
タクロリムス	併用によりタクロリムスの血中濃度が上昇し、腎障害等のタクロリムスの副作用が発現するおそれがある。併用時にはタクロリムスの血中濃度をモニターし、必要に応じてタクロリムスの用量を調整すること。	本剤とタクロリムスは、主としてCYP3A4により代謝されるため、併用によりタクロリムスの代謝が阻害される可能性が考えられる。

8. 副作用

11. 副作用

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

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 劇症肝炎（頻度不明）、肝機能障害、黄疸（0.1%未満）

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

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

11.1.3 房室ブロック（0.1%未満）

徐脈、めまい等の初期症状があらわれることがある。

11.1.4 横紋筋融解症（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等があらわれた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。また、横紋筋融解症による急性腎障害の発症に注意すること。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	0.1～1%未満 ^{注2)}	0.1%未満 ^{注2)}	頻度不明
肝臓	ALT、ASTの上昇、肝機能障害、ALP、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	めまい・ふらつき、頭痛・頭重	眠気、振戦、末梢神経障害	気分動揺、不眠、錐体外路症状
消化器	心窩部痛、便秘、嘔気・嘔吐	口渇、消化不良、下痢・軟便、排便回数増加、口内炎、腹部膨満、胃腸炎	脾炎
筋・骨格系		筋緊張亢進、筋痙攣、背痛	関節痛、筋肉痛
泌尿・生殖器	BUN上昇	クレアチニン上昇、頻尿・夜間頻尿、尿管結石、尿潜血陽性、尿中蛋白陽性	勃起障害、排尿障害
代謝異常		血清コレステロール上昇、CK上昇、高血糖、糖尿病、尿中ブドウ糖陽性	
血液		赤血球、ヘモグロビン、白血球の減少、白血球増加、紫斑	血小板減少
過敏症	発疹	そう痒、じん麻疹、光線過敏症	多形紅斑、血管炎、血管浮腫
口腔		(連用により) 歯肉肥厚	
その他	全身倦怠感	しびれ、脱力感、耳鳴、鼻出血、味覚異常、疲労、咳、発熱、視力異常、呼吸困難、異常感覚、多汗、血中カリウム減少	女性化乳房、脱毛、鼻炎、体重増加、体重減少、疼痛、皮膚変色

注1) 増量して10mgを投与した場合に、高い頻度で認められた。[9.3、17.1.2参照]
注2) 発現頻度は使用成績調査を含む。

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

13. 過量投与

13.1 症状

過度の末梢血管拡張により、ショックを含む著しい血圧低下と反射性頻脈を起こすことがある。また、非心原性肺水腫が、本剤の過量投与の 24 ～ 48 時間後に発現することがある。なお、循環動態、心拍出量維持を目的とした救急措置（輸液の過負荷等）が要因となる可能性もある。

13.2 処置

特異的な解毒薬はない。本剤は蛋白結合率が高いため、透析による除去は有効ではない。また、本剤服用直後に活性炭を投与した場合、本剤の AUC は 99%減少し、服用 2 時間後では 49%減少したことから、本剤過量投与時の吸収抑制処置として活性炭投与が有効であると報告されている⁴⁴⁾。

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤調製時の注意

分割後は遮光の上、早めに使用すること。

14.2 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

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

(2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

〔VI.薬効薬理に関する項目〕の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) その他の薬理試験

該当資料なし

2. 毒性試験

(1) 単回投与毒性試験

該当資料なし

(2) 反復投与毒性試験

該当資料なし

(3) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

該当資料なし

(5) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) その他の特殊毒性

該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

(1) 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

(2) 有効成分：毒薬

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

設定されていない

5. 患者向け資材

- ・患者向医薬品ガイド：有り
- ・くすりのしおり：有り

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アムロジピン錠 2.5mg、アムロジピン錠 5mg、アムロジピン錠 10mg、アムロジピン OD 錠 2.5mg、アムロジピン OD 錠 5mg、アムロジピン OD 錠 10mg、ノルバスク錠 2.5mg、ノルバスク錠 5mg、ノルバスク錠 10mg、ノルバスク OD 錠 2.5mg、ノルバスク OD 錠 5mg、ノルバスク OD 錠 10mg

同効薬：ニフェジピン、ニトレンジピン、ベニジピン塩酸塩等

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
アムロジピン錠 2.5mg 「CH」	2008年3月14日	22000AMX01041000	2008年7月4日	2008年7月4日
アムロジピン錠 5mg 「CH」	2008年3月14日	22000AMX01042000	2008年7月4日	2008年7月4日
アムロジピン錠 10mg 「CH」	2013年2月15日	22500AMX00337000	2013年6月21日	2013年6月21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

用法・用量追加承認年月日：2009年10月19日

内容：「高血圧症」の効能・効果に対する効果不十分な場合における用法・用量の追加

用法・用量追加承認年月日：2012年10月2日

内容：小児の高血圧症における用法・用量の追加

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 コード
アムロジピン錠 2.5mg「CH」	2171022F1010	2171022F1053	118557703	620007839
アムロジピン錠 5mg「CH」	2171022F2017	2171022F2050	118576803	620007873
アムロジピン錠 10mg「CH」	2171022F5245	2171022F5245	122577801	622257701

14. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品に該当しない。

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 医療用医薬品品質情報集 (オレンジブック) No.27 (平成 19 年 1 月版、厚生労働省医薬食品局)
- 2) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 2.5mg 「CH」 の加速試験)
- 3) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 5mg 「CH」 の加速試験)
- 4) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 10mg 「CH」 の加速試験)
- 5) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 2.5mg 「CH」 の長期保存試験)
- 6) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 5mg 「CH」 の長期保存試験)
- 7) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 2.5mg 「CH」 の無包装状態での安定性試験)
- 8) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 5mg 「CH」 の無包装状態での安定性試験)
- 9) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 10mg 「CH」 の無包装状態での安定性試験)
- 10) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 2.5mg 「CH」 の溶出試験)
- 11) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 5mg 「CH」 の溶出試験)
- 12) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 10mg 「CH」 の溶出試験)
- 13) Fujiwara T, et al. : J Hum Hypertens. 2009 ; 23 (8) : 521-529
- 14) アムロジピン 5mg で効果不十分な患者に対するアムロジピン 10mg の長期投与試験 (ノルバスク錠・OD 錠、アムロジピン錠・OD 錠 : 2009 年 2 月 23 日承認、審査報告書)
- 15) アムロジピンの高血圧症に対する有効性および安全性 (カデュエット配合錠 : 2009 年 7 月 7 日承認、申請資料概要 2.7.3.4)
- 16) 中島譲ほか : 薬理と治療. 1991 ; 19 (8) : 3205-3219
- 17) 増山善明ほか : 薬理と治療. 1991 ; 19 (7) : 2853-2871
- 18) 増山善明ほか : 薬理と治療. 1991 ; 19 (7) : 2873-2893
- 19) 増山善明ほか : 薬理と治療. 1991 ; 19 (7) : 2895-2908
- 20) 増山善明ほか : 臨床評価. 1991 ; 19 (2) : 213-241
- 21) 猿田享男ほか : 薬理と治療. 1993 ; 21 (2) : 505-526
- 22) 山田和生ほか : 薬理と治療. 1991 ; 19 (8) : 3189-3203
- 23) 山中教造ほか : 日本薬理学雑誌. 1991 ; 97 (3) : 167-178
- 24) 第十八改正日本薬局方解説書. 2021 : C306-311
- 25) 山中教造ほか : 日本薬理学雑誌. 1991 ; 97 (2) : 115-126
- 26) Fleckenstein A, et al. : Am J Cardiol. 1989 ; 64 (17) : 21 I -34 I
- 27) Suzuki M, et al. : Eur J Pharmacol. 1993 ; 228 (5-6) : 269-274
- 28) Nayler WG, et al. : Am J Cardiol. 1989 ; 64 (17) : 65 I -70 I
- 29) 田村裕男ほか : 薬理と治療. 1990 ; 18 (Suppl.2) : S339-S345
- 30) 健康成人におけるアムロジピン 10mg 単回投与時の安全性と薬物動態 (ノルバスク錠・OD 錠、アムロジピン錠・OD 錠 : 2009 年 2 月 23 日承認、審査報告書)
- 31) 中島光好ほか : 臨床医薬. 1991 ; 7 (7) : 1407-1435
- 32) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 2.5mg 「CH」 の生物学的同等性試験)
- 33) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 5mg 「CH」 の生物学的同等性試験)
- 34) 長生堂製薬株式会社 社内資料 (アムロジピン錠 10mg 「CH」 の生物学的同等性試験)
- 35) 浦江隆次ほか : 薬理と治療. 1991 ; 19 (7) : 2933-2942
- 36) 分布 (ユニシア配合錠 : 2010 年 4 月 16 日承認、申請資料概要 2.6.4.4)

- 37) Beresford AP, et al. : Xenobiotica. 1988 ; 18 (2) : 245-254
38) 足立幸彦ほか : 薬理と治療. 1991 ; 19 (7) : 2923-2932
39) Flynn JT, et al. : J Clin Pharmacol. 2006 ; 46 : 905-916
40) 桑島巖ほか : Geriatric Medicine. 1991 ; 29 (6) : 899-902
41) Packer M, et al. : JACC Heart Fail. 2013 ; 1 (4) : 308-314
42) 堀本政夫ほか : 応用薬理. 1991 ; 42 (2) : 167-176
43) Naito T, et al. : J Hum Lact. 2015 ; 31 (2) : 301-306
44) Laine K, et al. : Br J Clin Pharmacol. 1997 ; 43 (1) : 29-33

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。

(1) 粉砕

1. 保存条件

錠 2.5mg、錠 5mg

温度に対する安定性試験：40±2℃/60±5%RH、30日〔遮光・気密容器〕

湿度に対する安定性試験：25±2℃/75±5%RH、30日〔遮光・開放〕

光に対する安定性試験：120万lx・hr〔シャーレ+ラップ〕※

※1000lx/hr 25±2℃/60±5%RH

錠 10mg

25℃/75%RH、4週間〔遮光・開放〕

2. 試験項目

錠 2.5mg、錠 5mg

性状、定量試験

錠 10mg

定量試験

3. 試験結果
錠 2.5mg

試験項目		性状	定量試験 (%) (残存率 (%))
製剤の規格 (参考) (粉碎前の状態)		(1)	(2)
試験開始時		白色の粉末	100.2 (100.0)
①温度	15 日	変化なし	100.7 (100.5)
	30 日	変化なし	100.5 (100.3)
②湿度	15 日	変化なし	101.4 (101.2)
	30 日	変化なし	100.5 (100.3)
③光	30 万 lx・hr	変化なし	93.7 (93.5)
	60 万 lx・hr	変化なし	89.5 (89.3)
	120 万 lx・hr	変化なし	84.5 (84.3)

(1) 白色のフィルムコーティング錠

(2) 表示量の 95.0 ~ 105.0%

錠 5mg

試験項目		性状	定量試験 (%) (残存率 (%))
製剤の規格 (参考) (粉碎前の状態)		(1)	(2)
試験開始時		白色の粉末	98.2 (100.0)
①温度	15 日	変化なし	98.0 (99.8)
	30 日	変化なし	97.3 (99.1)
②湿度	15 日	変化なし	98.8 (100.6)
	30 日	変化なし	97.8 (99.6)
③光	30 万 lx·hr	変化なし	95.1 (96.8)
	60 万 lx·hr	変化なし	92.1 (93.8)
	120 万 lx·hr	変化なし	87.7 (89.3)

(1) 白色の片面割線入りのフィルムコーティング錠

(2) 表示量の 95.0 ~ 105.0%

錠 10mg

試験項目	定量試験 (%)
製剤の規格 (参考) (粉碎前の状態)	(1)
試験開始時	100.9
2 週間後	94.1
4 週間後	93.7

(1) 表示量の 95.0 ~ 105.0%

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

1. 試験方法

崩壊懸濁試験：

ディスペンサー内に錠剤 1 個を入れ、約 55℃の温湯 20mL を吸い取り 5 分間自然放置する。5 分後にディスペンサーを 90 度で 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を確認する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、錠剤を破壊して上記と同様の操作を行う。

通過性試験：

錠 2.5mg、錠 5mg

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管投与チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、チューブ（8Fr.）の通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。

錠 10mg

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を経管栄養チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入し、チューブ（8Fr.）の通過性を確認する。注入後、水を使い洗浄する。

チューブ（8Fr.）を通過した場合は、再度懸濁液を作成し、ガストロボタンフィーディングチューブ（18Fr.）に注入してその通過性を観察する。注入後、適量の水を同じディスペンサーで吸い取り、注入してチューブ及びガストロボタン内を洗浄する。

2. 試験結果

崩壊懸濁試験結果

品目名	崩壊・懸濁状況
アムロジピン錠 2.5mg 「CH」	5 分以内に崩壊・懸濁した。
アムロジピン錠 5mg 「CH」	5 分以内に崩壊・懸濁した。
アムロジピン錠 10mg 「CH」	10 分以内に崩壊・懸濁した。

通過性試験結果

品目名	通過性
アムロジピン錠 2.5mg 「CH」	8Fr.のチューブを通過した。
アムロジピン錠 5mg 「CH」	8Fr.のチューブを通過した。
アムロジピン錠 10mg 「CH」	8Fr.のチューブ及び 18Fr.のガストロボタンフィーディングチューブを通過した。

2. その他の関連資料

該当資料なし

