※※2023年７月改訂（第16版）
※2022年12月改訂

日本標準商品分類番号
872171

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錠

アムロジピン錠2.5mg「フソー」
アムロジピン錠5mg「フソー」
アムロジピン錠10mg「フソー」

AMLODIPINE Tab.

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
貯　　法：室温保存
使用期限：外装に表示
注　　意：「取扱い上の注意」の項参照

	2.5mg	5mg	10mg
承認番号	22000AMX01038000	22000AMX01039000	22500AMX00305000
薬価収載	2008年７月		2013年６月
販売開始	2008年７月		2013年６月

※ **【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

【組成・性状】

販売名	アムロジピン錠2.5mg「フソー」			アムロジピン錠5mg「フソー」			アムロジピン錠10mg「フソー」		
成分・分量（1錠中）	日局アムロジピンベシル酸塩3.47mg（アムロジピンとして2.5mg）			日局アムロジピンベシル酸塩6.93mg（アムロジピンとして5mg）			日局アムロジピンベシル酸塩13.87mg（アムロジピンとして10mg）		
添加物	結晶セルロース、リン酸水素カルシウム水和物、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク			結晶セルロース、リン酸水素カルシウム水和物、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、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		
色・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			白色の片面割線入りのフィルムコーティング錠		
外　形	表面	裏面	側面	表面	裏面	側面	表面	裏面	側面
	S1			S 2			S 3		
規　格	直径（mm）	厚さ（mm）	質量（mg）	直径（mm）	厚さ（mm）	質量（mg）	直径（mm）	厚さ（mm）	質量（mg）
	6.1	2.9	100	8.6	3.3	200	8.6	4.1	258
識別コード	S1			S2			S3		

【効能・効果】

・高血圧症
・狭心症

【効能・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。

【用法・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2.5mg～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［アムロジピン錠2.5mg、5mg「フソー」］

・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・用量に関連する使用上の注意】
［アムロジピン錠2.5mg、5mg「フソー」］
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。

【使用上の注意】

１．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［本剤は主に肝で代謝されるため、肝機能障害患者では、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（「副作用」の項参照）。］
(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。］

２．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。

※※**３．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。

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こと。	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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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。

4．副作用

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。

(1) **重大な副作用（頻度不明）**

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不全の発症に注意すること。

(2) **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。

	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。

5．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。

6．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。[1)]]

(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。[ヒト母乳中へ移行することが報告されている。[2)]]

7．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)。

8．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。

9．適用上の注意

(1) 分割後

分割後は早めに使用すること。分割後に使用する場合には、遮光の上30日以内に使用すること。

(2) 薬剤交付時

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。)

10．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。

【薬物動態】

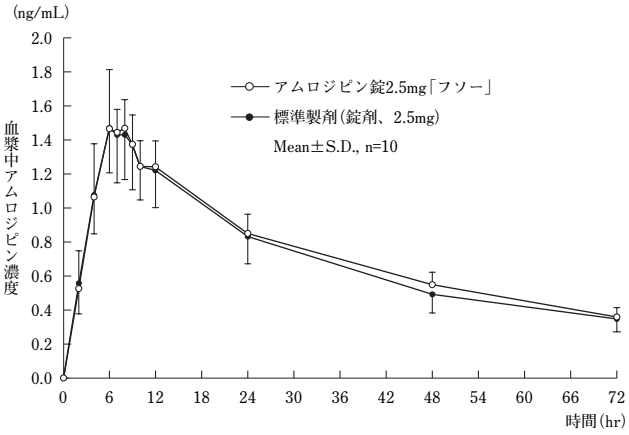
1．生物学的同等性試験[3)]

(1) アムロジピン錠2.5mg「フソー」

アムロジピン錠2.5mg「フソー」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）健康成人男子に絶食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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}72}$ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
アムロジピン錠2.5mg「フソー」	53.0±5.8	1.6±0.3	7.0±1.5	38.6±9.3
標準製剤（錠剤、2.5mg）	51.1±8.4	1.5±0.3	6.5±0.7	38.1±8.5

（Mean±S.D., n=10）



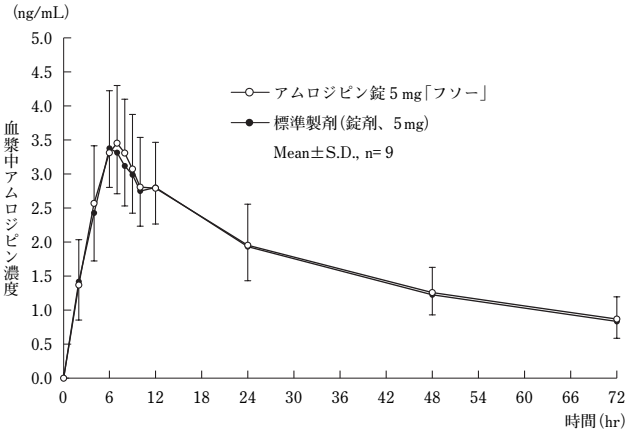
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(2) アムロジピン錠5mg「フソー」

アムロジピン錠5mg「フソー」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5mg）健康成人男子に絶食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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}72}$ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
アムロジピン錠5mg「フソー」	122.5±33.4	3.5±0.8	6.6±1.1	42.5±4.8
標準製剤（錠剤、5mg）	120.0±25.4	3.4±0.6	6.4±0.5	39.1±8.2

（Mean±S.D., n=9）



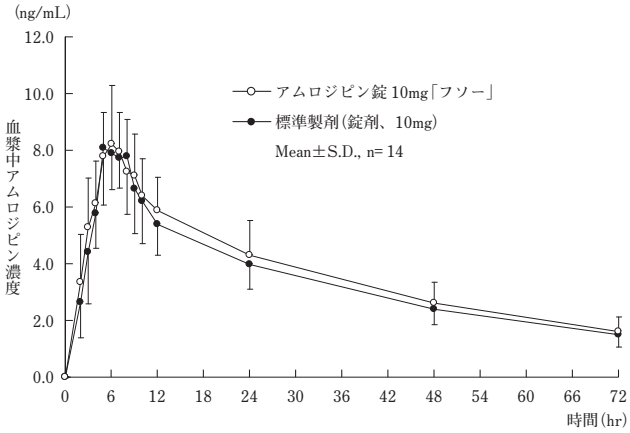
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(3) アムロジピン錠10mg「フソー」

アムロジピン錠10mg「フソー」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10mg）健康成人男子に絶食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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}72}$ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
アムロジピン錠10mg「フソー」	264.4±59.0	8.9±1.8	5.9±1.0	33.8±6.9
標準製剤（錠剤、10mg）	246.1±44.5	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。

2．溶出挙動[4)]

アムロジピン錠2.5mg「フソー」及びアムロジピン錠5mg「フソー」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたアムロジピンベシル酸塩錠の溶出規格bに適合していることが確認されている。

【薬効薬理】[5)]

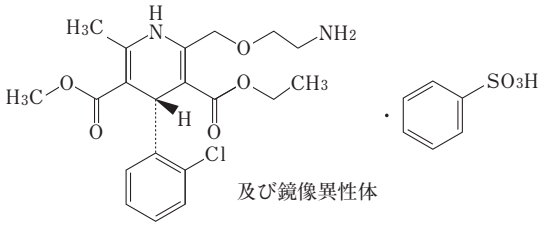
アムロジピンベシル酸塩はジヒドロピリジン系カルシウム拮抗薬としての作用を示すが、作用の発現が緩徐で持続的であるという特徴を有する。

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。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：アムロジピンベシル酸塩（Amlodipine Besilate）

構造式：



分子式：$C_{20}H_{25}ClN_2O_5 \cdot C_6H_6O_3S$

分子量：567.05

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

性　状：本品は白色～帯黄白色の結晶性の粉末である。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。メタノール溶液（1→100）は旋光性を示さない。

融　点：約198℃（分解）

【取扱い上の注意】

1．注意

［アムロジピン錠 2.5mg、5mg「フソー」］
使用期限内であっても、開封後はなるべく速やかに使用すること。
［アムロジピン錠 10mg「フソー」］
使用期限内であっても、開封後はなるべく速やかに使用すること。
アルミピロー開封後は湿気を避けて保存すること。

2．安定性試験結果[6)]

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75％、6ヵ月）の結果、アムロジピン錠 2.5mg「フソー」、アムロジピン錠5mg「フソー」及びアムロジピン錠10mg「フソー」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。

【包　　装】

アムロジピン錠2.5mg「フソー」：（PTP）100錠（10錠×10）
700錠（14錠×50）

アムロジピン錠5mg「フソー」：（PTP）100錠（10錠×10）
700錠（14錠×50）

アムロジピン錠10mg「フソー」：（PTP）100錠（10錠×10）

【主要文献】

※1）堀本　政夫他：応用薬理. 1991；42（2）：167-176
2）Naito, T., et al. ：J. Hum. Lact. 2015；31（2）：301-306
3）シオノケミカル（株）：アムロジピン錠 2.5mg「フソー」、アムロジピン錠 5mg「フソー」及びアムロジピン錠 10mg「フソー」の生物学的同等性試験に関する資料（社内資料）
4）シオノケミカル（株）：アムロジピン錠 2.5mg「フソー」及びアムロジピン錠 5mg「フソー」の溶出試験に関する資料（社内資料）
※5）第十八改正日本薬局方解説書、C-306（2021）
6）シオノケミカル（株）：アムロジピン錠 2.5mg「フソー」、アムロジピン錠 5mg「フソー」及びアムロジピン錠 10mg「フソー」の安定性試験に関する資料（社内資料）

【文献請求先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求下さい。

シオノケミカル株式会社　学術情報本部
〒104-0028 東京都中央区八重洲 2 丁目10番10号
TEL 03-5202-0213　FAX 03-5202-0230

販売元
扶桑薬品工業株式会社
大阪市城東区森之宮二丁目3番11号

製造販売元
SHIONO シオノケミカル株式会社
東京都中央区八重洲 2 丁目10番10号

3150159-Q