＊2026年11月改訂（第2版、効能又は効果、用法及び用量変更）
2026年2月作成（第1版）

貯法：室温保存
有効期間：36ヵ月

処方箋医薬品[注)]

経口CGRP受容体拮抗薬
アトゲパント水和物錠

アクイプタ®錠60mg
アクイプタ®錠30mg
アクイプタ®錠10mg

AQUIPTA® Tablets

日本標準商品分類番号
87119

承認番号	
錠60mg	30800AMX00075000
錠30mg	30800AMX00074000
錠10mg	30800AMX00073000
販売開始	
錠60mg	2026年4月
錠30mg	2026年4月
錠10mg	2026年4月

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

®登録商標

2．禁忌（次の患者には投与しないこと）

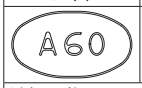
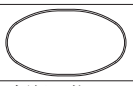
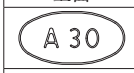
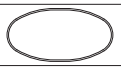
本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3．組成・性状

3.1 組成

販売名	有効成分	添加剤
アクイプタ錠60mg	1錠中 アトゲパント水和物（無水物として）60mg	コポビドン、コハク酸*d*-α-トコフェロールポリエチレングリコール、D-マンニトール、結晶セルロース、塩化ナトリウム、クロスカルメロースナトリウム、軽質無水ケイ酸、フマル酸ステアリルナトリウム
アクイプタ錠30mg	1錠中 アトゲパント水和物（無水物として）30mg	
アクイプタ錠10mg	1錠中 アトゲパント水和物（無水物として）10mg	

3.2 製剤の性状

販売名	性状	外形			識別コード
		上面	下面	側面	
アクイプタ錠60mg	白色～微黄白色の楕円形の素錠				A60
		長径：約16mm、短径：約9mm、厚さ：約6mm、重量：約0.6g			
アクイプタ錠30mg	白色～微黄白色の楕円形の素錠				A30
		長径：約14mm、短径：約7mm、厚さ：約4mm、重量：約0.3g			
アクイプタ錠10mg	白色～微黄白色の円形の素錠				A10
		直径：約6mm、厚さ：約4mm、重量：約0.1g			

＊4．効能又は効果

片頭痛発作の急性期治療及び発症抑制

5．効能又は効果に関連する注意

〈片頭痛発作の急性期治療〉

＊5.1 本剤は国際頭痛学会による片頭痛診断基準により「前兆のない片頭痛」あるいは「前兆のある片頭痛」と確定診断が行われた場合にのみ投与すること。

特に以下のような患者は、本剤投与前に問診、診察、検査を十分に行い、頭痛の原因を確認してから投与すること。

・今までに片頭痛と診断が確定したことのない患者
・片頭痛と診断されたことはあるが、片頭痛に通常見られる症状や経過とは異なった頭痛及び随伴症状のある患者

〈片頭痛発作の発症抑制〉

5.2 十分な診察を実施し、前兆のある又は前兆のない片頭痛の発作が月に複数回以上発現している、又は慢性片頭痛であることを確認した上で本剤の適用を考慮すること。

5.3 最新のガイドライン等を参考に、非薬物療法、片頭痛発作の急性期治療等を適切に行っても日常生活に支障をきたしている患者にのみ投与すること。

＊6．用法及び用量

〈片頭痛発作の急性期治療〉

通常、成人にはアトゲパントとして1回60mgを片頭痛発作時に経口投与する。

〈片頭痛発作の発症抑制〉

通常、成人にはアトゲパントとして60mgを1日1回経口投与する。

7．用法及び用量に関連する注意

〈効能共通〉

＊7.1 重度の腎機能障害患者及び末期腎不全患者（クレアチニンクリアランスが30mL/min未満）の場合は、本剤の1回投与量をアトゲパントとして10mgとすること。［9.2.1、16.6.1参照］

＊7.2 強いCYP3A阻害剤と併用する場合は、本剤の1回投与量をアトゲパントとして10mgとすること。［10.2、16.7.1参照］

＊7.3 OATP阻害剤と併用する場合は、本剤の1回投与量をアトゲパントとして30mgとすること。［10.2、16.7.3参照］

〈片頭痛発作の急性期治療〉

＊7.4 片頭痛発作に対して本剤を投与しても頭痛の消失に至らず発作が継続している場合、同日中は本剤を追加投与せず、本剤以外の急性期治療薬の投与を考慮すること。

＊7.5 本剤投与により全く効果が認められない場合は、再検査の上、頭痛の原因を確認するとともに、他の治療法を考慮すること。

〈片頭痛発作の発症抑制〉

＊7.6 片頭痛発作の発症抑制を目的として本剤投与中に頭痛発作が発現した場合には必要に応じて本剤以外の急性期治療薬を頓用させること。投与前にこのことを患者に十分に説明しておくこと。

7.7 本剤投与中は症状の経過を十分に観察し、以下のとおり投与継続の可否を考慮すること。

7.7.1 本剤投与開始後3カ月を目安に治療上の有益性を評価して症状の改善が認められない場合には、本剤の投与中止を考慮すること。

7.7.2 本剤投与開始3カ月以降も本剤投与を継続する場合には、定期的に投与継続の要否を検討し、頭痛発作発現の消失・軽減等により日常生活に支障をきたさなくなった場合には、本剤の投与中止を考慮すること。

＊8．重要な基本的注意

本剤は片頭痛の治療に関する十分な知識及び経験を有する医師のもとで使用すること。

9．特定の背景を有する患者に関する注意

9.2 腎機能障害患者

9.2.1 重度の腎機能障害患者（クレアチニンクリアランスが15～29mL/min）及び末期腎不全患者（クレアチニンクリアランスが15mL/min未満）

本剤の曝露量が増加し、副作用が増強されるおそれがある。重度の腎機能障害患者及び末期腎不全患者を対象とした臨床試験は実施していない。［7.1、16.6.1参照］

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重度の肝機能障害患者（Child-Pugh分類C）

投与しないことが望ましい。本剤の曝露量が増加し、副作用が増強されるおそれがある。［16.6.2参照］

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、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。ラットの胚・胎児発生毒性試験において、ヒトに本剤60mgを1日1回投与したときの曝露量（AUC）の10.9倍以上の用量で母体毒性に伴う胎児体重の減少及び骨格異常の発現頻度増加が認められた[1]。

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。授乳中の健康成人女性12例にアトゲパント60mgを単回経口投与したとき、乳汁中/血漿中濃度比は約0.08であり、乳児相対摂取量は体重で標準化した授乳婦薬物摂取量の約0.19%であった[2]。

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

10．相互作用

本剤は主にCYP3Aにより代謝される。また、P-糖たんぱく質（P-gp）、乳癌耐性蛋白（BCRP）、有機アニオン輸送ポリペプチド（OATP）1B1/1B3の基質である。［16.4参照］

＊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
強いCYP3A阻害剤 イトラコナゾール クラリスロマイシン 等 ［7.2、16.7.1参照］	本剤の副作用が増強されるおそれがある。	これらの薬剤の強いCYP3A阻害作用により、本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。
OATP阻害剤 シクロスポリン 等 ［7.3、16.7.3参照］	本剤の副作用が増強されるおそれがある。	これらの薬剤のOATP阻害作用により、本剤の血中濃度が上昇する可能性がある。

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。

11.1 重大な副作用

11.1.1 過敏症反応（頻度不明）

アナフィラキシー、呼吸困難、発疹、そう痒症、蕁麻疹及び顔面浮腫等の過敏症反応があらわれることがあり、投与から数日後にあらわれることもある。

＊11.2 その他の副作用

	1%以上	0.1～1%未満
消化器	悪心、便秘	－
全身症状	－	疲労
代謝及び栄養障害	－	食欲減退
神経系障害	－	傾眠
臨床検査値	－	体重減少、ALT/AST増加
皮膚及び皮下組織障害	－	そう痒症

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。

16．薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

日本人健康成人24例にアトゲパント10mg、30mg又は60mgを空腹時に単回経口投与したときの血漿中アトゲパント濃度推移の平均値を図1に、アトゲパントの薬物動態パラメータを表1にそれぞれ示す。アトゲパントは投与後速やかに吸収され、曝露量は10-60mgの用量範囲で用量に伴い増加した。日本人及び外国人健康成人の薬物動態パラメータは概ね類似していた[3]。

図1．日本人健康成人における血漿中アトゲパント濃度－時間推移（平均値）

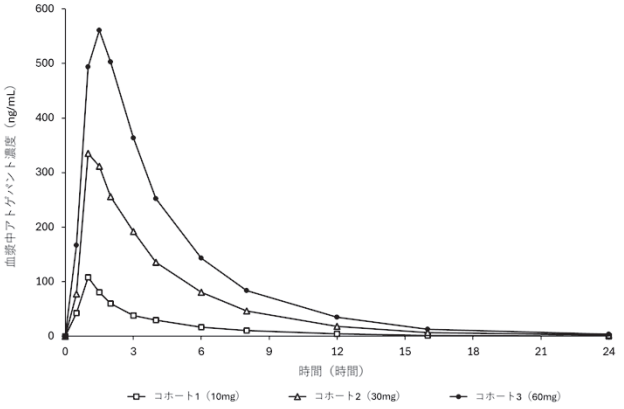


表1．日本人健康成人にアトゲパントを単回経口投与したときのアトゲパントの薬物動態パラメータ

	10mg N=8	30mg N=8	60mg N=8
C_{max}（ng/mL）	109.38±12.51	355.02±171.47	665.58±182.73
$AUC_{0\text{-}inf}$（ng・h/mL）	328.07±53.29	1354.24±518.88	2480.34±866.37
T_{max}（h）[a]	1.00（1.00–1.50）	1.00（1.00–3.00）	1.50（1.00–3.00）
$t_{1/2}$（h）	2.97±0.33	4.49±3.42	4.43±1.84

平均値±標準偏差
a：中央値（最小値-最大値）

16.1.2 反復投与

日本人健康成人24例にアトゲパント10mg、30mg又は60mgを1日1回反復経口投与したとき、8日目のアトゲパントの薬物動態パラメータを表2に示す。アトゲパントは投与後速やかに吸収され、曝露量は10-60mgの用量範囲で用量に伴い増加した。アトゲパントを1日1回投与したとき、アトゲパントの蓄積は認められなかった。日本人及び外国人健康成人の薬物動態パラメータは概ね類似していた[3]。

表2．日本人健康成人にアトゲパントを1日1回反復経口投与したときの8日目のアトゲパントの薬物動態パラメータ

	10mg N=8	30mg N=8	60mg N=8
C_{max}（ng/mL）	76.31（23.07）	348.99（76.17）	744.30（207.7）
$AUC_{0\text{-}24h}$（ng・h/mL）	290.72（59.73）	1467.02（261.86）	2855.69（881.31）
T_{max}（h）[a]	1.25（1.00-2.00）	1.00（1.00-3.00）	1.00（1.00-2.00）
$t_{1/2}$（h）	3.04（0.54）	3.82（1.15）	5.77（3.09）

平均値±標準偏差
a：中央値（最小値-最大値）

16.2 吸収

健康成人被験者20例に高脂肪食摂取後にアトゲパントを投与したとき、アトゲパントのC_{max}及びAUCはそれぞれ約22%及び18%低下し、T_{max}は変化しなかった[4]（外国人データ）。

16.3 分布

アトゲパントのヒト血漿中非タンパク結合率は約4.7%であり、0.1-10μMの濃度範囲で濃度依存性は認められなかった[5]（*in vitro*）。アトゲパントを経口投与したときの見かけの分布容積は約292Lであった[6]。

16.4 代謝

アトゲパントは主にCYP3Aによって代謝される[7]（*in vitro*）。循環血中での主要な成分はアトゲパント及びグルクロン酸抱合体（M23）であった[8]。［10.参照］

16.5 排泄

健康男性成人被験者6例に^{14}C-アトゲパント50mgを単回経口投与したとき、投与量の約42%及び5%は未変化体としてそれぞれ糞中及び尿中から回収された[8]（外国人データ）。

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

腎排泄を介したアトゲパントの排泄はわずかである。生理学的薬物速度論モデル解析及び母集団薬物動態解析の結果、軽度及び中等度の腎機能障害患者（CLcr 30-89mL/min）でのアトゲパントの薬物動態は、正常な患者（CLcr >90mL/min）と比べ顕著な差がなかった[9]、[10]。重度の腎機能障害患者又は末期腎不全患者におけるアトゲパントの薬物動態に関する試験は実施していない。生理学的薬物速度論モデルを用いて、重度の腎機能障害患者においてOATP阻害によりアトゲパントの肝取り込みが52%低下したワーストケースを想定してシミュレートしたアトゲパントの曝露量の増加は約2.3倍であった。［7.1、9.2.1参照］

16.6.2 肝機能障害患者

軽度（Child-Pugh分類A、8例）、中等度（Child-Pugh分類B、8例）及び重度（Child-Pugh分類C、8例）の肝機能障害患者にアトゲパント60mgを単回経口投与したとき、アトゲパント（結合型及び非結合型）の曝露量は正常肝機能患者（8例）と比べそれぞれ約1.24倍、1.15倍及び1.38倍、非結合型アトゲパントの曝露量はそれぞれ約1.8倍、1.9倍及び3.7倍であった[11]。［9.3.1参照］

16.7 薬物相互作用

アトゲパントは主にCYP3Aにより代謝される。アトゲパントはOATP1B1、OATP1B3、P-gp及びBCRPの基質である。アトゲパントはOATP1B1、OATP1B3及びMATE1の弱い阻害作用がある。

16.7.1 CYP3A阻害剤

健康成人被験者40例に強力なCYP3A阻害剤であるイトラコナゾールを反復投与時（1日1回200mg）にアトゲパント60mgを単回経口投与したとき、アトゲパントのC_{max}及びAUCはそれぞれ約2.15倍及び5.5倍であった[6]（外国人データ）。［7.2、10.2参照］

生理学的薬物速度論モデル解析によるシミュレーション結果から、中程度及び弱いCYP3A阻害剤はアトゲパントのAUCをそれぞれ約1.7倍及び1.1倍であることが予測された[9]。［7.2、10.2参照］

16.7.2 CYP3A誘導剤

健康成人被験者32例に強力なCYP3A誘導剤であるリファンピシンを反復投与時（1日1回600mg）にアトゲパント60mgを単回経口投与したとき、アトゲパントのAUC及びC_{max}はそれぞれ約0.4倍及び0.7倍であった[12]（外国人データ）。

健康成人被験者25例に弱いCYP3A誘導剤であるトピラマートを反復投与時（1日1-2回25-100mg）にアトゲパント60mgを反復経口投与したとき、アトゲパントのAUC及びC_{max}はそれぞれ約0.75倍及び0.76倍であった[13]（外国人データ）。

16.7.3 OATP阻害剤

健康成人被験者32例にOATP阻害剤であるリファンピシンを単回投与時（600mg）にアトゲパント60mgを単回経口投与したとき、アトゲパントのAUC及びC_{max}はそれぞれ約2.85倍及び2.23倍であった[12]（外国人データ）。［7.3、10.2参照］

16.7.4 経口避妊薬

健康成人被験者26例に経口避妊薬（エチニルエストラジオール0.03mg及びレボノルゲストレル0.15mg）を単回投与時にアトゲパント60mgを反復経口投与したとき、エチニルエストラジオールのAUC及びC_{max}はそれぞれ約1.00倍及び0.90倍、レボノルゲストレルのAUC及びC_{max}はそれぞれ約1.19倍及び1.09倍であった[14]（外国人データ）。

16.7.5 スマトリプタン

健康成人被験者27例にスマトリプタンを単回投与時（100mg）にアトゲパント60mgを単回経口投与したとき、スマトリプタンのAUC及びC_{max}はそれぞれ約1.02倍及び0.95倍、アトゲパントのAUC及びC_{max}はそれぞれ約0.95倍及び0.79倍であった[15]（外国人データ）。

16.7.6 P-gp阻害剤

健康成人被験者24例にP-gp阻害剤であるグルコン酸キニジンを反復投与時（1日2回648mg）にアトゲパント60mgを単回投与したとき、アトゲパントのAUC及びC_{max}はそれぞれ約1.26倍及び1.04倍であった[16]（外国人データ）。

16.7.7 その他の薬剤

アトゲパントとアセトアミノフェン又はナプロキセンを併用投与した結果、アトゲパント及び併用薬の薬物動態への明らかな影響は認められなかった[17]。

アトゲパントとファモチジン又はエソメプラゾールを併用投与した結果、アトゲパントの薬物動態への明らかな影響は認められなかった[18]、[19]。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈片頭痛発作の急性期治療〉

＊17.1.1 国際共同第Ⅲ相試験：ECLIPSE（M24-305試験）

18歳以上の片頭痛患者（スクリーニング来院前3か月間の中等度又は重度の片頭痛発作回数が2-8回/月）1232例（日本人145例を含む）を対象とした無作為化二重盲検比較試験の二重盲検投与期（最長16週間）において、4回の中等度又は重度の片頭痛発作について評価することとされ、各発作時に、本剤60mg又はプラセボを単回経口投与した[20]。

主要評価項目である初回発作時の投与2時間後の頭痛消失割合は表1のとおりであり、本剤60mg群のプラセボ群に対する優越性が示された。

表1. 国際共同第Ⅲ相試験（二重盲検投与期）の初回発作時の投与2時間後の頭痛消失割合

	プラセボ（N=612）	アトゲパント60mg（N=602）
初回発作時の投与2時間後の頭痛消失割合[a]（%）	13.1%（80/612）	24.3%（146/602）
群間差[b]（95%信頼区間）	12.4（8.31，16.52）	
オッズ比[b]（95%信頼区間）	2.36（1.76，3.15）	
p値[b, c]	<0.0001	

a: 上段: 初回発作時の投与2時間後に頭痛消失した被験者の割合、下段: 初回発作時の投与2時間後に頭痛消失した被験者数

b: 投与群、発作、投与群と発作の交互作用、地域（欧州、中国、日本、その他）、トリプタンに対する反応（トリプタン不適、トリプタン使用経験あり、トリプタン使用経験なし）、片頭痛予防薬の使用（あり／なし）、ベースラインの頭痛重症度を因子として含む一般化線形混合効果モデルにて算出した。応答変数には二項分布を仮定し、logitリンク関数を用いた。被験者内共分散構造として無構造共分散行列を仮定した。群間差及びその95%信頼区間は一般化線形混合効果モデルにより推定されたオッズ比に基づき算出した。

c: 有意水準（両側）5%; モデルベースのオッズ比について統計的に有意

二重盲検投与期における副作用発現頻度は、本剤60mg群で5.9%（70/1195例）であり、主な副作用は悪心1.3%（15/1195例）であった。

〈片頭痛発作の発症抑制〉

17.1.2 国内第Ⅱ/Ⅲ相試験：RELEASE（M22-056試験）

18歳以上の日本人反復性片頭痛患者523例（ベースラインの月間片頭痛日数（MMD）が4日以上、月間頭痛日数（MHD）が15日未満）を対象としたプラセボ対照二重盲検比較試験において、本剤10mg、30mg、60mg又はプラセボを1日1回、12週間経口投与した[21]。

主要評価項目である投与開始12週間における平均MMDのベースラインからの変化量は表2の通りであり、本剤10mg群、30mg群及び60mg群のプラセボ群に対する優越性が示された[注]。

表2. 国内第Ⅱ/Ⅲ相試験の投与開始12週間における平均MMDのベースラインからの変化量

	プラセボ（133例）	本剤		
		10mg（127例）	30mg（130例）	60mg（131例）
ベースラインのMMD[a]	7.20（2.40）	7.24（2.44）	7.34（2.28）	7.07（2.32）
投与開始12週間における平均MMDのベースラインからの変化量[b, c]	−1.24（−1.72, −0.75）	−2.80（−3.30, −2.30）	−3.14（−3.63, −2.64）	−3.34（−3.83, −2.85）
投与開始12週間における平均MMDのプラセボ群との差[b, c]	−	−1.57（−2.24, −0.89）	−1.90（−2.57, −1.22）	−2.10（−2.78, −1.43）
p値[c, d]	−	<0.0001	<0.0001	<0.0001

a: 上段: 平均値　下段: 標準偏差
b: 上段: 最小二乗平均値　下段: 95%信頼区間
c: 片頭痛予防薬の使用状況（あり／なし）、投与群、予定された来院、投与群と予定された来院の交互作用、ベースラインと予定された来院の交互作用を因子とし、ベースラインのMMDを共変量とした反復測定混合効果モデルにて算出した。
d: Hochberg法により多重性を調整したp値

副作用発現頻度[注)]は、本剤10mg群で10.3%（13/126例）、30mg群で14.5%（19/131例）、60mg群で15.2%（20/132例）であり、主な副作用は本剤10mg群で便秘3.2%（4/126例）、好中球減少症2.4%（3/126例）、30mg群で便秘6.9%（9/131例）、食欲減退2.3%（3/131例）、60mg群で便秘9.8%（13/132例）、悪心3.0%（4/132例）であった。

注）本剤の承認用法用量は、60mgを1日1回経口投与である。

17.1.3 国際共同第Ⅲ相試験：PROGRESS（3101-303-002試験）

18歳以上の慢性片頭痛患者773例（日本人157例を含む）（ベースラインのMMDが8日以上、MHDが15日以上）を対象としたプラセボ対照二重盲検比較試験において、本剤30mg1日2回、60mg1日1回又はプラセボを12週間経口投与した[22)]。

主要評価項目である投与開始12週間における平均MMDのベースラインからの変化量は表3の通りであり、本剤30mg1日2回群及び60mg1日1回群のプラセボ群に対する優越性が示された[注)]。

表3. 国際共同第Ⅲ相試験の投与開始12週間における平均MMDのベースラインからの変化量

	プラセボ（246例）	本剤	
		30mg1日2回（253例）	60mg1日1回（256例）
ベースラインのMMD[a]	18.95（4.78）	18.56（5.07）	19.16（5.28）
投与開始12週間における平均MMDのベースラインからの変化量[b, c]	−5.05（−5.86, −4.25）	−7.46（−8.26, −6.67）	−6.88（−7.67, −6.08）
投与開始12週間における平均MMDのプラセボ群との差[b, c]	−	−2.41（−3.48, −1.33）	−1.82（−2.89, −0.75）
p値[c, d]	−	<0.0001	0.0009

a: 上段: 平均値　下段: 標準偏差
b: 上段: 最小二乗平均値　下段: 95%信頼区間
c: 投与群、予定された来院、急性期治療薬の使用過多の状況（あり／なし）、片頭痛予防薬の使用状況（あり／なし）、治療に失敗した片頭痛予防薬の数、地域、投与群と予定された来院の交互作用を因子とし、ベースラインのMMDとベースラインと予定された来院の交互作用を共変量とした反復測定混合効果モデルにて算出した。
d: Hochberg法により多重性を調整したp値

副作用発現頻度[注)]は、本剤30mg1日2回群で20.2%（52/257例）、60mg1日1回群で17.2%（45/261例）であり、主な副作用は本剤30mg1日2回群で便秘8.9%（23/257例）、悪心4.7%（12/257例）、疲労2.3%（6/257例）、60mg1日1回群で悪心5.7%（15/261例）、便秘5.4%（14/261例）、食欲減退2.3%（6/261例）であった。

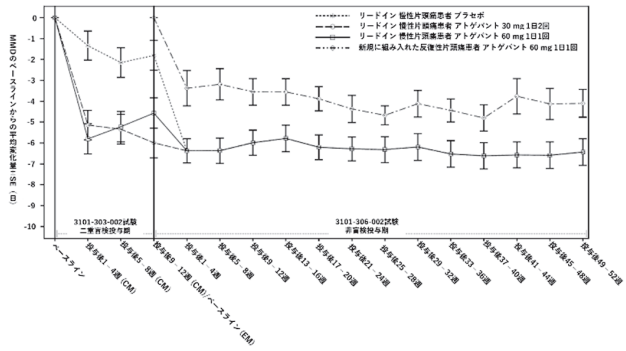
注）本剤の承認用法用量は、60mgを1日1回経口投与である。

17.1.4 国内第Ⅲ相長期投与試験：3101-306-002試験

国際共同第Ⅲ相試験を完了した日本人慢性片頭痛患者155例及び新規参加の日本人反復性片頭痛患者31例（計186例）を対象とした非盲検非対照試験において、本剤60mg1日1回を52週間経口投与した[23)]。

52週間のMMDの経時的推移を図1に示す。

図1. 国内第Ⅲ相長期投与試験におけるMMD変化量の経時的推移



副作用発現頻度は、16.7%（31/186例）であり、主な副作用は便秘7.5%（14/186例）、アラニンアミノトランスフェラーゼ上昇4.3%（8/186例）、アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ上昇3.2%（6/186例）、食欲減退2.2%（4/186例）であった。

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

カルシトニン遺伝子関連ペプチド（CGRP）は片頭痛の病態生理と関連する神経ペプチドである。アトゲパントはCGRPの受容体への結合を阻害し、CGRP受容体のシグナル伝達を阻害する[24)、25)]。

18.2 CGRP受容体に対する結合親和性

アトゲパントは、ヒトCGRP受容体に親和性を示し、そのKi値は15–26pmol/Lであった（*in vitro*）[26)]。

18.3 アカゲザルにおけるCGRP受容体拮抗作用

アトゲパントをアカゲザルに静脈内投与したとき、アトゲパントは、カプサイシンにより惹起される内因性CGRPを介した皮膚血流量増加を用量依存的に阻害した（*in vivo*）[27)]。

19. 有効成分に関する理化学的知見

一般的名称：アトゲパント水和物（Atogepant Hydrate）［JAN］

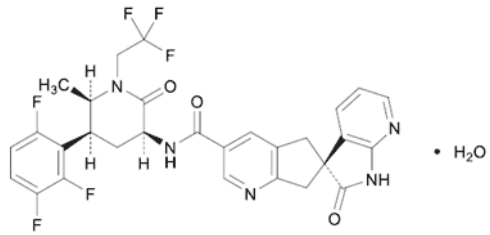
化学名：(3'*S*)-*N*-［(3*S*,5*S*,6*R*)-6-Methyl-2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroethyl)-5-(2,3,6-trifluorophenyl)piperidin-3-yl］-2'-oxo-1',2',5,7-tetrahydrospiro［cyclopenta［*b*］pyridine-6,3'-pyrrolo［2,3-*b*］pyridine］-3-carboxamide monohydrate

分子式：$C_{29}H_{23}F_6N_5O_3 \cdot H_2O$

分子量：621.53

性　状：アトゲパント水和物は白色～淡灰白色の粉末である。エタノールに溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、アセトンにやや溶けにくい、アセトニトリルに溶けにくく、水にほとんど解けない。

構造式：



融　点：融解開始144℃、融解ピーク約175℃

分配係数（log P）：2.4（オクタノール／水）

21. 承認条件

21.1 医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

22. 包装

〈アクイプタ錠60mg〉
28錠［7錠（PTP）×4］

〈アクイプタ錠30mg〉
28錠［7錠（PTP）×4］

〈アクイプタ錠10mg〉
28錠［7錠（PTP）×4］

23．主要文献

1)社内資料：生殖発生毒性試験（2026年2月19日承認、CTD2.6.6.6）
2)社内資料：第Ⅰ相授乳試験（M22-394試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.2.5.1）
3)社内資料：日本人及び外国人健康被験者を対象とした第Ⅰ相試験（3101-101-002試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.4.2.1）
4)社内資料：第Ⅰ相食事の影響試験（3101-105-002試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.5.11）
5)社内資料：血漿タンパク結合の検討（*in vitro*）（2026年2月19日承認、CTD2.6.4.4.2）
6)社内資料：イトラコナゾールを用いた第I相薬物相互作用試験（CGP-PK-02試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.5.1）
7)社内資料：代謝の検討（*in vitro*）（2026年2月19日承認、CTD2.6.4.5.1）
8)社内資料：第Ⅰ相マスバランス試験（CGP-PK-03試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.2.4.1）
9)社内資料：生理学的薬物速度論解析（3101-S04-000）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.3.7）
10)社内資料：母集団薬物動態解析（CGP-MS-03）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.3.2）
11)社内資料：肝機能障害被験者を対象とした第Ⅰ相試験（CGP-PK-01試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.4.3.1）
12)社内資料：リファンピシンを用いた第Ⅰ相薬物相互作用試験（CGP-PK-12試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.5.2）
13)社内資料：トピラマートを用いた第Ⅰ相薬物相互作用試験（CGP-PK-14試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.5.9）
14)社内資料：経口避妊薬を用いた第Ⅰ相薬物相互作用試験（MK-8031 P005試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.5.6）
15)社内資料：スマトリプタンを用いた第Ⅰ相薬物相互作用試験（CGP-PK-13試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.5.8）
16)社内資料：グルコン酸キニジンを用いた第Ⅰ相薬物相互作用試験（3101-103-002試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.5.3）
17)社内資料：ナプロキセン及びアセトアミノフェンを用いた第Ⅰ相薬物相互作用試験（CGP-PK-06試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.5.7）
18)社内資料：ファモチジンを用いた第Ⅰ相薬物相互作用試験（MK-8031 P008試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.5.4）
19)社内資料：エソメプラゾールを用いた第Ⅰ相薬物相互作用試験（3101-102-002試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.2.2.5.5）
20)社内資料：国際共同第Ⅲ相試験（M24-305試験）（2026年11月16日承認、CTD2.7.6）
21)社内資料：国内第Ⅱ/Ⅲ相試験（M22-056試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.6）
22)社内資料：国際共同第Ⅲ相試験（3101-303-002試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.6）
23)社内資料：国内第Ⅲ相長期投与試験（3101-306-002試験）（2026年2月19日承認、CTD2.7.6）
24)Russell FA, King R, Smillie SJ, et al. Calcitonin gene-related peptide: physiology andpathophysiology. Physiol Rev. 2014;94（4）:1099-142.
25)社内資料：ヒト及び動物由来CGRP受容体を介した*in vitro*細胞活性（2026年2月19日承認、CTD2.6.2.2.1.3）
26)社内資料：ヒトCGRP受容体に対する結合親和性（2026年2月19日承認、CTD2.6.2.2.1.1）
27)社内資料：カプサイシン誘発皮膚血管拡張モデルにおける有効性（2026年2月19日承認、CTD2.6.2.2.2.1）

24．文献請求先及び問い合わせ先

アッヴィ合同会社 くすり相談室
〒108-0023 東京都港区芝浦3-1-21
フリーダイヤル 0120-587-874

25．保険給付上の注意

本剤は新医薬品であるため、厚生労働省告示第107号（平成18年3月6日付）に基づき、2027年4月末日までは、1回14日分を限度として投薬すること。

26．製造販売業者等

26.1 製造販売元

アッヴィ合同会社
東京都港区芝浦3-1-21