

## 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

## アンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤

日本薬局方 ロサルタンカリウム錠

ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」

ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」

ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」

LOSARTAN POTASSIUM Tablets [SAWAI]

剤形	割線入りフィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品 <sup>注)</sup> 注)注意-医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	錠25mg : 1錠中日局ロサルタンカリウム25mg含有 錠50mg : 1錠中日局ロサルタンカリウム50mg含有 錠100mg : 1錠中日局ロサルタンカリウム100mg含有
一般名	和名:ロサルタンカリウム(JAN) 洋名:Losartan Potassium(JAN)
製造販売承認年月日 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:2012年2月15日 薬価基準収載年月日:2012年6月22日 販売開始年月日:2012年6月22日
製造販売(輸入)・提携・販売会社名	製造販売元:沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL:0120-381-999、FAX:06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト: <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a>

本IFは2023年7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。

## 医薬品インタビューフォーム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、IF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IFの位置付け、IF記載様式、IF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IF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IF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IFが速やかに提供されることとなった。最新版のIF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IF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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF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. IFとは

IF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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF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、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。

IF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. IFの利用にあたって

電子媒体のIF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IFを作成・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利用者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、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、IF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

IF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。IF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IF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、IF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	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	27
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	27
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	27
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	27
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	27
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	27
6. RMPの概要	1	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	27
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	29
1. 販売名	3	8. 副作用	31
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	32
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	32
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	32
5. 化学名(命名法)又は本質	4	12. その他の注意	32
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	IX. 非臨床試験に関する項目	33
III. 有効成分に関する項目	5	1. 薬理試験	33
1. 物理化学的性質	5	2. 毒性試験	33
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	X. 管理的事項に関する項目	34
3. 有効成分の確認試験法、定量法	5	1. 規制区分	34
IV. 製剤に関する項目	6	2. 有効期間	34
1. 剤形	6	3. 包装状態での貯法	34
2. 製剤の組成	7	4. 取扱い上の注意	34
3. 添付溶解液の組成及び容量	7	5. 患者向け資材	34
4. 力価	7	6. 同一成分・同効薬	34
5. 混入する可能性のある夾雑物	7	7. 国際誕生年月日	34
6. 製剤の各種条件下における安定性	7	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	34
7. 調製法及び溶解後の安定性	11	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	35
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	11	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	35
9. 溶出性	12	11. 再審査期間	35
10. 容器・包装	16	12. 投薬期間制限に関する情報	35
11. 別途提供される資材類	16	13. 各種コード	35
12. その他	16	14. 保険給付上の注意	35
V. 治療に関する項目	17	XI. 文献	36
1. 効能又は効果	17	1. 引用文献	36
2. 効能又は効果に関連する注意	17	2. その他の参考文献	37
3. 用法及び用量	17	XII. 参考資料	38
4. 用法及び用量に関連する注意	17	1. 主な外国での発売状況	38
5. 臨床成績	17	2. 海外における臨床支援情報	38
VI. 薬効薬理に関する項目	20	XIII. 備考	39
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	20	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	39
2. 薬理作用	20	2. その他の関連資料	40
VII. 薬物動態に関する項目	21		
1. 血中濃度の推移	21		
2. 薬物速度論的パラメータ	23		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	24		
4. 吸収	24		
5. 分布	24		
6. 代謝	25		
7. 排泄	25		
8. トランスポーターに関する情報	25		
9. 透析等による除去率	25		
10. 特定の背景を有する患者	25		
11. その他	26		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ロサルタンカリウム錠25mg/錠50mg/錠100mg「サワイ」は、日局ロサルタンカリウムを含有するアンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成17年3月31日 薬食発第0331015号(平成21年3月4日 薬食発第0304004号により一部改正)
承認	2012年2月
上市	2012年6月

2012年7月に「高血圧及び蛋白尿を伴う2型糖尿病における糖尿病性腎症」の効能又は効果が追加承認された。(X. -9. 参照)

### 2. 製品の治療学的特性

1) ロサルタンカリウムは経口投与後速やかに吸収され、その一部が主代謝物であるカルボン酸体に変換される。ロサルタン及びカルボン酸体は、いずれも生理的昇圧物質であるアンジオテンシンⅡ(A-II)に対して、その受容体において特異的に拮抗し、降圧効果を発揮する。(VI. -2. 参照)

2) 重大な副作用として、アナフィラキシー、血管浮腫、急性肝炎又は劇症肝炎、腎不全、ショック、失神、意識消失、横紋筋融解症、高カリウム血症、不整脈、汎血球減少、白血球減少、血小板減少、低血糖、低ナトリウム血症が報告されている。(VIII. -8. 参照)

### 3. 製品の製剤学的特性

特になし

### 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

(2024年2月1日時点)

### 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

I. 概要に関する項目

- 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

ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」  
 ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」  
 ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」

#### 2) 洋名

LOSARTAN POTASSIUM Tablets [SAWAI]

#### 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

### 2. 一般名 .....

#### 1) 和名(命名法)

ロサルタンカリウム(JAN)

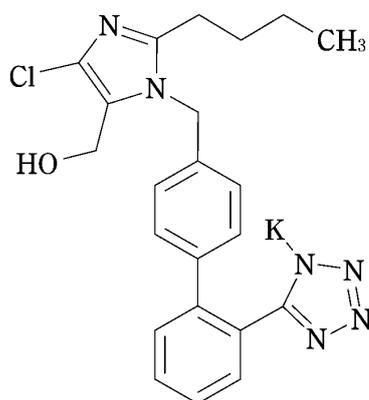
#### 2) 洋名(命名法)

Losartan Potassium(JAN)  
 Losartan(INN)

#### 3) ステム(stem)

-sartan : angiotensin II receptor antagonists, antihypertensive (non-peptidic)

### 3. 構造式又は示性式 .....



### 4. 分子式及び分子量 .....

分子式 :  $C_{22}H_{22}ClKN_6O$   
 分子量 : 461.00

II. 名称に関する項目

5. 化学名(命名法)又は本質 .....

Monopotassium 5-{[4'-(2-butyl-4-chloro-5-hydroxymethyl-1*H*-imidazol-1-yl)  
methyl]biphenyl-2-yl}-1*H*-tetrazol-1-ide (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....

特になし

---

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

---

1. 物理化学的性質……………
- 1) 外観・性状  
白色の結晶性の粉末である。
- 2) 溶解性  
水に極めて溶けやすく、メタノール又はエタノール(99.5)に溶けやすい。
- 3) 吸湿性  
水分：0.5%以下(0.25g、容量滴定法、直接滴定)
- 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>  
    日局「ロサルタンカリウム」の確認試験に準ずる。
- 1) 紫外可視吸光度測定法  
    2) 赤外吸収スペクトル測定法  
    3) カリウム塩の定性反応  
    4) 炎色反応試験
- <定量法>  
    日局「ロサルタンカリウム」の定量法に準ずる。(液体クロマトグラフィー)

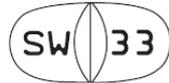
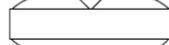
## IV. 製剤に関する項目

## 1. 剤形

## 1) 剤形の区別

割線入りフィルムコーティング錠

## 2) 製剤の外観及び性状

品名	ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」	ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」	ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」
外形	  	  	  
性状	白色		
直径(mm)	5.7	7.6	12.6×6.3
厚さ(mm)	3.0	3.3	4.7
重量(mg)	約77	約154	約308

## 3) 識別コード

## ●ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW 31

## ●ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW 32

## ●ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW 33

## 4) 製剤の物性

製剤均一性：日局ロサルタンカリウム錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局ロサルタンカリウム錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

## 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

品名	ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」	ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」	ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」
有効成分 [1錠中]	日局ロサルタンカリウム		
	25mg	50mg	100mg
添加剤	カルナウバロウ、結晶セルロース、酸化チタン、ステアリン酸Mg、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、部分アルファー化デンプン		

## 2) 電解質等の濃度

該当資料なし

## 3) 熱量

該当資料なし

## 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

## ●ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>1)</sup>

ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.6	99.6

※：表示量に対する含有率(%)

2) バラ包装品の安定性(加速試験)<sup>1)</sup>

ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

IV. 製剤に関する項目

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.6	99.9

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性試験<sup>2)</sup>

目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「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)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
590T1S1420	温度	40°C、遮光気密容器
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放
	室温	25°C/60%RH、遮光開放
	光	1000lx

結果

試験実施：2011年3月

試験項目	性状	硬度(kgf)	溶出試験	定量試験※
保存条件・期間				
イニシャル	(a)	7.0	適合	100.0
温度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 6.9	変化なし	変化なし 99.2
湿度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 6.0	変化なし	変化なし 99.0
室温(3ヵ月)	変化なし	変化なし 6.9	変化なし	変化なし 99.4
光(60万lx・hr)	変化なし	変化なし 7.0	変化なし	変化なし 99.2

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)、n=3の平均値  
(a)：白色の割線入りフィルムコーティング錠

●ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>3)</sup>

ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

## IV. 製剤に関する項目

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	101.1	99.9

※：表示量に対する含有率(%)

2)バラ包装品の安定性(加速試験)<sup>3)</sup>

ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶、乾燥剤入り)したものについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	101.1	100.4

※：表示量に対する含有率(%)

3)無包装下の安定性試験<sup>4)</sup>

## 目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

## 方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「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)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

## 試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
590T2S1421	温度	40°C、遮光気密容器
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放
	室温	25°C/60%RH、遮光開放
	光	1000lx

IV. 製剤に関する項目

結果

試験実施：2011年3月

試験項目 保存条件・期間	性状	硬度(kgf)	溶出試験	定量試験※
イニシャル	(a)	7.2	適合	100.0
温度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 7.8	変化なし	変化なし 99.5
湿度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 7.5	変化なし	変化なし 99.3
室温(3ヵ月)	変化なし	変化なし 7.9	変化なし	変化なし 99.7
光(60万lx・hr)	変化なし	変化なし 7.8	変化なし	変化なし 99.8

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)、n=3の平均値  
(a)：白色の割線入りフィルムコーティング錠

●ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)<sup>5)</sup>

ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」をPTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔)したもののについて、安定性試験を行った。  
その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠であった	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.7	100.1

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験<sup>6)</sup>

目的

本製剤の無包装状態の安定性を確認するため試験を実施する。

方法

無包装の本製剤を下記条件で保存した後、本製剤の[規格及び試験方法]に従い試験を実施する。その結果について「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)を参考に作成した評価分類基準<sup>A)</sup>に従い評価する。

試験検体及び保存条件

ロット番号	保存条件	
590T3S1420	温度	40°C、遮光気密容器
	湿度	25°C/75%RH、遮光開放
	室温	25°C/60%RH、遮光開放
	光	1000lx

## 結果

試験実施：2011年3月

試験項目 保存条件・期間	性状	硬度(kgf)	溶出試験	定量試験※
イニシャル	(a)	13.1	適合	100.0
温度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 13.7	変化なし	変化なし 100.0
湿度(3ヵ月)	変化なし	変化なし 14.0	変化なし	変化なし 100.1
室温(3ヵ月)	変化なし	変化なし 13.4	変化なし	変化なし 99.8
光(60万lx・hr)	変化なし	変化なし 12.5	変化なし	変化なし 99.2

※：イニシャルを100としたときの含有率(%), n=3の平均値  
(a)：白色で楕円形の割線入りフィルムコーティング錠

## A) 評価分類基準

## 【性状】

分類	評価基準
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合
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
変化あり(規格外)	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱している場合

## 【硬度】

分類	評価基準
変化なし	硬度変化が30%未満の場合
変化あり(規格内)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)以上の場合
変化あり(規格外)	硬度変化が30%以上で、硬度が2.0kgf(19.6N)未満の場合

## 【定量試験】

分類	評価基準
変化なし	含量低下が3%未満の場合
変化あり(規格内)	含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

## 【その他の試験項目】

分類	評価基準
変化なし	変化なし、または規格値内で変化する場合
変化あり(規格外)	規格値外の場合

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)……………  
該当資料なし

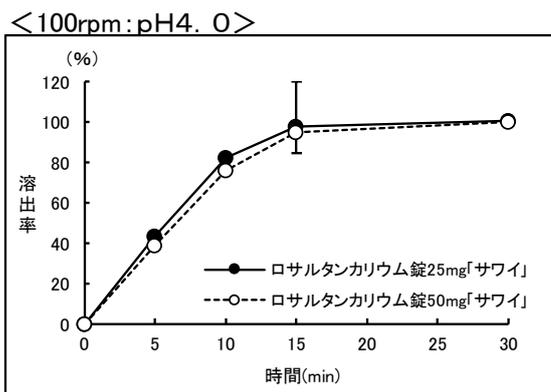
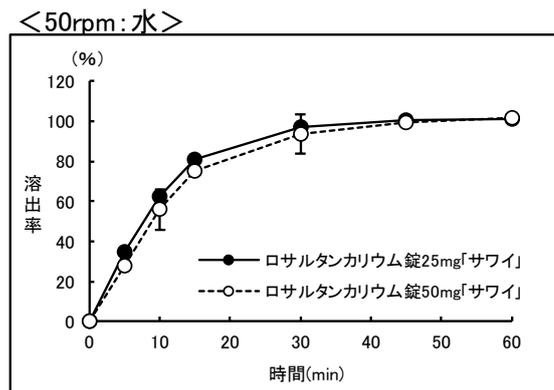
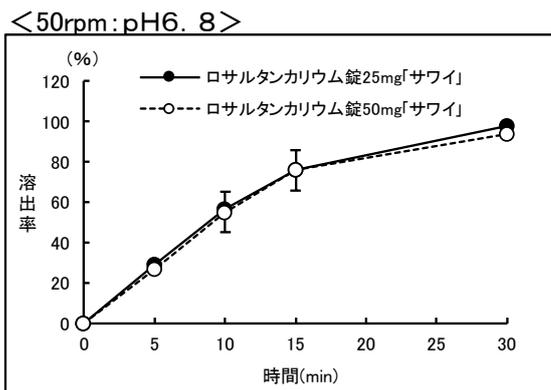
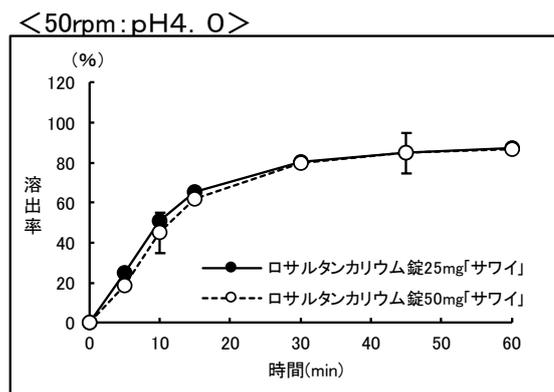
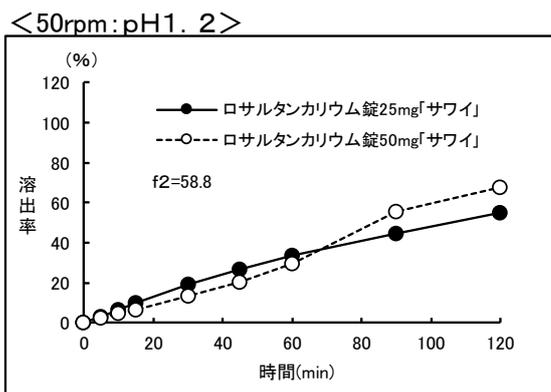
IV. 製剤に関する項目

9. 溶出性

<溶出挙動における同等性及び類似性>

●ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」<sup>7)</sup>

通知等	「含量が異なる経口固形製剤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	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水)、100rpm(pH4.0)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」	
標準製剤	ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」	
結果及び考察	<p>&lt;50rpm : pH1.2&gt; f2関数の値が55以上であった。 最終比較時点(120分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±20%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>&lt;50rpm : pH4.0&gt; 標準製剤の平均溶出率が40%(10分)及び85%(45分)付近の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±10%の範囲にあった。 最終比較時点(45分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6.8&gt; 標準製剤の平均溶出率が60%(10分)及び85%(15分)付近の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±10%の範囲にあった。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>&lt;50rpm : 水&gt; 標準製剤の平均溶出率が60%(10分)及び85%(30分)付近の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±10%の範囲にあった。 最終比較時点(30分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>&lt;100rpm : pH4.0&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。 最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがなかった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。 本剤の処方変更水準はB水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。</p>	



( I : 判定基準の適合範囲)

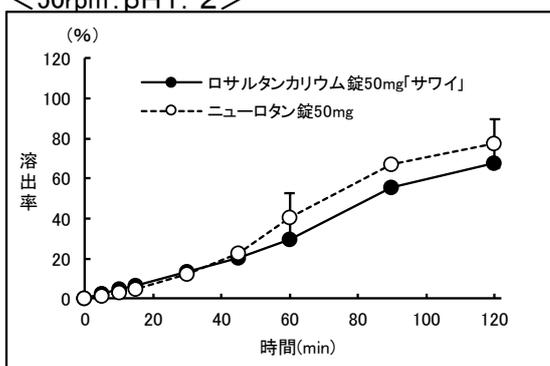
●ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」<sup>8, 9)</sup>

通知等	「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	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1. 2、5. 0、6. 8、水)、100rpm (pH5. 0)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」	
標準製剤	ニューロタン錠50mg	
結果及び考察	<p>&lt;50rpm : pH1. 2&gt; 標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(60分)及び規定された試験時間(120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±12%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH5. 0&gt; 標準製剤の平均溶出率が60%(15分)及び85%(30分)付近の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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;50rpm : pH6. 8&gt; 標準製剤の平均溶出率が60%(10分)及び85%(15分)付近の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%の範囲にあった。</p>	

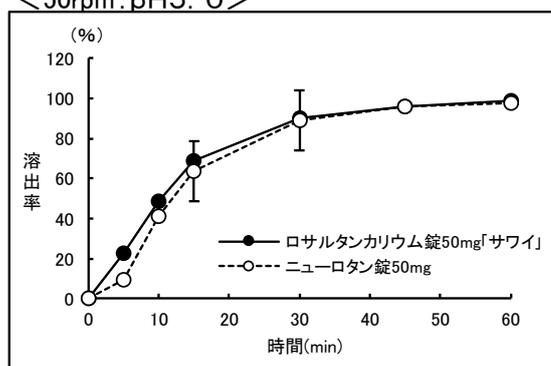
IV. 製剤に関する項目

結果 及び 考察	<p>&lt;50rpm : 水&gt; 標準製剤の平均溶出率が60% (10分) 及び85% (15分) 付近の 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%の範囲にあった。</p> <p>&lt;100rpm : pH5.0&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p>
----------------	---

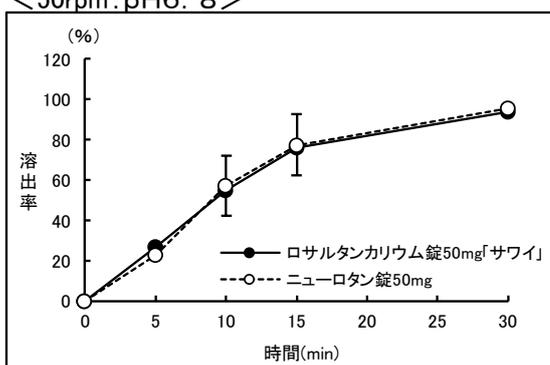
<50rpm : pH1.2>



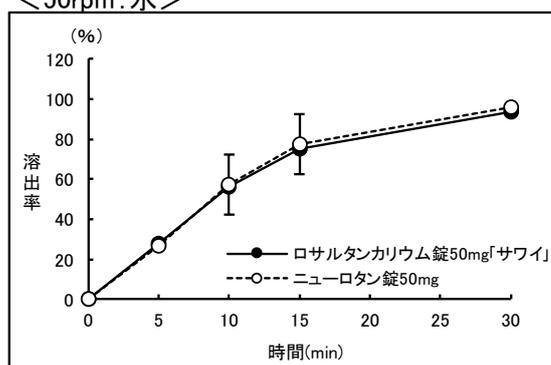
<50rpm : pH5.0>



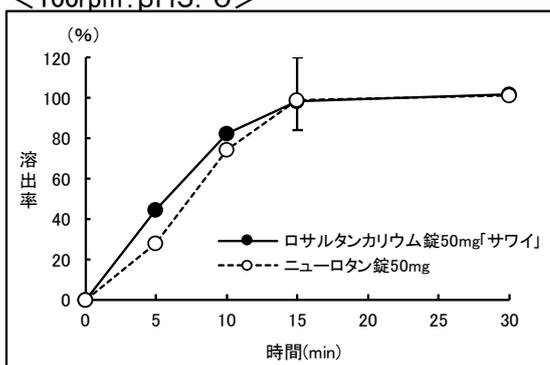
<50rpm : pH6.8>



<50rpm : 水>



<100rpm : pH5.0>



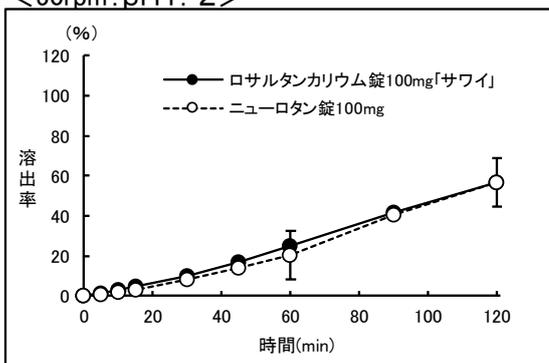
( I : 判定基準の適合範囲)

●ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」<sup>8,10)</sup>

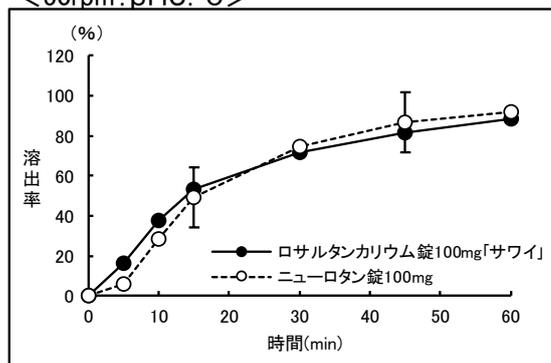
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」：平成18年11月24日 薬食審査 発第1124004号	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、5.0、6.8、水)、100rpm(pH5.0)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」	
標準製剤	ニューロタン錠100mg	

結果 及び 考察	<50rpm : pH1. 2> 標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(60分)及び規定された試験時間(120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±12%の範囲にあった。
	<50rpm : pH5. 0> 標準製剤の平均溶出率が40% (15分) 及び85% (45分) 付近の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%の範囲にあった。
	<50rpm : pH6. 8> 標準製剤の平均溶出率が60% (15分) 及び85% (30分) 付近の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%の範囲にあった。
	<50rpm : 水> 標準製剤の平均溶出率が60% (10分) 及び85% (30分) 付近の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%の範囲にあった。
	<100rpm : pH5. 0> 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。
	以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

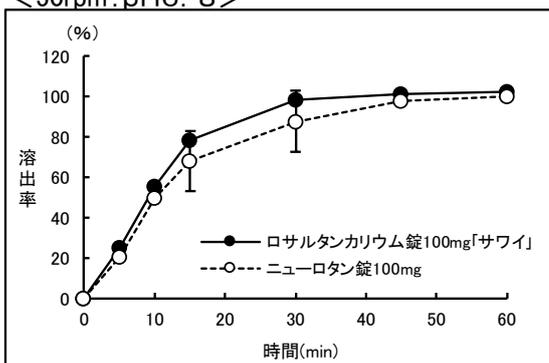
<50rpm : pH1. 2>



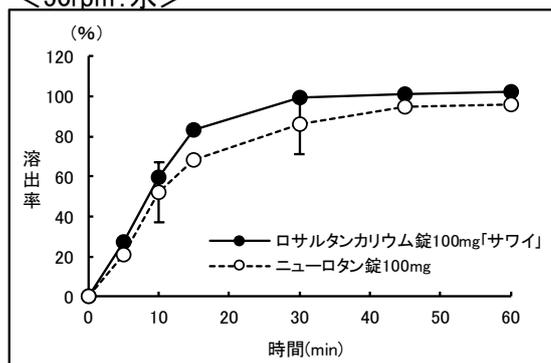
<50rpm : pH5. 0>



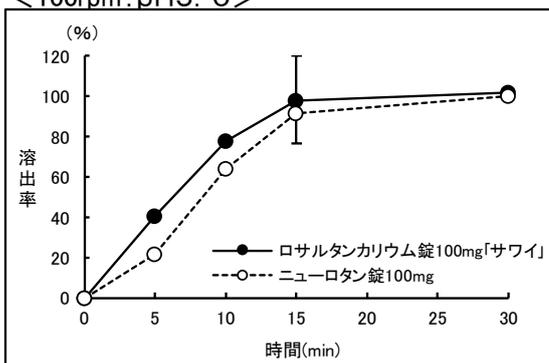
<50rpm : pH6. 8>



<50rpm : 水>



<100rpm : pH5. 0>



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

IV. 製剤に関する項目

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

該当資料なし

2) 包装

<p>22. 包装</p> <p>&lt;ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」&gt; PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50) バラ[乾燥剤入り]：500錠</p> <p>&lt;ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」&gt; PTP：100錠(10錠×10)、500錠(10錠×50) バラ[乾燥剤入り]：500錠</p> <p>&lt;ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」&gt; PTP：100錠(10錠×10)</p>
--

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

●ロサルタンカリウム錠25mg/錠50mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔

[ピロー]ポリプロピレンフィルム

バラ：[本体]ポリエチレン瓶、[キャップ]ポリエチレン、ポリプロピレン

●ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔

[ピロー]ポリプロピレンフィルム

11. 別途提供される資材類 .....

該当しない

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

- 高血圧症
- 高血圧及び蛋白尿を伴う2型糖尿病における糖尿病性腎症

### 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

〈高血圧及び蛋白尿を伴う2型糖尿病における糖尿病性腎症〉

高血圧及び蛋白尿(尿中アルブミン/クレアチニン比300mg/g以上)を合併しない患者における本剤の有効性及び安全性は確認されていない。

### 3. 用法及び用量

#### 1) 用法及び用量の解説

#### 6. 用法及び用量

〈高血圧症〉

通常、成人にはロサルタンカリウムとして25～50mgを1日1回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減するが、1日100mgまで増量できる。

〈高血圧及び蛋白尿を伴う2型糖尿病における糖尿病性腎症〉

通常、成人にはロサルタンカリウムとして50mgを1日1回経口投与する。なお、血圧値をみながら1日100mgまで増量できる。ただし、過度の血圧低下を起こすおそれのある患者等では25mgから投与を開始する。

#### 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

〈高血圧及び蛋白尿を伴う2型糖尿病における糖尿病性腎症〉

本剤を投与後、血清クレアチニン値が前回の検査値と比較して30%(あるいは1mg/dL)以上増加した場合、及び糸球体ろ過値、1/血清クレアチニン値の勾配等で評価した腎機能障害の進展速度が加速された場合は、減量あるいは投与中止を考慮すること。

### 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

## V. 治療に関する項目

### 4) 検証的試験

#### (1) 有効性検証試験

##### 17.1 有効性及び安全性に関する試験

###### <高血圧症>

##### 17.1.1 国内臨床試験

国内で実施された軽・中等症本態性高血圧症患者を対象とした二重盲検比較試験、重症高血圧症及び腎障害を伴う高血圧症を対象とした臨床試験において、臨床効果の概要は次のとおりである。

疾患名	例数	下降以上の例数(有効率)
軽・中等症本態性高血圧症	144	98 (68.1%)
重症高血圧症	34	21 (61.8%)
腎障害を伴う高血圧症	26	17 (65.4%)

なお、軽・中等症本態性高血圧症患者を対象とした二重盲検比較試験において、65歳以上の高齢者における降圧効果については、高齢者の有効率が67.7% (31例中21例)であり、非高齢者群(113例中77例、68.1%)と同様であった。

また、軽・中等症本態性高血圧症患者を対象とした二重盲検比較試験において、降圧効果に関するエナラプリルマレイン酸塩との同等性が検証され、ロサルタンカリウムの有用性が認められている。咳の発現率は、エナラプリルマレイン酸塩の13.3% (19例)に対し、ロサルタンカリウムでは0.7% (1例)であった<sup>11~13)</sup>。

##### 17.1.2 海外第Ⅲ相試験

アンジオテンシン変換酵素(ACE)阻害剤による咳の既往を有する患者を対象とした二重盲検比較試験で、リシノプリル投与群の咳の再発現率(71.7%)は、ヒドロクロチアジド投与群(34.1%)及びロサルタン投与群(29.2%)より有意に高く、ロサルタン投与群はヒドロクロチアジド投与群と同程度であった<sup>14)</sup>。

###### <高血圧及び蛋白尿を伴う2型糖尿病における糖尿病性腎症>

##### 17.1.3 国際共同第Ⅲ相試験

国際共同試験として実施された二重盲検比較試験 (RENAAL試験)において1,513例(日本人96例を含む)が評価された。本試験の主要エンドポイントは、血清クレアチニン値倍増、末期腎不全(透析あるいは腎移植の必要性)及び死亡の複合エンドポイントであった。ロサルタンカリウム(327例)は、プラセボ(359例)に比べて、主複合エンドポイントに到達するリスクを16.1%軽減( $p=0.022$ )させた。さらに、ロサルタンカリウム治療群において、血清クレアチニン値倍増で25.3% ( $p=0.006$ )、末期腎不全で28.6% ( $p=0.002$ )、末期腎不全又は死亡で19.9% ( $p=0.009$ )、血清クレアチニン値倍増又は末期腎不全で21.0% ( $p=0.010$ )のリスク軽減が認められた。エンドポイント構成要素である全原因による死亡率については、両治療群間で有意な差はみられなかった。本試験の二次エンドポイントは、尿蛋白の変化量、腎症の悪化率、心血管系疾患の罹病率及び死亡率の複合(心不全による入院、心筋梗塞、血行再建術、脳卒中、不安定狭心症による入院又は心血管系疾患による死亡)であった。ロサルタンカリウムを平均3.4年以上投与された群において、尿蛋白量が平均で34.3%低下( $p<0.001$ )した。また、ロサルタンカリウムは、血清クレアチニン値の逆数の傾きにより評価される腎機能低下率を13.9% ( $p=0.003$ )低下させた(低下率の中央値18.5%、 $p=0.01$ )。一方、心血管系疾患の罹病率及び死亡率の複合エンドポイントでは、ロサルタンカリウム治療群(247例)とプラセボ群(268例)との間に有意な差はみられなかったが、これは本試験がこのような効果に対する検出力を持ち合わせていなかったためである。なお、本試験におけるロサルタンカリウムの忍容性は良好であり、副作用による中止例の割合はプラセボ群と同等であった<sup>15)</sup>。

副作用は751例(日本人44例を含む)中129例(17.2%)に認められた。主な副作用は、めまい34例(4.5%)、高カリウム血症28例(3.7%)、低血圧19例(2.5%)、無力症/疲労12例(1.6%)であった。また、臨床検査値の異常変動は、111例(14.8%)に認められた。主な臨床検査値の異常変動は、血清カリウム上昇89例(11.9%)、クレアチニン上昇30例(4.0%)、BUN上昇10例(1.3%)であった<sup>16)</sup>。

(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

該当資料なし

## 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

アンジオテンシンⅡ受容体拮抗作用：バルサルタン、カンデサルタンシレキセチル、テルミサルタン、オルメサルタン メドキシミル、イルベサルタン、アジルサルタン<sup>17)</sup>

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、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

ロサルタンカリウムは経口投与後速やかに吸収され、その一部が主代謝物であるカルボン酸体に変換される。ロサルタン及びカルボン酸体は、いずれも生理的昇圧物質であるアンジオテンシンⅡ (A-Ⅱ) に対して、その受容体において特異的に拮抗し、降圧効果を発揮する。

#### 2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 アンジオテンシン受容体拮抗作用

18.2.1 A-Ⅱ受容体にはサブタイプが知られており、ロサルタン及びカルボン酸体は、AT<sub>1</sub>受容体と選択的に結合し、A-Ⅱの生理作用を阻害するが、アゴニスト作用は示さない<sup>18~20)</sup>。ブラジキニン分解酵素であるACE(キニナーゼⅡ)には直接の影響を及ぼさない<sup>21)</sup>。

18.2.2 実験動物(ラット)に対する外因性A-Ⅱ昇圧反応を抑制する<sup>19,20)</sup>。

##### 18.3 降圧作用

ロサルタンカリウム及びカルボン酸体は高血圧自然発症ラット<sup>22,23)</sup>、腎性高血圧ラット<sup>22,24)</sup>、高血圧自然発症イヌ<sup>25)</sup>、脳卒中易発症高血圧自然発症ラット<sup>26)</sup>等の高血圧モデル動物において、血圧を下降させ、連続経口投与中安定した降圧効果を示す。また、血圧の下降に伴う心拍数の増加を認めず、投与中止に伴う血圧のリバウンド現象は生じない<sup>22)</sup>。

##### 18.4 腎保護作用

ロサルタンは腎の輸出細動脈を選択的に拡張させ、糸球体内圧を低下させることにより糸球体への過剰負荷を改善する<sup>27)</sup>。また、ストレプトゾトシン誘発糖尿病ラット(インスリン依存性糖尿病モデル)<sup>28)</sup>、自然発症インスリン非依存性糖尿病マウス<sup>29)</sup>、5/6腎切除ラット<sup>30)</sup>等、糖尿病及び非糖尿病性の腎障害モデル動物において尿中蛋白排泄量の増加並びに腎組織障害を抑制する。

#### 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 血中濃度

##### 16.1.1 単回投与

健康成人にロサルタンカリウム25及び50mgを空腹時に1回経口投与した場合、ロサルタン及びカルボン酸体の血漿中濃度はそれぞれ投与約1時間及び約3時間でピークに達し、半減期は約2時間及び約4時間であり、カルボン酸体のAUC(血漿中濃度曲線下面積)はロサルタンの約7倍であった<sup>31)</sup>。

##### 16.1.2 反復投与

健康成人にロサルタンカリウム100mgを1日1回7日間連続経口投与した場合の血漿中濃度から、ロサルタン及びカルボン酸体の蓄積性は認められなかった<sup>32)</sup>。

### <生物学的同等性試験>

#### ●ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」<sup>7)</sup>

##### 16.8 その他

##### <ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」>

ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」は溶出挙動に基づき、ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」と生物学的に同等とみなされた。

### IV. -9. 参照

#### ●ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」<sup>8,33)</sup>

通知等	「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
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.33、1.67、2、2.5、3、4、6、8 hr
休薬期間	2日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」
標準製剤	ニューロタン錠50mg

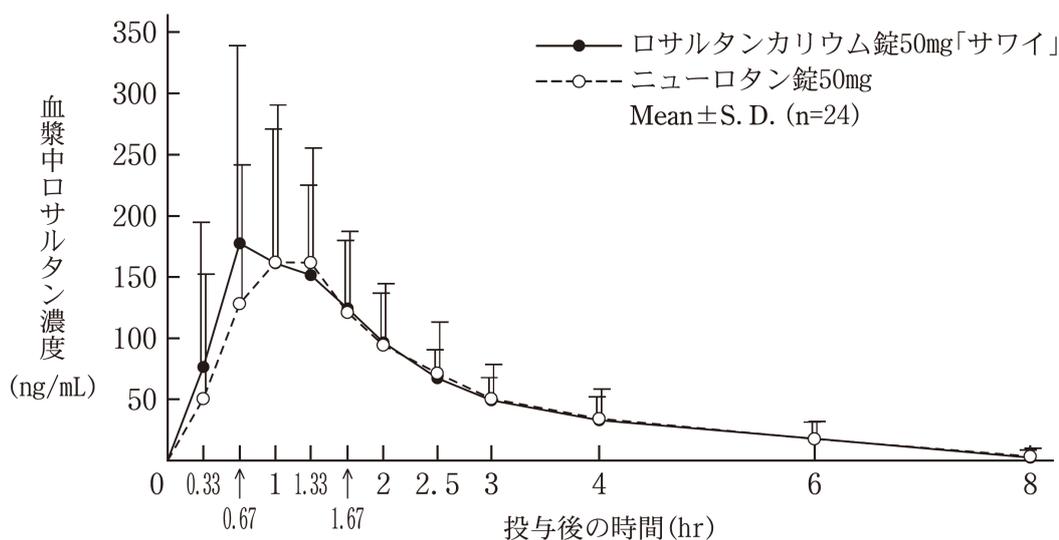
ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」とニューロタン錠50mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(ロサルタンカリウムとして50mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中ロサルタン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、AUCtは $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、また、Cmaxは対数値の平均値の差が $\log(0.90) \sim \log(1.11)$ の範囲内であり、かつ、溶出試験で溶出挙動が類似であることから、両剤の生物学的同等性が確認された。

VII. 薬物動態に関する項目

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-8hr</sub> (ng・hr/mL)
ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」	242.6±131.9	1.2±0.8	1.8±0.4	429.7±157.4
ニューロタン錠50mg	242.8±99.1	1.2±0.8	1.8±0.5	411.6±144.7

(Mean±S.D.)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC <sub>0-8hr</sub>	log(1.04)	log(0.98)～log(1.10)
Cmax	log(0.95)	log(0.78)～log(1.17)

血漿中濃度ならびにAUCt、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。

●ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」<sup>8,34)</sup>

通知等	「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
採血時点	0、0.33、0.67、1、1.33、1.67、2、2.5、3、4、6、8 hr
休薬期間	2日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」
標準製剤	ニューロタン錠100mg

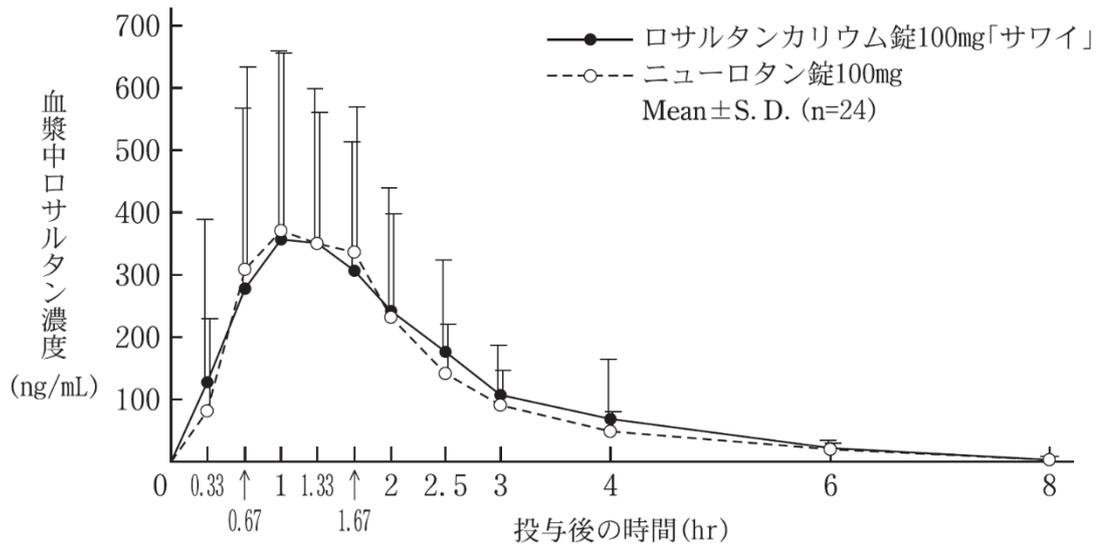
ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」とニューロタン錠100mgを健康成人男子にそれぞれ1錠（ロサルタンカリウムとして100mg）空腹時単回経口投与（クロスオーバー法）し、血漿中ロサルタン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUCt、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

VII. 薬物動態に関する項目

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-8hr</sub> (ng・hr/mL)
ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」	607.4±263.2	1.4±0.8	1.5±0.4	892.9±327.8
ニューロタン錠100mg	618.6±255.5	1.2±0.5	1.5±0.4	834.7±303.9

(Mean±S.D.)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC <sub>0-8hr</sub>	log(1.07)	log(1.01)～log(1.13)
Cmax	log(0.97)	log(0.83)～log(1.14)

血漿中濃度ならびにAUCt、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

16.2 吸収

健康成人にロサルタンカリウム100mgを食後及び空腹時に1回経口投与した場合、吸収速度は食後投与で低下したが、吸収量の減少は僅かであった<sup>31)</sup>。

VIII. -7. 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

## VII. 薬物動態に関する項目

### 3) 消失速度定数

● ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(ロサルタンカリウムとして50mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>8, 33)</sup>

0.401±0.105hr<sup>-1</sup>

● ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(ロサルタンカリウムとして100mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>8, 34)</sup>

0.492±0.126hr<sup>-1</sup>

### 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 .....

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

VIII. -6. -5) 参照

### 3) 乳汁への移行性

VIII. -6. -6) 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

該当資料なし

6. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

健康成人にロサルタンカリウム25、50、100又は200mg<sup>注)</sup>を1回経口投与した場合、速やかに吸収され、主に肝臓において主代謝物であるカルボン酸体(イミダゾール環の5-ヒドロキシメチル基の酸化物)に変換される<sup>31)</sup>。

注)本剤の承認された1回用量は25～100mgである。

2) 代謝に関与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

VIII. -7. 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

VIII. -7. 参照

7. 排泄

16.5 排泄

健康成人にロサルタンカリウム25、50、100又は200mg<sup>注)</sup>を1回経口投与した場合、投与後30時間までのロサルタン及びカルボン酸体の尿中排泄率は各投与量のそれぞれ3.2～4.1%及び6.1～7.9%であった<sup>31)</sup>。

注)本剤の承認された1回用量は25～100mgである。

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

VII. -10. 参照

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎障害患者

腎障害を伴う高血圧症患者に、ロサルタンカリウム50mgを食後1回経口投与した場合、血清クレアチニン値の高い群ほどロサルタン並びにカルボン酸体の最高血漿中濃度(C<sub>max</sub>)及びAUCは大きな値を示した。

血清クレアチニン値3.0mg/dL以上の群では1.5mg/dL未満の群に比較してロサルタンのC<sub>max</sub>及びAUCは2.4及び2.2倍に、カルボン酸体では1.6及び2.0倍の値を示した<sup>35)</sup>。

## VII. 薬物動態に関する項目

### 16.6.2 透析患者

高血圧症を伴う透析患者に、ロサルタンカリウム50mgを空腹時に1回経口投与した場合、ロサルタンの $C_{max}$ 及びAUCはいずれも増加し、健康成人男子及び高血圧症患者と比較してロサルタンの $C_{max}$ 及びAUCはそれぞれ約2及び3～4倍の値を示した<sup>36,37)</sup>。

透析患者にロサルタンを投与したとき、ロサルタン及びカルボン酸体は透析により血漿中から除去されないことが報告されている<sup>38)</sup>(外国人データ)。<sup>[9.2.2参照]</sup>

### 16.6.3 高齢者

健康高齢者及び健康非高齢者に、ロサルタンカリウム50mgを空腹時に1回経口投与した場合、ロサルタンの吸収速度に差はみられなかったが、高齢者ではロサルタンの $C_{max}$ 及びAUCは非高齢者の約2倍を示した。一方、高齢者におけるカルボン酸体の平均 $C_{max}$ 及びAUCは、非高齢者に比べてそれぞれ約25及び27%の軽度な増加であった<sup>39)</sup>。<sup>[9.8.3参照]</sup>

## 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 妊婦又は妊娠している可能性のある女性[9.5参照]
  - 2.3 重篤な肝障害のある患者[9.3.1参照]
  - 2.4 アリスキレンを投与中の糖尿病患者(ただし、他の降圧治療を行ってもなお血圧のコントロールが著しく不良の患者を除く)[10.1 参照]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由……………  
V. -2. 参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由……………  
V. -4. 参照

5. 重要な基本的注意とその理由……………

8. 重要な基本的注意
- <効能共通>
- 8.1 一過性の血圧低下(ショック症状、意識消失、呼吸困難等を伴う)を起こすおそれがあるので、本剤投与中は定期的(投与開始時：2週間ごと、安定後：月1回程度)に血圧のモニタリングを実施すること。
  - 8.2 降圧作用に基づくめまい、ふらつき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。
  - 8.3 手術前24時間は投与しないことが望ましい。アンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤投与中の患者は、麻酔及び手術中にレニン・アンジオテンシン系の抑制作用による高度な血圧低下を起こすおそれがある。
  - 8.4 本剤を含むアンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤投与中にまれに肝炎等の重篤な肝障害があらわれたとの報告がある。肝機能検査を実施するなど、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するなど適切な処置を行うこと。
- <高血圧及び蛋白尿を伴う2型糖尿病における糖尿病性腎症>
- 8.5 貧血があらわれやすいので、本剤投与中は定期的(投与開始時：2週間ごと、安定後：月1回程度)に血液検査を実施するなど観察を十分に行うこと。
  - 8.6 血清カリウム上昇及び血清クレアチニン上昇があらわれやすいので、本剤投与中は定期的(投与開始時：2週間ごと、安定後：月1回程度)に血清カリウム値及び血清クレアチニン値のモニタリングを実施すること。

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 両側性腎動脈狭窄のある患者又は片腎で腎動脈狭窄のある患者  
治療上やむを得ないと判断される場合を除き、使用は避けること。腎血流量の減少や糸球体ろ過圧の低下により急速に腎機能を悪化させるおそれがある。

## VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

### 9.1.2 高カリウム血症の患者

治療上やむを得ないと判断される場合を除き、使用は避けること。高カリウム血症を増悪させるおそれがある。

また、腎機能障害、コントロール不良の糖尿病等により血清カリウム値が高くなりやすい患者では、血清カリウム値に注意すること。[9.2.1参照]

### 9.1.3 脳血管障害のある患者

過度の降圧が脳血流不全を惹起し、病態を悪化させるおそれがある。

### 9.1.4 嚴重な減塩療法中の患者

本剤の投与を低用量から開始し、増量する場合は徐々に行うこと。一過性の血圧低下を起こすおそれがある。[11.1.5参照]

## 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(血清クレアチニン2.5mg/dL以上)のある患者

投与量を減らすなど慎重に投与すること。高カリウム血症があらわれやすい。また、腎機能の悪化が起きるおそれがある。[9.1.2参照]

#### 9.2.2 血液透析中の患者

本剤の投与を低用量から開始し、増量する場合は徐々に行うこと。一過性の血圧低下を起こすおそれがある。[11.1.5、16.6.2参照]

## 3) 肝機能障害患者

### 9.3 肝機能障害患者

#### 9.3.1 重篤な肝障害のある患者

投与しないこと。[2.3、9.3.2参照]

#### 9.3.2 肝機能障害又はその既往のある患者(ただし、重篤な肝障害のある患者を除く)

外国において、健康成人と比較して軽・中等度のアルコール性肝硬変患者ではロサルタンの消失速度が遅延し、ロサルタン及びカルボン酸体の血漿中濃度がそれぞれ約5倍及び約2倍に上昇することが報告されている。[9.3.1参照]

## 4) 生殖能を有する者

### 9.4 生殖能を有する者

#### 9.4.1 妊娠する可能性のある女性

妊娠していることが把握されずアンジオテンシン変換酵素阻害剤又はアンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤を使用し、胎児・新生児への影響(腎不全、頭蓋・肺・腎の形成不全、死亡等)が認められた例が報告されている<sup>40,41)</sup>。

本剤の投与に先立ち、代替薬の有無等も考慮して本剤投与の必要性を慎重に検討し、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。また、投与が必要な場合には次の注意事項に留意すること。[9.5参照]

(1) 本剤投与開始前に妊娠していないことを確認すること。本剤投与中も、妊娠していないことを定期的に確認すること。投与中に妊娠が判明した場合には、直ちに投与を中止すること。

(2) 次の事項について、本剤投与開始時に患者に説明すること。また、投与中も必要に応じ説明すること。

- ・ 妊娠中に本剤を使用した場合、胎児・新生児に影響を及ぼすリスクがあること。
- ・ 妊娠が判明した又は疑われる場合は、速やかに担当医に相談すること。
- ・ 妊娠を計画する場合は、担当医に相談すること。

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は投与しないこと。投与中に妊娠が判明した場合には、直ちに投与を中止すること。妊娠中期及び末期にアンジオテンシン変換酵素阻害剤又はアンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤を投与された患者で羊水過少症、胎児・新生児の死亡、新生児の低血圧、腎不全、多臓器不全、頭蓋の形成不全及び羊水過少症によると推測される四肢の拘縮、頭蓋顔面の奇形、肺の低形成等があらわれたとの報告がある。[2.2、9.4.1参照]

6) 授乳婦

**9.6 授乳婦**  
 授乳しないことが望ましい。動物実験(ラット)で乳汁中へ移行することが報告されている。ラットの周産期及び授乳期に10~100mg/kg/日投与した試験において、100mg/kg/日で産児死亡の軽度の増加が認められた。また、各投与群で産児の低体重が認められ、本試験の無毒性量は追加試験の成績から5mg/kg/日であった<sup>42,43)</sup>。

7) 小児等

**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。

8) 高齢者

**9.8 高齢者**  
**9.8.1** 一般に生理機能が低下しているので、患者の状態に注意すること。  
**9.8.2** 低用量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。脳梗塞等が起こるおそれがある。  
**9.8.3** 高齢者での体内薬物動態試験で、ロサルタン及びカルボン酸体の血漿中濃度が非高齢者に比べて高かった。[16.6.3参照]

7. 相互作用.....

**10. 相互作用**  
 本剤は、薬物代謝酵素チトクロームP450 2C9(CYP2C9)及び3A4(CYP3A4)により活性化代謝物であるカルボン酸体に代謝される。

1) 併用禁忌とその理由

**10.1 併用禁忌(併用しないこと)**

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アリスキレン ラジレス (糖尿病患者に使用する場合。ただし、他の降圧治療を行ってもなお血圧のコントロールが著しく不良の患者を除く。) [2.4参照]	非致死性脳卒中、腎機能障害、高カリウム血症及び低血圧のリスク増加が報告されている。	レニン・アンジオテンシン系阻害作用が増強される可能性がある。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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
カリウム保持性利尿剤： スピロノラクトン トリアムテレン等 カリウム補給剤： 塩化カリウム アンジオテンシン変換酵素 阻害剤 トリメトプリム含有製剤： スルファメトキサゾール・ トリメトプリム	血清カリウム上昇、高カリウ ム血症を起こすおそれがあ る。	カリウム貯留作用が増強す るおそれがある。腎機能障害 のある患者には特に注意す ること。 また、本剤とアンジオテンシ ン変換酵素阻害剤及びカリ ウム保持性利尿剤の3剤併 用の場合には特に注意する こと。
利尿降圧剤： フロセミド トリクロルメチアジド等 [11.1.5参照]	一過性の血圧低下を起こす おそれがある。本剤の投与を 低用量から開始し、増量する 場合は徐々に行うこと。	利尿降圧剤で治療を受けて いる患者にはレニン活性が 亢進している患者が多く、本 剤が奏効しやすい。
アリスキレン	腎機能障害、高カリウム血症 及び低血圧を起こすおそれ がある。eGFRが60mL/min/ 1.73m <sup>2</sup> 未満の腎機能障害の ある患者へのアリスキレン との併用については、治療上 やむを得ないと判断される 場合を除き避けること。	レニン・アンジオテンシン系 阻害作用が増強される可能 性がある。
アンジオテンシン変換酵素 阻害剤	急性腎障害、高カリウム血症 のリスクが増加するとの報 告がある。また、低血圧を起 こすおそれがある。	
非ステロイド性消炎鎮痛剤： インドメタシン等	降圧作用が減弱されるおそ れがある。	プロスタグランジンの合成 阻害作用により、本剤の降圧 作用を減弱させる可能性が ある。
	腎機能が悪化している患者 では、さらに腎機能が悪化す るおそれがある。	プロスタグランジンの合成 阻害作用により、腎血流量が 低下するためと考えられる。
リチウム： 炭酸リチウム	リチウム中毒が報告されて いる。血中リチウム濃度に注 意すること。	本剤のナトリウム排泄作用 により、リチウムの蓄積が起 こると考えられている。
グレープフルーツジュース	降圧作用が減弱されるおそ れがある。本剤の投与中はグ レープフルーツジュースの 摂取は避けること。	グレープフルーツジュース に含まれる成分のCYP3A4 阻害作用によりロサルタン の活性代謝物の血中濃度が 低下するため、本剤の降圧作 用が減弱されるおそれがあ 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 アナフィラキシー(頻度不明)

不快感、口内異常感、発汗、蕁麻疹、呼吸困難、全身潮紅、浮腫等があらわれることがある。

## 11.1.2 血管浮腫(頻度不明)

顔面、口唇、咽頭、舌等の腫脹があらわれることがある。

## 11.1.3 急性肝炎又は劇症肝炎(いずれも頻度不明)

## 11.1.4 腎不全(頻度不明)

## 11.1.5 ショック、失神、意識消失(いずれも頻度不明)

冷感、嘔吐、意識消失等があらわれた場合には、直ちに適切な処置を行うこと。[9.1.4、9.2.2、10.2参照]

## 11.1.6 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を特徴とする横紋筋融解症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。

## 11.1.7 高カリウム血症(頻度不明)

## 11.1.8 不整脈(頻度不明)

心室性期外収縮、心房細動等の不整脈があらわれることがある。

## 11.1.9 汎血球減少、白血球減少、血小板減少(いずれも頻度不明)

## 11.1.10 低血糖(頻度不明)

脱力感、空腹感、冷汗、手の震え、集中力低下、痙攣、意識障害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。糖尿病治療中の患者であらわれやすい。

## 11.1.11 低ナトリウム血症(頻度不明)

倦怠感、食欲不振、嘔気、嘔吐、痙攣、意識障害等を伴う低ナトリウム血症があらわれることがある。

## 2) その他の副作用

## 11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	頻度不明
精神神経系	頭痛、めまい、不眠、浮遊感	耳鳴、眠気
循環器系	低血圧、起立性低血圧、胸痛	調律障害(頻脈等)、動悸
消化器	口角炎、嘔吐・嘔気、胃不快感、胃潰瘍	口内炎、下痢、口渇
肝臓	肝機能障害(AST上昇、ALT上昇、LDH上昇等)	黄疸
腎臓	BUN上昇、クレアチニン上昇	
皮膚	発疹、そう痒	蕁麻疹、多形紅斑、光線過敏、紅皮症、紅斑
血液	赤血球減少、ヘマトクリット低下、好酸球増多	貧血
その他	ほてり、倦怠感、無力症/疲労、浮腫、筋肉痛、総コレステロール上昇、CK上昇、血中尿酸値上昇	咳嗽、発熱、味覚障害、しびれ感、眼症状(かすみ、異和感等)、関節痛、筋痙攣、女性化乳房、勃起不全

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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 .....  
設定されていない

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

設定されていない

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」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 .....

規制区分	
製剤	処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
有効成分	該当しない

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間 .....

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 .....

<p><b>20. 取扱い上の注意</b> 開封後は湿気を避けて保存すること。</p>
---

5. 患者向け資材 .....

患者向医薬品ガイド：あり、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材

**XIII. -2. 参照**

6. 同一成分・同効薬 .....

同一成分：ニューロタン錠25mg/錠50mg/錠100mg

同効薬：アンジオテンシンII受容体拮抗作用

バルサルタン、カンデサルタンシレキセチル、テルミサルタン、オルメサルタン、メドキシミル、イルベサルタン、アジルサルタン<sup>17)</sup>

7. 国際誕生年月日 .....

該当しない

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 .....

●ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」

製品名	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
ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」	2012年2月15日	22400AMX00241000	2012年6月22日	2012年6月22日

●ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」

製品名	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
ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」	2012年2月15日	22400AMX00242000	2012年6月22日	2012年6月22日

●ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」

製品名	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
ロサルタンカリウム 錠100mg「サワイ」	2012年 2月15日	22400AMX00243000	2012年 6月22日	2012年 6月22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

承認年月日：2012年 7月18日

効能又は効果内容：「高血圧及び蛋白尿を伴う 2 型糖尿病における糖尿病性腎症」の効能又は効果を追加した。

用法及び用量内容：効能又は効果追加に伴い、関連の用法及び用量を追加した。

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

品名	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番号	レセプト電算処理 システム用コード
ロサルタンカリウム 錠25mg「サワイ」	2149039F1279	2149039F1279	121686801	622168601
ロサルタンカリウム 錠50mg「サワイ」	2149039F2275	2149039F2275	121687501	622168701
ロサルタンカリウム 錠100mg「サワイ」	2149039F3263	2149039F3263	121688201	622168801

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

- 1) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」
- 2) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[加速試験] ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」
- 8) 陶易王他：診療と新薬，2012；49(3)：297-307
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」
- 10) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」
- 11) 吉永馨他：医学のあゆみ，1995；172：785-823
- 12) 吉永馨他：臨床医薬，1994；10(Supple. 6)：123-140
- 13) 吉永馨他：臨床医薬，1994；10(Supple. 6)：103-122
- 14) Lacourcière, Y. et al. : J. Hypertens., 1994 ; 12 : 1387-1393
- 15) Brenner, B. M. et al. : N. Engl. J. Med., 2001 ; 345 : 861-869
- 16) 国際共同第Ⅲ相試験(ニューロタン錠：2006年4月20日承認、申請資料概要ト. 1.(3)3))
- 17) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>>  
(2024/2/1 アクセス)
- 18) Chiu, A. T. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., 1990 ; 252 : 711-718
- 19) Wong, P. C. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., 1990 ; 255 : 211-217
- 20) Wong, P. C. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., 1990 ; 252 : 719-725
- 21) Mizuno, K. et al. : Eur. J. Pharmacol., 1992 ; 215 : 305-308
- 22) 岡田恵他：基礎と臨床，1994；28：4063-4073
- 23) Wong, P. C. et al. : Hypertension, 1990 ; 15 : 459-468
- 24) Wong, P. C. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., 1990 ; 252 : 726-732
- 25) Bovee, K. C. et al. : Am. J. Hypertens., 1991 ; 4 : 327S-333S
- 26) Okada, M. et al. : Hypertens. Res., 1993 ; 16 : 49-55
- 27) Anderson, S. et al. : Am. J. Physiol., 1993 ; 265 : F477-486
- 28) Remuzzi, A. et al. : J. Am. Soc. Nephrol., 1993 ; 4 : 40-49
- 29) Sasaki, M. et al. : Life Sci., 2004 ; 75 : 869-880
- 30) Pollock, D. M. et al. : J. Pharmacol. Exp. Ther., 1993 ; 267 : 657-663
- 31) 中島光好他：臨床薬理，1995；26：671-684
- 32) 中島光好他：臨床薬理，1995；26：685-696
- 33) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」
- 34) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」
- 35) 猿田享男他：臨床医薬，1994；10(Supple. 6)：157-171
- 36) 多川斉他：臨床透析，1995；11：247-264
- 37) 透析患者①(ニューロタン錠：2006年4月20日承認、申請資料概要へ。(2)1))
- 38) 透析患者②(ニューロタン錠：2006年4月20日承認、申請資料概要へ。(3)3))
- 39) 高齢者(ニューロタン錠：2006年4月20日承認、申請資料概要へ。(1)1)①)
- 40) 阿部真也他：周産期医学，2017；47：1353-1355
- 41) 齊藤大祐他：鹿児島産科婦人科学会雑誌，2021；29：49-54

- 42) Spence, S. G. et al. : Teratology, 1995 ; 51 : 383-397  
43) Spence, S. G. et al. : Teratology, 1995 ; 51 : 367-382  
44) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」  
45) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」  
46) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」  
47) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」  
48) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」  
49) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」

## 2. その他の参考文献 .....

(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”西岡豊他.錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報.改訂6版,医薬ジャーナル社,2009, p441-444

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....
  
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

###### <粉砕後の安定性試験>

###### ●ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」<sup>44)</sup>

ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験*	100.0	100.2	100.5	100.9

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

###### ●ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」<sup>45)</sup>

ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験*	100.0	100.2	100.3	100.2

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

###### ●ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」<sup>46)</sup>

ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」を粉砕後、以下の保存条件下で30日間保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	透明瓶開放 (室温、30日)	透明瓶密栓 (室温、30日)	褐色瓶密栓 (室温、30日)
性状	白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量試験*	100.0	99.2	100.0	100.4

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

## 2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

### <崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験>

#### ●ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」<sup>47)</sup>

##### 試験方法

1. ロサルタンカリウム錠25mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

##### 結 果

懸濁状態	錠剤は完全には崩壊しなかった
チューブ通過性	—

##### 備考

- ・10分時点で錠剤が完全には崩壊していなかったが、更に放置したところ、15分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。シリンジ内の液は8Fr. チューブを通過した。
- ・錠剤が崩壊するのに時間を要したことから、別途コーティングを破壊(錠剤を薬包紙に包み、木槌で2回たたき)して試験を行った。その結果、錠剤は5分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。シリンジ内の液は8Fr. チューブを通過した。

#### ●ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」<sup>48)</sup>

##### 試験方法

1. ロサルタンカリウム錠50mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

##### 結 果

懸濁状態	錠剤は完全には崩壊しなかった
チューブ通過性	—

##### 備考

- ・10分時点で錠剤が完全には崩壊していなかったが、更に放置したところ、20分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。
- ・錠剤が崩壊するのに時間を要したことから、別途コーティングを破壊(錠剤を薬包紙に包み、木槌で2回たたき)して試験を行った。その結果、錠剤は10分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。シリンジ内の液は8Fr. チューブを通過した。

#### ●ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」<sup>49)</sup>

1. ロサルタンカリウム錠100mg「サワイ」を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取して放置した。
2. 5分後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行った。
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、通過状態を観察した。

##### 結 果

懸濁状態	錠剤は完全には崩壊しなかった
チューブ通過性	—

## 備考

- ・10分時点で錠剤が完全には崩壊していなかったが、更に放置したところ、25分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。
- ・錠剤が崩壊するのに時間を要したことから、別途コーティングを破壊(錠剤を薬包紙に包み、木槌で2回たたき)して試験を行った。その結果、錠剤は10分後に崩壊し、転倒混和により懸濁液となった。シリンジ内の液は8 Fr. チューブを通過した。

## 2. その他の関連資料 .....

### 患者向け資料

- ・サワイの降圧薬を服用される方へ 血圧手帳【数値式】
- ・気をつけよう！血圧と生活習慣
- ・ACE阻害薬/ARBを使用する女性の患者さんへ
- ・自動車運転等は注意してください・お知らせ指導箋

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照





