

## 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 2013 に準拠して作成[一部 2018(2019年更新版)に準拠]

### A-Ⅱアンタゴニスト

日本薬局方 ロサルタンカリウム錠

**ロサルタンK錠 25mg 「オーハラ」**

**ロサルタンK錠 50mg 「オーハラ」**

**ロサルタンK錠 100mg 「オーハラ」**

LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 25mg 「OHARA」

LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 50mg 「OHARA」

LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 100mg 「OHARA」

剤形	錠剤(円形の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	25mg 錠：1 錠中日局ロサルタンカリウム 25mg を含有する。 50mg 錠：1 錠中日局ロサルタンカリウム 50mg を含有する。 100mg 錠：1 錠中日局ロサルタンカリウム 100mg を含有する。
一般名	和名：ロサルタンカリウム [JAN] 洋名：Losartan Potassium [JAN] Losartan [INN]
製造販売承認年月日 薬価基準収載 ・発売年月日	製造販売承認年月日：2012年2月15日 製造販売一部変更承認年月日：2012年7月18日(効能・効果追加による) 薬価基準収載年月日：2012年6月22日 発売年月日：2012年6月22日
開発・製造販売(輸入) ・提携・販売会社名	製造販売会社名：大原薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	大原薬品工業株式会社 お客様相談室 フリーダイヤル 0120-419-363 URL <a href="https://www.ohara-ch.co.jp">https://www.ohara-ch.co.jp</a>

本 IF は 2018 年 8 月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、PMDA ホームページ「医薬品に関する情報」

<http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>にてご確認ください。

## IF 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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ（<http://www.info.pmda.go.jp/>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

### 2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

#### [IF の作成]

- ① IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤，注射剤，外用剤）に作成される。
- ② IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③ 添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④ 製薬企業の機密等に関するもの，製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤ 「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下，「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は，電子媒体での提供を基本とし，必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

#### [IF の発行]

- ① 「IF 記載要領 2013」は，平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ② 上記以外の医薬品については，「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③ 使用上の注意の改訂，再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ，記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

### 3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては，PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は，電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については，医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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，当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等，あるいは医薬品医療機器情報配信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，最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお，適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり，その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし，薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により，製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて，当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから，記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は，IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり，インターネットでの公開等も踏まえ，薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

# 目 次

## I 概要に関する項目

1. 開発の経緯…………… 1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性…………… 1

## II 名称に関する項目

1. 販売名…………… 2
  - (1) 和名…………… 2
  - (2) 洋名…………… 2
  - (3) 名称の由来…………… 2
2. 一般名…………… 2
  - (1) 和名 (命名法) …… 2
  - (2) 洋名 (命名法) …… 2
  - (3) ステム…………… 2
3. 構造式又は示性式…………… 2
4. 分子式及び分子量…………… 3
5. 化学名 (命名法) …… 3
6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号…………… 3
7. CAS 登録番号…………… 3

## III 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質…………… 4
  - (1) 外観・性状…………… 4
  - (2) 溶解性…………… 4
  - (3) 吸湿性…………… 4
  - (4) 融点 (分解点), 沸点, 凝固点…………… 4
  - (5) 酸塩基解離定数…………… 4
  - (6) 分配係数…………… 4
  - (7) その他の主な示性値…………… 4
2. 有効成分の各種条件下における安定性…………… 4
3. 有効成分の確認試験法…………… 4
4. 有効成分の定量法…………… 4

## IV 製剤に関する項目

1. 剤形…………… 5
  - (1) 剤形の区別, 外観及び性状…………… 5
  - (2) 製剤の物性…………… 5
  - (3) 識別コード…………… 5
  - (4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等…………… 5
2. 製剤の組成…………… 6
  - (1) 有効成分 (活性成分) の含量…………… 6
  - (2) 添加物…………… 6
  - (3) その他…………… 6
3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意…………… 6
4. 製剤の各種条件下における安定性…………… 6
5. 調製法及び溶解後の安定性…………… 7

6. 他剤との配合変化 (物理化学的变化) …… 7
7. 溶出性…………… 8
8. 生物学的試験法…………… 12
9. 製剤中の有効成分の確認試験法…………… 12
10. 製剤中の有効成分の定量法…………… 12
11. 力価…………… 12
12. 混入する可能性のある夾雑物…………… 12
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報…………… 13
14. その他…………… 13

## V 治療に関する項目

1. 効能又は効果…………… 14
2. 用法及び用量…………… 14
3. 臨床成績…………… 14
  - (1) 臨床データパッケージ…………… 14
  - (2) 臨床効果…………… 14
  - (3) 臨床薬理試験…………… 14
  - (4) 探索的試験…………… 14
  - (5) 検証的試験…………… 14
  - (6) 治療的使用…………… 15

## VI 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群…………… 16
2. 薬理作用…………… 16
  - (1) 作用部位・作用機序…………… 16
  - (2) 薬効を裏付ける試験成績…………… 16
  - (3) 作用発現時間・持続時間…………… 16

## VII 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法…………… 17
  - (1) 治療上有効な血中濃度…………… 17
  - (2) 最高血中濃度到達時間…………… 17
  - (3) 臨床試験で確認された血中濃度…………… 17
  - (4) 中毒域…………… 21
  - (5) 食事・併用薬の影響…………… 21
  - (6) 母集団 (ポピュレーション) 解析により判明した薬物体内動態変動要因…………… 21
2. 薬物速度論的パラメータ…………… 21
  - (1) 解析方法…………… 21
  - (2) 吸収速度定数…………… 21
  - (3) バイオアベイラビリティ…………… 21
  - (4) 消失速度定数…………… 21
  - (5) クリアランス…………… 21
  - (6) 分布容積…………… 21
  - (7) 血漿蛋白結合率…………… 21
3. 吸収…………… 21
4. 分布…………… 22

(1) 血液－脳関門通過性	22	(2) 副次的薬理試験	32
(2) 血液－胎盤関門通過性	22	(3) 安全性薬理試験	32
(3) 乳汁への移行性	22	(4) その他の薬理試験	32
(4) 髄液への移行性	22	2. 毒性試験	32
(5) その他の組織への移行性	22	(1) 単回投与毒性試験	32
5. 代謝	22	(2) 反復投与毒性試験	32
(1) 代謝部位及び代謝経路	22	(3) 生殖発生毒性試験	32
(2) 代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種	22	(4) その他の特殊毒性	32
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	22	X 管理的事項に関する項目	
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	22	1. 規制区分	33
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	22	2. 有効期間又は使用期限	33
6. 排泄	22	3. 貯法・保存条件	33
(1) 排泄部位及び経路	22	4. 薬剤取扱い上の注意点	33
(2) 排泄率	22	(1) 薬局での取り扱い上の留意点について	33
(3) 排泄速度	22	(2) 薬剤交付時の取扱いについて	
7. トランスポーターに関する情報	22	(患者等に留意すべき必須事項等)	33
8. 透析等による除去率	23	(3) 調剤時の留意点について	33
VIII 安全性(使用上の注意等)に関する項目		5. 承認条件等	33
1. 警告内容とその理由	24	6. 包装	34
2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	24	7. 容器の材質	34
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	24	8. 同一成分・同効薬	34
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	24	9. 国際誕生年月日	34
5. 慎重投与内容とその理由	24	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	34
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	25	11. 薬価基準収載年月日	34
7. 相互作用	26	12. 効能又は効果追加, 用法及び用量変更追加等の	
(1) 併用禁忌とその理由	26	年月日及びその内容	35
(2) 併用注意とその理由	27	13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	35
8. 副作用	28	14. 再審査期間	35
(1) 副作用の概要	28	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	35
(2) 重大な副作用と初期症状	28	16. 各種コード	35
(3) その他の副作用	29	17. 保険給付上の注意	35
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	29	X I 文献	
(5) 基礎疾患, 合併症, 重症度及び		1. 引用文献	36
手術の有無等背景別の副作用発現頻度	29	2. その他の参考文献	36
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	29	X II 参考資料	
9. 高齢者への投与	30	1. 主な外国での発売状況	37
10. 妊婦, 産婦, 授乳婦等への投与	30	2. 海外における臨床支援情報	37
11. 小児等への投与	30	X III 備考	
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	30	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての	
13. 過量投与	30	参考情報	38
14. 適用上の注意	31	2. その他の関連資料	39
15. その他の注意	31	付表	40
16. その他	31		
IX 非臨床試験に関する項目			
1. 薬理試験	32		
(1) 薬効薬理試験			
(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)	32		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

ロサルタンカリウム(一般名)は、アンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤であり、本邦では1998年に上市されている。

本ロサルタンK錠25mg、50mg、100mg「オーハラ」は、大原薬品工業株式会社が発行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)(付表参照)に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、2012年2月に承認を取得し、2012年6月に上市された。

その後、「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・効果追加の一部変更承認申請を行い、2012年7月に承認を取得した。

なお、本剤は発行医薬品として、大原薬品工業株式会社と第一三共エスファ株式会社の2社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 本剤は、高血圧症、高血圧症及び蛋白尿を伴う2型糖尿病性腎症の治療薬である。(「V. 治療に関する項目」参照)
- (2) ロサルタンカリウムはアンジオテンシンⅡ受容体のうちAT<sub>1</sub>受容体と選択的に結合し、アンジオテンシンⅡの生理作用を阻害することによって降圧作用を現す。(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)
- (3) 成分名、含量、屋号が印字された錠剤である。
- (4) 成分名、含量、屋号、薬効、GS1コードが表示されたPTPシートである。
- (5) 個装箱にはQRコード(添付文書)、錠剤イメージ図、製品情報カード、新バーコードの4つの製品情報が盛り込まれている。
- (6) 重大な副作用として、**アナフィラキシー、血管浮腫、急性肝炎または劇症肝炎、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**(いずれも頻度不明)が報告されている。(「VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目」参照)

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

ロサルタン K 錠 25mg 「オーハラ」

ロサルタン K 錠 50mg 「オーハラ」

ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」

#### (2) 洋名

LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 25mg 「OHARA」

LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 50mg 「OHARA」

LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 100mg 「OHARA」

#### (3) 名称の由来

通知「薬食審査発第 0922001 号」に基づき設定した。

### 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)

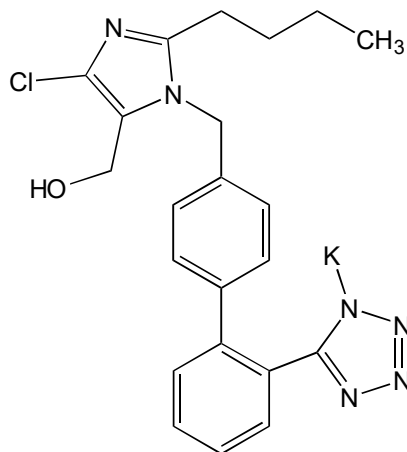
Losartan (INN)

#### (3) ステム

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

(アジオテンシン II 受容体拮抗薬、抗高血圧薬(非ペプチド性))

### 3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

(1) 分子式:  $C_{22}H_{22}ClKN_6O$

(2) 分子量: 461.00

5. 化学名 (命名法)

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

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

開発番号: OHK6881 (ロサルタン K 錠 25mg 「オーハラ」)

開発番号: OHK6882 (ロサルタン K 錠 50mg 「オーハラ」)

開発番号: OHK6883 (ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」)

7. CAS 登録番号

Losartan Potassium (124750-99-8)

Losartan (114798-26-4)



### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

##### (1) 外観・性状

本品は白色の結晶性の粉末である。

##### (2) 溶解性

表. ロサルタンカリウム原薬の溶解性

溶媒	日本薬局方の溶解度表記
水	極めて溶やすい
メタノール	溶けやすい
エタノール(99.5)	溶けやすい

##### (3) 吸湿性

該当資料なし

##### (4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点

該当資料なし

##### (5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

日局「ロサルタンカリウム」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) カリウム塩の定性反応(1)

(4) 炎色反応試験(2)

#### 4. 有効成分の定量法

日局「ロサルタンカリウム」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, 外観及び性状

区別：錠剤(フィルムコーティング錠)

販売名	剤形	色調	外形・サイズ・識別コード		
			表面	裏面	側面
ロサルタン K 錠 25mg 「オーハラ」	割線入りの 円形のフィ ルムコーテ ィング錠	白色			
			直径：5.6mm 厚さ：2.9mm 重量：73mg 識別コード※：ロサルタン 25 オーハラ		
ロサルタン K 錠 50mg 「オーハラ」	割線入りの 円形のフィ ルムコーテ ィング錠	白色			
			直径：7.6mm 厚さ：3.4mm 重量：145mg 識別コード※：ロサルタン 50 オーハラ		
ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」	円形のフィ ルムコーテ ィング錠	白色			
			直径：9.1mm 厚さ：4.8mm 重量：288mg 識別コード※：ロサルタン 100 オーハラ		

※錠剤両面に印刷表示

#### (2) 製剤の物性<sup>1)</sup>

品名	硬度(kp, n=5)
ロサルタン K 錠 25mg 「オーハラ」	10.4[10.0~11.0]
ロサルタン K 錠 50mg 「オーハラ」	10.3[8.7~12.3]
ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」	11.9[11.3~12.7]

平均値 [最小値~最大値]

#### (3) 識別コード

ロサルタン K 錠 25mg 「オーハラ」 : ロサルタン 25 オーハラ

ロサルタン K 錠 50mg 「オーハラ」 : ロサルタン 50 オーハラ

ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」 : ロサルタン 100 オーハラ

#### (4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

## 2. 製剤の組成

### (1) 有効成分(活性成分)の含量

ロサルタン K 錠 25mg 「オーハラ」 : 1 錠中 日局ロサルタンカリウム 25mg 含有  
ロサルタン K 錠 50mg 「オーハラ」 : 1 錠中 日局ロサルタンカリウム 50mg 含有  
ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」 : 1 錠中 日局ロサルタンカリウム 100mg 含有

### (2) 添加物

乳糖水和物、結晶セルロース、部分アルファー化デンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、カルナウバロウ

### (3) その他

該当資料なし

## 3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

## 4. 製剤の各種条件下における安定性

### (1) 加速条件下での安定性<sup>2)</sup>

#### ・ 保存形態 :

PTP 包装 : PTP (ポリ塩化ビニル、アルミ箔) 包装したものを、アルミ多層フィルム製袋 (ポリエチレン、アルミ箔及びポリエチレンテレフタレート) に入れ封を施した。

バラ包装 : ポリエチレン製容器に入れ、乾燥剤付きポリプロピレンキャップで封をした。(25mg、50mg 錠のみ)

#### ・ 保存条件 : 40°C (±1°C)、75%RH (±5%RH)

#### ・ 保存期間 : 6 ヶ月

#### ・ 試験項目 : 性状、確認試験、含量均一性試験、溶出試験、定量

#### ・ 試験方法 : 製剤の規格及び試験方法に従った。

#### 1) ロサルタン K 錠 25mg、50mg 「オーハラ」

保存条件	期間	保存形態	結果
40°C (±1°C)、 75%RH (±5%RH)	6 ヶ月	PTP 包装	全て変化なし。
		バラ包装	全て変化なし。

#### 2) ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」

保存条件	期間	保存形態	結果
40°C (±1°C)、 75%RH (±5%RH)	6 ヶ月	PTP 包装	全て変化なし。

(2) 長期条件下での安定性<sup>3)</sup>

・保存形態：

PTP包装：PTP（ポリ塩化ビニル、アルミ箔）包装したものを、アルミ多層フィルム製袋（ポリエチレン、アルミ箔及びポリエチレンテレフタレート）に入れ封を施した。

バラ包装：ポリエチレン製容器に入れ、乾燥剤付きポリプロピレンキャップで封をした。（25mg、50mg錠のみ）

- ・保存条件：25°C（±2°C）、60%RH（±5%RH）
- ・保存期間：36ヵ月
- ・試験項目：性状、確認試験、含量均一性試験、溶出試験、定量
- ・試験方法：製剤の規格及び試験方法に従った。

1) ロサルタン K 錠 25mg、50mg 「オーハラ」

保存条件	期間	保存形態	結果
25°C（±2°C）、 60%RH（±5%RH）	36ヵ月	PTP包装	全て変化なし。
		バラ包装	全て変化なし。

2) ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」

保存条件	期間	保存形態	結果
25°C（±2°C）、 60%RH（±5%RH）	36ヵ月	PTP包装	全て変化なし。

(3) 無包装状態での安定性試験<sup>1)</sup>

ロサルタン K 錠 25mg、50mg、100mg 「オーハラ」 の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性〔性状、純度試験（類縁物質）、溶出試験、定量、硬度〕を調べた。

ロサルタン K 錠 25mg、50mg、100mg 「オーハラ」

	期間 保存形態	結果
温度	40°C、3ヵ月（遮光・気密容器）	全て変化なし。
湿度	25°C、75%RH、3ヵ月（遮光・開放）	全て変化なし。
光	総照射量 120 万 lx・hr（開放/25°C、60%RH）	全て変化なし。

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当しない

## 7. 溶出性

### (1) 日局溶出試験<sup>4)</sup>

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」による。

条件：回転数 25、50mg錠：50rpm

100mg錠：75rpm

試験液 水

試験結果：日本薬局方医薬品各条に定められたロサルタンカリウム錠の溶出規格(25、50mg錠:45分間の溶出率が85%以上及び100mg錠:30分間の溶出率が85%以上)に適合した。

	時間	溶出率※ (最小値～最大値)
ロサルタンK錠25mg 「オーハラ」	45分	99.7% (97.3～100.9%)
ロサルタンK錠50mg 「オーハラ」	45分	99.1% (98.1～100.3%)
ロサルタンK錠100mg 「オーハラ」	30分	99.7% (98.8～100.5%)

※3Lot 平均値

### (2) 後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに基づく溶出試験<sup>5)</sup>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について(平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号)に準じ試験を実施した。

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」による。

試験液量：900mL

温度：37℃±0.5℃

試験結果：

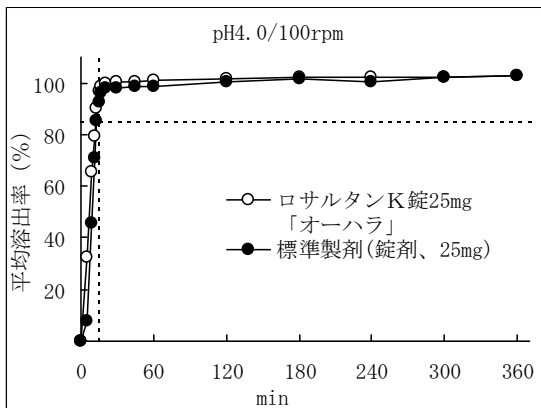
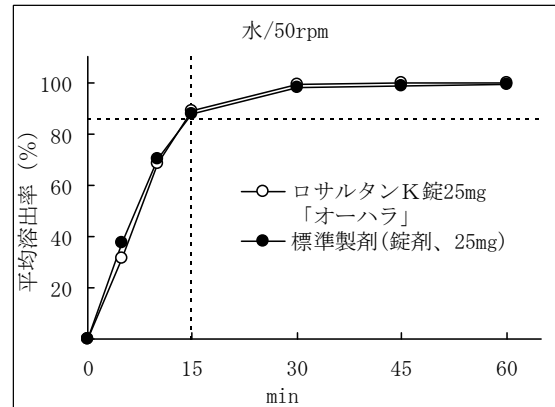
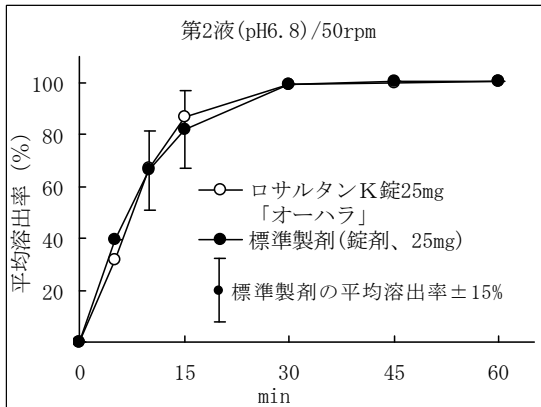
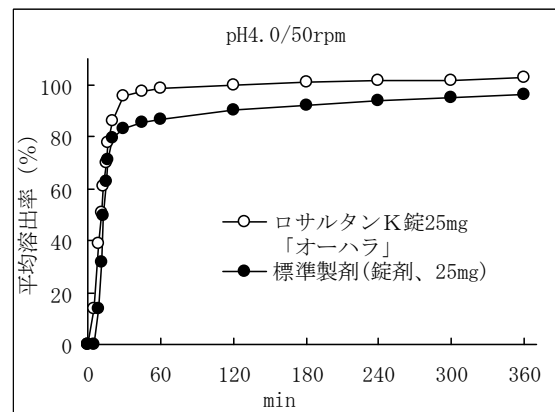
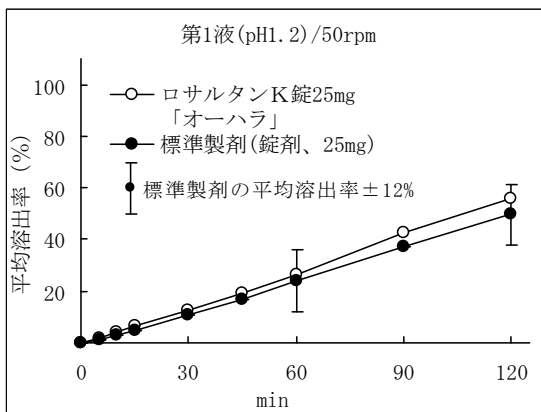
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。これによりロサルタンK錠25mg、50mg、100mg「オーハラ」の溶出挙動は、全ての試験条件において標準製剤と類似と判定された。

1) ロサルタンK錠25mg「オーハラ」  
表 溶出挙動における類似性

試験条件	判定 時点 (分)	平均溶出率(%)		類似性の判定基準	判定	
		試験製剤	標準製剤 (錠剤、25mg)			
50rpm	pH1.2	60	26.3	23.8	60及び120分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±12%の範囲	類似
		120	56.1	49.6		
	pH4.0	f <sub>2</sub> 関数：44.0		f <sub>2</sub> 関数の値が42以上	類似	
	pH6.8	10	67.0	66.1	10及び15分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±15%の範囲	類似
		15	86.5	82.1		
水	15	88.6	87.4	試験製剤が15分間に平均85%以上溶出	類似	
100rpm	pH4.0	15	96.5	92.3	試験製剤が15分間に平均85%以上溶出	類似

(n=12)

(溶出曲線)



試験液: pH1.2=日本薬局方溶出試験液の第1液  
pH4.0=薄めたMcllvaine緩衝液  
pH6.8=日本薬局方溶出試験液の第2液  
水=日本薬局方精製水

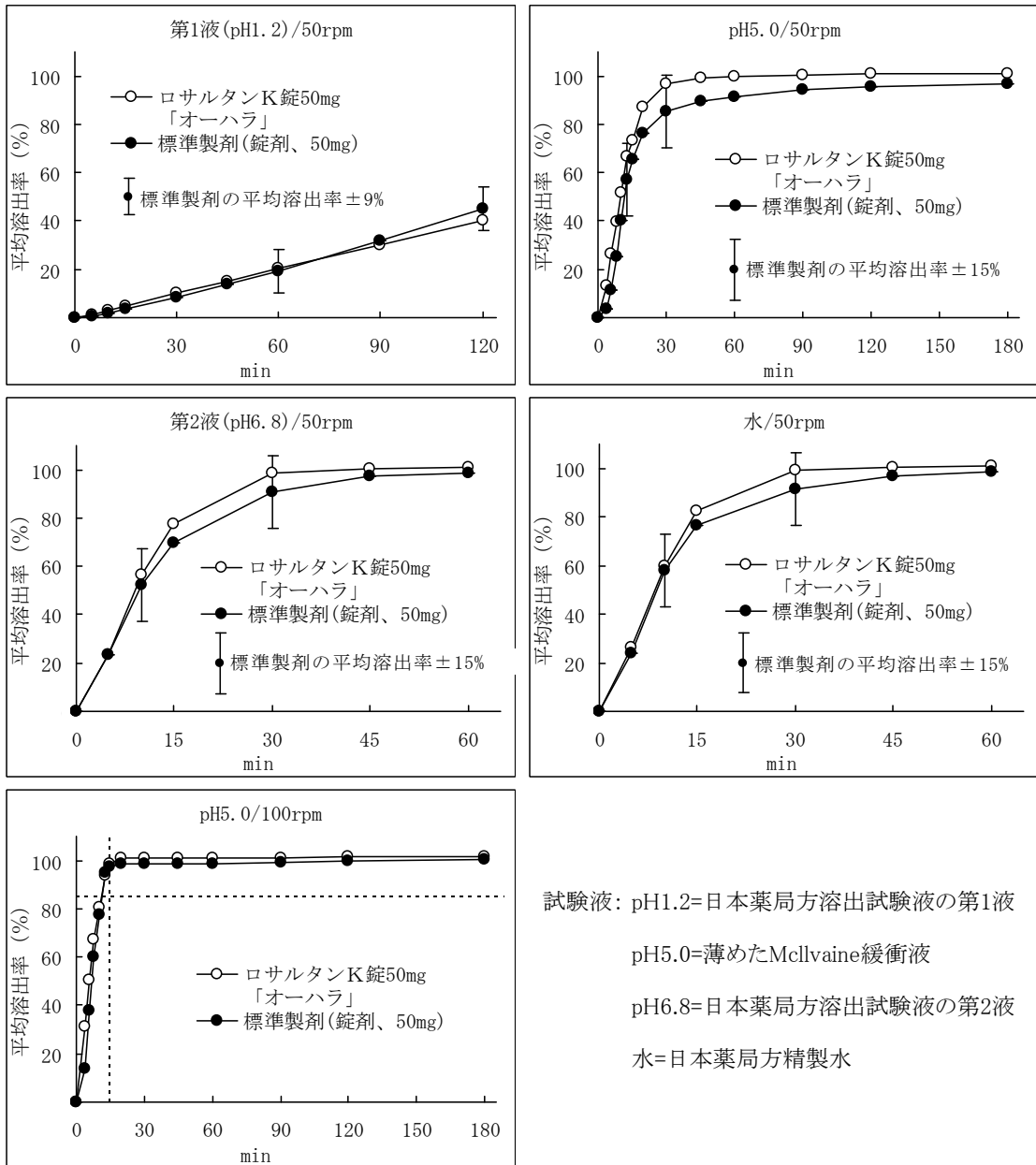
2) ロサルタンK錠50mg「オーハラ」

表 溶出挙動における類似性

試験条件	判定 時点 (分)	平均溶出率(%)		類似性の判定基準	判定	
		試験製剤	標準製剤 (錠剤、50mg)			
50rpm	pH1.2	60	20.2	19.4	60及び120分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±9%の範囲	類似
		120	40.0	45.1		
	pH5.0	13	66.6	57.3	13及び30分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±15%の範囲	類似
		30	96.8	85.5		
	pH6.8	10	56.5	52.3	10及び30分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±15%の範囲	類似
		30	98.6	90.9		
水	10	60.0	57.8	10及び30分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±15%の範囲	類似	
	30	99.3	91.7			
100rpm	pH5.0	15	98.8	97.5	試験製剤が15分間に平均85%以上溶出	類似

(n=12)

(溶出曲線)



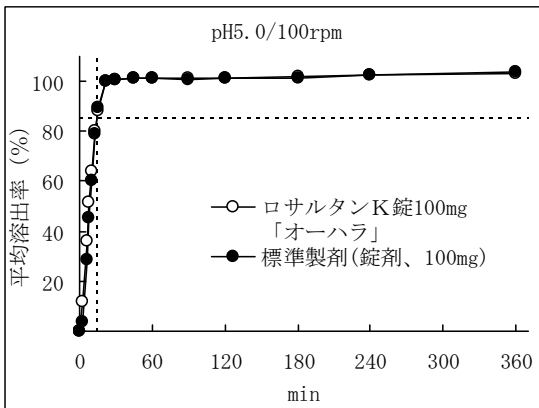
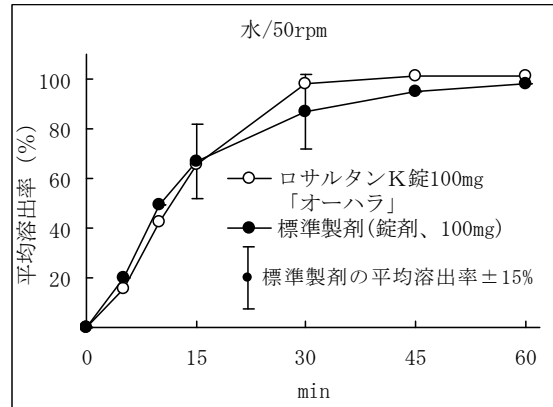
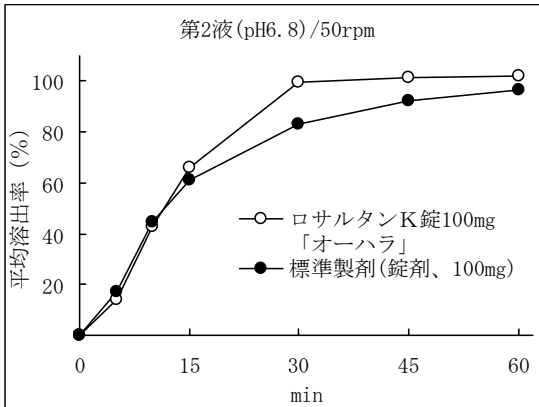
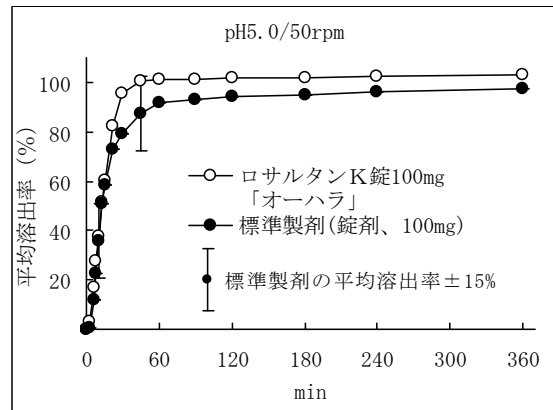
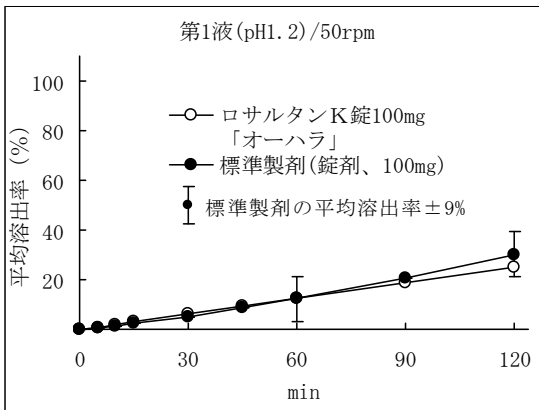
3) ロサルタンK錠100mg「オーハラ」

表 溶出挙動における類似性

試験条件	溶出時間(分)	平均溶出率(%)		類似性の判定基準	判定	
		試験製剤	標準製剤(錠剤、100mg)			
50rpm	pH1.2	60	12.2	12.3	60及び120分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±9%の範囲	類似
		120	25.3	30.3		
	pH5.0	10	37.6	35.7	10及び45分間における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の±15%の範囲	類似
		45	100.4	87.6		
pH6.8	f <sub>2</sub> 関数：50.3		f <sub>2</sub> 関数の値が42以上		類似	
水	15	65.4	66.6	15及び30分間に試験製剤における平均溶出率が標準製剤の±15%の範囲	類似	
	30	98.0	86.6			
100rpm	pH5.0	15	88.1	89.3	試験製剤が15分間に平均85%以上溶出	類似

(n=12)

(溶出曲線)



試験液： pH1.2=日本薬局方溶出試験液の第1液  
 pH5.0=薄めたMcllvaine緩衝液  
 pH6.8=日本薬局方溶出試験液の第2液  
 水=日本薬局方精製水



8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日局「ロサルタンカリウム錠」による。

薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

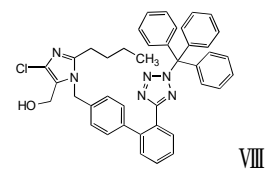
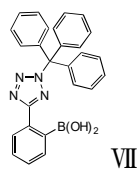
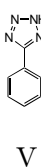
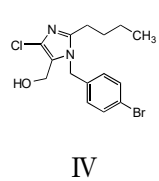
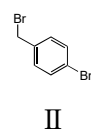
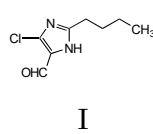
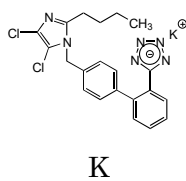
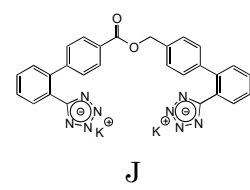
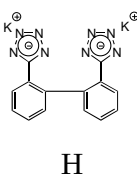
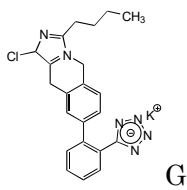
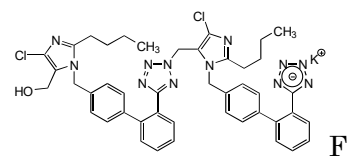
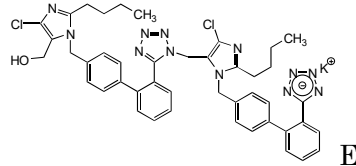
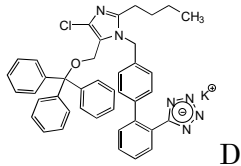
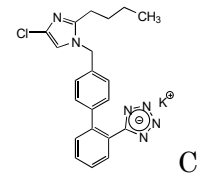
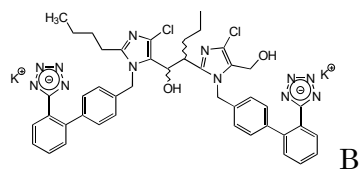
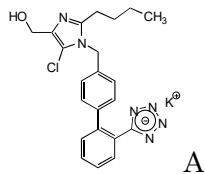
日局「ロサルタンカリウム錠」による。

液体クロマトグラフィー

11. カ価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物



13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

特になし

14. その他

特になし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

1. 高血圧症
2. 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

#### <効能・効果に関連する使用上の注意>

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の場合

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。

### 2. 用法及び用量

#### 1. 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。

#### 2. 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。

#### <用法・用量に関連する使用上の注意>

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に対して、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。

### 3. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床効果

該当資料なし

#### (3) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (4) 探索的試験

該当資料なし

#### (5) 検証的試験

##### 1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

2) 比較試験

該当資料なし

3) 安全性試験

該当資料なし

4) 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・特定使用成績調査（特別調査）・製造販売後臨床試験（市販後臨床試験）

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試験の概要

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

A-IIアンタゴニスト(カンデサルタン シレキセチル、バルサルタン、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)

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

ロサルタンカリウムは主に肝臓において主代謝物であるカルボン酸体に変換される。

アンジオテンシンII受容体のうちAT<sub>1</sub>受容体と選択的に結合し、アンジオテンシンIIの生理作用を阻害することによって降圧作用を現す。本薬の主代謝物のカルボン酸体も本薬と同様の作用を示す。なお、ブラジキニンの分解酵素(キナーゼII)には直接作用しない<sup>6)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

#### (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・測定法

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 最高血中濃度到達時間<sup>5)</sup>

(カルボン酸体)

ロサルタン K錠 25mg 「オーハラ」を1錠：4.6時間

ロサルタン K錠 50mg 「オーハラ」を1錠：3.1時間

ロサルタン K錠 100mg 「オーハラ」を1錠：2.5時間

(未変化体：ロサルタン)

ロサルタン K錠 25mg 「オーハラ」を1錠：1.6時間

ロサルタン K錠 50mg 「オーハラ」を1錠：1.2時間

ロサルタン K錠 100mg 「オーハラ」を1錠：1.3時間

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 生物学的同等性試験

ロサルタン K錠 25mg、50mg 及び 100mg「オーハラ」と各標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(ロサルタンカリウムとしてそれぞれ 25mg、50mg 及び 100mg)健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中活性代謝物(カルボン酸体<sup>\*</sup>)濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、 $C_{max}$ )について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲であり、両剤の生物学的同等性が確認された。また、同時に測定した血漿中未変化体(ロサルタン)濃度についても、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>5)</sup>。

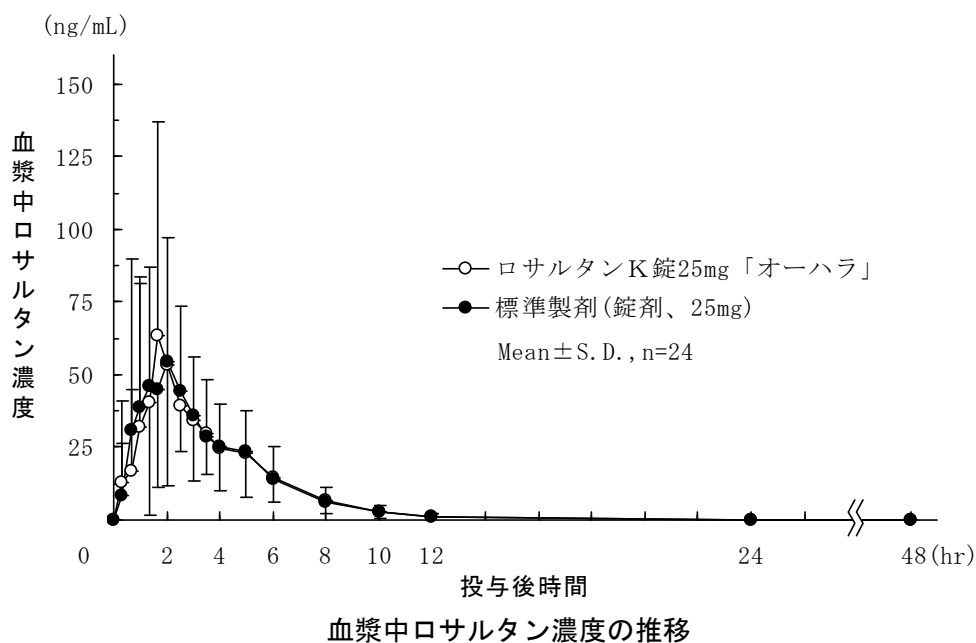
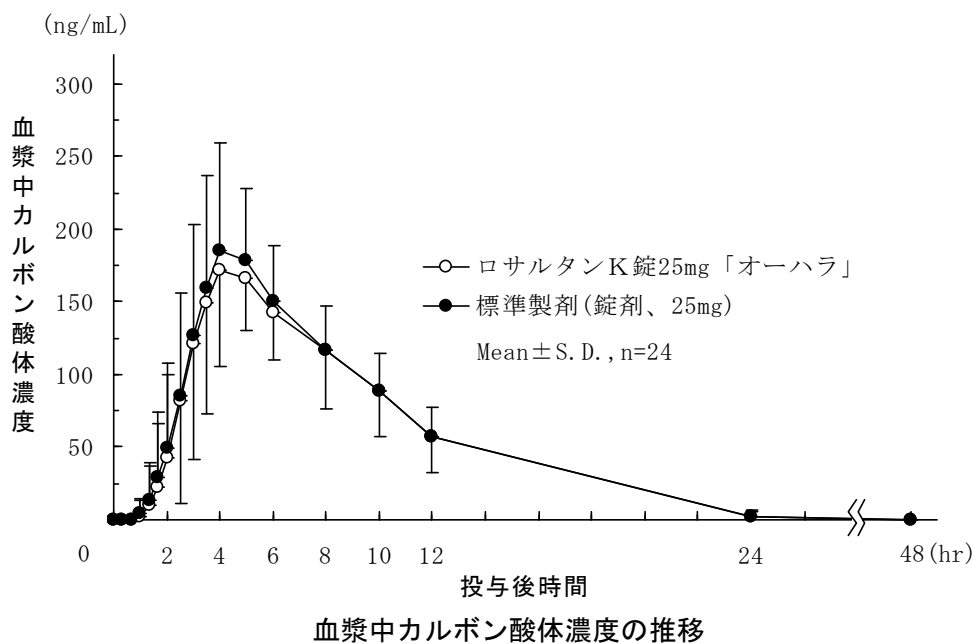
※イミダゾール環の5-ヒドロキシメチル基の酸化物

1) ロサルタンK錠25mg「オーハラ」

薬物動態パラメータ

		n	AUC <sub>0→48</sub> (ng·hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
カルボン酸体	ロサルタンK錠25mg「オーハラ」	24	1573.57±404.82	194.83±56.37	4.6±1.2	3.3±0.7
	標準製剤(錠剤、25mg)	24	1626.60±396.42	200.67±59.17	4.5±1.0	3.3±0.7
ロサルタン	ロサルタンK錠25mg「オーハラ」	24	216.91±73.18	105.92±70.54	1.6±0.8	1.6±0.3
	標準製剤(錠剤、25mg)	24	221.46±72.92	100.54±53.28	1.7±0.9	1.6±0.3

(Mean±S. D.)

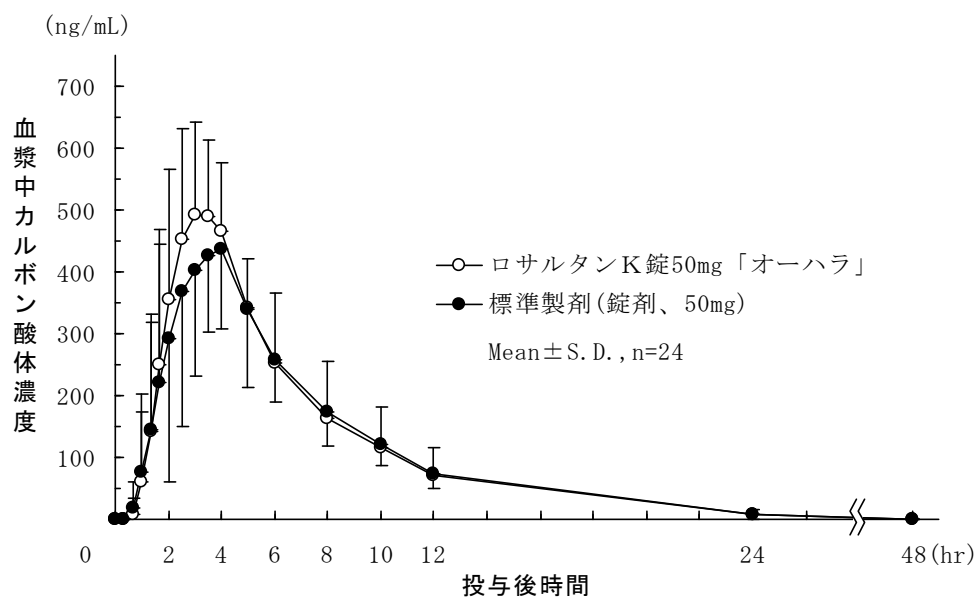


2) ロサルタンK錠50mg「オーハラ」

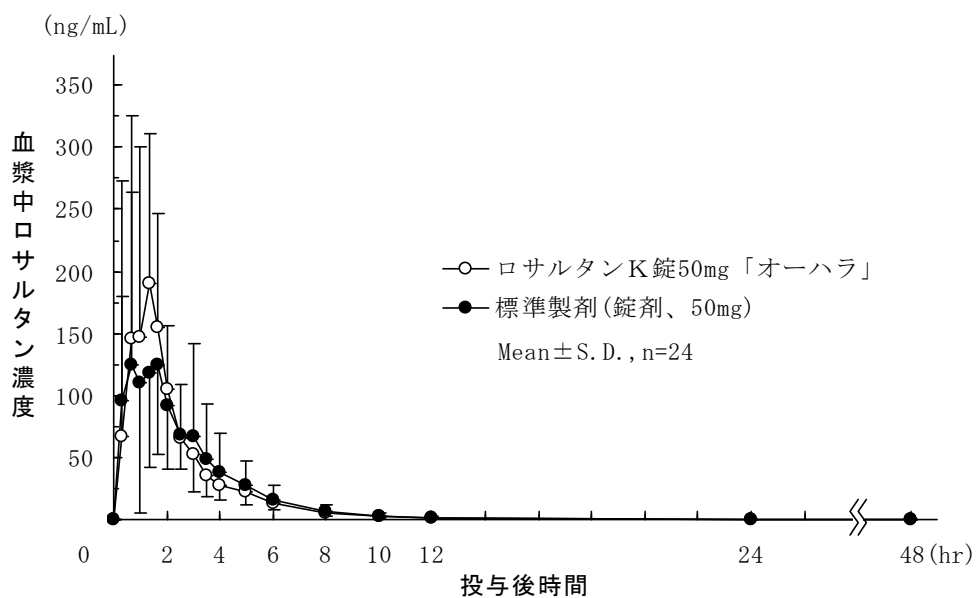
薬物動態パラメータ

		n	AUC <sub>0→48</sub> (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
カルボン酸体	ロサルタンK錠50mg「オーハラ」	24	3255.94±856.44	527.67±128.98	3.1±0.8	3.3±0.7
	標準製剤(錠剤、50mg)	24	3162.67±900.52	510.11±136.49	3.3±1.1	3.4±0.6
ロサルタン	ロサルタンK錠50mg「オーハラ」	24	442.34±161.25	298.47±155.73	1.2±0.6	1.6±0.3
	標準製剤(錠剤、50mg)	24	428.83±135.40	264.85±133.27	1.4±0.9	1.6±0.4

(Mean±S. D.)



血漿中カルボン酸体濃度の推移



血漿中ロサルタン濃度の推移

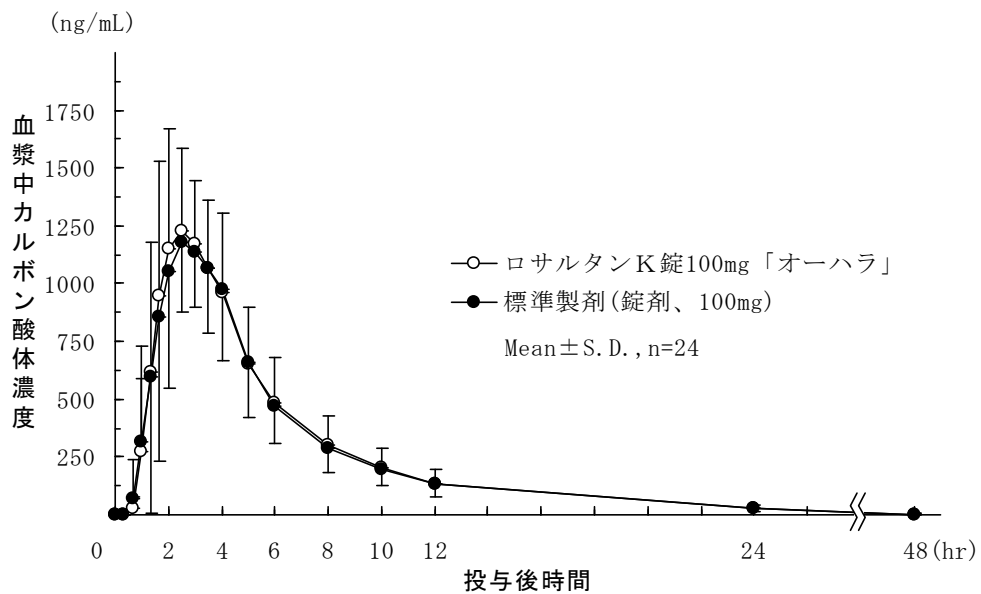


3) ロサルタンK錠100mg「オーハラ」

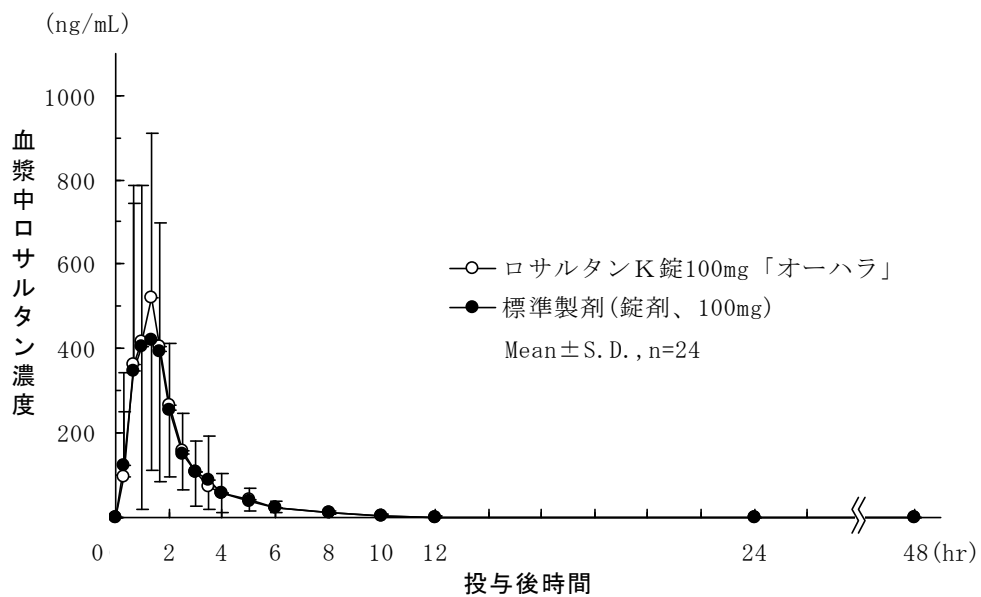
薬物動態パラメータ

		n	AUC <sub>0→48</sub> (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	t <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
カルボン酸体	ロサルタンK錠100mg「オーハラ」	24	7450.64±2142.74	1403.31±315.48	2.5±0.7	5.9±1.5
	標準製剤(錠剤、100mg)	24	7276.85±2060.65	1367.59±324.07	2.4±0.7	6.5±2.1
ロサルタン	ロサルタンK錠100mg「オーハラ」	24	1035.36±311.60	785.19±356.29	1.3±0.7	2.1±1.0
	標準製剤(錠剤、100mg)	24	993.74±268.87	791.49±349.85	1.3±0.7	2.2±1.1

(Mean±S. D.)



血漿中カルボン酸体濃度の推移



血漿中ロサルタン濃度の推移

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

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 7. 相互作用」の項を参照のこと。

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

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) バイオアベイラビリティ

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 1. 血中濃度の推移・測定法 (3)臨床試験で確認された血中濃度」の項を参照すること。

(4) 消失速度定数<sup>7)</sup>

(カルボン酸体)

健康成人男子単回投与

投与量	25mg (n=24)	50mg (n=24)	100mg (n=24)
Kel (/hr)	0.221 ± 0.047	0.217 ± 0.044	0.124 ± 0.027

(Mean ± S. D.)

(未変化体：ロサルタン)

健康成人男子単回投与

投与量	25mg (n=24)	50mg (n=24)	100mg (n=24)
Kel (/hr)	0.457 ± 0.075	0.458 ± 0.103	0.387 ± 0.135

(Mean ± S. D.)

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

「Ⅶ. 薬物動態に関する項目 5. 代謝」を参照すること。

#### 4. 分布

##### (1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

##### (2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

##### (3) 乳汁への移行性

該当資料なし

##### (4) 髄液への移行性

該当資料なし

##### (5) その他の組織への移行性

該当資料なし

#### 5. 代謝

##### (1) 代謝部位及び代謝経路<sup>6)</sup>

健康成人にロサルタンカリウム 25、50、100 又は 200mg 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。

##### (2) 代謝に關与する酵素(CYP450 等)の分子種

チトクローム P450 2C9(CYP2C9)

##### (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比率<sup>6)</sup>

活性代謝物：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)

##### (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

該当資料なし

#### 6. 排泄

##### (1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

##### (2) 排泄率<sup>6)</sup>

健康成人にロサルタンカリウム 25、50、100 又は 200mg 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。

##### (3) 排泄速度

該当資料なし

#### 7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)

#### 【禁忌】 (次の患者には投与しないこと)

- (1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- (2) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
- (3) 重篤な肝障害のある患者(「慎重投与」の項参照)
- (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。)[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。(「2. 重要な基本的注意」の項参照)]

### 3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

「Ⅴ. 治療に関する項目」を参照すること。

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「Ⅴ. 治療に関する項目」を参照すること。

### 5. 慎重投与内容とその理由

#### 慎重投与 (次の患者には慎重に投与すること)

- (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(「重要な基本的注意」の項参照)
- (2) 高カリウム血症の患者(「重要な基本的注意」の項参照)
- (3) 重篤な腎機能障害のある患者〔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ので、血清クレアチニンが2.5mg/dL以上の場合には、投与量を減らすなど慎重に投与すること。(「重要な基本的注意」の項参照)]
- (4) 肝機能障害又はその既往のある患者〔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。〕
- (5) 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。〕
- (6) 体液量が減少している患者(利尿降圧剤投与中、嚴重な減塩療法中、血液透析中)(「重要な基本的注意」の項参照)
- (7) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)

## 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

### 重要な基本的注意

- (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においては、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ので、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。
- (2) 高カリウム血症の患者においては、高カリウム血症を増悪させるおそれがあるので、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。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、高カリウム血症が発現するおそれがあるので、血清カリウム値に注意すること。
- (3) アリスキレンを併用する場合、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ため、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。なお、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。
- (4) 本剤の投与によって、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、そのような場合には投与を中止し適切な処置を行うこと。また、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。特に次の患者では投与は少量より開始し、増量する場合は患者の状態を十分に観察しながら徐々に行うこと。
  - ア. 利尿降圧剤投与中の患者
  - イ. 厳重な減塩療法中の患者
  - ウ. 血液透析中の患者
- (5) 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。
- (6) 手術前 24 時間は投与しないことが望ましい。
- (7) 本剤を含むアンジオテンシンⅡ受容体拮抗薬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。
- (8) 2 型糖尿病における糖尿病性腎症の患者では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い、異常が認められた場合には貧血の原因を考慮し、適切な処置を行うこと。

(9) 2 型糖尿病における糖尿病性腎症の患者では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し、観察を十分に行うこと。血清カリウム値及び血清クレアチニン値に異常が認められた場合には、適切な処置を行うこと。

特に、本剤とアンジオテンシン変換酵素阻害剤を併用した場合、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ため、本剤とアンジオテンシン変換酵素阻害剤を併用する際には注意すること。

## 7. 相互作用

本剤は、主に薬物代謝酵素チトクローム P450 2C9 (CYP2C9)により活性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

該当しない

(2) 併用注意とその理由

併用注意（併用注意すること）		
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。	併用により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。
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ため、腎機能、血清カリウム値及び血圧を十分に観察すること。なお、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。	併用によりレニン・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	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ため、腎機能、血清カリウム値及び血圧を十分に観察すること。	併用によりレニン・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。
非ステロイド性消炎鎮痛剤 インドメタシン等	本剤の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ので、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れると考えられている。



## 8. 副作用

### (1) 副作用の概要

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。

### (2) 重大な副作用と初期症状

#### 重大な副作用(頻度不明)

次のような副作用があらわれることがあるので、症状があらわれた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- (1) **アナフィラキシー**：不快感、口内異常感、発汗、蕁麻疹、呼吸困難、全身潮紅、浮腫等が症状としてあらわれることがあるので観察を十分に行うこと。
- (2) **血管浮腫**：顔面、口唇、咽頭、舌等の腫脹が症状としてあらわれることがあるので観察を十分に行うこと。
- (3) **急性肝炎または劇症肝炎**
- (4) **腎不全**
- (5) **ショック、失神、意識消失**：ショック、血圧低下に伴う失神、意識消失があらわれることがあるので、観察を十分に行い、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。特に血液透析中、嚴重な減塩療法中、利尿降圧剤投与中の患者では低用量から投与を開始し、増量する場合は患者の状態を十分に観察しながら徐々に行うこと。
- (6) **横紋筋融解症**：筋肉痛、脱力感、CK(CPK)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ることがあるので、このような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。
- (7) **高カリウム血症**：重篤な高カリウム血症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、直ちに適切な処置を行うこと。
- (8) **不整脈**：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ので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、直ちに適切な処置を行うこと。
- (9) **汎血球減少、白血球減少、血小板減少**：汎血球減少、白血球減少、血小板減少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、直ちに適切な処置を行うこと。
- (10) **低血糖**：低血糖があらわれることがある(糖尿病治療中の患者であらわれやすい)ので、観察を十分に行い、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。
- (11) **低ナトリウム血症**：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、直ちに適切な処置を行うこと。

### (3) その他の副作用

次のような症状又は異常があらわれた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。	
	副作用の頻度
	頻度不明
精神神経系	頭痛、めまい、耳鳴、眠気、不眠、浮遊感
循環器系	低血圧、調律障害(頻脈等)、起立性低血圧、胸痛、動悸
消化器	口内炎、口角炎、胃不快感、胃潰瘍、下痢、嘔吐・嘔気、口渇
肝臓	肝機能障害(AST(GOT)上昇、ALT(GPT)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、光線過敏、紅斑、掻痒、蕁麻疹、多形紅斑、紅皮症
血液	貧血、赤血球減少、ヘマトクリット低下、好酸球増多
その他	咳嗽、発熱、ほてり、味覚障害、しびれ感、眼症状(かすみ、異和感等)、倦怠感、無力症/疲労、浮腫、関節痛、筋痙攣、筋肉痛、総コレステロール上昇、CK(CPK)上昇、血中尿酸値上昇、女性化乳房、勃起不全

### (4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

### (5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

### (6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

**【禁忌】** (次の患者には投与しないこと)

(1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

#### 重大な副作用(頻度不明)

(1) アナフィラキシー：不快感、口内異常感、発汗、蕁麻疹、呼吸困難、全身潮紅、浮腫等が症状としてあらわれることがあるので観察を十分に行うこと。

(5) ショック、失神、意識消失：ショック、血圧低下に伴う失神、意識消失があらわれることがあるので、観察を十分に行い、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。特に血液透析中、嚴重な減塩療法中、利尿降圧剤投与中の患者では低用量から投与を開始し、増量する場合は患者の状態を十分に観察しながら徐々に行うこと。

## 9. 高齢者への投与

- (1) 高齢者では一般に生理機能が低下しているため、患者の状態に注意すること。
- (2) 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(脳梗塞等が起こるおそれがある)ので、低用量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。
- (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くなることが認められている。(非高齢者に比較して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2倍及び約1.3倍に上昇)
- (4) 高齢者と非高齢者との間で降圧効果及び副作用の発現に関する差異は認められていない。

## 10. 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は投与しないこと。また、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本剤を含むアンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤を投与された高血圧症の患者で羊水過少症、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奇形、頭蓋顔面の奇形、肺の発育不全等があらわれたとの報告がある。〕
- (2) 本剤投与中は授乳を中止させること。〔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。〕

(参考)

他社が実施した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。

## 11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。(使用経験がない。)

## 12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

## 13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

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。〕

15. その他の注意

該当資料なし

16. その他

特になし

## IX. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

薬効薬理試験(「VI. 薬効薬理に関する項目」参照)

#### (1) 副次的薬理試験

該当資料なし

#### (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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

#### (4) その他の特殊毒性

該当資料なし

## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製剤：ロサルタン K 錠 25mg 「オーハラ」 処方箋医薬品<sup>注)</sup>

ロサルタン K 錠 50mg 「オーハラ」 処方箋医薬品<sup>注)</sup>

ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」 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

有効成分：ロサルタンカリウム 該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）※

※ 安定性試験：最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月)の結果、ロサルタン K 錠 25mg、50mg、100mg 「オーハラ」は通常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<sup>2)</sup>。

### 3. 貯法・保存条件

室温保存、気密容器(開封後は湿気を避けて保存すること。)

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について

該当資料なし

#### (2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

- ・ 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。(「VIII. 安全性(使用上の注意等)」に関する項目 6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 重要な基本的注意(5)」の項を参照すること。)
- ・ 「VIII. 安全性(使用上の注意等)」に関する項目 14. 適用上の注意」の項を参照すること。
- ・ 患者向医薬品ガイド：有り、くすりのしおり：有り

#### (3) 調剤時の留意点について

該当資料なし

### 5. 承認条件等

該当しない

## 6. 包装

ロサルタン K 錠 25mg 「オーハラ」	:	(PTP) 100 錠 (10 錠×10×1 袋)
		500 錠 (10 錠×10×5 袋)
		700 錠 (14 錠×10×5 袋)
		(バラ) 500 錠
ロサルタン K 錠 50mg 「オーハラ」	:	(PTP) 100 錠 (10 錠×10×1 袋)
		500 錠 (10 錠×10×5 袋)
		700 錠 (14 錠×10×5 袋)
		(バラ) 500 錠
ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」	:	100 錠 (10 錠×10×1 袋)

## 7. 容器の材質

PTP 包装

PTP : ポリ塩化ビニル、アルミ箔

アルミ多層フィルム袋 : ポリエチレン、アルミ箔及びポリエチレンテレフタレート

バラ包装

ボトル : ポリエチレン、キャップ : ポリプロピレン

## 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬 : ニューロタン<sup>®</sup>錠25mg、50mg、100mg

同 効 薬 : A-IIアンタゴニスト(カンデサルタン シレキセチル、バルサルタン、テルミサルタン、オルメサルタンメドキシミル、イルベサルタンなど)

## 9. 国際誕生年月日

1994年 9月 2日

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日 : 2012年 2月 15日

承認番号

ロサルタン K 錠 25mg 「オーハラ」 : 22400AMX00478000

ロサルタン K 錠 50mg 「オーハラ」 : 22400AMX00479000

ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」 : 22400AMX00480000

## 11. 薬価基準収載年月日

2012年 6月 22日

12. 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

追加年月日

2012年 7月 18日

追加内容

効能・効果	用法・用量
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。

13. 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

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は厚生労働大臣の定める「投薬期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

16. 各種コード

	HOT9	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算処理 システムコード
ロサルタン K 錠 25mg 「オーハラ」	121389801	2149039F1015	622138901
ロサルタン K 錠 50mg 「オーハラ」	121390401	2149039F2011	622139001
ロサルタン K 錠 100mg 「オーハラ」	121391101	2149039F3018	622139101

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。



## X I . 文 献

### 1 . 引 用 文 献

- 1) 大原薬品工業株式会社 社内資料：苛酷試験(2012年)
- 2) 大原薬品工業株式会社 社内資料：加速試験(2011年)
- 3) 大原薬品工業株式会社 社内資料：長期保存試験(2018年)
- 4) 大原薬品工業株式会社 社内資料：第十六改正日本薬局方第一追補適合性確認  
について(2012年)
- 5) 米納誠ほか：新薬と臨床 61, 671-691(2012)
- 6) 第十七改正日本薬局方解説書(廣川書店)：C-6013(2016)
- 7) 大原薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験(2011年)
- 8) 大原薬品工業株式会社 社内資料：粉碎後の安定性試験(2012年)
- 9) 大原薬品工業株式会社 社内資料：経管通過性試験(2011年)

### 2 . その他の参考文献

該当資料なし

## X II. 参考文献

### 1. 主な外国での発売状況

本剤は海外では発売されていない。

尚、ロサルタンカリウム製剤としては海外で販売されている。

(2021年9月時点)

### 2. 海外における臨床支援情報

該当しない

## XIII. 備考

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

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

#### (1) 粉碎<sup>8)</sup>

ロサルタン K 錠 25mg、50mg、100mg 「オーハラ」の粉碎品について保存し、安定性試験(性状、純度試験、定量)を行った。

ロサルタン K 錠 25mg、50mg、100mg 「オーハラ」

試験条件	結果
25℃、60%RH、1 ヶ月(遮光・開放)	全て変化なし。

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性<sup>9)</sup>

### 試験方法

#### 〔崩壊懸濁試験〕

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、ディスペンサー内に試料1錠を入れてピストンを戻し、ディスペンサーに約55℃の温湯20mLを吸い取り、筒先の蓋をして5分間自然放置する。5分後にディスペンサーを手で90度15往復横転し、崩壊・懸濁の状態を観察する。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、錠剤をコーティング破壊してから、ディスペンサー内に入れて同様の操作を行い、崩壊・懸濁の状態を観察する。

#### 〔通過性試験〕

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液を、ディスペンサーに吸い取り、経管チューブの注入端より2~3mL/秒の速度で注入する。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端から3分の2を水平にし、他端（注入端）を30cmの高さにセットし、チューブ（サイズ；8フレンチ）の通過性を観察する。

なお、8フレンチのチューブを通過しない場合は、18フレンチのチューブを用いて同様に通過性を観察する。

#### 1) ロサルタンK錠25mg「オーハラ」

試験方法	崩壊懸濁試験	通過性試験	判定
試験結果	10分間では完全に崩壊しなかった。 (25分間で崩壊・懸濁) 錠剤をコーティング破壊すれば10分以内に崩壊・懸濁した。	チューブ(8フレンチ)を通過した。	適2

#### 2) ロサルタンK錠50mg「オーハラ」

試験方法	崩壊懸濁試験	通過性試験	判定
試験結果	10分間では完全に崩壊しなかった。 (35分間で崩壊・懸濁) 錠剤をコーティング破壊すれば10分以内に崩壊・懸濁した。	チューブ(8フレンチ)を通過した。	適2

#### 3) ロサルタンK錠100mg「オーハラ」

試験方法	崩壊懸濁試験	通過性試験	判定
試験結果	10分間では完全に崩壊しなかった。 (60分間で崩壊・懸濁) 錠剤をコーティング破壊すれば10分以内に崩壊・懸濁した。	チューブ(8フレンチ)を通過した。	適2

## 2. その他の関連資料

特になし

## 付表

薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づく承認申請時に添付する資料  
別表 1 及び別表 2-(1)医療用医薬品より改変

添付資料の内容		新有効成分含有 製剤 (先発医薬品)	その他の医薬品 (後発医薬品)	剤形追加に係る 医薬品 (後発医薬品)
イ 起原又は発見の経緯及び外国における使用状況等に関する資料	1 起原又は発見の経緯	○	×	○
	2 外国における使用状況	○	×	○
	3 特性及び他の医薬品との比較検討等	○	×	○
ロ 製造方法並びに規格及び試験方法等に関する資料	1 構造決定及び物理化学的性質等	○	×	×
	2 製造方法	○	△	○
	3 <b>規格及び試験方法</b>	○	○	○
ハ 安定性に関する資料	1 長期保存試験	○	×	△
	2 苛酷試験	○	×	△
	3 <b>加速試験</b>	○	○	○
ニ 薬理作用に関する資料	1 効力を裏付ける試験	○	×	×
	2 副次的薬理・安全性薬理	○	×	×
	3 その他の薬理	△	×	×
ホ 吸収、分布、代謝、排泄に関する資料	1 吸収	○	×	×
	2 分布	○	×	×
	3 代謝	○	×	×
	4 排泄	○	×	×
	5 <b>生物学的同等性</b>	×	○	○
	6 その他の薬物動態	△	×	×
ヘ 急性毒性、亜急性毒性、慢性毒性、催奇形性その他の毒性に関する資料	1 単回投与毒性	○	×	×
	2 反復投与毒性	○	×	×
	3 遺伝毒性	○	×	×
	4 がん原性	△	×	×
	5 生殖発生毒性	○	×	×
	6 局所刺激性	△	×	×
	7 その他の毒性	△	×	×
ト 臨床試験の成績に関する資料	臨床試験成績	○	×	×

○：添付 ×：添付不要 △：個々の医薬品により判断される

平成 17 年 4 月 1 日以後、承認申請時に適用される。