

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2008に準拠して作成

A- アンタゴニスト

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

LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 25mg

LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 50mg

LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 100mg

剤形	ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」 白色の片面割線入りフィルムコーティング錠である。 ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」 白色の片面割線入りフィルムコーティング錠である。 ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」 ティアドロップ形の白色のフィルムコーティング錠である。
製剤の規制区分	処方せん医薬品（注意 - 医師等の処方せんにより使用すること）
規格・含量	ロサルタンカリウム錠25m「本草」 1錠中、（日局）ロサルタンカリウム25mg を含有する。 ロサルタンカリウム錠50mg「本草」 1錠中、（日局）ロサルタンカリウム50mg を含有する。 ロサルタンカリウム錠100mg「本草」 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）
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 発売年月日	製造販売承認年月日： 平成24年2月15日 薬価基準収載年月日： 平成24年6月22日 発売年月日： 平成24年6月22日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元： 本草製薬株式会社
問い合わせ窓口	本草製薬株式会社 お客様相談室 〒468-0046 名古屋市天白区古川町125番地 TEL 052 - 892-1287/FAX 052 - 895-4928 医療関係者向けホームページ http://www.honzo.co.jp/medical/check.html

本IF は2012 年5 月作成（第1版）の添付文書の記載に基づき作成した。

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（以下、MRと略す）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）として位置付け並びに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年が経過した現在、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新たなIF記載要領が策定された。

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]

規格はA4判、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。

IF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。

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]

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。

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。

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。

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。

「医薬品インタビューフォーム記載要領2008」（以下、「IF記載要領2008」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]

「IF記載要領2008」は、平成21年4月以降に承認された新医薬品から適用となる。

上記以外の医薬品については、「IF記載要領2008」による作成・提供は強制されるものではない。

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2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、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、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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の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、今後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て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。
(2008年9月)

目次

概要に関する項目	4	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	
1. 開発の経緯		4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	
2. 製品の治療学的・製剤学的特性		5. 慎重投与内容とその理由	
名称に関する項目	5	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	
1. 販売名		7. 相互作用	
2. 一般名		8. 副作用	
3. 構造式又は示性式		9. 高齢者への投与	
4. 分子式及び分子量		10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	
5. 化学名（命名法）		11. 小児等への投与	
6. 慣用名、別名、略号、記号番号		12. 臨床検査結果に及ぼす影響	
7. CAS 登録番号		13. 過量投与	
有効成分に関する項目	7	14. 適用上の注意	
1. 物理化学的性質		15. その他の注意	
2. 有効成分の各種条件下における安定性		16. その他	
3. 有効成分の確認試験法		非臨床試験に関する項目	3 1
4. 有効成分の定量法		1. 薬理試験	
製剤に関する項目	8	2. 毒性試験	
1. 剤形		管理的事項に関する項目	3 2
2. 製剤の組成		1. 規制区分	
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に関する注意		2. 有効期間又は使用期限	
4. 製剤の各種条件下における安定性		3. 貯法・保存条件	
5. 調整法及び溶解後の安定性		4. 薬剤取扱い上の注意点	
6. 他剤との配合変化（物理化学的变化）		5. 承認条件等	
7. 溶出性		6. 包装	
8. 生物学的試験法		7. 容器の材質	
9. 製剤中の有効成分の確認試験法		8. 同一成分・同効薬	
10. 製剤中の有効成分の定量法		9. 国際誕生年月日	
11. 力価		10. 製造販売承認年月日及び承認番号	
12. 混入する可能性のある夾雑物		11. 薬価基準収載年月日	
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報		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	
14. その他		13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	
治療に関する項目	1 7	14. 再審査期間	
1. 効能又は効果		15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	
2. 用法及び用量		16. 各種コード	
3. 臨床成績		17. 保険給付上の注意	
薬効薬理に関する項目	1 9	文献	3 5
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群		1. 引用文献	
2. 薬理作用		2. その他の参考文献	
薬物動態に関する項目	2 0	参考資料	3 5
1. 血中濃度の推移・測定法		1. 主な外国での発売状況	
2. 薬物速度論的パラメータ		2. 海外における臨床支援情報	
3. 吸収		備考	3 5
4. 分布		その他の関連資料	
5. 代謝			
6. 排泄			
7. 透析等による除去率			
安全性（使用上の注意等）に関する項目	2 5		
1. 警告内容とその理由			
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）			

．概要に関する項目

1．開発の経緯

ロサルタンカリウムは、アンギオテンシン 受容体に選択的に拮抗し、ブラジキニン代謝に直接的な影響を及ぼさずに降圧作用を示す、A- アンタゴニストである。

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」、ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」及びロサルタンカリウム錠 100mg「本草」は本草製薬株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 0331015 号（平成 17 年 3 月 31 日）に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、平成 24 年 2 月に承認を得た。

2．製品の治療学的・製剤学的特性

該当資料なし

．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「本草」
ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」
ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」

(2) 洋名

LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 25mg
LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 50mg
LOSARTAN POTASSIUM TABLETS 100mg

(3) 名称の由来

成分名

2．一般名

(1) 和名(命名法)

ロサルタンカリウム (JAN)

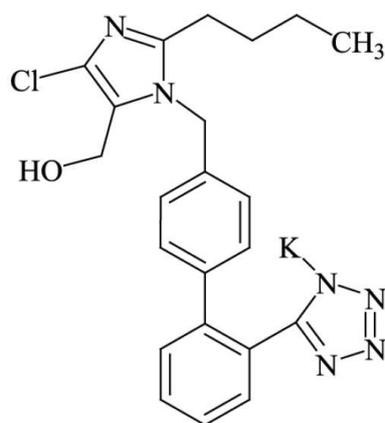
(2) 洋名(命名法)

Losartan Potassium (JAN)

(3) ステム

アンギオテンシン 受容体拮抗薬：-sartan

3．構造式又は示性式



4．分子式及び分子量

分子式： C₂₂H₂₂ClKN₆O

分子量： 461.00

5 . 化学名 (命名法)

Monopotassium5- {[4 - (2-butyl-4-chloro-5-hydroxymethyl-1H-imidazol-1-yl)methyl]-
biphenyl-2-yl}-1H-tetrazol-1-ide (IUPAC)

6 . 慣用名、別名、略号、記号番号

該当資料なし

7 . C A S 登録番号

1 2 4 7 5 0 - 9 9 - 8

．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

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

- (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)

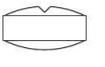
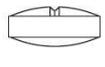
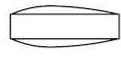
4．有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

・ 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

商品名		ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」	ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」	ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」			
剤形		フィルムコーティング錠					
色調		白色					
重量		78mg	156mg	312mg			
形 状	表面		直径 約 5.6mm		直径 約 7.6mm		長径 約 11.1mm 短径 約 7.6mm
	裏面						
	側面		厚さ 約 3.1mm		厚さ 約 3.5mm		厚さ 約 4.5mm

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」

白色の片面割線入りフィルムコーティング錠である。

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」

白色の片面割線入りフィルムコーティング錠である。

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」

ティアドロップ形の白色のフィルムコーティング錠である。

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」：HN201（本体・P T P）

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」：HN202（本体・P T P）

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」：HN203（本体・P T P）

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」

1錠中、ロサルタンカリウム 25mg を含有する。

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」

1錠中、ロサルタンカリウム 50mg を含有する。

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」

1錠中、ロサルタンカリウム 100mg を含有する。

(2) 添加物

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」

添加物として、乳糖水和物、部分アルファー化デンプン、セルロース、無水ケイ酸、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、酸化チタン、カルナウバロウを含有する。

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」

添加物として、乳糖水和物、部分アルファー化デンプン、セルロース、無水ケイ酸、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、酸化チタン、カルナウバロウを含有する。

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」

添加物として、乳糖水和物、部分アルファー化デンプン、セルロース、無水ケイ酸、ステアリン酸Mg、ヒプロメロース、ヒドロキシプロピルセルロース、酸化チタン、カルナウバロウを含有する。

(3) その他

該当記載事項なし

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⁾

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」

< 加速試験 >

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、ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

保存形態：PTP包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	99.6	99.2

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」

< 加速試験 >

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、ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

保存形態：P T P 包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	99.9	99.6

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」

< 加速試験 >

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、ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

保存形態：P T P 包装

試験項目	試験開始時	6ヶ月後
性状	適合	適合
確認試験	適合	適合
製剤均一性試験	適合	適合
溶出試験	適合	適合
定量試験(%) (95.0~105.0)	98.7	98.6

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)

該当資料なし

7. 溶出性

溶出挙動における類似性²⁾

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審第487号、平成13年5月31日付医薬審第786号及び平成18年11月24日付薬食審第1124004号)」

試験方法

装置 : 日本薬局方一般試験法溶出試験第2法(パドル法)

試験液量 : 900mL

温度 : 37±0.5

回転数 : 50 回転
 試験液 : pH1.2 = 日本薬局方溶出試験第 1 液
 pH5.0 = 薄めた McIlvaine の緩衝液
 pH6.8 = 日本薬局方溶出試験第 2 液
 水 = 日本薬局方精製水

判定基準 : 【pH1.2】

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 50%以上 85%に達しない場合、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 \pm 12%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 46 以上である。

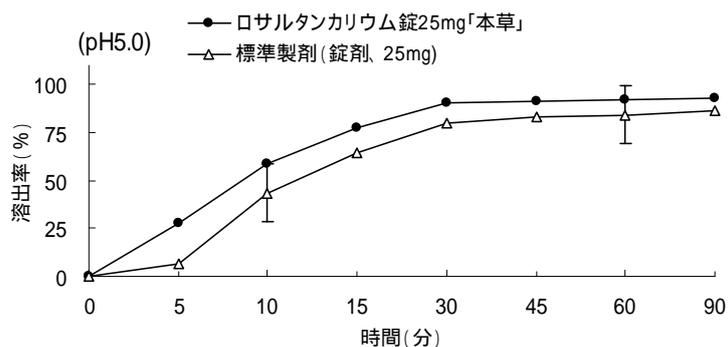
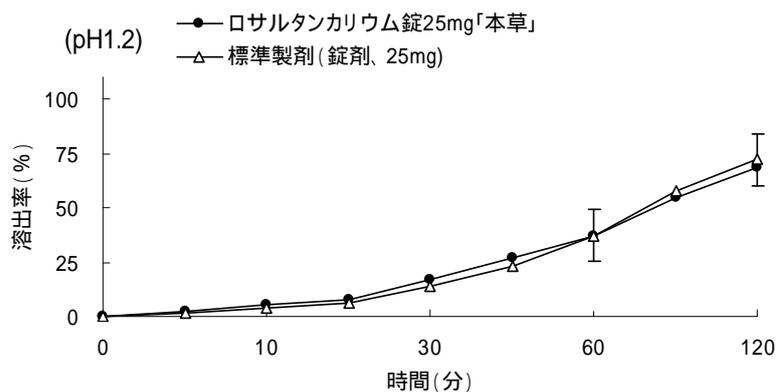
【pH5.0】

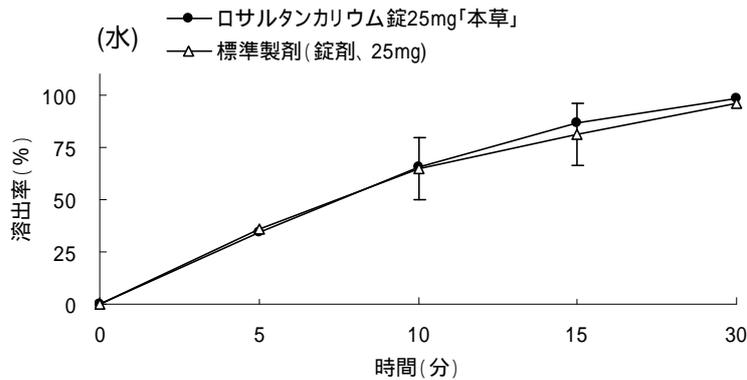
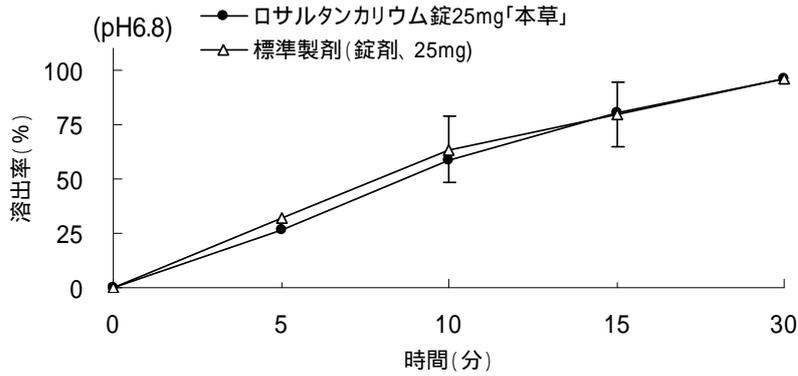
標準製剤が 30 分～規定された時間に平均 85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 \pm 15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。

【pH6.8、水】

標準製剤が 15 分～30 分に平均 85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 \pm 15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。

試験結果 :





ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 9 年 12 月 22 日付医薬審第 487 号、平成 13 年 5 月 31 日付医薬審第 786 号及び平成 18 年 11 月 24 日付薬食審第 1124004 号)」

試験方法

装置 : 日本薬局方一般試験法溶出試験第 2 法(パドル法)

試験液量 : 900mL

温度 : 37 ± 0.5

回転数 : 50 回転

試験液 : pH 1.2 = 日本薬局方溶出試験第 1 液

pH 5.0 = 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH 6.8 = 日本薬局方溶出試験第 2 液

水 = 日本薬局方精製水

判定基準 : 【pH 1.2】

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 50%以上 85%に達しない場合、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 12\%$ の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 46 以上である。

【pH 5.0】

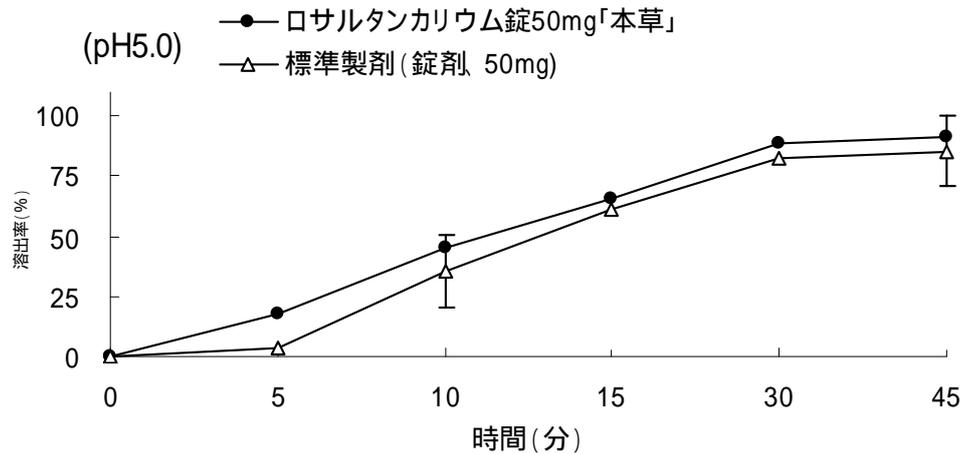
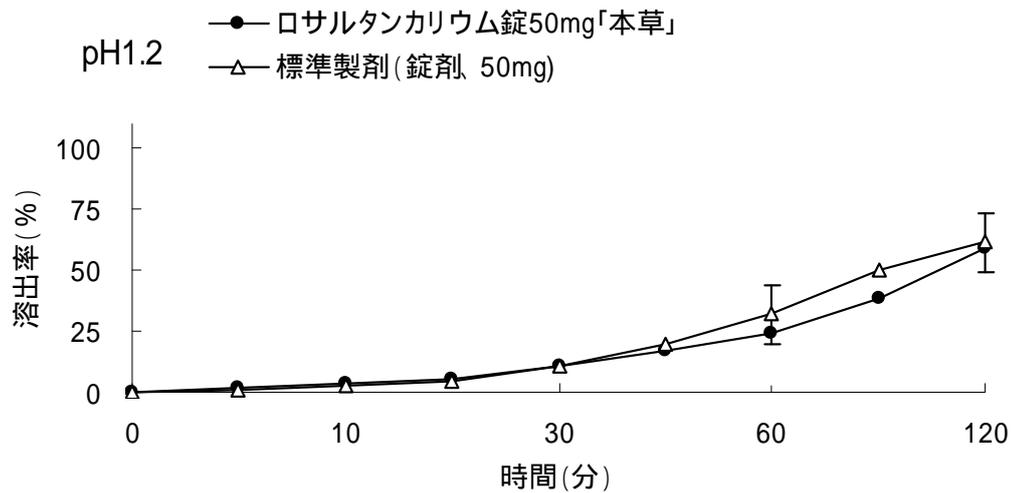
標準製剤が 30 分 ~ 規定された時間に平均 85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率

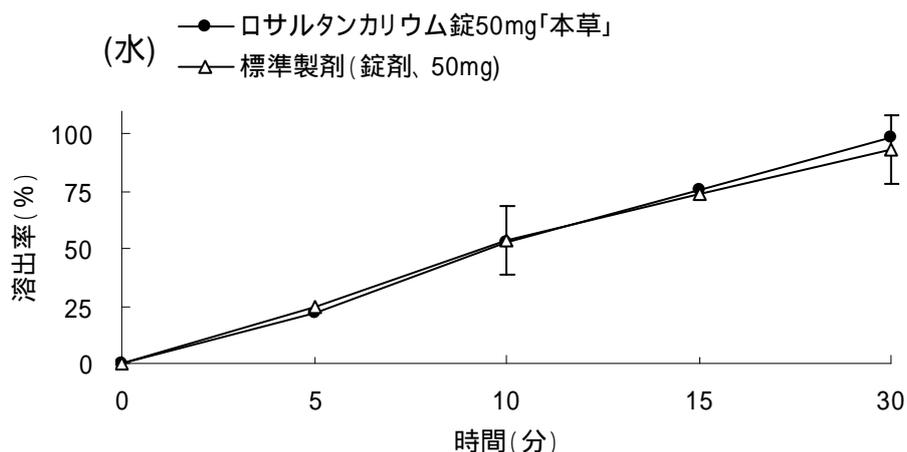
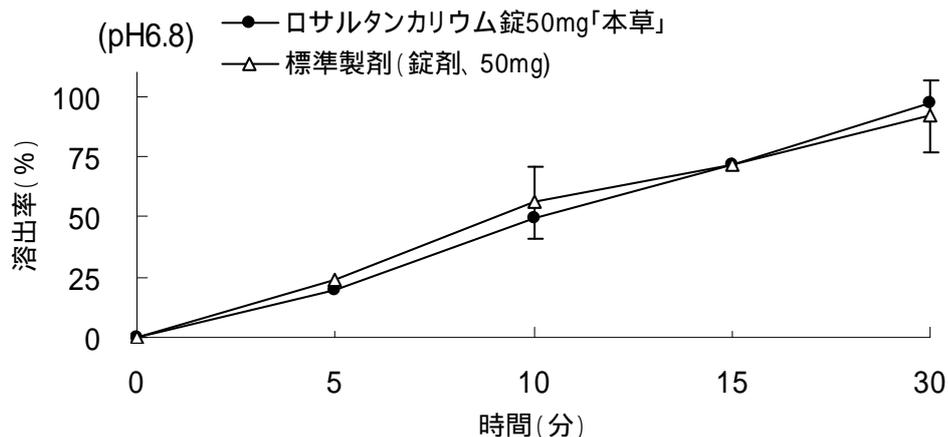
が 40% 及び 85% 付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 42 以上である。

【pH6.8、水】

標準製剤が 15 分～30 分に平均 85% 以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が 60% 及び 85% 付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 42 以上である。

試験結果：





ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成9年12月22日付医薬審第487号、平成13年5月31日付医薬審第786号及び平成18年11月24日付薬食審第1124004号)」

試験方法

装置 : 日本薬局方一般試験法溶出試験第2法(パドル法)

試験液量 : 900mL

温度 : 37 ± 0.5

回転数 : 50 回転

試験液 : pH1.2 = 日本薬局方溶出試験第1液

pH5.0 = 薄めた McIlvaine の緩衝液

H6.8 = 日本薬局方溶出試験第2液

水 = 日本薬局方精製水

判定基準 : 【pH1.2】

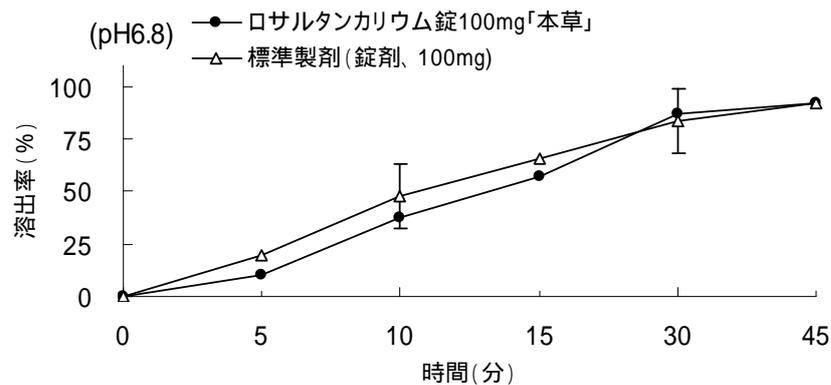
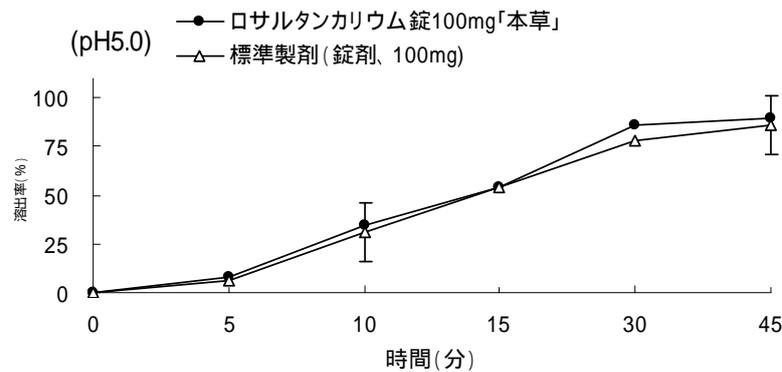
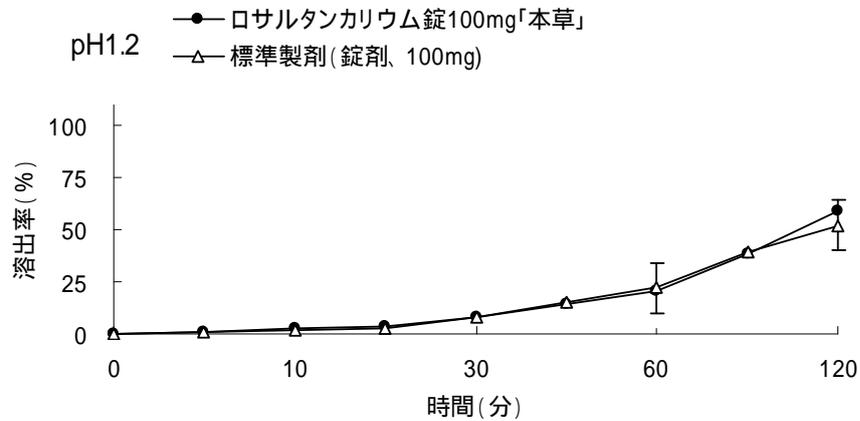
規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が50%以上85%に達しない場合、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及

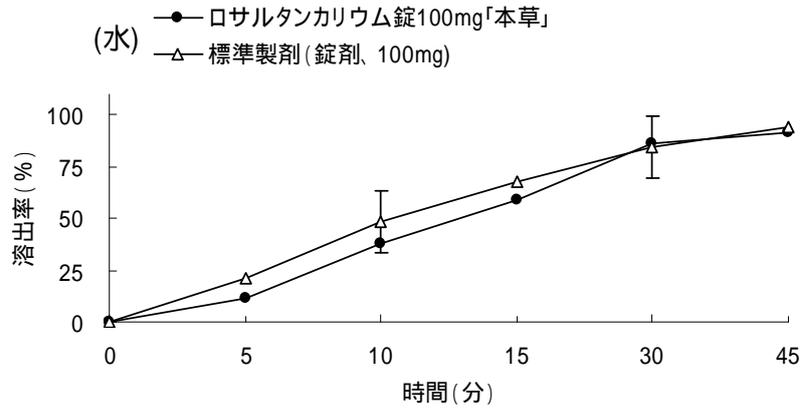
び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 12\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 46 以上である。

【pH5.0、pH6.8、水】

標準製剤が 30 分～規定された時間に平均 85%以上溶出する場合、標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 42 以上である。

試験結果：





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

薄層クロマトグラフィー

10 . 製剤中の有効成分の定量法

液体クロマトグラフィー

11 . 力価

該当しない

12 . 混入する可能性のある夾雑物³⁾

イミダゾール環部とテトラゾール環部の間、又はイミダゾール環部間での2分子縮合体

13 . 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

14 . その他

．治療に関する項目

1．効能又は効果

高血圧症

効能又は効果に関連する使用上の注意

該当記載なし

2．用法及び用量

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。

用法及び用量に関連する使用上の注意

該当記載なし

3．臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床効果

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

(4) 探索的試験：用量反応探索試験

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

該当しない

．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

アンギオテンシン 受容体拮抗薬(カンデサルタン シレキセチル、オルメサルタン メドキシミル、テルミサルタン、バルサルタン等)

2．薬理作用

(1) 作用部位・作用機序³⁾

ロサルタンカリウムは、アンギオテンシン 受容体のうちA T 1 受容体と選択的に結合し、アンギオテンシン 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(キニナーゼ)には直接作用しない。

(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

・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²⁾

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」

約 1.9 時間

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」

約 1.4 時間

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」

約 1.4 時間

(3) 臨床試験で確認された血中濃度²⁾

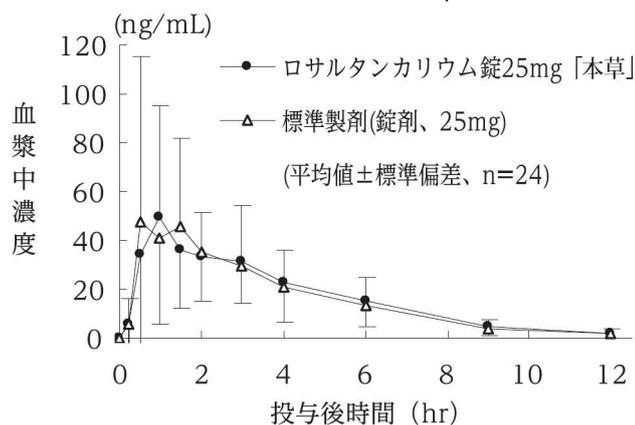
ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 9 年 12 月 22 日付医薬審第 487 号、平成 13 年 5 月 31 日付医薬審第 786 号、平成 18 年 11 月 24 日付薬食審第 1124004 号)」

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」と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 25mg) 健康成人男子 24 名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	Tmax (hr)	t _{1/2} (hr)
ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」	202.1 ± 63.9	83.1 ± 50.0	1.9 ± 1.5	2.0 ± 0.4
標準製剤 (錠剤、25mg)	197.6 ± 69.4	85.4 ± 51.7	1.4 ± 0.9	2.1 ± 0.3

(平均値 ± 標準偏差、n=24)



血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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。

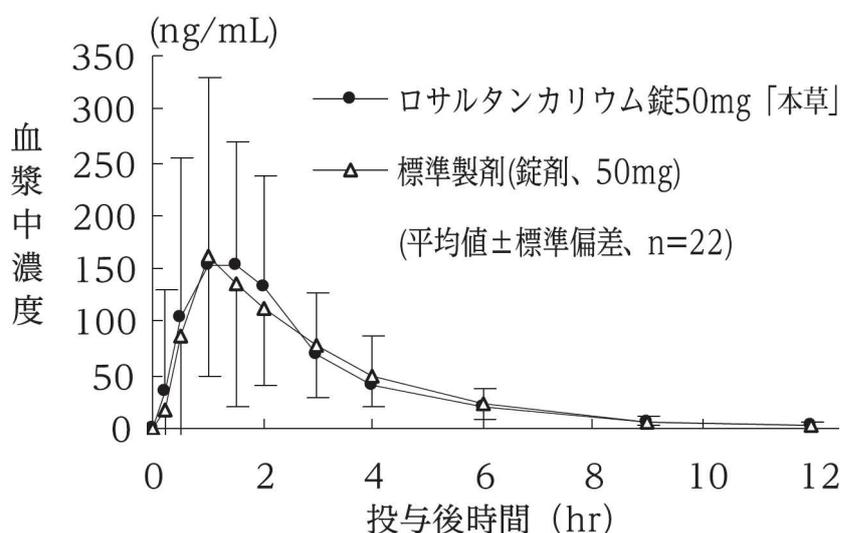
ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 9 年 12 月 22 日付医薬審第 487 号、平成 13 年 5 月 31 日付医薬審第 786 号、平成 18 年 11 月 24 日付薬食審第 1124004 号)」

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」と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 50mg) 健康成人男子 22 名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」	502.7 ± 193.1	257.3 ± 149.2	1.4 ± 0.9	1.8 ± 0.2
標準製剤 (錠剤、50mg)	501.3 ± 199.7	252.6 ± 150.0	1.7 ± 1.2	1.8 ± 0.2

(平均値 ± 標準偏差、n=22)



血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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「本草」

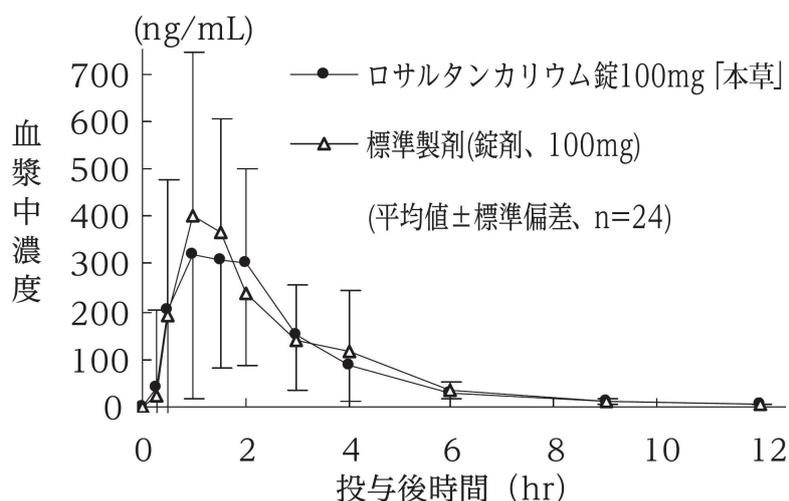
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 9 年 12 月 22 日付医薬審第 487 号、平成 13 年 5 月 31 日付医薬審第 786 号、平成 18 年 11 月 24 日付薬食審第 1124004 号)」

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」と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 100mg) 健康成人男子 24 名に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定

した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₀₋₁₂ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」	1013.9 ± 260.2	568.5 ± 178.4	1.4 ± 0.9	1.7 ± 0.2
標準製剤 (錠剤、100mg)	1086.3 ± 318.4	593.3 ± 224.3	1.7 ± 1.0	1.7 ± 0.2

(平均値 ± 標準偏差、n=24)



血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 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。

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

該当資料なし

(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) コンパートメントモデル

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

該当資料なし

(4) 消失速度定数²⁾

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」

0.36(hr⁻¹)

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」

0.39(hr⁻¹)

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」

0.42(hr⁻¹)

(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

該当資料なし

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

(参考：動物データ)

「 .安全性（使用上の注意等）に関する項目 10.妊婦、産婦、授乳婦等への投与」を参照

(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

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路³⁾

主に肝臓において主代謝物のカルボン酸体(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

該当資料なし

(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³⁾

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。

(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³⁾

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。

(2) 排泄率

「 . 薬物動態に関する項目 6 . 排泄 (1) 排泄部位及び経路」

(3) 排泄速度

「 . 薬物動態に関する項目 6 . 排泄 (1) 排泄部位及び経路」

7. 透析等による除去率

該当資料なし

．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

該当記載なし

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〕

3．効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当記載なし

4．用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当記載なし

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、厳重な減塩療法中、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)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．嚴重な減塩療法中の患者

ウ．血液透析中の患者

(4)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。

(5)手術前24時間は投与しないことが望ましい。

(6)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。

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

該当記載なし

(2) 併用注意とその理由

相互作用

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	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。
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。 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。	機序不明
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

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) アナフィラキシー様症状（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（頻度不明）

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（いずれも頻度不明）

4) 腎不全（頻度不明）

5) ショック、失神、意識消失（いずれも頻度不明）

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（頻度不明）

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不全の発症に注意すること。

7) 高カリウム血症（頻度不明）

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（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（いずれも頻度不明）

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（頻度不明）

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。

(3) その他の副作用

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。	
	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、動悸、調律障害（頻脈等）
消化器	口角炎、嘔吐・嘔気、胃不快感、胃潰瘍、口内炎、下痢
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、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 (CPK) 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）、筋痙攣、関節痛、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

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) アナフィラキシー様症状（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。

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。

	頻度不明
皮膚	発疹、そう痒、蕁麻疹、多形紅斑、光線過敏、紅皮症、紅斑

9. 高齢者への投与

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

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)

他のロサルタンカリウム製剤で、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、当該試験の無毒性量は追加試験の成績から5mg/kg/日であったとの報告がある。

11. 小児等への投与

小児等への投与

小児等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

該当記載なし

13. 過量投与

該当記載なし

14. 適用上の注意

適用上の注意（薬剤交付時）

P T P 包装の薬剤はP T Pシートから取り出して服用するよう指導すること。〔P T P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

該当記載なし

16. その他

・ 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

処方せん医薬品注)

注) 注意 医師等の処方せんにより使用すること

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年

3. 貯法・保存条件

室温保存、気密容器

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

湿気を避けて保存してください。

(2) 薬剤交付時の注意(患者等に留意すべき必須事項等)

「 . 安全性(使用上の注意等)に関する項目 14. 適用上の注意」を参照。

5. 承認条件等

該当資料なし

6. 包装

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」

P T P : 100 錠

ロサルタンカリウム錠 50 mg「本草」

P T P : 100 錠

ロサルタンカリウム錠 100 mg「本草」

P T P : 100 錠

7. 容器の材質

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」

P T P : アルミニウム箔、ポリ塩化ビニルフィルム、ポリエチレンテレフタレート・ポリエチレン蒸着フィルム

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」

P T P : アルミニウム箔、ポリ塩化ビニルフィルム、ポリエチレンテレフタレート・ポリエチレン蒸着フィルム

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」

P T P : アルミニウム箔、ポリ塩化ビニルフィルム、ポリエチレンテレフタレート・ポリエチレ

ン蒸着フィルム

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ニューロタン（MSD）

同効薬：アンギオテンシン 受容体拮抗薬(カンデサルタン シレキセチル、オルメサルタン メドキシミル、テルミサルタン、バルサルタン等)

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

承認年月日

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」：平成 24 年 2 月 15 日

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」：平成 24 年 2 月 15 日

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」：平成 24 年 2 月 15 日

承認番号

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」：22400AMX00597000

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」：22400AMX00422000

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」：22400AMX00426000

11. 薬価基準収載年月日

ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」：薬価基準未収載

ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」：薬価基準未収載

ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」：薬価基準未収載

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

該当しない

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

本剤は投与期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード

販売名	HOT(9)番号	厚生労働省薬価基準	収載医薬品コード
ロサルタンカリウム錠 25mg「本草」			
ロサルタンカリウム錠 50mg「本草」			
ロサルタンカリウム錠 100mg「本草」			

17. 保険給付上の注意

． 文 献

1 ． 引用文献

- 1) 本草製薬 (株) 社内資料 : 安定性試験
- 2) 本草製薬 (株) 社内資料 : 生物学的同等性試験
- 3) 第十六改正日本薬局方解説書 廣川書店 C-5372 ~ 5377p

2 ． その他の参考文献

． 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

該当しない

． 備考

その他の関連資料

該当資料なし

[MEMO]

製造販売元

本草製薬

本草製薬株式会社

名古屋市天白区古川町125番地