製造販売元
本草製薬株式会社
名古屋市天白区古川町125番地

A-Ⅱアンタゴニスト

処方せん医薬品

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

（ロサルタンカリウム錠）

［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）

製造販売元
本草製薬株式会社
名古屋市天白区古川町125番地

薬物動態（生物学的同等性試験）

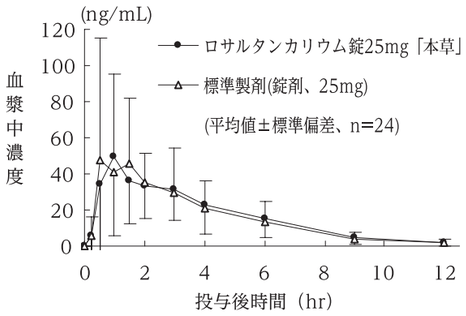
ロサルタンカリウム錠25mg「本草」

生物学的同等性試験

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、Cmax）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	
	$AUC_{0\text{-}12}$ (ng･hr/mL)	Cmax (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、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。

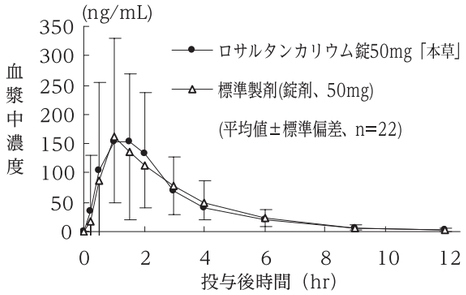
ロサルタンカリウム錠50mg「本草」

生物学的同等性試験

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、Cmax）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	
	$AUC_{0\text{-}12}$ (ng･hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (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、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。

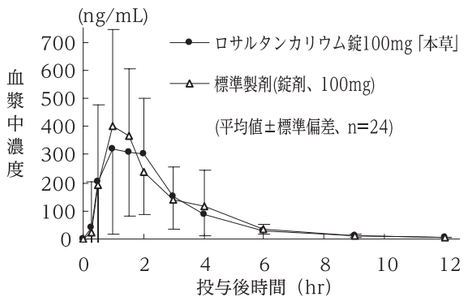
ロサルタンカリウム錠100mg「本草」

生物学的同等性試験

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、Cmax）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	
	$AUC_{0\text{-}12}$ (ng･hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (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、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。

ドラッグインフォメーション

販売名	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」 LOSARTAN POTASSIUM TABLETS	承認番号	錠 25mg 22400AMX00597000 錠 50mg 22400AMX00422000 錠100mg 22400AMX00426000
		薬価収載	2012年６月
一般名	ロサルタンカリウム (Losartan Potassium)	販売開始	2012年６月
日本標準商品分類番号	872149	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

【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）

【組成・性状】

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。
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」
１錠中、ロサルタンカリウム50mgを含有する。
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」
１錠中、ロサルタンカリウム100mgを含有する。
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。

	外形 表	外形 裏	外形 側面	直径(mm)	厚さ(mm)	重量(mg)	識別コード(PTP)
ロサルタンカリウム錠25mg「本草」	HN 201	25		約5.6	約3.1	78	HN 201
ロサルタンカリウム錠50mg「本草」	HN 202	50		約7.6	約3.5	156	HN 202
ロサルタンカリウム錠100mg「本草」	HN 203	100		長径：約11.1 短径：約7.6	約4.5	312	HN 203

【効能又は効果】

高血圧症

【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。

【使用上の注意】

１．**慎重投与**（次の患者には慎重に投与すること）
（１）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2.5 mg/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）

２．**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．厳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。

３．**相互作用**
本剤は、主に薬物代謝酵素チトクロームP 450 2C9(CYP 2C9)により活性代謝物であるカルボン酸体に代謝される。
併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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	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ると考えられている。

４．**副作用**
本剤は、使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。
（１）**重大な副作用**
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、厳重な減塩療法中、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。
（２）**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

５．**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ので、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。

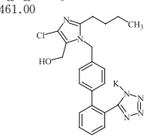
６．**妊婦、産婦、授乳婦等への投与**
（１）妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。また、投与中に妊娠が判明した場合には、直ちに投与を中止すること。
［妊娠中期及び末期に本剤を含むアンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤を投与された高血圧症の患者で羊水過少症、胎児・新生児の死亡、新生児の低血圧、腎不全、多臓器不全、頭蓋の形成不全及び羊水過少症によると推測される四肢の奇形、頭蓋顔面の奇形、肺の発育不全等があらわれたとの報告がある。］
（２）本剤投与中は授乳を中止させること。
［動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。］
（参考）
他のロサルタンカリウム製剤で、ラットの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。

７．**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）。

８．**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、更には穿孔をお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）

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：ロサルタンカリウム（Losartan Potassium）
化学名：Monopotassium 5-[[4'-(2-butyl-4-chloro-5-hydroxymethyl-1H-imidazol-1-yl)methyl]-biphenyl-2-yl]-1H-tetrazol-1-ide
分子式：$C_{22}H_{22}ClKN_6O$
分子量：461.00
構造式：



性　状：白色の結晶性の粉末である。
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。

【取扱い上の注意】

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」は通常の市場流通下において３年間安定であることが推測された。

【包　装】

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

平成24年４月作成

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