

## 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

## A-II アンタゴニスト

日本薬局方 ロサルタンカリウム錠

ロサルタンカリウム錠 25mg 「TCK」

ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」

ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」

LOSARTAN POTASSIUM Tablets 「TCK」

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品（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錠中にロサルタンカリウム（日局）を 25mg 含有する。 錠 50mg：1錠中にロサルタンカリウム（日局）を 50mg 含有する。 錠 100mg：1錠中にロサルタンカリウム（日局）を 100mg 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 ・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 辰巳化学株式会社
医薬情報担当者の 連絡先	
問い合わせ窓口	辰巳化学株式会社 薬事・学術課 TEL:076-247-2132 FAX:076-247-5740 医療関係者向け情報 <a href="https://www.tatsumi-kagaku.com/public/info_medical/list.php">https://www.tatsumi-kagaku.com/public/info_medical/list.php</a>

本IFは2024年1月改訂（第1版）の添付文書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－

(2020年4月改訂)

## 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、I F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I Fの位置付け、I F記載様式、I F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I F記載要領の改訂を行ってきた。I F記載要領2008以降、I F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I Fが速やかに提供されることとなった。最新版のI F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I F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I F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、I F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. I Fとは

I F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。

I Fに記載する項目配列は日病薬が策定したI F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 I F 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 I F 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。

I F 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. I F の利用にあたって

電子媒体の I F は、PMD A 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 I F を作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 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、I F 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、I F 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、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMD A 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

I F 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。I F 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 I F 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、I F 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。

# 目次

I.	概要に関する項目	1	8.	トランスポーターに関する情報	26
1.	開発の経緯	1	9.	透析等による除去率	26
2.	製品の治療学的特性	1	10.	特定の背景を有する患者	26
3.	製品の製剤学的特性	1	11.	その他	26
4.	適正使用に関して周知すべき特性	1	VIII.	安全性（使用上の注意等）に関する項目	27
5.	承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1.	警告内容とその理由	27
6.	RMP の概要	1	2.	禁忌内容とその理由	27
II.	名称に関する項目	2	3.	効能又は効果に関連する注意とその理由	27
1.	販売名	2	4.	用法及び用量に関連する注意とその理由	27
2.	一般名	2	5.	重要な基本的注意とその理由	27
3.	構造式又は示性式	2	6.	特定の背景を有する患者に関する注意	28
4.	分子式及び分子量	2	7.	相互作用	30
5.	化学名（命名法）又は本質	2	8.	副作用	32
6.	慣用名、別名、略号、記号番号	3	9.	臨床検査結果に及ぼす影響	33
III.	有効成分に関する項目	4	10.	過量投与	34
1.	物理化学的性質	4	11.	適用上の注意	34
2.	有効成分の各種条件下における安定性	4	12.	その他の注意	34
3.	有効成分の確認試験法、定量法	4	IX.	非臨床試験に関する項目	35
IV.	製剤に関する項目	5	1.	薬理試験	35
1.	剤形	5	2.	毒性試験	35
2.	製剤の組成	6	X.	管理的事項に関する項目	36
3.	添付溶解液の組成及び容量	6	1.	規制区分	36
4.	力価	6	2.	有効期間	36
5.	混入する可能性のある夾雑物	6	3.	包装状態での貯法	36
6.	製剤の各種条件下における安定性	7	4.	取扱い上の注意	36
7.	調製法及び溶解後の安定性	11	5.	患者向け資材	36
8.	他剤との配合変化（物理化学的変化）	11	6.	同一成分・同効薬	36
9.	溶出性	12	7.	国際誕生年月日	36
10.	容器・包装	12	8.	製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準取載年月日、販売開始年月日	37
11.	別途提供される資材類	19	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	37
12.	その他	19	10.	再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	37
V.	治療に関する項目	20	11.	再審査期間	37
1.	効能又は効果	20	12.	投薬期間制限に関する情報	37
2.	効能又は効果に関連する注意	20	13.	各種コード	37
3.	用法及び用量	20	14.	保険給付上の注意	37
4.	用法及び用量に関連する注意	20	XI.	文献	38
5.	臨床成績	20	1.	引用文献	38
VI.	薬効薬理に関する項目	22	2.	その他の参考文献	38
1.	薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	22	XII.	参考資料	39
2.	薬理作用	22	1.	主な外国での発売状況	39
VII.	薬物動態に関する項目	23	2.	海外における臨床支援情報	39
1.	血中濃度の推移	23	XIII.	備考	40
2.	薬物速度論的パラメータ	25	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	40
3.	母集団（ポピュレーション）解析	25	2.	その他の関連資料	43
4.	吸収	25			
5.	分布	25			
6.	代謝	26			
7.	排泄	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「TCK」／錠 50mg「TCK」／錠 100mg「TCK」は、辰巳化学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（2005 年 3 月 31 日）に基づき、承認申請し、2012 年 2 月に承認を得て、2012 年 6 月発売に至った。

また、2012 年 10 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、用法及び用量の追加が承認された。

## 2. 製品の治療学的特性

本剤は、ロサルタンカリウム（日局）を有効成分とする A-II アンタゴニストである。

主な副作用として頭痛、めまい、肝機能障害（AST 上昇、ALT 上昇、LDH 上昇等）、BUN 上昇、クレアチニン上昇がある。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あらわれることがある。（「VIII. 8. 副作用」の項参照）

## 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、 最適使用推進ガイドライン等	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

## 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

## 6. RMP の概要

該当しない

## II. 名称に関する項目

### 1. 販売名

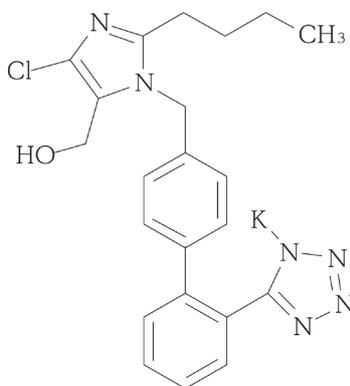
- (1) 和名：ロサルタンカリウム錠 25mg 「TCK」  
ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」  
ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」
- (2) 洋名：LOSARTAN POTASSIUM Tablets 25mg 「TCK」  
LOSARTAN POTASSIUM Tablets 50mg 「TCK」  
LOSARTAN POTASSIUM Tablets 100mg 「TCK」
- (3) 名称の由来  
有効成分に係る一般的名称+剤型+含量+屋号

### 2. 一般名

- (1) 和名：ロサルタンカリウム (JAN)
- (2) 洋名：Losartan Potassium (JAN)  
Losartan (INN)
- (3) ステム：アンジオテンシン II 受容体拮抗薬：-sartan

### 3. 構造式又は示性式

構造式：



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>22</sub>H<sub>22</sub>ClKN<sub>6</sub>O

分子量：461.00

### 5. 化学名（命名法）又は本質

Monopotassium 5-{[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

### 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

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、定量法

確認試験法

日本薬局方による

定量法

日本薬局方による

## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

錠剤（フィルムコーティング錠）

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	外形			色調 剤形
	直径(mm)	厚さ(mm)	重量(mg)	
ロサルタンカリウム錠 25mg「TCK」	 5.6	 3.1	 76	白色 フィルム コーティング錠 (割線入り)
ロサルタンカリウム錠 50mg「TCK」	 7.6	 3.5	 152	白色 フィルム コーティング錠 (割線入り)
ロサルタンカリウム錠 100mg「TCK」	 11.1×7.6	 4.3	 275	白色 ティアドロップ型 フィルム コーティング錠

#### (3) 識別コード

販売名	本体	包装材料
ロサルタンカリウム錠 25mg「TCK」	TU 251	TU 251
ロサルタンカリウム錠 50mg「TCK」	TU 252	TU 252
ロサルタンカリウム錠 100mg「TCK」	TU 253	TU 253

#### (4) 製剤の物性

該当資料なし

#### (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

販売名	有効成分（1錠中）	添加剤
ロサルタンカリウム錠 25mg「TCK」	ロサルタンカリウム （日局）25mg	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、酸化チタン、カルナ ウバロウ
ロサルタンカリウム錠 50mg「TCK」	ロサルタンカリウム （日局）50mg	
ロサルタンカリウム錠 100mg「TCK」	ロサルタンカリウム （日局）100mg	

### (2) 電解質等の濃度

該当しない

### (3) 熱量

該当しない

## 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

混入が予想される類縁物質として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分子縮合体が日本薬局方医薬品各条で規定されている。

## 6. 製剤の各種条件下における安定性

### 試験項目及び規格

試験項目	規 格
性状	25mg 及び 50mg：白色の割線入りフィルムコーティング錠 100mg：白色でティアドロップ形のフィルムコーティング錠
確認試験	薄層クロマトグラフィー 規格：試料溶液から得た主スポット及び標準溶液から得られたスポットの Rf 値は等しい
製剤均一性 (含量均一性)	判定値は 15.0%を超えない
溶出性	25mg 及び 50mg：45 分間の溶出率は 85%以上である（パドル法、水、50rpm） 100mg：30 分間の溶出率は 85%以上である（パドル法、水、75rpm）
定量	表示量の 95.0～105.0%を含む

### <加速試験>

#### ●ロサルタンカリウム錠 25mg 「TCK」<sup>1)</sup>

保管条件：40±1°C、75±5%RH

包装形態：PTP 包装

試験結果：

	開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状	白色の割線入り フィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
確認試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性	適合			適合
溶出性	適合	適合	適合	適合
定量 (%)	100.9 100.7 100.6	100.4 100.3 100.5	100.2 100.0 100.6	99.7 100.1 100.6

1 ロット n=3 3 ロット

●ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」<sup>2)</sup>

保管条件：40±1°C、75±5%RH

包装形態：PTP 包装

試験結果：

	開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状	白色の割線入り フィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
確認試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性	適合	/		適合
溶出性	適合	適合	適合	適合
定量 (%)	100.4	100.1	99.8	99.8
	100.5	100.5	99.6	99.4
	100.3	100.3	99.7	99.6

1 ロット n=3 3 ロット

●ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」<sup>3)</sup>

保管条件：40±1°C、75±5%RH

包装形態：PTP 包装

試験結果：

	開始時	1 カ月後	3 カ月後	6 カ月後
性状	白色でティア ドロップ形の フィルム コーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
確認試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性	適合	/		適合
溶出性	適合	適合	適合	適合
定量 (%)	99.9	99.1	99.0	98.6
	100.3	99.7	99.1	98.9
	99.4	99.5	99.4	98.6

1 ロット n=3 3 ロット

< 無包装下の安定性 >

平成 11 年 8 月 20 日付「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）」  
（日本病院薬剤師会）を参考に、無包装状態の試験を行った。

●ロサルタンカリウム錠 25mg 「TCK」

保存条件		試験項目	規格	結果			
				開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
温度	40°C 遮光 気密容器	性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	白色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	4.60	4.50	4.35	4.41
		溶出性*2 (%)	45 分間、85% 以上 (最小値～最大値)	97.1～102.7	99.5～102.0	96.6～102.8	98.4～104.5
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	98.17	99.18	98.23	98.51
湿度	25°C 75%RH 遮光 開放	性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	白色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	4.60	5.27	5.16	6.05
		溶出性*2 (%)	45 分間、85% 以上 (最小値～最大値)	97.1～102.7	97.7～101.7	98.1～102.1	98.0～101.0
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	98.17	98.30	98.71	99.02

保存条件		試験項目	規格	結果		
				開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
光	温度 なりゆき 1000lx/hr 気密容器	性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	白色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	4.60	3.81	3.62
		溶出性*2 (%)	45 分間、85% 以上 (最小値～最大値)	97.1～102.7	99.4～104.2	96.1～101.6
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	98.17	98.71	98.22

\*1 n=5 の平均値

\*2 n=6

\*3 n=3 の平均値

●ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」

保存条件		試験項目	規格	結果			
				開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
温度	40°C 遮光 気密容器	性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	白色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	6.20	5.49	5.42	4.92
		溶出性*2 (%)	45 分間、85% 以上 (最小値～最大値)	98.2～102.4	99.3～103.4	88.7～102.3	97.4～102.3
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	98.72	98.95	97.92	99.22
湿度	25°C 75%RH 遮光 開放	性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	白色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	6.20	7.34	8.18	7.25
		溶出性*2 (%)	45 分間、85% 以上 (最小値～最大値)	98.2～102.4	98.7～101.9	100.1～101.3	96.8～101.9
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	98.72	98.57	99.05	99.23

保存条件		試験項目	規格	結果		
				開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
光	温度 なりゆき 1000lx/hr 気密容器	性状	白色の割線入りフィルムコーティング錠	白色の割線入りフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	6.20	4.94	4.68
		溶出性*2 (%)	45 分間、85% 以上 (最小値～最大値)	98.2～102.4	90.6～103.2	98.6～102.5
		定量*3 (%)	95.0%～105.0%	98.72	98.31	98.67

\*1 n=5 の平均値

\*2 n=6

\*3 n=3 の平均値

●ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」

保存条件		試験項目	規格	結果			
				開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
温度	40°C 遮光 気密容器	性状	白色のティアドロップ型フィルムコーティング錠	白色のティアドロップ型フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	7.54	7.20	6.39	7.03
		溶出性*2 (%)	30 分間、85%以上 (最小値~最大値)	95.1~99.9	95.9~100.2	97.0~100.4	95.6~102.3
		定量*3 (%)	95.0%~105.0%	98.21	98.33	98.64	98.91
湿度	25°C 75%RH 遮光 開放	性状	白色のティアドロップ型フィルムコーティング錠	白色のティアドロップ型フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	7.54	8.24	8.63	9.13
		溶出性*2 (%)	30 分間、85%以上 (最小値~最大値)	95.1~99.9	98.2~101.7	97.8~101.6	98.9~101.8
		定量*3 (%)	95.0%~105.0%	98.21	97.98	98.47	98.55

保存条件		試験項目	規格	結果		
				開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
光	温度 なりゆき 1000lx/hr 気密容器	性状	白色のティアドロップ型フィルムコーティング錠	白色のティアドロップ型フィルムコーティング錠	変化なし	変化なし
		硬度*1 (kg)	2.0kg 以上 (参考)	7.54	6.87	7.09
		溶出性*2 (%)	30 分間、85%以上 (最小値~最大値)	95.1~99.9	99.0~99.9	98.7~102.4
		定量*3 (%)	95.0%~105.0%	98.21	98.32	98.55

\*1 n=5 の平均値

\*2 n=6

\*3 n=3 の平均値

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

## 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 「TCK」<sup>4)</sup>

ロサルタンカリウム錠 25mg 「TCK」(試験製剤)は、「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(薬食審査発 1124004 号、2006 年 11 月 24 日)」に基づき、ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」を標準製剤としたとき、溶出挙動に基づき生物学的に同等とみなされた。

結果

平均溶出率

#### ○pH 1.2 (毎分 50 回転)

溶出曲線のラグ時間補正後、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(45 分)、及び規定された試験時間(95 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 $\pm 8\%$ の範囲にはなかったが、 $f_2$  関数の値は 55.9 であり、55 以上であった。

#### ○pH 4.0 (毎分 50 回転)

標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点(15 分及び 30 分)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 $\pm 10\%$ の範囲にないが、 $f_2$  関数の値は 51.1 であり、50 以上であった。

#### ○pH 6.8 (毎分 50 回転)、水 (毎分 50 回転)、pH 4.0 (毎分 100 回転)

試験製剤は 15 分以内に平均 85%以上溶出した。

個々の溶出率

#### ○pH 1.2 (毎分 50 回転)

溶出曲線のラグ時間補正後、試験製剤の平均溶出率 $\pm 12\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 20\%$ の範囲を超えるものがなかった。

#### ○pH 4.0 (毎分 50 回転)、pH 6.8 (毎分 50 回転)、水 (毎分 50 回転)、pH 4.0 (毎分 100 回転)

試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがなかった。

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較

溶出試験条件		判定時間 (分)	平均溶出率 (%)		結果
			ロサルタンカリウム 錠 50mg 「TCK」	ロサルタンカリウム 錠 25mg 「TCK」	
pH 1.2	50 回転/分	45	28.03	35.53	範囲内
		95	56.73	67.83	範囲外
		f2 関数の値は 55.9 で 55 以上			適合
pH 4.0	50 回転/分	15	65.57	49.38	範囲外
		30	85.53	84.94	範囲内
		f2 関数の値は 51.1 で 50 以上			適合
pH 6.8	50 回転/分	15	85.66	92.73	範囲内
水	50 回転/分	15	86.60	96.89	範囲内
pH 4.0	100 回転/分	15	91.63	96.43	範囲内

(n=12)

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率

溶出試験条件		最終比較時点 (分)	平均溶出率 (%)	個々の溶出率			結果
				最小～最大 (%)	±12%を 超える 個数	±20%を 超える 個数	
pH 1.2	50 回転/分	80 <sup>注)</sup>	58.17	46.4～67.1	0	0	適合

(n=12)

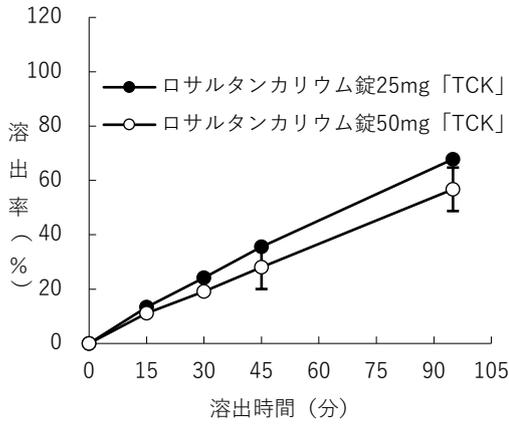
注) f2 関数を求めるために各時点の平均溶出率を内挿法により求めた。

溶出試験条件		最終比較時点 (分)	平均溶出率 (%)	個々の溶出率			結果
				最小～最大 (%)	±15%を 超える 個数	±25%を 超える 個数	
pH 4.0	50 回転/分	45 <sup>注)</sup>	91.06	84.3～96.9	0	0	適合
pH 6.8	50 回転/分	15	92.73	79.9～99.4	0	0	適合
水	50 回転/分	15	96.89	84.0～100.4	0	0	適合
pH 4.0	100 回転/分	15	96.43	90.2～98.9	0	0	適合

(n=12)

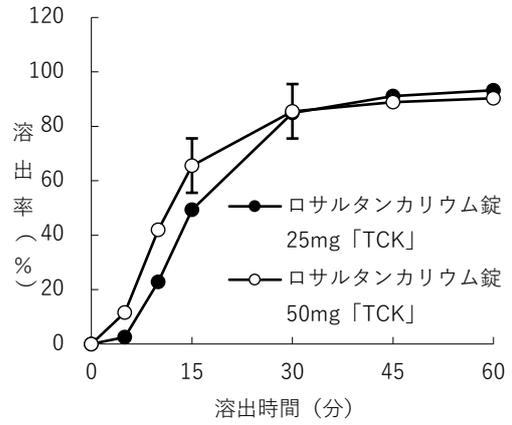
注) f2 関数を求めるために各時点の平均溶出率を内挿法により求めた。

pH 1.2 (毎分 50 回転)



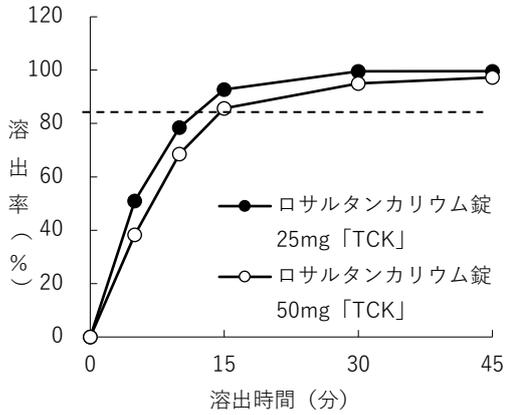
(n=12)

pH 4.0 (毎分 50 回転)



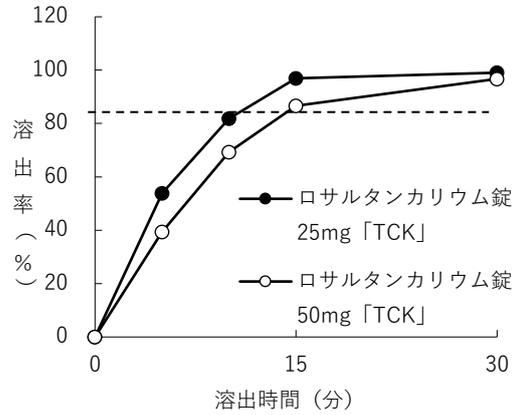
(n=12)

pH 6.8 (毎分 50 回転)



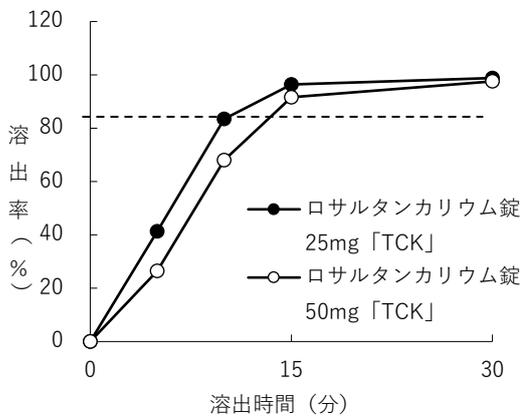
(n=12)

水 (毎分 50 回転)



(n=12)

pH 4.0 (毎分 100 回転)



(n=12)

--- 溶出率 85%  
 ○ 判定基準の  
 適合範囲

●ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」<sup>5)</sup>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（薬食審査発第 1124004 号、2006 年 11 月 24 日）に従いロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」（試験製剤）とニューロタン錠 50mg（標準製剤）との溶出挙動の比較を行った結果、全ての溶出試験条件において同等性試験ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。

結果

○pH 1.2（毎分 50 回転）

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（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。

○pH 4.0（毎分 50 回転）

標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる適当な 2 時点（15 分及び 45 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±15%の範囲になかったが、 $f_2$  関数の値は 45.2 であり、42 以上であった。

○pH 6.8（毎分 50 回転）

標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点（10 分及び 15 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±15%の範囲にあった。

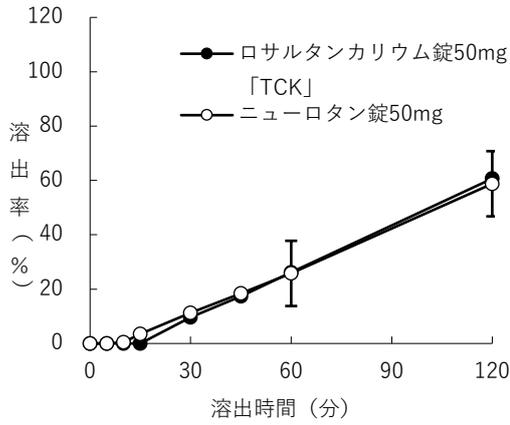
○水（毎分 50 回転）、pH 4.0（毎分 100 回転）

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率は 15 分以内に 85%以上であった。

溶出試験条件		判定時間 (分)	平均溶出率 (%)		平均溶出率の 差 (%)
			ニューロタン錠 50mg	ロサルタンカリウム 錠 50mg 「TCK」	
pH 1.2	50 回転/分	60	25.78	26.21	範囲内
		120	58.78	60.68	範囲内
pH 4.0	50 回転/分	15	46.48	65.57	範囲外
		45	86.49	88.88	範囲内
		$f_2$ 関数の値は 45.2 で、42 以上			適合
pH 6.8	50 回転/分	10	58.50	68.57	範囲内
		15	78.57	85.66	範囲内
水	50 回転/分	15	87.07	86.60	範囲内
pH 4.0	100 回転/分	15	96.42	91.63	範囲内

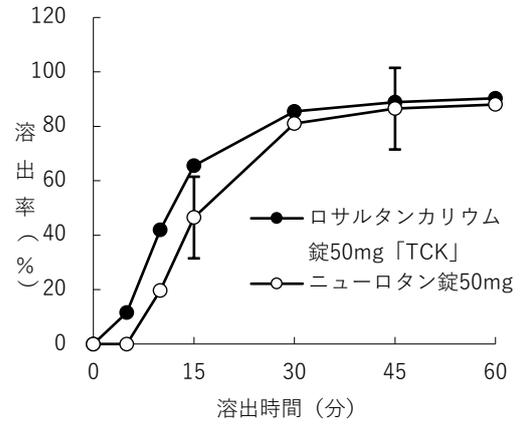
(n=12)

pH 1.2 (毎分 50 回転)



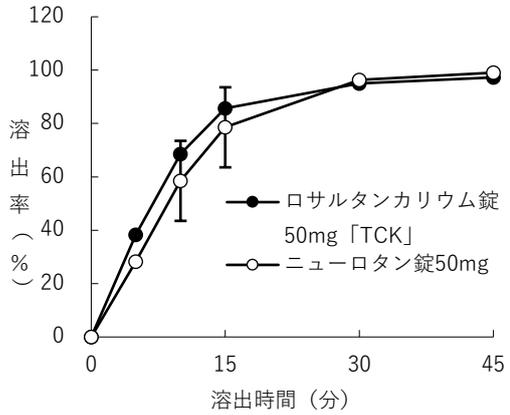
(n=12)

pH 4.0 (毎分 50 回転)



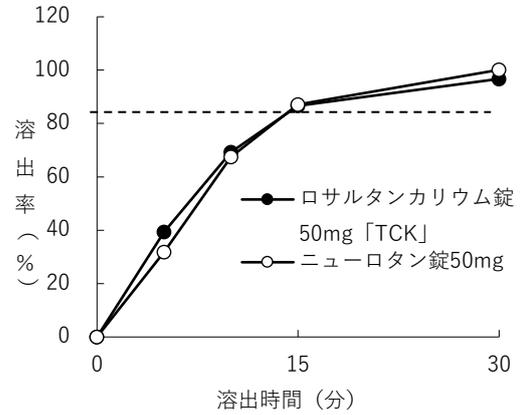
(n=12)

pH 6.8 (毎分 50 回転)



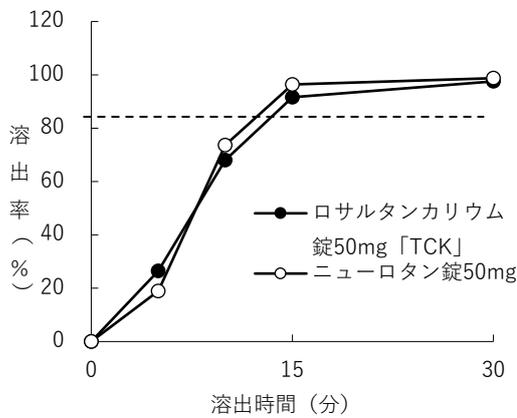
(n=12)

水 (毎分 50 回転)



(n=12)

pH 4.0 (毎分 100 回転)



(n=12)

--- 溶出率 85%  
 ○ 判定基準の  
 適合範囲

●ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」<sup>6)</sup>

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（薬食審査発第 1124004 号、2006 年 11 月 24 日）に従いロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」（試験製剤）とニューロタン錠 100mg（標準製剤）との溶出挙動の比較を行った結果、全ての溶出試験条件において同等性試験ガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合した。

結果

○pH 1.2（毎分 50 回転）

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（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±9%の範囲にあった。

○pH 5.0（毎分 50 回転）

標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近となる適当な 2 時点（10 分及び 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±15%の範囲にあった。

○pH 6.8（毎分 50 回転）

標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点（15 分及び 30 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±15%の範囲にあった。

○水（毎分 50 回転）

標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点（10 分及び 30 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±15%の範囲にあった。

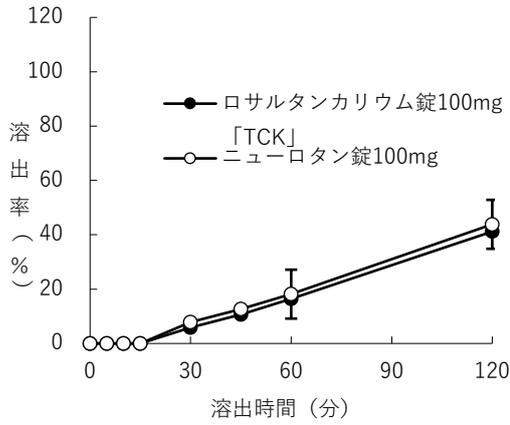
○pH 5.0（毎分 100 回転）

試験製剤及び標準製剤の平均溶出率は 15 分以内に 85%以上であった。

溶出試験条件		判定時間 (分)	平均溶出率 (%)		平均溶出率の 差 (%)
			ニューロタン錠 100mg	ロサルタンカリウム 錠 100mg 「TCK」	
pH 1.2	50 回転/分	60	18.16	16.40	範囲内
		120	43.85	41.19	範囲内
pH 5.0	50 回転/分	10	32.20	27.23	範囲内
		120	87.88	91.93	範囲内
pH 6.8	50 回転/分	15	67.62	68.51	範囲内
		30	88.99	93.89	範囲内
水	50 回転/分	10	51.55	48.56	範囲内
		30	91.55	91.96	範囲内
pH 5.0	100 回転/分	15	94.33	88.83	範囲内

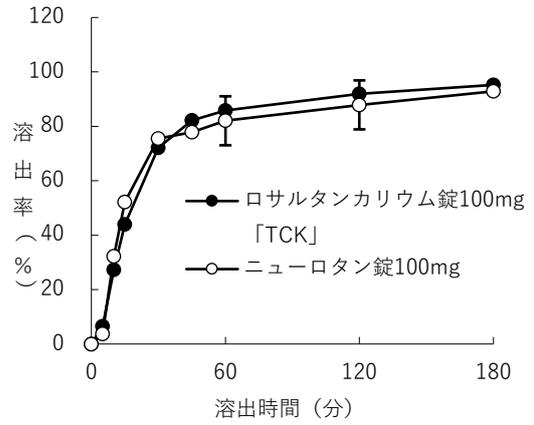
(n=12)

pH 1.2 (毎分 50 回転)



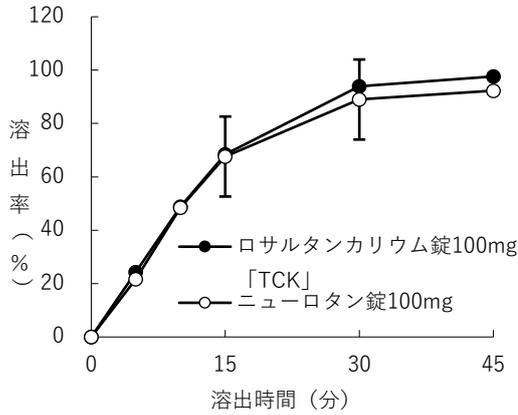
(n=12)

pH 5.0 (毎分 50 回転)



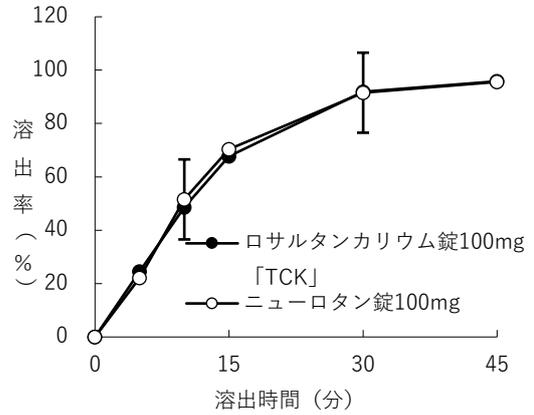
(n=12)

pH 6.8 (毎分 50 回転)



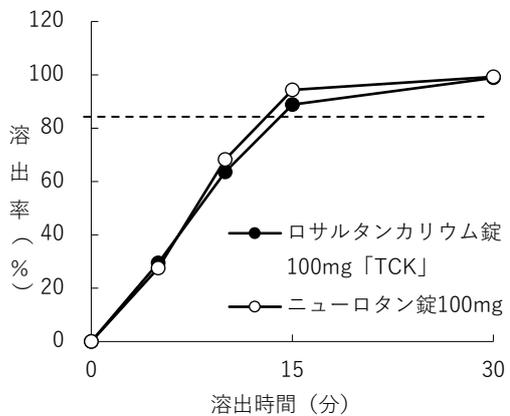
(n=12)

水 (毎分 50 回転)



(n=12)

pH 5.0 (毎分 100 回転)



(n=12)

--- 溶出率 85%  
 ○ 判定基準の  
 適合範囲

## 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

<ロサルタンカリウム錠 25mg 「TCK」 >

100 錠 (10 錠 (PTP) × 10)

500 錠 (10 錠 (PTP) × 50)

<ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」 >

100 錠 (10 錠 (PTP) × 10)

500 錠 (10 錠 (PTP) × 50)

<ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」 >

100 錠 (10 錠 (PTP) × 10)

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

包装形態	材質
PTP 包装	ポリプロピレンフィルム アルミニウム箔

## 11. 別途提供される資材類

無し

## 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

○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

〈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

該当資料なし

#### (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

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

該当資料なし

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受容体拮抗剤（バルサルタン、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 など）

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・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<sup>7),8)</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

#### (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

生物学的同等性試験

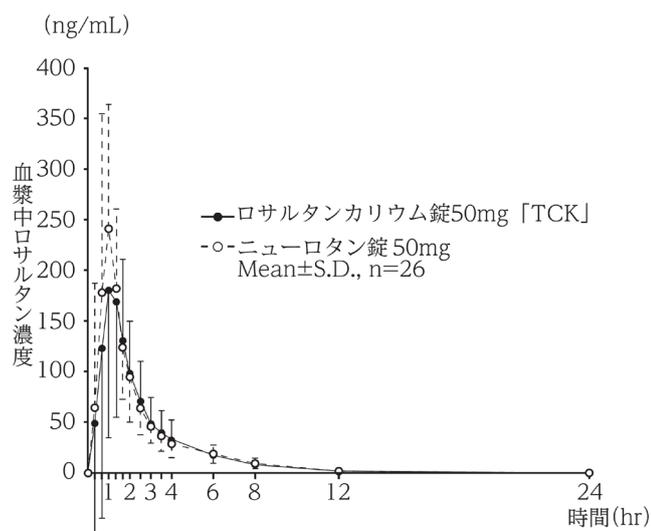
##### ●ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」

生物学的同等性試験ガイドライン（薬食審査発第 1124004 号 2006 年 11 月 24 日）

ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」とニューロタン錠 50mg 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 50mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、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。AUC については対数値の平均値の差の 90%信頼区間が  $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、また、 $C_{max}$  については対数値の平均値の差が  $\log(0.90) \sim \log(1.11)$  の範囲内で、かつ溶出挙動が類似していることから、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>9)</sup>。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→24h</sub> (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 「TCK」	450±155	277.43±132.96	1.29±0.59	2.22±0.41
ニューロタン錠 50mg	490±123	302.13±128.40	1.17±1.04	2.25±0.32

(Mean ± S.D., n=26)



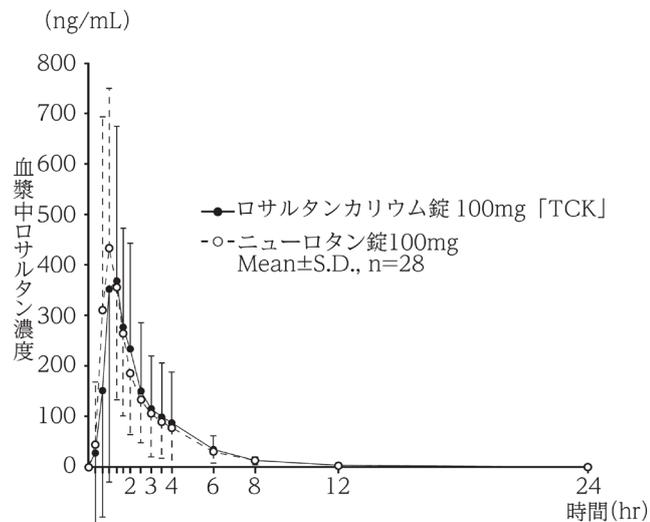
●ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」

生物学的同等性試験ガイドライン（薬食審査発第 1124004 号 2006 年 11 月 24 日）

ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」とニューロタン錠 100mg 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 100mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、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。AUC については対数値の平均値の差の 90% 信頼区間が  $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、また、 $C_{max}$  については対数値の平均値の差が  $\log(0.90) \sim \log(1.11)$  の範囲内で、かつ溶出挙動が類似していることから、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>10)</sup>。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→24h</sub> (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 「TCK」	916±295	634.40±308.20	1.71±0.96	2.12±0.36
ニューロタン錠 100mg	941±279	601.67±309.49	1.33±0.75	2.16±0.49

(Mean ± S.D., n=28)



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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

「VIII. 7. 相互作用」の項を参照すること。

## 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) 消失速度定数

該当資料なし

### (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

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

### (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

該当資料なし

### (2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率

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

### (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

該当資料なし

## 7. 排泄

該当資料なし

## 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

該当資料なし

## 10. 特定の背景を有する患者

### 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>11),12)</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>13)</sup>（外国人データ）。[9.2.2 参照]

### 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>14)</sup>。[9.8.3 参照]

## 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. 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注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

### 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。

##### 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 厳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、16.6.1 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>15),16)</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を確認すること。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>17),18)</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。[16.6.2 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。

## (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。	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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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

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

製剤：ロサルタンカリウム錠 25mg 「TCK」

ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」

ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」

処方箋医薬品（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 処方箋医薬品

### 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

20 取扱い上の注意

開封後は湿気を避けて保存すること。

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：有り

くすりのしおり：有り

その他の患者用資料：ロサルタン錠「TCK」を使用する女性の患者さんへ

（辰巳化学株式会社ホームページ 医療関係者向け情報

[https://www.tatsumi-kagaku.com/public/info\\_medical/information.php](https://www.tatsumi-kagaku.com/public/info_medical/information.php) 参照)

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ニューロタン錠 25mg／錠 50mg／錠 100mg

同効薬：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、バルサルタン など

### 7. 国際誕生年月日

該当資料なし

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

販売名	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 「TCK」	2012年2月15日	22400AMX00515000	2012年6月22日	2012年6月22日
ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」	2012年2月15日	22400AMX00516000	2012年6月22日	2012年6月22日
ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」	2012年2月15日	22400AMX00517000	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

2012年10月2日

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、用法及び用量追加

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

販売名	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(9桁)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 「TCK」	2149039F1210	2149039F1210	121566301	622156601
ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」	2149039F2216	2149039F2216	121567001	622156701
ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」	2149039F3204	2149039F3204	121568701	622156801

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。

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) 社内資料：安定性試験（錠 25mg）
- 2) 社内資料：安定性試験（錠 50mg）
- 3) 社内資料：安定性試験（錠 100mg）
- 4) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 25mg）
- 5) 社内資料：溶出試験（錠 50mg）
- 6) 社内資料：溶出試験（錠 100mg）
- 7) 中島光好、他. 臨床薬理. 1995；26：671-684.
- 8) 作用機序（ニューロタン錠：2006 年 4 月 20 日承認、申請資料概要ホ）
- 9) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 50mg）
- 10) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 100mg）
- 11) 多川斉、他. 臨床透析. 1995；11：247-264.
- 12) 本態性高血圧症患者における検討（ニューロタン錠：2006 年 4 月 20 日承認、申請資料概要へ. (2) .1))
- 13) 腎機能障害を伴う高血圧症患者における血漿中濃度（ニューロタン錠：2006 年 4 月 20 日承認、申請資料概要へ. (3) .3))
- 14) 加齢の影響（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)
- 15) 阿部真也 他：周産期医学.2017；47：1353-1355
- 16) 齊藤大祐 他：鹿児島産科婦人科学会雑誌.2021；29：49-54
- 17) Spence SG, et al. Teratology. 1995；51：383-397.
- 18) Spence SG, et al. Teratology. 1995；51：367-382.

### 2. その他の参考文献

該当資料なし

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 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

##### 粉砕時の安定性試験結果

##### ●ロサルタンカリウム錠 25mg 「TCK」

保存条件		試験項目	規格	結果			
				開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
温度	40°C ファルコン チューブ (密栓)	性状*1	(参考)	白色のフィルム が混じった白色 の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		定量*2 (%)	95.0%~105.0%	97.64	98.03	98.07	98.74
湿度	25°C 75%RH ファルコン チューブ (開栓)	性状*1	(参考)	白色のフィルム が混じった白色 の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		定量*2 (%)	95.0%~105.0%	97.64	97.62	98.02	98.43

保存条件		試験項目	規格	結果		
				開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
光	温湿度 なりゆき 2000lx/hr ファルコン チューブ (密栓)	性状*1	(参考)	白色のフィルム が混じった白色 の粉末	変化なし	変化なし
		定量*2 (%)	95.0%~105.0%	97.64	97.60	97.55

\*1 n=3

\*2 n=3 の平均値

●ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」

保存条件		試験項目	規格	結果			
				開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
温度	40°C ファルコン チューブ (密栓)	性状*1	(参考)	白色のフィルム が混じった白色 の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		定量*2 (%)	95.0%~105.0%	98.03	97.91	99.11	98.54
湿度	25°C 75%RH ファルコン チューブ (開栓)	性状*1	(参考)	白色のフィルム が混じった白色 の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		定量*2 (%)	95.0%~105.0%	98.03	97.93	99.59	98.58

保存条件		試験項目	規格	結果		
				開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
光	温湿度 なりゆき 2000lx/hr ファルコン チューブ (密栓)	性状*1	(参考)	白色のフィルム が混じった白色 の粉末	変化なし	変化なし
		定量*2 (%)	95.0%~105.0%	98.03	97.77	98.58

\*1 n=3

\*2 n=3 の平均値

●ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」

保存条件		試験項目	規格	結果			
				開始時	0.5 箇月	1 箇月	3 箇月
温度	40°C ファルコン チューブ (密栓)	性状*1	(参考)	白色のフィルム が混じった白色 の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		定量*2 (%)	95.0%~105.0%	98.22	98.21	98.56	98.33
湿度	25°C 75%RH ファルコン チューブ (開栓)	性状*1	(参考)	白色のフィルム が混じった白色 の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		定量*2 (%)	95.0%~105.0%	98.22	98.03	99.91	98.51

保存条件		試験項目	規格	結果		
				開始時	60 万 lx・hr	120 万 lx・hr
光	温湿度 なりゆき 2000lx/hr ファルコン	性状*1	(参考)	白色のフィルム が混じった白色 の粉末	変化なし	変化なし
	チューブ (密栓)	定量*2 (%)	95.0%~105.0%	98.22	97.57	98.66

\*1 n=3

\*2 n=3 の平均値

## (2) 崩壊・懸濁性および経管投与チューブの通過性

「内服薬 経管投与ハンドブック 第二版(監修:藤島一郎、執筆:倉田なおみ)、じほう」を参考に、製剤の崩壊・懸濁性および経管投与チューブの通過性の試験を行った。

### 試験方法

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製剤をそのまま1個入れてピストンを戻し、ディスペンサーに55°Cの温湯20mLを吸い取り、筒先に蓋をして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、崩壊懸濁の状況を観察する。5分後に崩壊しない場合、更に5分間放置後、同様の操作を行う。それでも崩壊懸濁しない場合は、この方法を中止する。中止した製品は、破壊(乳棒で数回叩く)後、上述と同様の操作を行う。

得られた懸濁液を経管チューブの注入端より、約2~3mL/secの速度で注入し、通過性を観察する。体内挿入端から3分の2を水平にし、他端(注入端)を30cmの高さにセットする。注入後に適量の水を注入して経管チューブ内を洗うとき、経管チューブ内に残存物がみられなければ、通過性に問題なしとする。

### 判定方法

水(約55°C)

製剤を55°Cの温湯20mLに入れ、5分または10分放置後に攪拌したときの通過性  
破壊→水

製剤を破壊した後に、55°Cの温湯20mLに入れ、5分または10分放置後に攪拌したときの通過性

○: 経管チューブを通過

△: 時間をかければ崩壊しそうな状況、または経管チューブを閉塞する危険性がある

×: 通過困難

結果

●ロサルタンカリウム錠 25mg 「TCK」

経管チューブサイズ	水 (約 55°C)		破壊→水	
	5分	10分	5分	10分
8Fr.	×	×	○	

●ロサルタンカリウム錠 50mg 「TCK」

経管チューブサイズ	水 (約 55°C)		破壊→水	
	5分	10分	5分	10分
8Fr.	×	×	○	

●ロサルタンカリウム錠 100mg 「TCK」

経管チューブサイズ	水 (約 55°C)		破壊→水	
	5分	10分	5分	10分
8Fr.	×	×	×	○

2. その他の関連資料

該当資料なし