2023年11月改訂（第12版）

日本標準商品分類番号：872149

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

LOSARTAN POTASSIUM Tablets

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)] 注)注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」:1錠中、日局ロサルタンカリウム25mg ロサルタンカリウム錠50mg「杏林」:1錠中、日局ロサルタンカリウム50mg ロサルタンカリウム錠100mg「杏林」:1錠中、日局ロサルタンカリウム100mg
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：キョーリンリメディオ株式会社 販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	キョーリンリメディオ株式会社　学術部 TEL：0120-960189　FAX：0120-189099 受付時間：8時～22時（日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ　https://www.med.kyorin-rmd.com/

本IFは2023年9月改訂の電子添文の記載に基づき作成した。
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。

(01)14987060304596

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、ＩＦと略す）が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第２小委員会がＩＦの位置付け、ＩＦ記載様式、ＩＦ記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第３小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会がＩＦ記載要領の改訂を行ってきた。

ＩＦ記載要領 2008 以降、ＩＦはＰＤＦ等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したＩＦが速やかに提供されることとなった。最新版のＩＦは、医薬品医療機器総合機構（以下、ＰＭＤＡ）の医療用医薬品情報検索のページ（http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/）にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品のＩＦの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のＩＦが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、ＩＦ記載要領 2018 が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

２．ＩＦとは

ＩＦは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

ＩＦに記載する項目配列は日病薬が策定したＩＦ記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はＩＦの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたＩＦは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

ＩＦの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

３．ＩＦの利用にあたって

電子媒体のＩＦは、ＰＭＤＡの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってＩＦを作成・提供するが、ＩＦの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やＩＦ作成時に記載し難い情報等については製薬企業のＭＲ等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、ＩＦの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、ＩＦが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、ＩＦの使用にあたっては、最新の添付文書をＰＭＤＡの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

４．利用に際しての留意点

ＩＦを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。ＩＦは日

病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、ＭＲ等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがＩＦの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、ＩＦを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目　次

Ⅰ. 概要に関する項目 …… 1
1. 開発の経緯 …… 1
2. 製品の治療学的特性 …… 1
3. 製品の製剤学的特性 …… 1
4. 適正使用に関して周知すべき特性 …… 1
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項 …… 1
6. RMP の概要 …… 1

Ⅱ. 名称に関する項目 …… 2
1. 販売名 …… 2
2. 一般名 …… 2
3. 構造式又は示性式 …… 2
4. 分子式及び分子量 …… 2
5. 化学名（命名法）又は本質 …… 2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 …… 3

Ⅲ. 有効成分に関する項目 …… 4
1. 物理化学的性質 …… 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、定量法 …… 4

Ⅳ. 製剤に関する項目 …… 5
1. 剤形 …… 5
2. 製剤の組成 …… 5
3. 添付溶解液の組成及び容量 …… 6
4. 力価 …… 6
5. 混入する可能性のある夾雑物 …… 6
6. 製剤の各種条件下における安定性 …… 6
7. 調製法及び溶解後の安定性 …… 8
8. 他剤との配合変化（物理化学的変化） …… 8
9. 溶出性 …… 9
10. 容器・包装 …… 13
11. 別途提供される資材類 …… 13
12. その他 …… 13

Ⅴ. 治療に関する項目 …… 14
1. 効能又は効果 …… 14
2. 効能又は効果に関連する注意 …… 14
3. 用法及び用量 …… 14
4. 用法及び用量に関連する注意 …… 14
5. 臨床成績 …… 14

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目 …… 17
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 …… 17
2. 薬理作用 …… 17

Ⅶ. 薬物動態に関する項目 …… 18
1. 血中濃度の推移 …… 18
2. 薬物速度論的パラメータ …… 20
3. 母集団（ポピュレーション）解析 …… 20
4. 吸収 …… 21
5. 分布 …… 21
6. 代謝 …… 21
7. 排泄 …… 21
8. トランスポーターに関する情報 …… 22
9. 透析等による除去率 …… 22
10. 特定の背景を有する患者 …… 22
11. その他 …… 22

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 …… 23
1. 警告内容とその理由 …… 23
2. 禁忌内容とその理由 …… 23
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 …… 23
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 …… 23
5. 重要な基本的注意とその理由 …… 23
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 …… 23
7. 相互作用 …… 25
8. 副作用 …… 26
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 …… 27
10. 過量投与 …… 27
11. 適用上の注意 …… 28
12. その他の注意 …… 28

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目 …… 29
1. 薬理試験 …… 29
2. 毒性試験 …… 29

Ⅹ. 管理的事項に関する項目 …… 30
1. 規制区分 …… 30
2. 有効期間 …… 30
3. 包装状態での貯法 …… 30
4. 取扱い上の注意 …… 30
5. 患者向け資材 …… 30
6. 同一成分・同効薬 …… 30
7. 国際誕生年月日 …… 30
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 …… 30
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 …… 31
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 …… 31
11. 再審査期間 …… 31
12. 投薬期間制限に関する情報 …… 31
13. 各種コード …… 31
14. 保険給付上の注意 …… 31

Ⅺ. 文献 …… 32
1. 引用文献 …… 32
2. その他の参考文献 …… 33

Ⅻ. 参考資料 …… 34
1. 主な外国での発売状況 …… 34
2. 海外における臨床支援情報 …… 34

ⅩⅢ. 備考 …… 35
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 …… 35
2. その他の関連資料 …… 36

略 語 表

略語	略語内容
ACE	アンジオテンシン変換酵素
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
AUC	血中濃度−時間曲線下面積
BUN	血中尿素窒素
CK	クレアチンキナーゼ
C_{max}	最高血中濃度
CYP	チトクロム P450
eGFR	推算糸球体濾過量
LDH	乳酸脱水素酵素
S.D.	標準偏差
$t_{1/2}$	消失半減期
T_{max}	最高血中濃度到達時間

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/50mg/100mg「杏林」は、後発医薬品として薬食発第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、安定性試験、生物学的同等性試験を行い承認申請し、2012年2月に承認を取得、2012年6月に薬価収載した。

2. 製品の治療学的特性

- 本剤はA-Ⅱ(アンジオテンシンⅡ)アンタゴニストであり、高血圧症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の効能又は効果を有している。(「Ⅴ．1．効能又は効果」の項参照)

- 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、低ナトリウム血症がある。(「Ⅷ．8．(1)重大な副作用と初期症状」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「杏林」
ロサルタンカリウム錠50mg「杏林」
ロサルタンカリウム錠100mg「杏林」

(2) 洋名

LOSARTAN POTASSIUM Tablets 25mg“KYORIN”
LOSARTAN POTASSIUM Tablets 50mg“KYORIN”
LOSARTAN POTASSIUM Tablets 100mg“KYORIN”

(3) 名称の由来

「一般的名称」＋「剤形」＋「含量」＋「屋号」
〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号)に基づく〕

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）

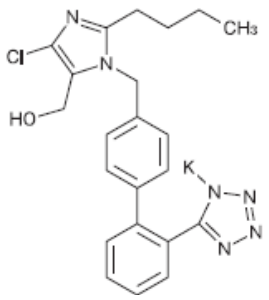
Losartan Potassium（JAN）
Losartan（INN）

(3) ステム

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

化学構造式：



4. 分子式及び分子量

分子式：$C_{22}H_{22}ClKN_6O$
分子量：461.00

5. 化学名（命名法）又は本質

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

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

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「ロサルタンカリウム」の確認試験による。

  (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)

- 定量法

  日本薬局方「ロサルタンカリウム」の定量法による。

  液体クロマトグラフィー

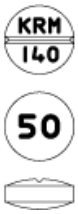
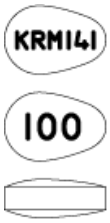
Ⅳ. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	ロサルタンカリウム錠 25mg「杏林」	ロサルタンカリウム錠 50mg「杏林」	ロサルタンカリウム錠 100mg「杏林」
剤形	円形・割線入り フィルムコーティング錠	円形・割線入り フィルムコーティング錠	ティアドロップ形・ フィルムコーティング錠
色調	白色		
外形			
直径(mm)	約 5.6	約 7.6	長径：約 11.1 短径：約 7.6
厚さ(mm)	約 3.1	約 3.5	約 4.5
質量(mg)	78	156	312

(3) 識別コード

販売名	ロサルタンカリウム錠 25mg「杏林」	ロサルタンカリウム錠 50mg「杏林」	ロサルタンカリウム錠 100mg「杏林」
識別コード	KRM139	KRM140	KRM141
記載場所	錠剤、PTP シート	錠剤、PTP シート	錠剤、PTP シート

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

販売名	ロサルタンカリウム錠 25mg「杏林」	ロサルタンカリウム錠 50mg「杏林」	ロサルタンカリウム錠 100mg「杏林」
有効成分 (1 錠中)	日局ロサルタンカリウム 25mg	日局ロサルタンカリウム 50mg	日局ロサルタンカリウム 100mg
添加剤	乳糖水和物、部分アルファー化デンプン、結晶セルロース、軽質無水ケイ酸、ステアリン酸マグネシウム、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		

(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

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分子縮合体がある。[1)]

6. 製剤の各種条件下における安定性

1) **加速試験** [2)]

［保存条件］

40℃±1℃、75%RH±5%RH

［試験検体］

PTP包装品：PTP包装(ポリ塩化ビニルフィルム及びアルミニウム箔)、ポリエチレンテレフタレートポリラミネート蒸着フィルムでピロー包装、紙箱

［試験項目及び規格］

試験項目	規　　格
性状	［25mg錠］ 白色の片面割線入りフィルムコーティング錠 ［50mg錠］ 白色の片面割線入りフィルムコーティング錠 ［100mg錠］ティアドロップ形の白色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：試料溶液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	含量均一性試験を行うとき、適合する
溶出性	［25mg錠］ 水/900mL/パドル法/毎分50回転/45分間/85%以上 ［50mg錠］ 水/900mL/パドル法/毎分50回転/45分間/85%以上 ［100mg錠］水/900mL/パドル法/毎分50回転/30分間/85%以上
定量法	含量：95.0～105.0%

［結果］

〈ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」〉

試験項目	開始時	1ヵ月	3ヵ月	6ヵ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適
製剤均一性	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量)※	99.0%	99.5%	99.9%	99.3%

※1ロットn=3の3ロットの平均値

〈ロサルタンカリウム錠 50mg「杏林」〉

試験項目	開始時	1ヵ月	3ヵ月	6ヵ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適
製剤均一性	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量)※	98.4%	99.5%	99.6%	99.4%

※1ロット n=3 の 3 ロットの平均値

〈ロサルタンカリウム錠 100mg「杏林」〉

試験項目	開始時	1ヵ月	3ヵ月	6ヵ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適
製剤均一性	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量)※	99.2%	98.7%	98.9%	99.0%

※1ロット n=3 の 3 ロットの平均値

2) **無包装状態での安定性**

〈ロサルタンカリウム錠 25mg「杏林」〉[3)]

保存条件	結　果			
	性状	溶出性	定量法	硬度
40℃、75%RH(遮光・開放)、3ヵ月	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
25℃、60%RH(遮光・開放)、3ヵ月	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
曝光量 120 万 lx･hr、25℃、60%RH(開放)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

［規格］性状：白色の片面割線入りフィルムコーティング錠、溶出性：45 分間 85%以上、定量法：95.0～105.0%、硬度：参考値

〈ロサルタンカリウム錠 50mg「杏林」〉[4)]

保存条件	結　果			
	性状	溶出性	定量法	硬度
40℃、75%RH(遮光・開放)、3ヵ月	変化なし	変化あり (規格外)※	変化なし	変化なし
25℃、60%RH(遮光・開放)、3ヵ月	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
曝光量 120 万 lx･hr、25℃、60%RH(開放)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

［規格］性状：白色の片面割線入りフィルムコーティング錠、溶出性：45 分間 85%以上、定量法：95.0～105.0%、硬度：参考値

※規格内(開始時)→規格外(1ヵ月)

〈ロサルタンカリウム錠100mg「杏林」〉[5)]

保存条件	結　　果			
	性状	溶出性	定量法	硬度
40℃、75%RH(遮光・開放)、3ヵ月	変化なし	変化あり(規格外)※1	変化なし	変化なし
25℃、60%RH(遮光・開放)、3ヵ月	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり(規格内)※2
曝光量120万lx･hr、25℃、60%RH(開放)	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり(規格内)※3

［規格］性状：ティアドロップ形の白色のフィルムコーティング錠、溶出性：30分間85%以上、定量法：95.0～105.0%、硬度：参考値

※1 規格内(開始時)→規格外(1ヵ月)

※2 10kgf(開始時)→9kgf(1ヵ月)、7kgf(3ヵ月)

※3 10kgf(開始時)→7kgf(120万lx･hr)

＜参考＞評価基準

分類	性状	溶出性	定量法	硬度
変化なし	外観上の変化をほとんど認めない場合	規格内の場合	含量変化が3%未満の場合	硬度変化が30%未満の場合
変化あり(規格内)	色調変化を認めるが、品質上、問題とならず、規格内の場合		含量変化が3%以上で、規格内の場合	硬度変化が30%以上であるが、2kg以上の硬度を有している場合
変化あり(規格外)	形状変化や著しい色調変化を認め、規格を逸脱する場合	規格を逸脱する場合	規格を逸脱する場合	硬度変化が30%以上で、硬度が2kg未満の場合

本試験は、「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申)、平成11年8月20日」を参考に評価しました。本剤の安定性に関する結果であり、無包装で保存した本剤を使用した場合の有効性・安全性についての評価は実施しておりません。

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（物理化学的変化）

該当資料なし

9. 溶出性

1）溶出挙動における類似性[6)]

〈ロサルタンカリウム錠 25mg「杏林」〉

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号)に準じて試験を実施した。

<table>
<tr><td>標準製剤</td><td colspan="4">ニューロタン錠 25mg</td></tr>
<tr><td>試験方法</td><td colspan="4">日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)</td></tr>
<tr><td rowspan="6">試験条件</td><td colspan="4">試験液量：900mL　試験液の温度：37℃±0.5℃</td></tr>
<tr><td rowspan="5">回転数/試験液</td><td rowspan="4">50rpm</td><td>pH1.2</td><td>日本薬局方 溶出試験第 1 液</td></tr>
<tr><td>pH5.0</td><td>薄めた McIlvaine の緩衝液</td></tr>
<tr><td>pH6.8</td><td>日本薬局方 溶出試験第 2 液</td></tr>
<tr><td>水</td><td>日本薬局方 精製水</td></tr>
<tr><td>100rpm</td><td>pH5.0</td><td>薄めた McIlvaine の緩衝液</td></tr>
</table>

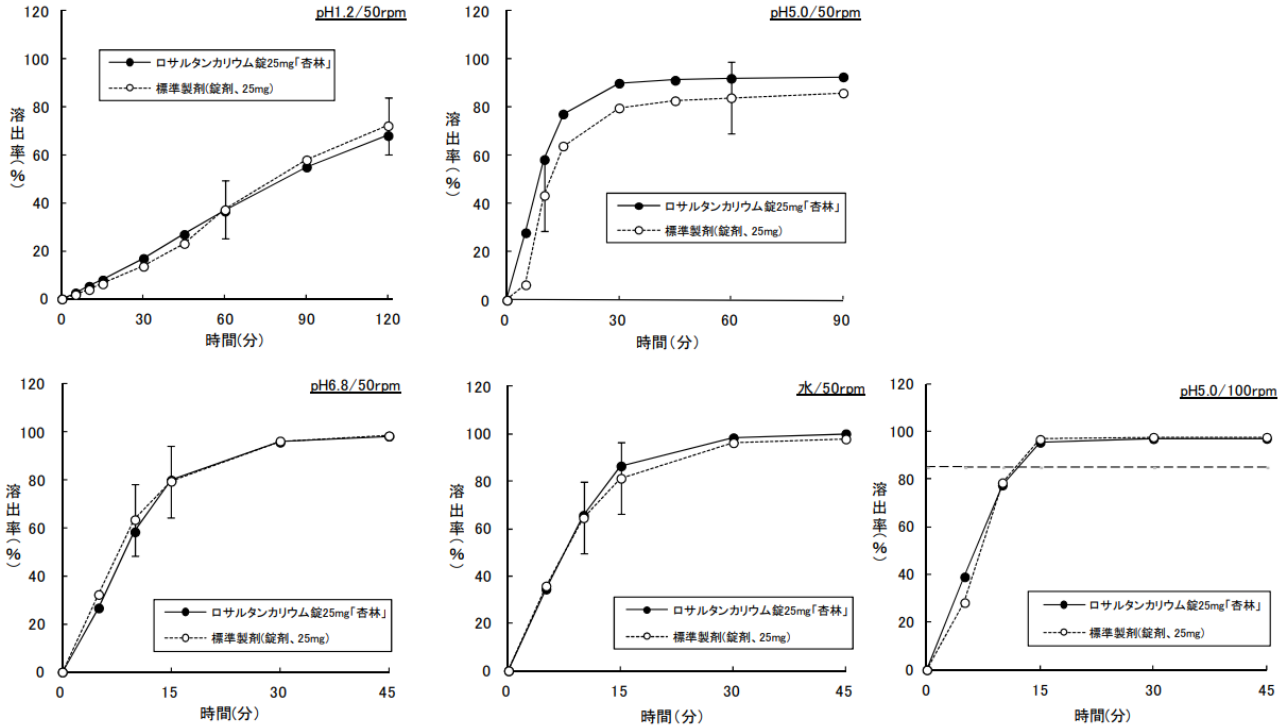
［判定基準］

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	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±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	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±15%の範囲にあるか、又は f 2 関数の値は 42 以上である。
	pH6.8	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±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。
	水	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±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。
100rpm	pH5.0	試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

［結果］

<table>
<tr><th rowspan="2">回転数</th><th rowspan="2">試験液</th><th rowspan="2">判定時点
(分)</th><th colspan="3">12 ベッセルの平均溶出率(%)</th><th rowspan="2">判定</th></tr>
<tr><th>ロサルタンカリウム
錠 25mg「杏林」</th><th>標準製剤</th><th>差</th></tr>
<tr><td rowspan="8">50rpm</td><td rowspan="2">pH1.2</td><td>60</td><td>36.6</td><td>37.2</td><td>-0.6</td><td rowspan="2">適合</td></tr>
<tr><td>120</td><td>68.1</td><td>72.2</td><td>-4.1</td></tr>
<tr><td rowspan="2">pH5.0</td><td>10</td><td>58.4</td><td>43.5</td><td>14.9</td><td rowspan="2">適合</td></tr>
<tr><td>60</td><td>92.1</td><td>84.0</td><td>8.1</td></tr>
<tr><td rowspan="2">pH6.8</td><td>10</td><td>58.4</td><td>63.5</td><td>-5.1</td><td rowspan="2">適合</td></tr>
<tr><td>15</td><td>80.0</td><td>79.5</td><td>0.5</td></tr>
<tr><td rowspan="2">水</td><td>10</td><td>65.7</td><td>64.6</td><td>1.1</td><td rowspan="2">適合</td></tr>
<tr><td>15</td><td>86.5</td><td>81.3</td><td>5.2</td></tr>
<tr><td>100rpm</td><td>pH1.2</td><td>15</td><td>95.4</td><td>96.7</td><td>－</td><td>適合</td></tr>
</table>

以上の結果より、すべての試験条件において溶出挙動の類似性の判定基準に適合したため、ロサルタンカリウム錠 25mg「杏林」は標準製剤と溶出挙動が類似していると判定された。



〈ロサルタンカリウム錠 50mg「杏林」〉

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号)に準じて試験を実施した。

標準製剤	ニューロタン錠 50mg			
試験方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)			
試験条件	試験液量：900mL　試験液の温度：37℃±0.5℃			
	回転数/試験液	50rpm	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
		100rpm	pH5.0	薄めた McIlvaine の緩衝液

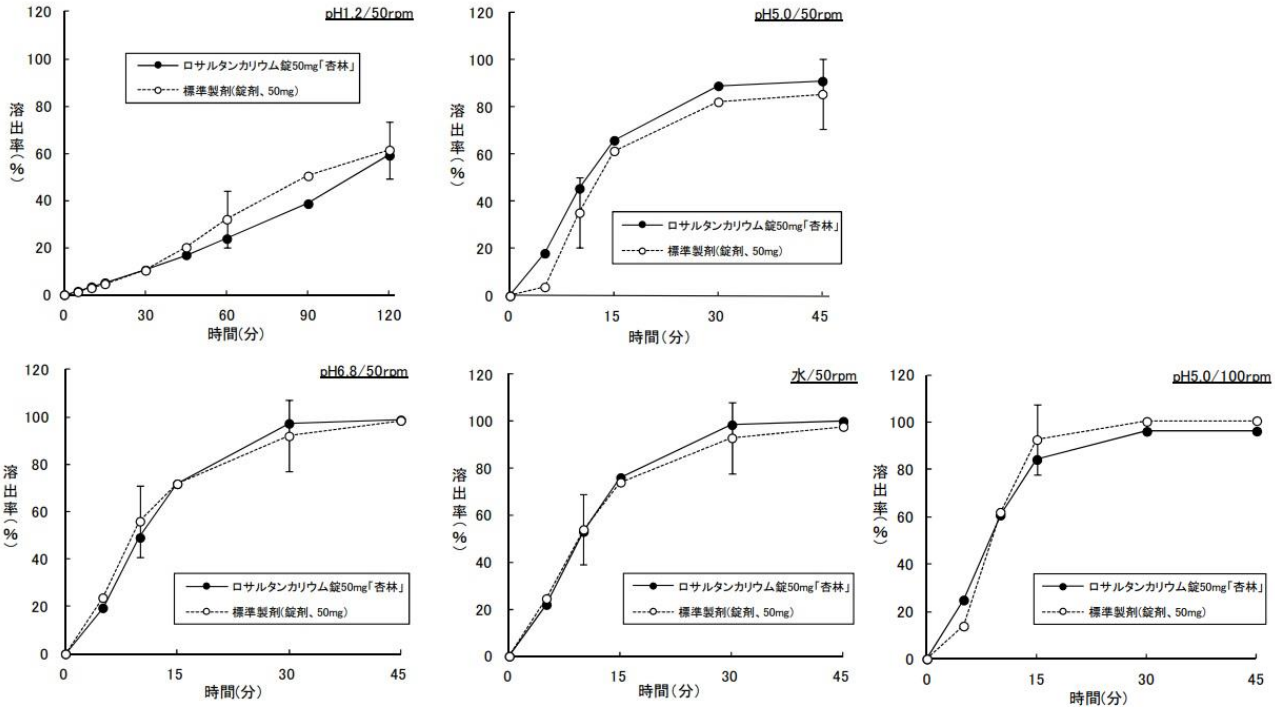
[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	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±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	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±15%の範囲にあるか、又は f 2 関数の値は 42 以上である。
	pH6.8	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±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。
	水	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±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。
100rpm	pH5.0	試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。

［結果］

回転数	試験液	判定時点（分）	12ベッセルの平均溶出率(%)			判定
			ロサルタンカリウム錠50mg「杏林」	標準製剤	差	
50rpm	pH1.2	60	23.8	32.0	-8.2	適合
		120	59.1	61.4	-2.3	
	pH5.0	10	45.6	35.3	10.3	適合
		45	91.1	85.6	5.5	
	pH6.8	10	49.1	56.0	-6.9	適合
		30	97.3	92.0	5.3	
	水	10	53.1	54.0	-0.9	適合
		30	98.6	93.0	5.6	
100rpm	pH5.0	15	84.3	92.7	-8.4	適合

以上の結果より、すべての試験条件において溶出挙動の類似性の判定基準に適合したため、ロサルタンカリウム錠50mg「杏林」は標準製剤と溶出挙動が類似していると判定された。



〈ロサルタンカリウム錠100mg「杏林」〉

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成18年11月24日 薬食審査発第1124004号)に準じて試験を実施した。

標準製剤	ニューロタン錠100mg			
試験方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)			
試験条件	試験液量：900mL　試験液の温度：37℃±0.5℃			
	回転数/試験液	50rpm	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
		100rpm	pH5.0	薄めたMcIlvaineの緩衝液

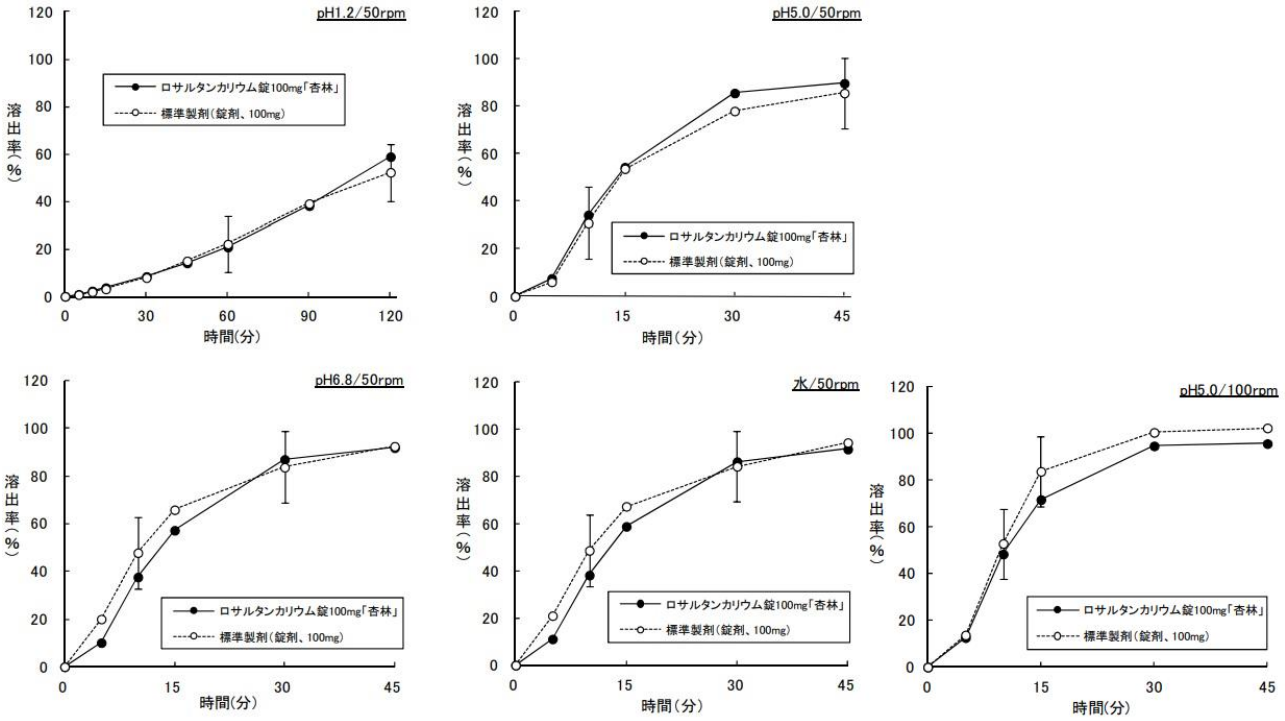
［判定基準］

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	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±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	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±15%の範囲にあるか、又は f 2 関数の値は 42 以上である。
	pH6.8	
	水	
100rpm	pH5.0	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±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。

［結果］

回転数	試験液	判定時点（分）	12 ベッセルの平均溶出率(%)			判定
			ロサルタンカリウム錠 100mg「杏林」	標準製剤	差	
50rpm	pH1.2	60	20.8	22.1	-1.3	適合
		120	58.8	52.2	6.6	
	pH5.0	10	34.2	30.9	3.3	適合
		45	89.8	85.7	4.1	
	pH6.8	10	37.6	47.8	-10.2	適合
		30	86.9	83.6	3.3	
	水	10	38.2	48.7	-10.5	適合
		30	86.4	84.4	2.0	
100rpm	pH5.0	10	48.4	52.9	-4.5	適合
		15	71.7	83.8	-12.1	

以上の結果より、すべての試験条件において溶出挙動の類似性の判定基準に適合したため、ロサルタンカリウム錠 100mg「杏林」は標準製剤と溶出挙動が類似していると判定された。



2）**公的溶出規格への適合性**[6)]

ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」、ロサルタンカリウム錠50mg「杏林」及びロサルタンカリウム錠100mg「杏林」は、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にそれぞれ適合していることが確認されている。

販売名	試験条件	規格
ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」	水/900mL/パドル法/50rpm	45分間85%以上
ロサルタンカリウム錠50mg「杏林」	水/900mL/パドル法/50rpm	45分間85%以上
ロサルタンカリウム錠100mg「杏林」	水/900mL/パドル法/75rpm	30分間85%以上

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

(2) 包装

〈ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」〉

100錠［10錠（PTP）×10］

500錠［10錠（PTP）×50］

〈ロサルタンカリウム錠50mg「杏林」〉

100錠［10錠（PTP）×10］

500錠［10錠（PTP）×50］

〈ロサルタンカリウム錠100mg「杏林」〉

100錠［10錠（PTP）×10］

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

〔PTP包装品〕

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔

ピロー包装：ポリエチレンテレフタレートポリラミネート蒸着フィルム

箱：紙

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当資料なし

Ⅴ. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4.効能又は効果
○高血圧症
○高血圧及び蛋白尿を伴う 2 型糖尿病における糖尿病性腎症

2. 効能又は効果に関連する注意

5.効能又は効果に関連する注意
〈高血圧及び蛋白尿を伴う 2 型糖尿病における糖尿病性腎症〉
高血圧及び蛋白尿（尿中アルブミン／クレアチニン比 300mg/g 以上）を合併しない患者における本剤の有効性及び安全性は確認されていない。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6.用法及び用量
〈高血圧症〉
通常、成人にはロサルタンカリウムとして 25～50mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減するが、1 日 100mg まで増量できる。
〈高血圧及び蛋白尿を伴う 2 型糖尿病における糖尿病性腎症〉
通常、成人にはロサルタンカリウムとして 50mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、血圧値をみながら 1 日 100mg まで増量できる。ただし、過度の血圧低下を起こすおそれのある患者等では 25mg から投与を開始する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7.用法及び用量に関連する注意
〈高血圧及び蛋白尿を伴う 2 型糖尿病における糖尿病性腎症〉
本剤を投与後、血清クレアチニン値が前回の検査値と比較して 30%（あるいは 1mg/dL）以上増加した場合、及び糸球体ろ過値、1／血清クレアチニン値の勾配等で評価した腎機能障害の進展速度が加速された場合は、減量あるいは投与中止を考慮すること。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(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

17.臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

〈高血圧症〉

17.1.1 国内臨床試験

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

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

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

また、軽・中等症本態性高血圧症患者を対象とした二重盲検比較試験において、降圧効果に関するエナラプリルマレイン酸塩との同等性が検証され、ロサルタンカリウムの有用性が認められている。咳の発現率は、エナラプリルマレイン酸塩の 13.3%（19 例）に対し、ロサルタンカリウムでは解析対象例の 0.7%（1 例）に認められた[7)～9)]。

17.1.2 海外第Ⅲ相試験

アンジオテンシン変換酵素（ACE）阻害剤による咳の既往を有する患者を対象とした二重盲検比較試験で、リシノプリル投与群の咳の再発現率（71.7%）は、ヒドロクロロチアジド投与群（34.1%）及びロサルタン投与群（29.2%）より有意に高く、ロサルタン投与群はヒドロクロロチアジド投与群と同程度であった[10)]。

〈高血圧及び蛋白尿を伴う 2 型糖尿病における糖尿病性腎症〉

17.1.3 国際共同第Ⅲ相試験

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

副作用は 751 例（日本人 44 例を含む）中 129 例（17.2%）に認められた。主な副作用は、めまい 34 例（4.5%）、高カリウム血症 28 例（3.7%）、低血圧 19 例（2.5%）、無力症／疲労 12 例（1.6%）であった。また、臨床検査値の異常変動は、111 例（14.8%）に認められた。主な臨床検査値の異常変動は、血清カリウム上昇 89 例（11.9%）、クレアチニン上昇 30 例（4.0%）、BUN 上昇 10 例（1.3%）であった[11)、12)]。

2) 安全性試験

該当資料なし

(5) 患者・病態別試験

該当資料なし

(6) 治療的使用

1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

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

アンジオテンシンⅡ受容体拮抗薬：
アジルサルタン、イルベサルタン、オルメサルタン メドキソミル、カンデサルタン シレキセチル、テルミサルタン、バルサルタン
注意：関連のある化合物の効能・効果等は，最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

ロサルタンカリウムは経口投与後速やかに吸収され、その一部が主代謝物であるカルボン酸体に変換される。ロサルタン及びカルボン酸体は、いずれも生理的昇圧物質であるアンジオテンシンⅡ（A-Ⅱ）に対して、その受容体において特異的に拮抗し、降圧効果を発揮する[1)、13)]。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 アンジオテンシン受容体拮抗作用

18.2.1 A-Ⅱ受容体にはサブタイプが知られており、ロサルタン及びカルボン酸体は、AT_1受容体と選択的に結合し、A-Ⅱの生理作用を阻害するが、アゴニスト作用は示さない[14)～16)]。ブラジキニン分解酵素であるACE（キニナーゼⅡ）には直接の影響を及ぼさない[17)]。

18.2.2 実験動物（ラット）に対する外因性A-Ⅱ昇圧反応を抑制する[15)、16)]。

18.3 降圧作用

ロサルタンカリウム及びカルボン酸体は高血圧自然発症ラット[18)、19)]、腎性高血圧ラット[18)、20)]、高血圧自然発症イヌ[21)]、脳卒中易発症高血圧自然発症ラット[22)]等の高血圧モデル動物において、血圧を下降させ、連続経口投与中安定した降圧効果を示す。また、血圧の下降に伴う心拍数の増加を認めず、投与中止に伴う血圧のリバウンド現象は生じない[18)]。

18.4 腎保護作用

ロサルタンは腎の輸出細動脈を選択的に拡張させ、糸球体内圧を低下させることにより糸球体への過剰負荷を改善する[23)]。また、ストレプトゾトシン誘発糖尿病ラット（インスリン依存性糖尿病モデル）[24)]、自然発症インスリン非依存性糖尿病マウス[25)]、5/6腎切除ラット[26)]等、糖尿病及び非糖尿病性の腎障害モデル動物において尿中蛋白排泄量の増加並びに腎組織障害を抑制する。

(3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

Ⅶ. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

健康成人にロサルタンカリウム 25 及び 50mg を空腹時に 1 回経口投与した場合、ロサルタン及びカルボン酸体の血漿中濃度はそれぞれ投与約 1 時間及び約 3 時間でピークに達し、半減期は約 2 時間及び約 4 時間であり、カルボン酸体の AUC（血漿中濃度曲線下面積）はロサルタンの約 7 倍であった[13)]。

16.1.2 反復投与

健康成人にロサルタンカリウム 100mg を 1 日 1 回 7 日間連続経口投与した場合の血漿中濃度から、ロサルタン及びカルボン酸体の蓄積性は認められなかった[27)]。

生物学的同等性試験[28)]

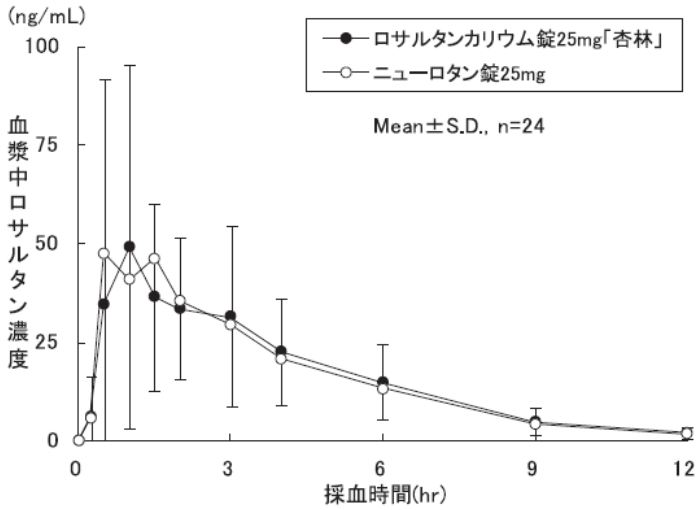
〈ロサルタンカリウム錠 25mg「杏林」〉

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号)に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

ロサルタンカリウム錠 25mg「杏林」とニューロタン錠 25mg 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 25mg「杏林」	202±64	83.1±50.0	1.90±1.45	2.03±0.41
ニューロタン錠 25mg	198±69	85.4±51.7	1.44±0.88	2.07±0.33

(Mean±S.D.、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。

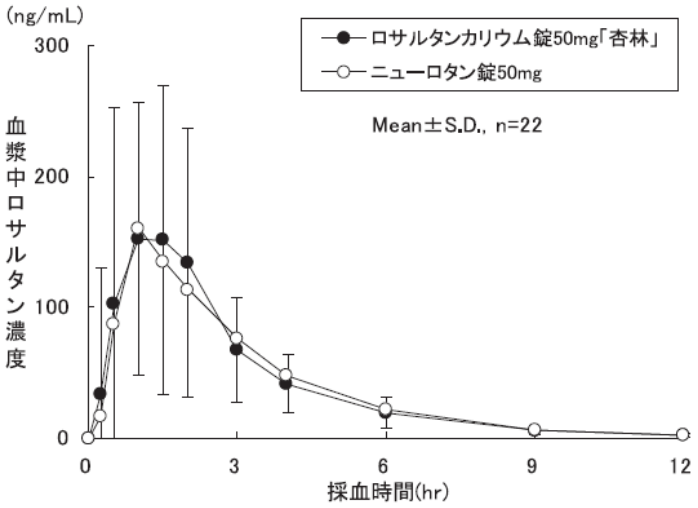
〈ロサルタンカリウム錠 50mg「杏林」〉

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号)に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

ロサルタンカリウム錠 50mg「杏林」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として 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「杏林」	503±193	257±149	1.35±0.88	1.79±0.22
ニューロタン錠 50mg	501±200	253±150	1.70±1.22	1.81±0.20

(Mean±S.D.、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。

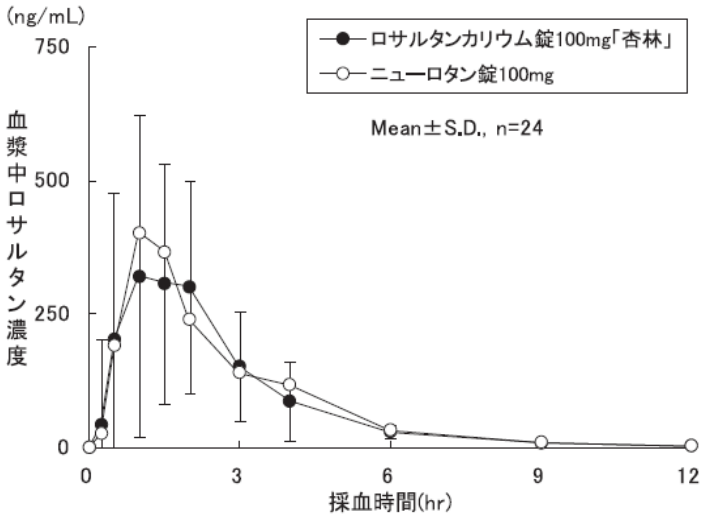
〈ロサルタンカリウム錠 100mg「杏林」〉

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 18 年 11 月 24 日 薬食審査発第 1124004 号)に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

ロサルタンカリウム錠 100mg「杏林」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として 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「杏林」	1014±260	568±178	1.45±0.86	1.67±0.19
ニューロタン錠 100mg	1086±318	593±224	1.67±1.05	1.66±0.16

(Mean±S.D.、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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響

「Ⅶ. 4. 吸収」の項参照

2) 併用薬の影響

「Ⅷ. 7. 相互作用」の項参照

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(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

16.2 吸収

健康成人にロサルタンカリウム 100mg を食後及び空腹時に 1 回経口投与した場合、吸収速度は食後投与で低下したが、吸収量の減少は僅かであった[13)]。

5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

「Ⅷ. 6. (5) 妊婦」の項参照

(3) 乳汁への移行性

「Ⅷ. 6. (6) 授乳婦」の項参照

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

健康成人にロサルタンカリウム 25、50、100 又は 200mg[注)] 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[13)]。

注）本剤の承認された 1 回用量は 25～100mg である。

(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

健康成人にロサルタンカリウム 25、50、100 又は 200mg[注)] 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[13)]。

注）本剤の承認された 1 回用量は 25～100mg である。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

「Ⅶ. 10. 特定の背景を有する患者」の項参照

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎障害患者

腎障害を伴う高血圧症患者に、ロサルタンカリウム 50mg を食後 1 回経口投与した場合、血清クレアチニン値の高い群ほどロサルタン並びにカルボン酸体の最高血漿中濃度（C_{max}）及び AUC は大きな値を示した。血清クレアチニン値 3.0mg/dL 以上の群では 1.5mg/dL 未満の群に比較してロサルタンの C_{max} 及び AUC は 2.4 及び 2.2 倍に、カルボン酸体では 1.6 及び 2.0 倍の値を示した[29)]。

16.6.2 透析患者

高血圧症を伴う透析患者に、ロサルタンカリウム 50mg を空腹時に 1 回経口投与した場合、ロサルタンの C_{max} 及び AUC はいずれも増加し、健康成人男子及び高血圧症患者と比較してロサルタンの C_{max} 及び AUC はそれぞれ約 2 及び 3～4 倍の値を示した[30)、31)]。

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[32)]（外国人データ）。[9.2.2 参照]

16.6.3 高齢者

健康高齢者及び健康非高齢者に、ロサルタンカリウム 50mg を空腹時に 1 回経口投与した場合、ロサルタンの吸収速度に差はみられなかったが、高齢者ではロサルタンの C_{max} 及び AUC は非高齢者の約 2 倍を示した。一方、高齢者におけるカルボン酸体の平均 C_{max} 及び AUC は、非高齢者に比べてそれぞれ約 25 及び 27%の軽度な増加であった[33)]。[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．2. 効能又は効果に関連する注意」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．4. 用法及び用量に関連する注意」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、16.6.2 参照]

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重篤な肝障害のある患者

投与しないこと。[2.3、9.3.2 参照]

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

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

(4) 生殖能を有する者

9.4 生殖能を有する者

9.4.1 妊娠する可能性のある女性

妊娠していることが把握されずアンジオテンシン変換酵素阻害剤又はアンジオテンシン II 受容体拮抗剤を使用し、胎児・新生児への影響（腎不全、頭蓋・肺・腎の形成不全、死亡等）が認められた例が報告されている[34)、35)]。

本剤の投与に先立ち、代替薬の有無等も考慮して本剤投与の必要性を慎重に検討し、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。また、投与が必要な場合には次の注意事項に留意すること。[9.5 参照]

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

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

・妊娠中に本剤を使用した場合、胎児・新生児に影響を及ぼすリスクがあること。

・妊娠が判明した又は疑われる場合は、速やかに担当医に相談すること。

・妊娠を計画する場合は、担当医に相談すること。

(5) 妊婦

9.5 妊婦

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

(6) 授乳婦

9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。動物実験（ラット）で乳汁中へ移行することが報告されている。ラットの周産期及び授乳期に 10～100mg/kg/日投与した試験において、100mg/kg/日で産児死亡の軽度の増加が認められた。また、各投与群で産児の低体重が認められ、本試験の無毒性量は追加試験の成績から 5mg/kg/日であった[36)、37)]。

(7) 小児等

9.7 小児等

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

9.8 高齢者

9.8.1 一般に生理機能が低下しているので、患者の状態に注意すること。

9.8.2 低用量から投与を開始するなど慎重に投与すること。一般に過度の降圧は好ましくないとされている。脳梗塞等が起こるおそれがある。

9.8.3 高齢者での体内薬物動態試験で、ロサルタン及びカルボン酸体の血漿中濃度が非高齢者に比べて高かった。[16.6.3 参照]

7. 相互作用

10.相互作用

本剤は、薬物代謝酵素チトクローム P450 2C9（CYP2C9）及び 3A4（CYP3A4）により活性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^{2}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。
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」の項参照

(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/50mg/100mg「杏林」　　処方箋医薬品[注)]
　　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

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：あり
くすりのしおり：あり
その他の患者向け資材：
キョーリンリメディオの ACE 阻害薬、ARB のお薬を使用する女性の患者さんへ
（キョーリンリメディオ株式会社 医療関係者向けサイト https://www.med.kyorin-rmd.com/ に掲載）

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ニューロタン錠 25mg/50mg/100mg
同　効　薬：アンジオテンシンⅡ受容体拮抗薬（アジルサルタン、イルベサルタン、オルメサルタン メドキソミル、カンデサルタン シレキセチル、テルミサルタン、バルサルタン）

7. 国際誕生年月日

1994 年 9 月 2 日

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「杏林」	2012 年 2 月 15 日	22400AMX00557000	2012 年 6 月 22 日	2012 年 6 月 22 日
ロサルタンカリウム錠 50mg「杏林」	2012 年 2 月 15 日	22400AMX00558000	2012 年 6 月 22 日	2012 年 6 月 22 日
ロサルタンカリウム錠 100mg「杏林」	2012 年 2 月 15 日	22400AMX00559000	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 7 月 18 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」の効能及び効果とその用法及び用量の追加

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「杏林」	2149039F1252	2149039F1252	121760501	622176001
ロサルタンカリウム錠 50mg「杏林」	2149039F2259	2149039F2259	121761201	622176101
ロサルタンカリウム錠 100mg「杏林」	2149039F3247	2149039F3247	121762901	622176201

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) 第十八改正日本薬局方解説書 廣川書店 2021：C6319-6323
2) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」・50mg「杏林」・100mg「杏林」の安定性に関する資料（加速試験）
3) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」の安定性に関する資料（無包装・粉砕状態での安定性）
4) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ロサルタンカリウム錠50mg「杏林」の安定性に関する資料（無包装・粉砕状態での安定性）
5) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ロサルタンカリウム錠100mg「杏林」の安定性に関する資料（無包装・粉砕状態での安定性）
6) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」・50mg「杏林」・100mg「杏林」の溶出性に関する資料
7) 吉永馨他：医学のあゆみ, 1995；172：785-823
8) 吉永馨他：臨床医薬, 1994；10(Supple.6)：123-140
9) 吉永馨他：臨床医薬, 1994；10(Supple.6)：103-122
10) Lacourcière, Y. et al.：J. Hypertens., 1994；12：1387-1393
11) Brenner, B. M. et al.：N. Engl. J. Med., 2001；345：861-869
12) RENAAL試験(ニューロタン錠：2006年4月20日承認、申請資料概要ト.1.(3).1)、ト.1.(3).3))
13) 中島光好他：臨床薬理, 1995；26：671-684
14) Chiu, A. T. et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther., 1990；252：711-718
15) Wong, P. C. et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther., 1990；255：211-217
16) Wong, P. C. et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther., 1990；252：719-725
17) Mizuno, K. et al.：Eur. J. Pharmacol., 1992；215：305-308
18) 岡田恵他：基礎と臨床, 1994；28：4063-4073
19) Wong, P. C. et al.：Hypertension, 1990；15：459-468
20) Wong, P. C. et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther., 1990；252：726-732
21) Bovee, K. C. et al.：Am. J. Hypertens., 1991；4：327S-333S
22) Okada, M. et al.：Hypertens. Res., 1993；16：49-55
23) Anderson, S. et al.：Am. J. Physiol., 1993；265：F477-F486
24) Remuzzi, A. et al.：J. Am. Soc. Nephrol., 1993；4：40-49
25) Sasaki, M. et al.：Life Sci., 2004；75：869-880
26) Pollock, D. M. et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther., 1993；267：657-663
27) 中島光好他：臨床薬理, 1995；26：685-696
28) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」・50mg「杏林」・100mg「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料
29) 猿田享男他：臨床医薬, 1994；10(Supple.6)：157-171
30) 多川斉他：臨牀透析, 1995；11：247-264
31) 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、申請資料概要ヘ.(2).1))
32) 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、申請資料概要ヘ.(3).3))
33) 加齢の影響(ニューロタン錠：2006年4月20日承認、申請資料概要ヘ.(1).1).①)
34) 阿部真也他：周産期医学, 2017；47：1353-1355
35) 齊藤大祐他：鹿児島産科婦人科学会雑誌, 2021；29：49-54
36) Spence, S. G. et al.：Teratology, 1995；51：383-397
37) Spence, S. G. et al.：Teratology, 1995；51：367-382
38) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」の経管投与試験に関する資料

39) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ロサルタンカリウム錠 50mg「杏林」の経管投与試験に関する資料
40) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
ロサルタンカリウム錠 100mg「杏林」の経管投与試験に関する資料

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。

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) 粉砕

〈ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」〉[3)]

保存条件：累積照度120万lx･hr、25℃、60%RH

試験項目	規格（参考）	開始時	120万lx･hr
性状	－	白色の粉末	微黄白色の粉末
定量法※	95.0～105.0%	97.4%	93.7%

※n=3の平均値

〈ロサルタンカリウム錠50mg「杏林」〉[4)]

保存条件：累積照度120万lx･hr、25℃、60%RH

試験項目	規格（参考）	開始時	120万lx･hr
性状	－	白色の粉末	微黄白色の粉末
定量法※	95.0～105.0%	97.4%	97.1%

※n=3の平均値

〈ロサルタンカリウム錠100mg「杏林」〉[5)]

保存条件：累積照度120万lx･hr、25℃、60%RH

試験項目	規格（参考）	開始時	120万lx･hr
性状	－	白色の粉末	微黄白色の粉末
定量法※	95.0～105.0%	98.6%	95.2%

※n=3の平均値

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

〈ロサルタンカリウム錠25mg/50mg/100mg「杏林」〉[38)～40)]

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錠剤をそのまま1個入れてピストンを戻し、ディスペンサーに55℃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。10分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、この方法を中止する。この中止した薬品のうち、粉砕可能な錠剤はコーティングを破壊してから、ディスペンサー内に入れて同様に試験を行う。コーティング破壊はシートの上から錠剤を乳棒で15回叩いて行う。

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約2～3mL/秒の速度で注入する。チューブは体内挿入端から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。サイズ8Fr.(フレンチ)のチューブ(外径2.7mm)に注入し、通過性を観察する。薬を注入した後に適量の水を同じ注入器で吸い取り、注入してチューブ内を洗う時、注入器・チューブ内の薬が残存していなければ通過性に

問題なしとする。

［結果］

販売名	崩壊懸濁試験	通過性試験
ロサルタンカリウム錠25mg「杏林」	錠剤の破壊なしでは10分以内に崩壊・懸濁しなかった。 錠剤を破壊し、10分で崩壊・懸濁した。	8Fr.のチューブを通過した。
ロサルタンカリウム錠50mg「杏林」	錠剤の破壊なしでは10分以内に崩壊・懸濁しなかった。 錠剤を破壊し、10分で崩壊・懸濁した。	8Fr.のチューブを通過した。
ロサルタンカリウム錠100mg「杏林」	錠剤の破壊なしでは10分以内に崩壊・懸濁しなかった。 錠剤を破壊し、10分で崩壊・懸濁した。	8Fr.のチューブを通過した。

2. その他の関連資料

該当資料なし