

# 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

高親和性AT<sub>1</sub>レセプターブロッカー  
日本薬局方 オルメサルタン メドキシミル錠  
**オルメサルタン錠5mg「杏林」**  
**オルメサルタン錠10mg「杏林」**  
**オルメサルタン錠20mg「杏林」**  
**オルメサルタン錠40mg「杏林」**  
OLMESARTAN Tablets

剤形	素錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品 <sup>注)</sup> 注) 注意—医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	オルメサルタン錠 5mg 「杏林」： 1錠中、日局オルメサルタン メドキシミル 5mg オルメサルタン錠 10mg 「杏林」： 1錠中、日局オルメサルタン メドキシミル 10mg オルメサルタン錠 20mg 「杏林」： 1錠中、日局オルメサルタン メドキシミル 20mg オルメサルタン錠 40mg 「杏林」： 1錠中、日局オルメサルタン メドキシミル 40mg
一般名	和名：オルメサルタン メドキシミル (JAN) 洋名：Olmesartan Medoxomil (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：2017年8月15日 薬価基準収載年月日：2017年12月8日 販売開始年月日：2017年12月8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 <a href="https://www.med.kyorin-rmd.com/">https://www.med.kyorin-rmd.com/</a>

本 IF は 2023 年 7 月改訂の電子添文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。



(01)14987060307917

## 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て、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	9. 透析等による除去率	26
1. 開発の経緯	1	10. 特定の背景を有する患者	27
2. 製品の治療学的特性	1	11. その他	27
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	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	28
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	28
6. RMP の概要	1	2. 禁忌内容とその理由	28
		3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	28
II. 名称に関する項目	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	28
1. 販売名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	28
2. 一般名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	28
3. 構造式又は示性式	2	7. 相互作用	30
4. 分子式及び分子量	2	8. 副作用	31
5. 化学名(命名法)又は本質	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	32
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	10. 過量投与	32
		11. 適用上の注意	32
III. 有効成分に関する項目	4	12. その他の注意	32
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	IX. 非臨床試験に関する項目	33
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	1. 薬理試験	33
		2. 毒性試験	33
IV. 製剤に関する項目	5		
1. 剤形	5	X. 管理的事項に関する項目	34
2. 製剤の組成	6	1. 規制区分	34
3. 添付溶解液の組成及び容量	6	2. 有効期間	34
4. 力価	6	3. 包装状態での貯法	34
5. 混入する可能性のある夾雑物	6	4. 取扱い上の注意	34
6. 製剤の各種条件下における安定性	7	5. 患者向け資料	34
7. 調製法及び溶解後の安定性	11	6. 同一成分・同効薬	34
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	11	7. 国際誕生年月日	34
9. 溶出性	12	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	35
10. 容器・包装	17	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	35
11. 別途提供される資料類	18	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	35
12. その他	18	11. 再審査期間	35
		12. 投薬期間制限に関する情報	35
V. 治療に関する項目	19	13. 各種コード	35
1. 効能又は効果	19	14. 保険給付上の注意	35
2. 効能又は効果に関連する注意	19		
3. 用法及び用量	19	XI. 文献	36
4. 用法及び用量に関連する注意	19	1. 引用文献	36
5. 臨床成績	19	2. その他の参考文献	37
VI. 薬効薬理に関する項目	21	XII. 参考資料	38
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	21	1. 主な外国での発売状況	38
2. 薬理作用	21	2. 海外における臨床支援情報	38
VII. 薬物動態に関する項目	22	XIII. 備考	39
1. 血中濃度の推移	22	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	39
2. 薬物速度論的パラメータ	25	2. その他の関連資料	42
3. 母集団(ポピュレーション)解析	25		
4. 吸収	25		
5. 分布	25		
6. 代謝	26		
7. 排泄	26		
8. トランスポーターに関する情報	26		

## 略語表

略語	略語内容
ALP	アルカリホスファターゼ
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
AT <sub>1</sub>	アンジオテンシンⅡ受容体サブタイプ1
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
CK	クレアチンキナーゼ
C <sub>max</sub>	最高血中濃度
CRP	C反応性タンパク
CYP	チトクロム P450
eGFR	推算糸球体濾過量
γ-GTP	γ-グルタミルトランスフェラーゼ
IC <sub>50</sub>	50%阻害濃度
LDH	乳酸脱水素酵素
SD	標準偏差
t <sub>1/2</sub>	消失半減期
T <sub>max</sub>	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

オルメサルタン錠 5mg/10mg/20mg/40mg「杏林」は、後発医薬品として薬食発 1121 第 2 号(平成 26 年 11 月 21 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、2017 年 8 月に承認を取得、2017 年 12 月に薬価収載した。

## 2. 製品の治療学的特性

- 本剤は高親和性 AT<sub>1</sub> レセプターブロッカーであり、高血圧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、血管浮腫、腎不全、高カリウム血症、ショック、失神、意識消失、肝機能障害、黄疸、血小板減少、低血糖、横紋筋融解症、アナフィラキシー、重度の下痢、間質性肺炎がある。  
(「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

錠剤に「成分名」、「含量」、「屋号」を両面印字している。

## 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料、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料	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

オルメサルタン錠 10mg 「杏林」  
オルメサルタン錠 5mg 「杏林」  
オルメサルタン錠 20mg 「杏林」  
オルメサルタン錠 40mg 「杏林」

#### (2) 洋名

OLMESARTAN Tablets 10mg “KYORIN”  
OLMESARTAN Tablets 5mg “KYORIN”  
OLMESARTAN Tablets 20mg “KYORIN”  
OLMESARTAN Tablets 40mg “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)

オルメサルタン メドキシミル (JAN)

#### (2) 洋名 (命名法)

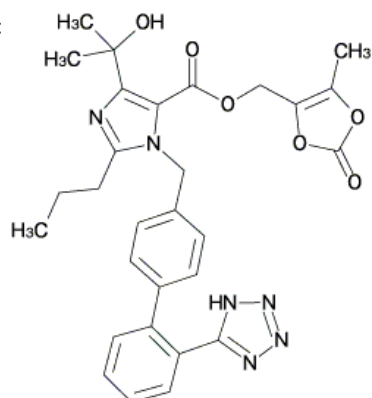
Olmesartan Medoxomil (JAN)

#### (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:  $C_{29}H_{30}N_6O_6$

分子量: 558.59

## 5. 化学名（命名法）又は本質

化学名：(5-Methyl-2-oxo-1,3-dioxol-4-yl)methyl 4-(2-hydroxypropan-2-yl)-2-propyl-1-  
{[2'-(1H-tetrazol-5-yl)biphenyl-4-yl]methyl}-1H-imidazole-5-carboxylate (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～微黄白色の結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

アセトニトリル又はエタノール (99.5) に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

(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「オルメサルタン メドキシミル」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)

● 定量法

日本薬局方「オルメサルタン メドキシミル」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


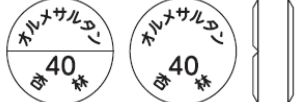
### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

素錠

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	オルメサルタン錠 5mg 「杏林」	オルメサルタン錠 10mg 「杏林」
剤形 <sup>注)</sup>	素錠	片面割線入り素錠
色調	淡黄白色	白色
外形		
本体表示	オルメサルタン 5 杏林	オルメサルタン 10 杏林
直径(mm)	7.0	7.0
厚さ(mm)	2.4	2.4
質量(mg)	120	120

販売名	オルメサルタン錠 20mg 「杏林」	オルメサルタン錠 40mg 「杏林」
剤形 <sup>注)</sup>	片面割線入り素錠	片面割線入り素錠
色調	白色	白色
外形		
本体表示	オルメサルタン 20 杏林	オルメサルタン 40 杏林
直径(mm)	8.0	9.5
厚さ(mm)	2.5	3.6
質量(mg)	160	320

注) においはないか、又はわずかに特異なおいがある。

#### (3) 識別コード

該当しない

#### (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	オルメサルタン錠 5mg 「杏林」	オルメサルタン錠 10mg 「杏林」
有効成分 (1錠中)	日局オルメサルタン メドキシミル 5mg	日局オルメサルタン メドキシミル 10mg
添加剤	低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、結晶セルロース、乳糖水和物、ステアリン酸マグネシウム、黄色三二酸化鉄	低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、結晶セルロース、乳糖水和物、ステアリン酸マグネシウム

販売名	オルメサルタン錠 20mg 「杏林」	オルメサルタン錠 40mg 「杏林」
有効成分 (1錠中)	日局オルメサルタン メドキシミル 20mg	日局オルメサルタン メドキシミル 40mg
添加剤	低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、結晶セルロース、乳糖水和物、ステアリン酸マグネシウム	低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、結晶セルロース、乳糖水和物、ステアリン酸マグネシウム

### (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

該当資料なし

## 6. 製剤の各種条件下における安定性

### 1) 加速試験<sup>1)</sup>

[保存条件]

40°C±2°C、75%RH±5%RH

[試験検体]

PTP 包装品：PTP 包装(ポリ塩化ビニル/ポリ塩化ビニリデン複合フィルム及びアルミニウム箔)、乾燥剤、ピロー包装(アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム)、紙箱

[試験項目及び規格]

試験項目	規 格
性状	[5mg] 淡黄白色の素錠 [10mg] 白色の片面割線入りの素錠 [20mg] 白色の片面割線入りの素錠 [40mg] 白色の片面割線入りの素錠
確認試験	紫外可視吸光度測定法:波長 255~259nm に吸収の極大を示す。
純度試験 (類縁物質)	相対保持時間約 0.2 及び約 1.6 の類縁物質:0.6%以下 上記以外の個々の類縁物質:0.2%以下 類縁物質の合計:1.4%以下
製剤均一性	判定値:15.0%以下
溶出性	[5mg] 溶出試験第2液/900mL/パドル法/毎回 50 回転/30 分間/80%以上 [10mg] 溶出試験第2液/900mL/パドル法/毎回 50 回転/30 分間/80%以上 [20mg] 溶出試験第2液/900mL/パドル法/毎回 50 回転/30 分間/80%以上 [40mg] 溶出試験第2液/900mL/パドル法/毎回 50 回転/30 分間/75%以上
定量法	含量:95.0~105.0%

[結果]

#### 〈オルメサルタン錠 5mg 「杏林」〉

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適			適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適			適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量) <sup>*</sup>	98.3%	97.3%	96.8%	96.9%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

#### 〈オルメサルタン錠 10mg 「杏林」〉

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適			適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適			適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量) <sup>*</sup>	98.2%	97.9%	97.5%	97.5%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

〈オルメサルタン錠 20mg 「杏林」〉

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適			適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適			適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量)*	98.0%	98.0%	97.8%	97.9%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

〈オルメサルタン錠 40mg 「杏林」〉

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適			適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適			適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量)*	97.9%	97.7%	97.8%	97.4%

※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

〈オルメサルタン錠 5mg 「杏林」<sup>2)</sup>〉

保存条件	結 果				
	性状	純度試験	溶出性	定量法	硬度
温度 [40℃、3 ヶ月、 遮光・気密ガラス瓶]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 [25℃、75%RH、1 ヶ月、 遮光・開放ガラス瓶]	変化なし	変化あり (規格外) <sup>※1</sup>	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※2</sup>
湿度 [25℃、60%RH、2 ヶ月、 遮光・開放ガラス瓶]	変化なし	変化あり (規格外) <sup>※3</sup>	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※4</sup>
光 [曝光量 120 万 lx・hr、25℃、 ガラスシャーレ(ラップで シール)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

[規格] 性状：淡黄白色の素錠、純度試験：RRT 約 0.2 : 0.6%、RRT 約 1.6 : 0.6%以下、その他の類縁物質：0.2%以下、類縁物質の合計：1.4%以下、溶出性：30 分間 80%以上、定量法：95.0 ~ 105.0%、硬度：参考値

※1 RRT 約 0.2 0.07%・RRT 約 1.6 0.01%・その他 0.04%・総量 0.17%(開始時)  
→RRT 約 0.2 0.64%・RRT 約 1.6 0.02%・その他 0.06%・総量 0.84%(1 ヶ月)

※2 64N(開始時)→30N(1 ヶ月)

※3 RRT 約 0.2 0.07%・RRT 約 1.6 0.01%・その他 0.04%・総量 0.17%(開始時)  
→RRT 約 0.2 0.59%・RRT 約 1.6 検出せず・その他 0.04%・総量 0.74%(1 ヶ月)、  
RRT 約 0.2 0.71%・RRT 約 1.6 検出せず・その他 0.06%・総量 0.89%(2 ヶ月)

※4 64N(開始時)→39N(1 ヶ月)、38N(2 ヶ月)

〈オルメサルタン錠 10mg 「杏林」〉<sup>3)</sup>

保存条件	結 果				
	性状	純度試験	溶出性	定量法	硬度
温度 [40℃、3 ヶ月、 遮光・気密ガラス瓶]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 [25℃、75%RH、3 ヶ月、 遮光・開放ガラス瓶]	変化なし	変化あり (規格外) <sup>※1</sup>	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※2</sup>
湿度 [25℃、60%RH、3 ヶ月、 遮光・開放ガラス瓶]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※3</sup>
光 [曝光量 120 万 lx・hr、25℃、 ガラスシャーレ(ラップで シール)]	変化なし	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の素錠、純度試験：RRT 約 0.2 : 0.6%、RRT 約 1.6 : 0.6%以下、  
その他の類縁物質：0.2%以下、類縁物質の合計：1.4%以下、溶出性：30 分間 80%以上、定  
量法：95.0~105.0%、硬度：参考値

※1 RRT 約 0.2 0.07%・RRT 約 1.6 検出せず・その他 0.04%・総量 0.13%(開始時)  
→RRT 約 0.2 0.48%・RRT 約 1.6 0.01%・その他 0.05%・総量 0.59%(1 ヶ月)、  
RRT 約 0.2 0.62%・RRT 約 1.6 検出せず・その他 0.03%・総量 0.73%(2 ヶ月)

※2 71N(開始時)→36N(1 ヶ月)、42N(2 ヶ月)

※3 71N(開始時)→44N(2 ヶ月)、49N(3 ヶ月)

〈オルメサルタン錠 20mg 「杏林」〉<sup>4)</sup>

保存条件	結 果				
	性状	純度試験	溶出性	定量法	硬度
温度 [40℃、3 ヶ月、 遮光・気密ガラス瓶]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 [25℃、75%RH、3 ヶ月、 遮光・開放ガラス瓶]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※</sup>
光 [曝光量 120 万 lx・hr、25℃、 ガラスシャーレ(ラップで シール)]	変化なし	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の素錠、純度試験：RRT 約 0.2 : 0.6%、RRT 約 1.6 : 0.6%以下、  
その他の類縁物質：0.2%以下、類縁物質の合計：1.4%以下、溶出性：30 分間 80%以上、定  
量法：95.0~105.0%、硬度：参考値

※ 82N(開始時)→37N(1 ヶ月)、45N(2 ヶ月)、46N(3 ヶ月)

〈オルメサルタン錠 40mg 「杏林」〉<sup>5)</sup>

保存条件	結 果				
	性状	純度試験	溶出性	定量法	硬度
温度 [40℃、3 ヶ月、 遮光・気密ガラス瓶]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 [25℃、75%RH、3 ヶ月、 遮光・開放ガラス瓶]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>*</sup>
光 [曝光量 120 万 lx・hr、25℃、 ガラスシャーレ(ラップで シール)]	変化なし	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の素錠、純度試験：RRT 約 0.2 : 0.6%、RRT 約 1.6 : 0.6%以下、  
その他の類縁物質：0.2%以下、類縁物質の合計：1.4%以下、溶出性：30 分間 75%以上、定  
量法：95.0~105.0%、硬度：参考値

※ 122N(開始時)→56N(1 ヶ月)、72N(3 ヶ月)

〈参考〉評価基準

分類	性状	純度試験 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	規格値内 の場合	含量低下が 3%未満 の場合	硬度変化が 30%未満の 場合
変化あり (規格内)	わずかな色調変化(退色 等)等を認めるが、品質上、 問題とならない程度の変 化であり、規格を満たして いる場合		含量低下が 3%以上 で、規格値内の場合	硬度変化が 30%以上 で、硬度が 19.6N 以上 の場合
変化あり (規格外)	形状変化や著しい色調変 化等を認め、規格を逸脱し ている場合	規格値外 の場合	規格値外の場合	硬度変化が 30%以上 で、硬度が 19.6N 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。

### 3) 分割後の安定性

#### 〈オルメサルタン錠 10mg 「杏林」<sup>6)</sup>〉

保存条件：温度及び湿度成り行き、遮光

保存形態：分割品（1錠を半分に分割）を分包紙（グラシンポリラミネート紙）に保存

試験項目	規格	開始時	2週	4週	8週	12週
性状	分割面：白色	分割面は白色	分割面は白色	分割面は白色	分割面は白色	分割面は白色
定量法	95.0～105.0%	99.6%	100.3%	100.6%	99.4%	99.8%

性状：分割品 20 個の外観を目視で観察、定量法：n=1

#### 〈オルメサルタン錠 20mg 「杏林」<sup>7)</sup>〉

保存条件：温度及び湿度成り行き、遮光

保存形態：分割品（1錠を半分に分割）を分包紙（グラシンポリラミネート紙）に保存

試験項目	規格	開始時	2週	4週	8週	12週
性状	分割面：白色	分割面は白色	分割面は白色	分割面は白色	分割面は白色	分割面は白色
定量法	95.0～105.0%	100.2%	100.2%	100.8%	100.1%	99.8%

性状：分割品 20 個の外観を目視で観察、定量法：n=1

#### 〈オルメサルタン錠 40mg 「杏林」<sup>8)</sup>〉

保存条件：温度及び湿度成り行き、遮光

保存形態：分割品（1錠を半分に分割）を分包紙（グラシンポリラミネート紙）に保存

試験項目	規格	開始時	2週	4週	8週	12週
性状	分割面：白色	分割面は白色	分割面は白色	分割面は白色	分割面は白色	分割面は白色
定量法	95.0～105.0%	101.0%	101.5%	101.5%	100.6%	98.9%

性状：分割品 20 個の外観を目視で観察、定量法：n=1

本剤の安定性に関する結果であり、分割品を分包紙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いません。
--

## 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（物理化学的变化）

「Ⅷ. 11. 適用上の注意」の項参照



## 9. 溶出性

### 1) 溶出挙動における類似性及び同等性<sup>9)</sup>

〈オルメサルタン錠 5mg 「杏林」〉

含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)の C 水準に準じて試験を実施した。

標準製剤	オルメサルタン錠 10mg 「杏林」			
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	溶出試験第 1 液
			pH3.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	溶出試験第 2 液
			水	水
100rpm	pH6.8	溶出試験第 2 液		

①平均溶出率

[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	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±10%の範囲にある。
	pH3.0	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±8%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 55 以上である。
	pH6.8	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±10%の範囲にある。
	水	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±8%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 55 以上である。
100rpm	pH6.8	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±10%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
			オルメサルタン錠 5mg 「杏林」	標準製剤	差	
50rpm	pH1.2	15	97.3	98.1	-0.8	適合
		360	42.5	35.9	6.6	
	pH3.0	15	71.4	69.1	2.3	適合
		360	93.0	92.8	0.2	
	pH6.8	15	35.2	28.6	6.6	適合
		360	63.1	57.4	5.7	
100rpm	pH6.8	15	97.3	97.9	-0.6	適合

②個々の溶出率

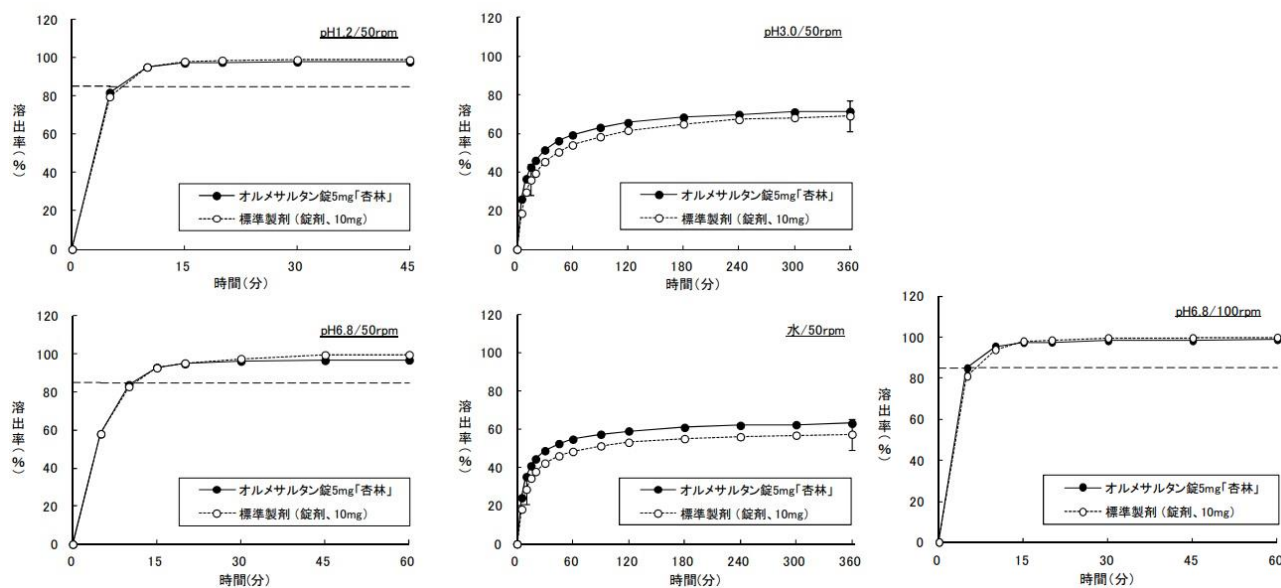
[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。
	pH3.0	試験製剤の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±20%の範囲を超えるものがない。
	pH6.8	試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。
	水	試験製剤の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±20%の範囲を超えるものがない。
100rpm	pH6.8	試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

[結果]

回転数	試験液	判定時点(分)	12ベッセルの溶出率(%)		判定
			平均値	範囲(最小値~最大値)	
50rpm	pH1.2	15	97.3	94.2~99.0	適合
	pH3.0	360	71.4	70.3~72.5	適合
	pH6.8	15	93.0	91.4~94.4	適合
	水	360	63.1	57.3~68.2	適合
100rpm	pH6.8	15	97.3	96.0~98.2	適合

以上の結果より、平均溶出率、個々の溶出率ともに溶出挙動の同等性の判定基準に適合したため、オルメサルタン錠5mg「杏林」は標準製剤と溶出挙動が同等であると判定された。



〈オルメサルタン錠 10mg 「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 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)に準じて試験を実施した。

標準製剤	オルメテック錠 10mg			
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	溶出試験第 1 液
			pH3.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	溶出試験第 2 液
			水	水
100rpm	pH6.8	溶出試験第 1 液		

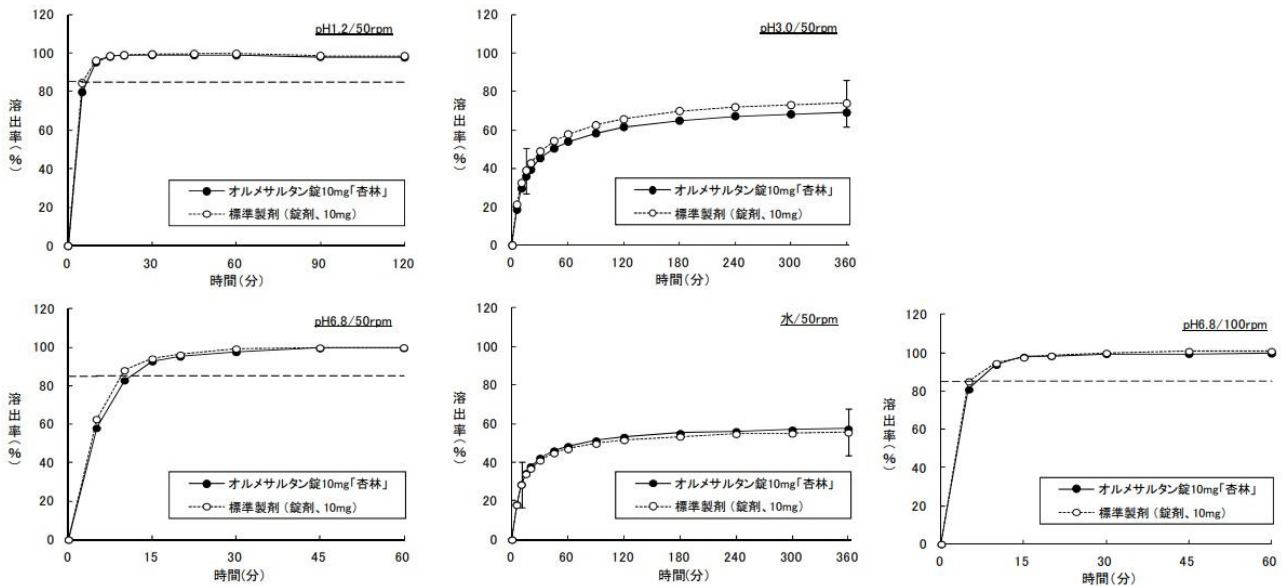
[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	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。
	pH3.0	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 f2 関数の値が 46 以上である。
	pH6.8	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。
	水	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 f2 関数の値が 46 以上である。
100rpm	pH6.8	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
			オルメサルタン錠 10mg 「杏林」	標準製剤	差	
50rpm	pH1.2	15	98.1	98.4	-0.3	適合
		360	35.9	38.9	-3.0	
	pH3.0	15	69.1	73.9	-4.8	適合
		360	28.6	28.5	0.1	
	pH6.8	15	92.8	94.2	-1.4	適合
		360	57.4	55.5	1.9	
100rpm	pH6.8	15	97.9	97.6	0.3	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、オルメサルタン錠 10mg 「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。



### 〈オルメサルタン錠 20mg 「杏林」〉

含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)の A 水準に準じて試験を実施した。

標準製剤	オルメサルタン錠 40mg 「杏林」
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	溶出試験第 2 液 (pH6.8)/900mL/パドル法/毎分 50 回転 試験液の温度 : 37±0.5℃

#### ①平均溶出率

##### [判定基準]

標準製剤の平均溶出率が約 60%及び 85%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±10%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 50 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
			オルメサルタン錠 20mg 「杏林」	標準製剤	差	
50rpm	pH6.8	10	71.7	64.9	6.8	適合
		20	91.4	86.0	5.4	

#### ②個々の溶出率

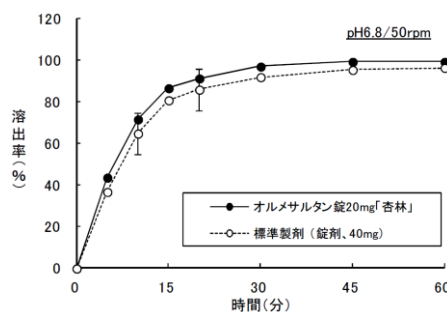
##### [判定基準]

試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。

##### [結果]

回転数	試験液	判定時点 (分)	12 ベッセルの溶出率 (%)		判定
			平均値	範囲 (最小値~最大値)	
50rpm	pH6.8	20	91.4	88.1~93.9	適合

以上の結果より、平均溶出率、個々の溶出率ともに溶出挙動の同等性の判定基準に適合したため、オルメサルタン錠 20mg 「杏林」は標準製剤と溶出挙動が同等であると判定された。



〈オルメサルタン錠 40mg 「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 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)に準じて試験を実施した。

標準製剤	オルメテック錠 40mg			
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	溶出試験第 1 液
			pH3.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	溶出試験第 2 液
			水	水
100rpm	pH6.8	溶出試験第 2 液		

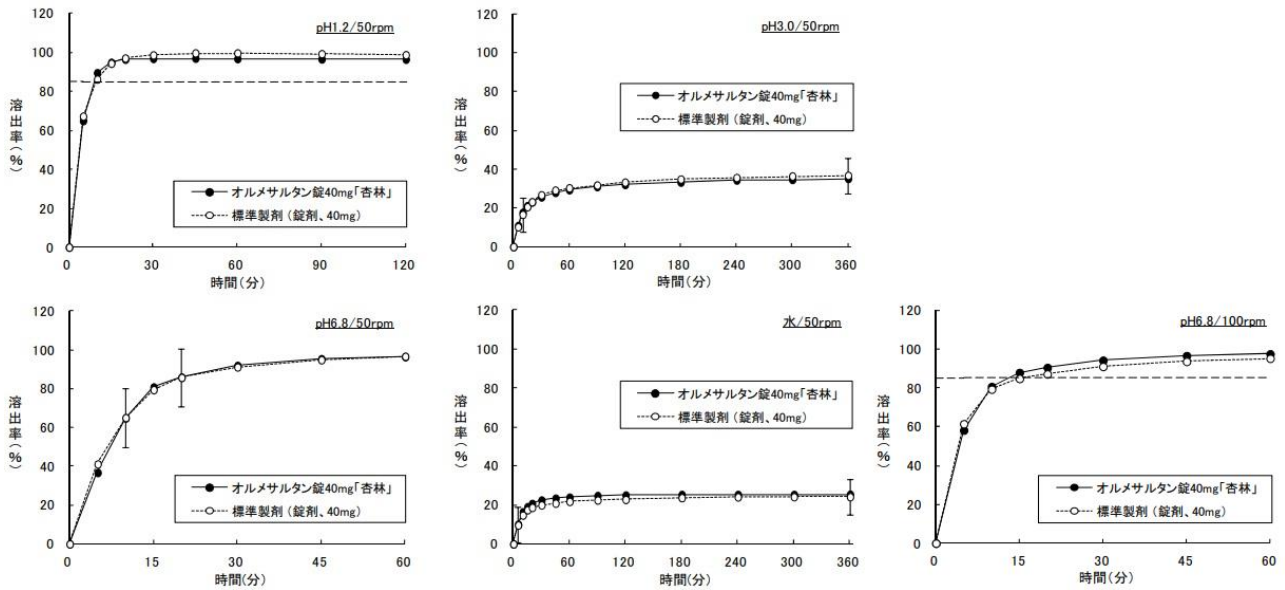
[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	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。
	pH3.0	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±9%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 53 以上である。ただし、規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 10%以下の場合、規定された試験時間でのみ評価し、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にある。
	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±9%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 53 以上である。ただし、規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 10%以下の場合、規定された試験時間でのみ評価し、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にある。
100rpm	pH6.8	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
			オルメサルタン錠 40mg 「杏林」	標準製剤	差	
50rpm	pH1.2	15	94.8	94.3	0.5	適合
		360	17.7	16.6	1.1	
	pH3.0	10	35.1	36.7	-1.6	適合
		360	64.9	65.1	-0.2	
	pH6.8	10	86.0	85.8	0.2	適合
		20	10.1	9.7	0.4	
水	5	25.5	24.2	1.3	適合	
	360	87.9	84.8	3.1		
100rpm	pH6.8	15	87.9	84.8	3.1	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、オルメサルタン錠 40mg 「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<sup>9)</sup>

オルメサルタン錠 5mg「杏林」、オルメサルタン錠 10mg「杏林」、オルメサルタン錠 20mg「杏林」及びオルメサルタン錠 40mg「杏林」は、日本薬局方医薬品各条に定められたオルメサルタンメドキシミル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
オルメサルタン錠 5mg「杏林」	溶出試験第 2 液/900mL/パドル法/50rpm	30 分間 80%以上
オルメサルタン錠 10mg「杏林」	溶出試験第 2 液/900mL/パドル法/50rpm	30 分間 80%以上
オルメサルタン錠 20mg「杏林」	溶出試験第 2 液/900mL/パドル法/50rpm	30 分間 80%以上
オルメサルタン錠 40mg「杏林」	溶出試験第 2 液/900mL/パドル法/50rpm	30 分間 75%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

該当しない

### (2) 包装

〈オルメサルタン錠 5mg「杏林」〉

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り]

〈オルメサルタン錠 10mg「杏林」〉

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り]

500 錠 [10 錠 (PTP) × 50、乾燥剤入り]

〈オルメサルタン錠 20mg「杏林」〉

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り]

500 錠 [10 錠 (PTP) × 50、乾燥剤入り]

〈オルメサルタン錠 40mg「杏林」〉

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り]

### (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/ポリ塩化ビニリデン複合フィルム、アルミニウム箔

ピロー包装：アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム

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

### 2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

#### 6.用法及び用量

通常、成人にはオルメサルタン メドキシミルとして10～20mgを1日1回経口投与する。なお、1日5～10mgから投与を開始し、年齢、症状により適宜増減するが、1日最大投与量は40mgまでとする。

#### (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

設定されていない

### 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

##### 17.1.1 国内臨床試験

本態性高血圧症患者を対象としたオルメサルタン メドキシミルの二重盲検比較試験を含む臨床試験での「判定不能」を含む降圧率（下降例数<sup>注1)</sup>/評価例数）は79.8%（364/456例）、「判定不能」を含まない降圧率は84.7%（364/430例）であった。

なお、このうち軽症・中等症の本態性高血圧症患者を対象とした二重盲検比較試験によって、オルメサルタン メドキシミルの有用性が確認された。

降圧効果はオルメサルタン メドキシミル投与後1週間で発現し、2週間以内に有意な降圧を示した後、4～8週間で最大に達することが確認された<sup>10)</sup>。

注 1) 下降：収縮期血圧（ $\geq 20$ mmHg以上）及び拡張期血圧（ $\geq 10$ mmHg以上）を満たす場合、平均血圧（ $\geq 13$ mmHg



以上)を満たす場合、あるいは下降傾向<sup>注2)</sup>であっても150/90mmHg未満(ただし、入院患者では140/85mmHg未満)に降圧した場合

注2)下降傾向:収縮期血圧(-10mmHg以上)及び拡張期血圧(-5mmHg以上)を満たす場合、あるいは平均血圧(-7mmHg以上)を満たす場合

#### 17.1.3 国内第Ⅲ相試験

重症高血圧症患者を対象としたオルメサルタン メドキシミルの臨床試験での「判定不能」を含む降圧率は86.2%(25/29例)、「判定不能」を含まない降圧率は92.6%(25/27例)であった。

副作用発現頻度は、自他覚症状が6.9%(2/29例)、臨床検査値異常が21.4%(6/28例)であり、認められた自他覚症状の副作用は、眠気及び軟便が各3.4%(1/29例)であった<sup>11)</sup>。

#### 17.1.4 国内臨床試験(長期投与)

軽症・中等症本態性高血圧症患者を対象に、12ヵ月間オルメサルタン メドキシミルを単独投与した結果、安定した降圧効果が得られた。「判定不能」を含む降圧率は80.7%(134/166例)、「判定不能」を含まない降圧率は93.1%(134/144例)であった<sup>12)</sup>

### 2) 安全性試験

#### 17.臨床成績

##### 17.1.5 国内第Ⅲ相試験(長期投与)

軽症・中等症本態性高血圧症患者を対象に、12ヵ月間オルメサルタン メドキシミルをカルシウム拮抗剤もしくはサイアザイド系利尿降圧剤を併用投与した結果、安定した降圧効果が得られた。カルシウム拮抗剤併用療法での「判定不能」を含む降圧率は85.0%(17/20例)、「判定不能」を含まない降圧率は100.0%(17/17例)であった。利尿剤併用療法での「判定不能」を含む降圧率は72.7%(16/22例)、「判定不能」を含まない降圧率は100.0%(16/16例)であった。

副作用発現頻度は、カルシウム拮抗剤併用療法群で自他覚症状が4.5%(1/22例)、臨床検査値異常が4.5%(1/22例)、利尿剤併用療法群で自他覚症状が37.0%(10/27例)、臨床検査値異常が25.9%(7/27例)であった。主な自他覚症状の副作用は、カルシウム拮抗剤併用療法群で立ちくらみ4.5%(1/22例)、利尿剤併用療法群でめまい14.8%(4/27例)であった<sup>13)</sup>。

### (5) 患者・病態別試験

#### 17.臨床成績

##### 17.1.2 国内第Ⅲ相試験

腎機能障害を伴う高血圧症患者を対象としたオルメサルタン メドキシミルの臨床試験での「判定不能」を含む降圧率は68.0%(17/25例)、「判定不能」を含まない降圧率は77.3%(17/22例)であった。

副作用発現頻度は、自他覚症状が10.0%(3/30例)、臨床検査値異常が20.7%(6/29例)であり、認められた自他覚症状の副作用は、頭重(感)、低血圧及び咳が各3.3%(1/30例)であった<sup>14)</sup>。

### (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

#### 17.臨床成績

##### 17.1.6 国内第Ⅱ相試験(血圧日内変動)

軽症・中等症本態性高血圧症を対象に、オルメサルタン メドキシミルを12週間投与し、自由行動下血圧測定による24時間血圧日内変動を検討した結果、オルメサルタン メドキシミルは1日1回投与において、血圧推移のプロファイルに影響を及ぼすことなく、また夜間血圧を過度に低下させることなく24時間安定した降圧作用を示すことが確認された<sup>15)</sup>。

## 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受容体拮抗薬：

アジルサルタン、イルベサルタン、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、ロサルタンカリウム

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

オルメサルタン メドキシミルはプロドラッグであり、生体内で活性代謝物であるオルメサルタンに変換され、アンジオテンシンⅡ (AⅡ) タイプ 1 (AT<sub>1</sub>) 受容体に選択的に作用して AⅡ の結合を競合的に阻害し、昇圧系である AⅡ の薬理作用を抑制する<sup>16)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 アンジオテンシンⅡ受容体拮抗作用

オルメサルタンの AT<sub>1</sub> 受容体拮抗作用をヒト AT<sub>1</sub> 受容体への<sup>125</sup>I-AⅡ 結合阻害で検討したところ、50%阻害濃度 (IC<sub>50</sub> 値) は 1.3nM であった (*in vitro*)。また、オルメサルタンはウサギ及びモルモットの摘出血管において、AⅡ による収縮反応を抑制し、その抑制作用は薬物除去後も持続的であった。ラット及びイヌにおいて、オルメサルタン メドキシミルは、経口投与により AⅡ による昇圧反応を持続的に抑制した<sup>17)</sup>。

##### 18.3 降圧作用

18.3.1 オルメサルタン メドキシミルは経口投与により、腎性高血圧ラット、高血圧自然発症ラット、正常血圧ラットの順に強い降圧作用を示したが、心拍数に影響を与えなかった<sup>17)</sup>。

18.3.2 オルメサルタン メドキシミルを高血圧自然発症ラットに 24 週間反復経口投与すると、耐性を生じることなく安定した降圧作用を示し、反射性の頻脈も認められなかった。また、14 日間反復経口投与後、休薬してもリバウンドは認められなかった<sup>17)</sup>。

18.3.3 オルメサルタンを高血圧自然発症ラットに静脈内投与すると総末梢血管抵抗が減少し、腎血管抵抗の減少が認められた。血圧は下降したが、心拍数に変化はなく、心拍出量は増大した。従って、オルメサルタンの降圧作用は全身血管の拡張に基づく総末梢血管抵抗の減少によるものと考えられる<sup>17)</sup>。

18.3.4 オルメサルタン メドキシミルを高血圧自然発症ラットに 20 週間反復経口投与すると、血圧の下降とともに尿中蛋白排泄及びアルブミン排泄量の減少が認められ、腎臓の病理所見の改善も認められた<sup>17)、18)</sup>。

18.3.5 オルメサルタン メドキシミルを高血圧自然発症ラットに 8 週間反復経口投与すると、血圧の下降とともに心重量の低下及び心筋線維径の減少が認められ、心肥大を抑制することが確認された<sup>17)</sup>。

#### (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

健康な成人男性 24 例にオルメサルタン メドキシミル 5mg、10mg、20mg 及び 40mg を空腹時単回経口投与したとき、オルメサルタンの血漿中濃度は速やかに上昇し、投与 1.7～2.2 時間後に最高に達した。C<sub>max</sub> 及び AUC は投与量に従い増加した<sup>19)</sup>。

表 16-1 オルメサルタン メドキシミル単回経口投与時のオルメサルタンの薬物動態パラメータ

投与量	例数	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)	AUC (ng・hr/mL)
5mg	6	152±31	1.8±0.4	8.7±1.2	892±191
10mg	6	277±46	1.7±0.5	10.2±1.8	1,576±244
20mg	6	481±117	2.2±0.4	11.0±3.8	2,903±915
40mg	6	1,006±152	1.7±0.5	10.6±4.7	5,807±1,142

mean±SD

###### 16.1.2 反復投与

本態性高血圧症患者にオルメサルタン メドキシミル 10mg (20 例) 及び 20mg (19 例) を 14 日間、40mg (10 例) を 7 日間反復経口投与したところ、最終日のオルメサルタンの薬物動態学的パラメータは、次のとおりであった<sup>20)、21)</sup>。

表 16-2 オルメサルタン メドキシミル反復経口投与時のオルメサルタンの薬物動態パラメータ

投与量	例数	C <sub>max</sub> <sup>注3)</sup> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sup>注3)</sup> (ng・hr/mL)
10mg <sup>注1)</sup>	20	285.1 (0.253)	2.2±0.8	6.5±0.9	1,981.2 (0.234)
20mg <sup>注1)</sup>	19	496.0 (0.300)	2.5±1.1	6.3±0.8	3,288.9 (0.254)
40mg <sup>注2)</sup>	10	1,008.5 (0.267)	2.6±1.0	6.0±1.0	7,848.0 (0.301)

mean±SD

注 1) 14 日間投与

注 2) 7 日間投与

注 3) 幾何平均値 (対数変換後の標準偏差)

健康な成人男性 27 例にオルメサルタン メドキシミル 10mg、20mg 及び 40mg を 1 日 1 回 7 日間反復経口投与したときの血漿中オルメサルタン濃度を検討したところ、速やかに定常状態に達し、蓄積性はほとんど認められなかった<sup>22)</sup>。

### 生物学的同等性試験<sup>23)</sup>

#### 〈オルメサルタン錠 5mg 「杏林」〉

オルメサルタン錠 5mg 「杏林」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(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)」に基づき、オルメサルタン錠 10mg 「杏林」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

(「IV. 9. 溶出性」の項参照)

#### 〈オルメサルタン錠 10mg 「杏林」〉

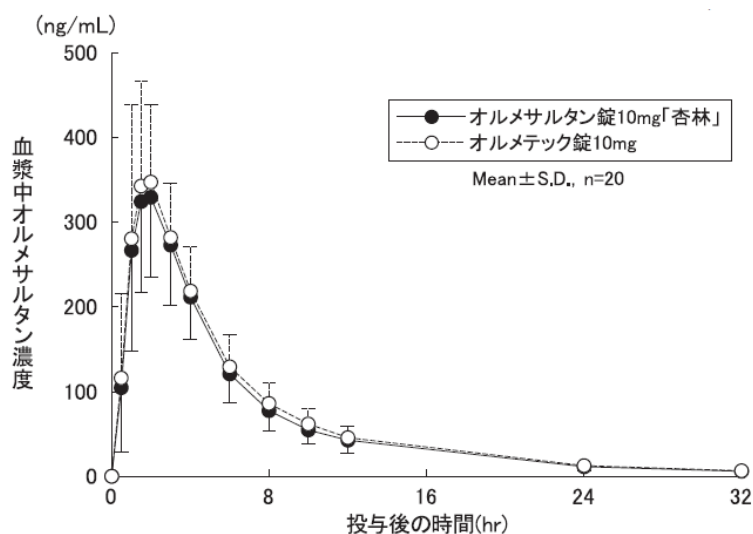
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

オルメサルタン錠 10mg 「杏林」とオルメテック錠 10mg をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (オルメサルタン メドキシミルとして 10mg) 健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中活性代謝物 (オルメサルタン) 濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC, Cmax) について 90% 信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

#### 薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-32</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
オルメサルタン錠 10mg 「杏林」	2130.4 ± 526.8	355.2 ± 81.2	1.9 ± 0.8	6.8 ± 0.7
オルメテック錠 10mg	2264.0 ± 459.6	385.4 ± 87.3	1.8 ± 0.9	6.9 ± 0.7

mean ± SD, n=20



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。

〈オルメサルタン錠 20mg 「杏林」〉

オルメサルタン錠 20mg 「杏林」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(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)」に基づき、オルメサルタン錠 40mg 「杏林」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

(「IV. 9. 溶出性」の項参照)

〈オルメサルタン錠 40mg 「杏林」〉

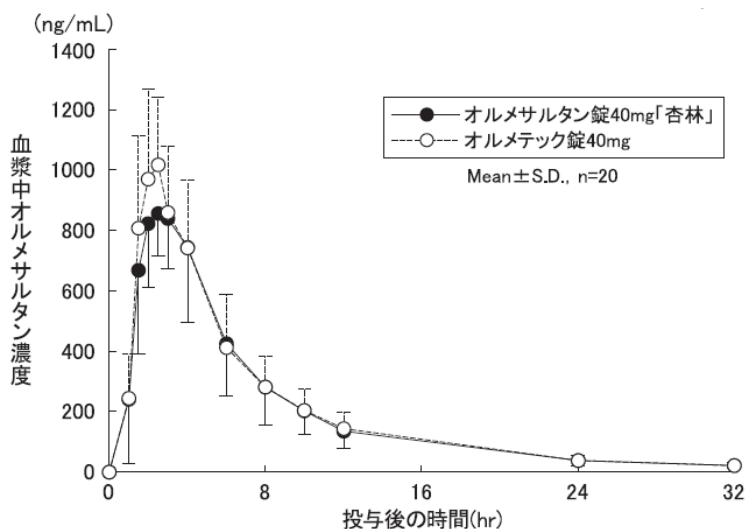
後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

オルメサルタン錠 40mg 「杏林」とオルメテック錠 40mg をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (オルメサルタン メドキシミルとして 40mg) 健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中活性代謝物 (オルメサルタン) 濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC, Cmax) について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-32</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
オルメサルタン錠 40mg 「杏林」	6689.3 ± 1704.7	1000.2 ± 184.0	2.3 ± 1.1	6.8 ± 0.8
オルメテック錠 40mg	6992.1 ± 1664.7	1112.6 ± 239.7	2.2 ± 1.2	6.7 ± 1.1

mean ± SD, n=20



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。

(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

#### 16.2.1 食事の影響

健康な成人男性 12 例にオルメサルタン メドキシミル 20mg を空腹時、低脂肪食摂取 30 分後あるいは高脂肪食摂取 30 分後に単回経口投与したとき、それぞれのオルメサルタンの C<sub>max</sub> 及び AUC にはほとんど差はなく、食事の影響は認められなかった<sup>24)</sup>。

#### 16.2.2 バイオアベイラビリティ

健康な成人男性 24 例にオルメサルタン メドキシミル 20mg を空腹時単回経口投与又はオルメサルタン 16.2mg を静脈内に単回投与し、絶対バイオアベイラビリティを求めた結果、25.6%であった<sup>25)</sup>（外国人データ）。

## 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

**16.3 分布**

**16.3.1 血清蛋白結合率（限外濾過法）**

オルメサルタンの血清蛋白結合率は 99%と高く、主にアルブミンのワルファリンサイトに結合する (*in vitro*) が、ワルファリンとの併用試験でワルファリンの薬物動態に影響がなく血液凝固系に影響を及ぼさなかった<sup>26)、27)</sup> (外国人データ)。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

**16.4 代謝**

オルメサルタン メドキシミルは、経口投与後、主に小腸上皮、肝臓又は血漿においてエステラーゼによる加水分解を受け、活性代謝物のオルメサルタンに代謝される。血漿中にはオルメサルタンのみが認められ、その他の代謝物は存在しない。ヒト肝ミクロソームを用い、チトクローム P450 分子種 7 種類 (1A1&2、2A6、2C19、2C8&9、2D6、2E1、3A4) の活性について、オルメサルタンによる阻害率を検討したところ、臨床用量で想定される血漿中濃度ではいずれの分子種もほとんど阻害しなかった。また、ヒト培養肝細胞にて、オルメサルタン メドキシミルによるチトクローム P450 の誘導は認められなかった<sup>28)</sup> (*in vitro*)。

(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**

健康な成人男性に <sup>14</sup>C-オルメサルタン メドキシミル 20mg を単回経口投与したところ、投与した総放射能の 12.6% (240 時間後まで) が尿中に、77.2% (312 時間後まで) が糞中に排泄された<sup>29)</sup> (外国人データ)。

健康な成人男性 24 例にオルメサルタン メドキシミル 5mg、10mg、20mg 及び 40mg を空腹時単回経口投与したとき、投与 48 時間までに尿中にオルメサルタンが 11.6~14.6%排泄された<sup>30)</sup>。

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

### 16.6 特定の背景を有する患者

#### 16.6.1 腎機能障害患者

健康な成人男性 8 例と、腎機能障害患者 26 例を重症度別に 8~9 例ずつ 3 群に分けた計 34 例に対し、オルメサルタン メドキシミル 10mg を 1 日 1 回 7 日間反復経口投与したときの 7 日目の定常状態における血漿中オルメサルタンの AUC の幾何平均値は、腎機能正常者と比較して、軽度、中等度及び重度腎機能障害患者でそれぞれ 1.6 倍、1.8 倍、2.8 倍であった<sup>31)</sup> (外国人データ)。[9.2.1 参照]

#### 16.6.2 肝機能障害患者

軽度及び中等度肝機能障害患者 12 例にオルメサルタン メドキシミル 10mg を空腹時単回経口投与したとき、肝機能正常者と比較して血漿中オルメサルタンの AUC はそれぞれ 1.1 倍、1.7 倍であった<sup>31)</sup> (外国人データ)。  
[9.3 参照]

#### 16.6.3 高齢者

健康な高齢者 (65 歳以上) 6 例にオルメサルタン メドキシミル 10mg を単回経口投与し、健康な非高齢者とオルメサルタンの AUC の幾何平均値を比較したところ、ほとんど差は認められなかった<sup>32)</sup>。  
また、高齢高血圧症患者 (75 歳以上) 17 例にオルメサルタン メドキシミル 10mg を 1 日 1 回 14 日間反復経口投与したところ、非高齢患者に比較し AUC の幾何平均値が 1.4 倍高値を示したが、蓄積性はほとんど認められなかった<sup>31)</sup> (外国人データ)。

## 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 アリスキレンフマル酸塩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

設定されていない

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

### 5. 重要な基本的注意とその理由

#### 8.重要な基本的注意

8.1 本剤を含むアンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤投与中に重篤な肝機能障害があらわれたとの報告があるので、肝機能検査を実施するなど観察を十分に行うこと。 [11.1.5 参照]

8.2 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可能性がある。

8.3 降圧作用に基づくめまい、ふらつきがあらわれることがあるので、高所作業、自動車の運転等危険を伴う機械を操作する際には注意させること。

### 6. 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。

##### 9.1.3 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

低用量から投与を開始し、増量する場合は徐々に行うこと。一過性の急激な血圧低下を起こすおそれがある。

[11.1.4 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（血清クレアチニン値 3.0mg/dL 以上）のある患者

これらの患者を対象とした有効性及び安全性を検討する臨床試験は実施していない。腎機能を悪化させるおそれがある。[16.6.1 参照]

#### 9.2.2 血液透析中の患者

低用量から投与を開始し、増量する場合は徐々に行うこと。一過性の急激な血圧低下を起こすおそれがある。  
[11.1.4 参照]

## (3) 肝機能障害患者

### 9.3 肝機能障害患者

軽度又は中等度の肝機能障害患者（Child-Pugh 分類スコア：5～9）でオルメサルタンの血漿中濃度が上昇することが報告されている。[16.6.2 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>33)、34)</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Ⅱ受容体拮抗剤又はアンジオテンシン変換酵素阻害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、高カリウム血症、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、頭蓋顔面の変形、肺の形成不全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）の 5mg/kg/日 で乳汁中への移行が認められている。動物実験（ラット周産期及び授乳期経口投与）の 200mg/kg/日 で出生児に腎盂拡張を伴う死亡及び体重減少が、8mg/kg/

日で出生児に体重増加抑制及び生後分化の遅延が認められている。

## (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

開始用量を遵守し、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。

## 7. 相互作用

### (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
アリスキレンフマル酸塩 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。) [2.3 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 塩化カリウム等	血清カリウム値が上昇することがある。	本剤のアルドステロン分泌抑制作用によりカリウム貯留作用が増強するおそれがある。 危険因子：腎機能障害のある患者
利尿降圧剤 フロセミド、 トリクロルメチアジド等 [11.1.4 参照]	一過性の急激な血圧低下を起こすおそれがある。低用量から投与を開始し、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。
リチウム製剤 炭酸リチウム	リチウム中毒が起こるおそれがある。	明確な機序は不明であるが、ナトリウムイオン不足はリチウムイオンの貯留を促進するといわれているため、本剤がナトリウム排泄を促進することにより起こると考えられる。
アリスキレンフマル酸塩	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フマル酸塩	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。

	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。	
アンジオテンシン変換酵素阻害剤	腎機能障害、高カリウム血症及び低血圧を起こすおそれがある。	
非ステロイド性消炎鎮痛剤	降圧作用が減弱するおそれがある。	非ステロイド性消炎鎮痛剤は、血管拡張作用を有す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。
	腎機能を悪化させるおそれがある。	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。

## 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 血管浮腫（頻度不明）

顔面、口唇、咽頭、舌の腫脹等が症状としてあらわれることがある。

###### 11.1.2 腎不全（頻度不明）

###### 11.1.3 高カリウム血症（頻度不明）

###### 11.1.4 ショック（頻度不明）、失神（頻度不明）、意識消失（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]

###### 11.1.5 肝機能障害（頻度不明）、黄疸（頻度不明）

AST、ALT、 $\gamma$ -GTP 上昇等の肝機能障害があらわれることがある。[8.1 参照]

###### 11.1.6 血小板減少（頻度不明）

###### 11.1.7 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。

###### 11.1.8 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ることがあるので、このような場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

###### 11.1.9 アナフィラキシー（頻度不明）

そう痒感、全身発赤、血圧低下、呼吸困難等が症状としてあらわれることがあり、アナフィラキシーショックを起こしたとの報告もある。

###### 11.1.10 重度の下痢（頻度不明）

長期投与により、体重減少を伴う重度の下痢があらわれることがある。生検により腸絨毛萎縮等が認められたとの報告がある。

###### 11.1.11 間質性肺炎（頻度不明）

発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部 X 線異常等を伴う間質性肺炎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、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

## (2) その他の副作用

11.2 その他の副作用			
	1～5%未満	1%未満	頻度不明
過敏症		発疹	そう痒
血液	赤血球数減少、ヘモグロビン減少、ヘマトクリット減少	白血球数増加、血小板数減少	貧血
精神神経系	めまい、立ちくらみ、ふらつき感	頭痛、頭重感、眠気	
消化器		軟便	下痢、嘔気・嘔吐、口渇、口内炎、胃部不快感、便秘、腹痛
循環器			心房細動、動悸、ほてり、胸痛
肝臓	ALT 上昇、AST 上昇、 $\gamma$ -GTP 上昇、LDH 上昇	ALP 上昇	
泌尿器	BUN 上昇	血清クレアチニン上昇、尿蛋白陽性、尿沈渣陽性	頻尿
その他	CK 上昇、CRP 上昇、トリグリセリド上昇、血清カリウム上昇、尿酸上昇	全身倦怠感、咳嗽	浮腫、異常感（浮遊感、気分不良等）、胸部不快感、筋肉痛、脱力感、疲労、しびれ、味覚異常、脱毛

## 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 薬剤調製時の注意

本剤をメトホルミン塩酸塩製剤又はカモスタットメシル酸塩製剤等と一包化し高温多湿条件下にて保存した場合、メトホルミン塩酸塩製剤又はカモスタットメシル酸塩製剤等が変色することがあるので、一包化は避けること。

#### 14.2 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：オルメサルタン錠 5mg/10mg/20mg/40mg 「杏林」 処方箋医薬品<sup>注)</sup>  
注) 注意－医師等の処方箋により使用すること  
有効成分：オルメサルタン メドキシミル 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：オルメテック OD 錠 5mg/10mg/20mg/40mg

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、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、ロサルタンカリウム）

### 7. 国際誕生年月日

2002年4月25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
オルメサルタン錠 5mg「杏林」	2017年8月15日	22900AMX00891000	2017年12月8日	2017年12月8日
オルメサルタン錠 10mg「杏林」	2017年8月15日	22900AMX00892000	2017年12月8日	2017年12月8日
オルメサルタン錠 20mg「杏林」	2017年8月15日	22900AMX00893000	2017年12月8日	2017年12月8日
オルメサルタン錠 40mg「杏林」	2017年8月15日	22900AMX00894000	2017年12月8日	2017年12月8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

該当しない

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
オルメサルタン錠 5mg「杏林」	2149044F3019	2149044F3094	125894301	622589401
オルメサルタン錠 10mg「杏林」	2149044F1016	2149044F1083	125895001	622589501
オルメサルタン錠 20mg「杏林」	2149044F2080	2149044F2080	125896701	622589601
オルメサルタン錠 40mg「杏林」	2149044F4015	2149044F4090	125897401	622589701

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) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 5mg「杏林」・10mg「杏林」・20mg「杏林」・40mg「杏林」の安定性試験に関する資料（加速試験）
- 2) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 5mg「杏林」の安定性試験に関する資料（無包装状態での安定性）
- 3) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 10mg「杏林」の安定性試験に関する資料（無包装状態での安定性）
- 4) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 20mg「杏林」の安定性試験に関する資料（無包装状態での安定性）
- 5) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 40mg「杏林」の安定性試験に関する資料（無包装状態での安定性）
- 6) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 10mg「杏林」の安定性試験に関する資料（分包紙保存(半錠分割)状態での安定性）
- 7) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 20mg「杏林」の安定性試験に関する資料（分包紙保存(半錠分割)状態での安定性）
- 8) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 40mg「杏林」の安定性試験に関する資料（分包紙保存(半錠分割)状態での安定性）
- 9) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 5mg「杏林」・10mg「杏林」・20mg「杏林」・40mg「杏林」の溶出性に関する資料
- 10) 併合解析の結果（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.7.3.3、2.7.6）
- 11) 重症高血圧症を対象とした第Ⅲ相試験（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.7.6）
- 12) 長期投与の有効性（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.7.3.5）
- 13) 本態性高血圧症を対象としたカルシウム拮抗薬、サイアザイド系利尿薬併用投与試験（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.7.6）
- 14) 腎機能障害を伴う高血圧症患者を対象とした第Ⅲ相試験（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.7.6）
- 15) 軽症・中等症本態性高血圧症患者を対象とした第Ⅱ相試験（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.7.6）
- 16) 薬理学的分類（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.5.1.3）
- 17) 小池博之ほか：三共研究所年報 2003；55：1-91
- 18) 腎臓に対する作用（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.6.1.3）
- 19) 田中孝典ほか：臨床医薬 2003；19（10）：1131-1142
- 20) 軽症・中等症本態性高血圧症患者を対象とした薬物動態と降圧作用の関係の検討（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.7.6）
- 21) 本態性高血圧症患者を対象とした40mg投与時の薬物動態の検討（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.7.6）
- 22) 田中孝典ほか：臨床医薬 2003；19（10）：1143-1156
- 23) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 5mg「杏林」・10mg「杏林」・20mg「杏林」・40mg「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料
- 24) 田中孝典ほか：臨床医薬 2003；19（11）：1283-1295
- 25) バイオアベイラビリティ（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.7.1.2）
- 26) 蛋白結合（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.6.2.4）
- 27) ワルファリンとの相互作用（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.7.6）
- 28) 代謝（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要 2.6.2.5）
- 29) 第十八改正日本薬局方解説書 2021；C-1265-C-1272

- 30) 単回経口投与における薬物動態の検討（オルメテック錠：2004年1月29日承認、申請資料概要2.7.6）
- 31) von Bergmann K, et al. : J Hypertens. 2001 ; 19 (S1) : S33-S40
- 32) 田中孝典ほか：臨床医薬 2003 ; 19 (11) : 1297-1306
- 33) 阿部真也ほか：周産期医学 2017 ; 47 : 1353-1355
- 34) 齊藤大祐ほか：鹿児島産科婦人科学会雑誌 2021 ; 29 : 49-54
- 35) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 5mg「杏林」の安定性試験に関する資料（分包紙保存(粉碎)状態での安定性）
- 36) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 5mg「杏林」の安定性試験に関する資料（粉碎後の安定性）
- 37) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 10mg「杏林」の安定性試験に関する資料（分包紙保存(粉碎)状態での安定性）
- 38) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 10mg「杏林」の安定性試験に関する資料（粉碎後の安定性）
- 39) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 20mg「杏林」の安定性試験に関する資料（分包紙保存(粉碎)状態での安定性）
- 40) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 20mg「杏林」の安定性試験に関する資料（粉碎後の安定性）
- 41) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 40mg「杏林」の安定性試験に関する資料（分包紙保存(粉碎)状態での安定性）
- 42) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 40mg「杏林」の安定性試験に関する資料（粉碎後の安定性）
- 43) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 5mg「杏林」の経管投与試験に関する資料
- 44) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 10mg「杏林」の経管投与試験に関する資料
- 45) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 20mg「杏林」の経管投与試験に関する資料
- 46) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
オルメサルタン錠 40mg「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

## XII. 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

〈オルメサルタン錠 5mg 「杏林」<sup>35), 36)</sup>

①保存条件：温度及び湿度成り行き、遮光 保存形態：分包紙(グラシンポリラミネート紙)

試験項目	規格 (参考)	開始時	2 週	4 週	8 週	12 週
性状	淡黄白色の粉末	淡黄白色の粉末	淡黄白色の粉末	淡黄白色の粉末	淡黄白色の粉末	淡黄白色の粉末
定量法	95.0~105.0%	99.9%	98.5%	98.8%	98.2%	97.0%

(n=1)

②保存条件：40±2℃ 保存形態：遮光、気密容器(ガラス瓶)

試験項目	規格 (参考)		開始時	4 週間
性状	淡黄白色の粉末		淡黄白色の粉末	淡黄白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.07%	0.45%
	RRT 約 1.6	0.6%以下	0.01%	0.02%
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.04%
	総量	1.4%以下	0.17%	0.65%
定量法	含量：95.0~105.0%		99.02%	98.54%

(n=1)

③保存条件：25±2℃、75%RH±5%RH 保存形態：遮光・開放(ガラス瓶)

試験項目	規格 (参考)		開始時	2 週間	4 週間
性状	淡黄白色の粉末		淡黄白色の粉末	淡黄白色の粉末	淡黄白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.07%	0.68% (規格外)	0.89% (規格外)
	RRT 約 1.6	0.6%以下	0.01%	検出せず	検出せず
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.05%	0.05%
	総量	1.4%以下	0.17%	0.82%	1.06%
定量法	含量：95.0~105.0%		99.02%	98.32%	98.16%

(n=1)

④保存条件：25℃、約 2000lx 保存形態：気密容器(ガラスシャーレ+サランラップ(フタ))

試験項目	規格 (参考)		開始時	12.5 日間 (曝光量 60 万 lx・hr)
性状	淡黄白色の粉末		淡黄白色の粉末	淡黄白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.07%	0.14%
	RRT 約 1.6	0.6%以下	0.01%	検出せず
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.06%
	総量	1.4%以下	0.17%	0.29%
定量法	含量：95.0~105.0%		99.02%	97.66%

(n=1)

〈オルメサルタン錠 10mg 「杏林」<sup>37), 38)</sup>

①保存条件：温度及び湿度成り行き、遮光 保存形態：分包紙(グラシンポリラミネート紙)

試験項目	規格 (参考)	開始時	2 週	4 週	8 週	12 週
性状	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
定量法	95.0~105.0%	100.0%	99.5%	99.2%	98.5%	98.1%

(n=1)

②保存条件：40±2℃ 保存形態：遮光、気密容器(ガラス瓶)

試験項目	規格 (参考)		開始時	4 週間
性状	白色の粉末		白色の粉末	白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.07%	0.27%
	RRT 約 1.6	0.6%以下	検出せず	0.01%
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.02%
	総量	1.4%以下	0.13%	0.39%
定量法	含量：95.0~105.0%		99.92%	97.66%

(n=1)

③保存条件：25±2℃、75%RH±5%RH 保存形態：遮光・開放(ガラス瓶)

試験項目	規格 (参考)		開始時	2 週間	4 週間
性状	白色の粉末		白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.07%	0.44%	0.56%
	RRT 約 1.6	0.6%以下	検出せず	検出せず	検出せず
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.04%	0.05%
	総量	1.4%以下	0.13%	0.55%	0.67%
定量法	含量：95.0~105.0%		99.02%	99.07%	99.54%

(n=1)

④保存条件：25℃、約 2000lx 保存形態：気密容器(ガラスシャーレ+サランラップ(フタ))

試験項目	規格 (参考)		開始時	12.5 日間(曝光量 60 万 lx・hr)
性状	白色の粉末		白色の粉末	白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.07%	0.09%
	RRT 約 1.6	0.6%以下	検出せず	検出せず
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.08%
	総量	1.4%以下	0.13%	0.27%
定量法	含量：95.0~105.0%		99.02%	98.43%

(n=1)

〈オルメサルタン錠 20mg 「杏林」<sup>39), 40)</sup>

①保存条件：温度及び湿度成り行き、遮光 保存形態：分包紙(グラシンポリラミネート紙)

試験項目	規格 (参考)	開始時	2 週	4 週	8 週	12 週
性状	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
定量法	95.0~105.0%	99.2%	99.3%	99.3%	98.5%	97.2%

(n=1)

②保存条件：40±2℃ 保存形態：遮光、気密容器(ガラス瓶)

試験項目	規格 (参考)		開始時	4 週間
性状	白色の粉末		白色の粉末	白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.05%	0.28%
	RRT 約 1.6	0.6%以下	検出せず	検出せず
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.02%
	総量	1.4%以下	0.12%	0.37%
定量法	含量：95.0~105.0%		99.49%	98.55%

(n=1)

③保存条件：25±2℃、75%RH±5%RH 保存形態：遮光・開放(ガラス瓶)

試験項目	規格 (参考)		開始時	2 週間	4 週間
性状	白色の粉末		白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.05%	0.30%	0.42%
	RRT 約 1.6	0.6%以下	検出せず	検出せず	検出せず
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.04%	0.04%
	総量	1.4%以下	0.17%	0.37%	0.51%
定量法	含量：95.0～105.0%		99.49%	99.48%	99.23%

(n=1)

④保存条件：25℃、約 2000lx 保存形態：気密容器(ガラスシャーレ+サランラップ(フタ))

試験項目	規格 (参考)		開始時	12.5 日間(曝光量 60 万 lx・hr)
性状	白色の粉末		白色の粉末	白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.05%	0.08%
	RRT 約 1.6	0.6%以下	検出せず	検出せず
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.06%
	総量	1.4%以下	0.17%	0.22%
定量法	含量：95.0～105.0%		99.49%	98.80%

(n=1)

〈オルメサルタン錠 40mg「杏林」<sup>41), 42)</sup>

①保存条件：温度及び湿度成り行き、遮光 保存形態：分包紙(グラシンポリラミネート紙)

試験項目	規格 (参考)	開始時	2 週	4 週	8 週	12 週
性状	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
定量法	95.0～105.0%	100.9%	99.8%	100.2%	99.2%	98.5%

(n=1)

②保存条件：40±2℃ 保存形態：遮光、気密容器(ガラス瓶)

試験項目	規格 (参考)		開始時	4 週間
性状	白色の粉末		白色の粉末	白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.05%	0.27%
	RRT 約 1.6	0.6%以下	検出せず	検出せず
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.02%
	総量	1.4%以下	0.13%	0.36%
定量法	含量：95.0～105.0%		99.99%	99.19%

(n=1)

③保存条件：25±2℃、75%RH±5%RH 保存形態：遮光・開放(ガラス瓶)

試験項目	規格 (参考)		開始時	2 週間	4 週間
性状	白色の粉末		白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.05%	0.31%	0.41%
	RRT 約 1.6	0.6%以下	検出せず	検出せず	検出せず
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.04%	0.04%
	総量	1.4%以下	0.13%	0.39%	0.49%
定量法	含量：95.0～105.0%		99.99%	99.30%	99.33%

(n=1)

④保存条件：25°C、約 2000lx 保存形態：気密容器(ガラスシャーレ+サランラップ(フタ))

試験項目	規格 (参考)		開始時	12.5 日間(曝光量 60 万 lx・hr)
性状	白色の粉末		白色の粉末	白色の粉末
純度試験	RRT 約 0.2	0.6%以下	0.05%	0.07%
	RRT 約 1.6	0.6%以下	検出せず	検出せず
	上記以外	0.2%以下	0.04%	0.04%
	総量	1.4%以下	0.13%	0.18%
定量法	含量：95.0～105.0%		99.99%	99.35%

(n=1)

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

〈オルメサルタン錠 5mg/10mg/20mg/40mg 「杏林」<sup>43)~46)</sup>

[試験方法]

### 崩壊懸濁試験

ディスペンサーのピストン部を抜き取り、ディスペンサー内に錠剤をそのまま 1 個入れてピストンを戻し、ディスペンサーに 55°C 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。崩壊しない場合、新たな錠剤 1 個を薬包紙の上から乳棒で数回叩いてコーティングを破壊し、同様の試験を行う。

### 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、通過性を観察した。薬を注入後に 20mL の水を吸い取り、注入してチューブ内を洗う時、注入器・チューブ内に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
オルメサルタン錠 5mg 「杏林」	5 分で崩壊・懸濁した。	8Fr. のチューブを通過した。
オルメサルタン錠 10mg 「杏林」	5 分で崩壊・懸濁した。	8Fr. のチューブを通過した。
オルメサルタン錠 20mg 「杏林」	5 分で崩壊・懸濁した。	8Fr. のチューブを通過した。
オルメサルタン錠 40mg 「杏林」	5 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