2024年4月改訂（第14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2008に準拠して作成（一部2018に準拠）

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K錠25mg「VTRS」
ロサルタンK錠50mg「VTRS」
ロサルタンK錠100mg「VTRS」

LOSARTAN K 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K錠25mg「ＶＴＲＳ」 1錠中 日局 ロサルタンカリウム25.0mg ロサルタンK錠50mg「ＶＴＲＳ」 1錠中 日局 ロサルタンカリウム50.0mg ロサルタンK錠100mg「ＶＴＲＳ」 1錠中 日局 ロサルタンカリウム100.0mg
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・発売年月日	製造販売承認年月日：2012年 2月15日 薬価基準収載年月日：2022年 6月 1日（25mg、100mg） 2022年 6月17日（50mg） 発売年月日：2012年 6月22日
開発・製造販売（輸入）・提携・販売会社名	製造販売元：ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社 販売元：ヴィアトリス製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ヴィアトリス製薬株式会社　メディカルインフォメーション部 フリーダイヤル　0120-419-043 https://www.viatris-e-channel.com/

本IFは2023年11月改訂の電子化された添付文書の記載に基づき改訂した。最新の添付文書情報は、PMDAホームページ「医薬品に関する情報」https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.htmlにてご確認ください。

IF 利用の手引きの概要　―日本病院薬剤師会―

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として医療用医薬品添付文書（以下、添付文書と略す）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合がある。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過した現在、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において新たな IF 記載要領が策定された。

2. IF とは

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

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・判断・提供すべき事項等は IF の記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供された IF は、薬剤師自らが評価･判断･臨床適応するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

［IF の様式］

①規格は A4 判、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。

②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。

③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

［IF の作成］

①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤、注射剤、外用剤）に作成される。

②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。

③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。

④製薬企業の機密等に関するもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価･判断･提供すべき事項については記載されない。

⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」と略す）により作成された IF は、電子媒体での提供を基本とし、必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

［IF の発行］

①「IF 記載要領 2008」は、平成 21 年 4 月以降に承認された新医薬品から適用となる。

②上記以外の医薬品については、「IF 記載要領 2008」による作成･提供は強制されるものではない。

③使用上の注意の改訂、再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ、記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2008」においては、従来の主に MR による紙媒体での提供に替え、PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は、電子媒体から印刷して利用することが原則で、医療機関での IT 環境によっては必要に応じて MR に印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

電子媒体の IF については、医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホームページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従って作成・提供するが、IF の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や IF 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の MR 等へのインタビューにより薬剤師自らが内容を充実させ､IF の利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IF が改訂されるまでの間は、当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等、あるいは医薬品医療機器情報配信サービス等により薬剤師自らが整備するとともに、IF の使用にあたっては、最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることがあり、その取扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IF を薬剤師等の日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用して頂きたい。しかし、薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により、製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて、当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから、記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は、IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり、今後インターネットでの公開等も踏まえ、薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

（2008 年 9 月）

目　次

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・製剤学的特性 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） 3
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 3
7. CAS登録番号 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 4
4. 有効成分の定量法 4

IV. 製剤に関する項目 5
1. 剤形 5
2. 製剤の組成 6
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 6
4. 製剤の各種条件下における安定性 7
5. 調製法及び溶解後の安定性 11
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化） 11
7. 溶出性 12
8. 生物学的試験法 16
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 16
10. 製剤中の有効成分の定量法 16
11. 力価 16
12. 混入する可能性のある夾雑物 16
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 17
14. その他 17

V. 治療に関する項目 18
1. 効能又は効果 18
2. 効能又は効果に関連する注意 18
3. 用法及び用量 18
4. 用法及び用量に関連する注意 18
5. 臨床成績 19

VI. 薬効薬理に関する項目 21
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 21
2. 薬理作用 21

VII. 薬物動態に関する項目 22
1. 血中濃度の推移・測定法 22
2. 薬物速度論的パラメータ 28
3. 吸収 28
4. 分布 29
5. 代謝 29
6. 排泄 30
7. 透析等による除去率 30

VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 31
1. 警告内容とその理由 31
2. 禁忌内容とその理由 31
3. 効能又は効果に関連する注意とその理由 31
4. 用法及び用量に関連する注意とその理由 31
5. 重要な基本的注意とその理由 32
6. 特定の背景を有する患者に関する注意 32
7. 相互作用 35
8. 副作用 37
9. 臨床検査結果に及ぼす影響 38
10. 過量投与 38
11. 適用上の注意 38
12. その他の注意 38

IX. 非臨床試験に関する項目 39
1. 薬理試験 39
2. 毒性試験 39

X. 管理的事項に関する項目 40
1. 規制区分 40
2. 有効期間又は使用期限 40
3. 貯法・保存条件 40
4. 薬剤取扱い上の注意点 40
5. 承認条件等 40
6. 包装 40
7. 容器の材質 41
8. 同一成分・同効薬 41
9. 国際誕生年月日 41
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 41
11. 薬価基準収載年月日 41
12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容..... 41
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容..... 41
14. 再審査期間 41
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 42
16. 各種コード 42
17. 保険給付上の注意 42

XI. 文献 43
1. 引用文献 43
2. その他の参考文献 44

XII. 参考資料..... 45
1. 主な外国での発売状況 45
2. 海外における臨床支援情報 45

XIII. 備考..... 46
その他の関連資料 46

Ⅰ. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

ロサルタンＫは、アンジオテンシン変換酵素阻害剤が直接影響を及ぼすブラジキニン代謝に作用を示さない血圧降下剤として開発されたアンジオテンシンⅡ（A-Ⅱ）アンタゴニストである。A-Ⅱ受容体の AT_1 サブタイプに選択的に結合してA-Ⅱの作用を阻害し、ブラジキニンの分解酵素（キニナーゼⅡ）には直接作用しない[1)]。

ロサルタンＫ錠 25mg・50mg・100mg「ファイザー」は、ファイザー株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第0331015号（平成17年3月31日）に基づく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実施し、2012年2月に承認を得た製剤である。

2022年6月、ファイザー株式会社からマイランEPD合同会社（現、ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社）へ製造販売移管したため、販売名をロサルタンＫ錠25mg・50mg・100mg「ＶＴＲＳ」に変更した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

1. 1日1回投与で降圧作用を示すアンジオテンシンⅡ（A-Ⅱ）アンタゴニスト
   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の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）受容体のサブタイプのうち AT_1 受容体と選択的に結合し、A-Ⅱの生理作用を阻害して降圧作用を示し、ブラジキニンの分解酵素（キニナーゼⅡ）には直接影響を及ぼさない[1)、2)]。
2. 誤投与・飲み違い防止のための認識性向上の取り組み
   1）包装（小函、PTPシート）にユニバーサルデザイン仕様の「つたわるフォント*」を採用することで、誤認防止と低視力状態に対応できるように可読性を高めている[3)～5)]。
   2）規格取り違えを防ぐための試みとして複数規格ある含量表示に上下の記号（▲▼）をラベル・小函に表記した。
   3）PTPシートや錠剤のデザインを工夫することで識別性を高めている。
3. 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報告されている。

（「Ⅷ-8. 副作用」の項を参照）

*「つたわるフォント」は、誤認を防ぐこと、可読性を高めることを目的に、慶應義塾大学、博報堂ユニバーサルデザイン、株式会社タイプバンクにより共同で開発された書体である。

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

ロサルタンＫ錠25mg「ＶＴＲＳ」
ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」
ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」

(2) 洋名

LOSARTAN K Tablets

(3) 名称の由来

有効成分であるロサルタンカリウムに剤形、含量及び「ＶＴＲＳ」を付した。

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

ロサルタンカリウム（JAN）

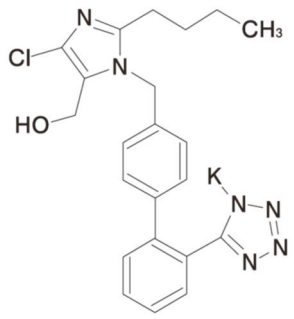
(2) 洋名（命名法）

Losartan Potassium（JAN）
Losartan（INN）

(3) ステム

AⅡアンタゴニスト、降圧剤（非ペプチド性）：-sartan

3. 構造式又は示性式



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）

Monopotassium 5‐{[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

該当資料なし

7. CAS 登録番号

124750-99-8

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 [1)]

日本薬局方「ロサルタンカリウム」確認試験法による。

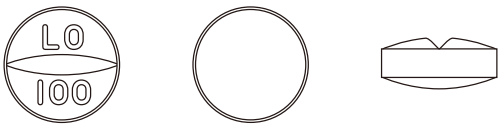
4. 有効成分の定量法 [1)]

日本薬局方「ロサルタンカリウム」定量法による。

Ⅳ. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、規格及び性状

販売名	外形			色調等
	上面	下面	側面	
ロサルタンＫ錠 25mg「ＶＴＲＳ」				白色 フィルムコーティング錠
	直径 6.1mm	厚さ 2.7mm	重量 79mg	
ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」				白色 フィルムコーティング錠
	直径 7.65mm	厚さ 3.65mm	重量 156mg	
ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」				白色 フィルムコーティング錠
	直径 9.1mm	厚さ 4.3mm	重量 300mg	

(2) 製剤の物性

該当資料なし

(3) 識別コード

ロサルタンＫ錠 25mg「ＶＴＲＳ」 ： L0 25
ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」 ： L0 50
ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」： L0 100

(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定な pH 域等

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量

ロサルタンＫ錠25mg「ＶＴＲＳ」
　1錠中 日局 ロサルタンカリウム25.0mg
ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」
　1錠中 日局 ロサルタンカリウム50.0mg
ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」
　1錠中 日局 ロサルタンカリウム100.0mg

(2) 添加物

ロサルタンＫ錠25mg「ＶＴＲＳ」、ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」
　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、ヒプロメロース、酸化チタン、カルナウバロウ
ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」
　乳糖水和物、結晶セルロース、部分アルファー化デンプン、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

(3) その他

該当資料なし

3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

加速試験[6)～8)]

試験条件：40±1℃、75±5%RH

①ロサルタンＫ錠25mg「ＶＴＲＳ」

包装形態：PTP包装（OPPフィルムピロー、紙箱）

項目及び規格	試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（白色のフィルムコーティング錠）	適合	適合	適合	適合
確認試験（薄層クロマトグラフィー）	適合	—	—	適合
製剤均一性試験*	適合	—	—	適合
溶出試験**（85%以上）	95.7～99.8	97.9～100.7	96.5～99.8	96.3～100.0
定量試験（93.0～107.0%）	98.8～99.7	98.8～99.7	98.4～99.6	98.8～100.0
純度試験	0.02～0.05	0.04～0.07	0.13～0.15	0.24～0.30

各ロット n=3

*各ロット n=10×3

**各ロット n=6×3

包装形態：ポリエチレン製瓶包装（ポリプロピレン製キャップで密栓）

項目及び規格	試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（白色のフィルムコーティング錠）	適合	適合	適合	適合
確認試験（薄層クロマトグラフィー）	適合	—	—	適合
製剤均一性試験*	適合	—	—	適合
溶出試験**（85%以上）	95.7～99.8	96.1～100.4	95.7～99.9	97.2～99.7
定量試験（93.0～107.0%）	98.8～99.7	98.7～99.7	98.6～99.5	98.3～100.1
純度試験	0.02～0.05	0.03～0.05	0.05～0.09	0.09～0.11

各ロット n=3

*各ロット n=10×3

**各ロット n=6×3

加速試験（40℃、相対湿度75%、6ヵ月）の結果、ロサルタンＫ錠25mg「ＶＴＲＳ」は通常の市場流通下において3年間安定であることが推測された。

②ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」

包装形態：PTP 包装（OPP フィルムピロー、紙箱）

項目及び規格	試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（白色のフィルムコーティング錠）	適合	適合	適合	適合
確認試験（薄層クロマトグラフィー）	適合	—	—	適合
製剤均一性試験*	適合	—	—	適合
溶出試験**（85%以上）	96.2～100.7	94.2～100.1	98.0～100.5	97.0～99.9
定量試験（93.0～107.0%）	98.8～99.9	98.9～100.0	98.7～99.8	99.3～99.8
純度試験	0.02～0.03	0.04～0.06	0.12～0.14	0.25～0.29

各ロット n=3

*各ロット n=10×3

**各ロット n=6×3

包装形態：ポリエチレン製瓶包装（ポリプロピレン製キャップで密栓）

項目及び規格	試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（白色のフィルムコーティング錠）	適合	適合	適合	適合
確認試験（薄層クロマトグラフィー）	適合	—	—	適合
製剤均一性試験*	適合	—	—	適合
溶出試験**（85%以上）	96.2～100.7	97.7～100.5	97.0～100.0	97.9～100.4
定量試験（93.0～107.0%）	98.8～99.9	98.7～99.5	98.6～100.3	98.9～99.8
純度試験	0.02～0.03	0.02～0.04	0.05～0.09	0.09～0.14

各ロット n=3

*各ロット n=10×3

**各ロット n=6×3

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6ヵ月）の結果、ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

③ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」
包装形態（PTP 包装）

項目及び規格	試験開始時	1ヵ月後	3ヵ月後	6ヵ月後
性状（白色のフィルムコーティング錠）	適合	適合	適合	適合
確認試験（薄層クロマトグラフィー）	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験*	適合	—	—	適合
溶出試験**（85%以上）	98.4～104.7	100.8～104.6	96.1～102.0	97.8～104.2
定量試験（95.0～105.0%）	98.85～100.90	100.46～101.70	98.82～100.77	99.90～101.05
純度試験	0.00	0.00～0.01	0.03～0.04	0.08～0.12

各ロット n=3
*各ロット n=10×3
**各ロット n=6×3

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6ヵ月）の結果、ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。

無包装状態の安定性[9)]
試験条件：① 温度　：40℃±1℃、75%RH±5%RH　褐色ガラス瓶（気密）
② 湿度　：25℃±2℃、75%RH±5%RH　透明プラスチックシャーレ（開放）
③ 光　　：25℃±2℃、45%RH±5%RH、曝光量 2500Lux
透明プラスチックシャーレ（開放）
測定時期：①、②開始時、1ヶ月後、2ヶ月後、3ヶ月後
③開始時、30 万 Lux・hr 時、60 万 Lux・hr 時、120 万 Lux・hr 時
試験項目：性状、含量、溶出性
試験回数：性状 3 回、含量 3 回、溶出性 1 回（6 ベッセル）

ロサルタンＫ錠 25mg「ＶＴＲＳ」
① 温度に対する安定性試験

測定項目	測定時期			
	開始時	1ヶ月	2ヶ月	3ヶ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
含量（%）［対開始時（%）］	99.4［100.0］	98.9［99.5］	99.1［99.7］	100.2［100.8］
溶出性（%）	98.7	100.8	100.7	100.1

② 湿度に対する安定性試験

測定項目	測定時期			
	開始時	1ヶ月	2ヶ月	3ヶ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
含量（%）［対開始時（%）］	99.4［100.0］	98.8［99.4］	99.5［100.1］	100.8［101.4］
溶出性（%）	98.7	100.4	100.3	99.4

③ 光に対する安定性試験

測定項目	測定時期			
	開始時	30 万 Lux・hr	60 万 Lux・hr	120 万 Lux・hr
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
含量（%） ［対開始時（%）］	99.4 ［100.0］	98.0 ［98.6］	97.8 ［98.4］	98.5 ［99.1］
溶出性（%）	98.7	100.5	99.5	98.8

ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」

① 温度に対する安定性試験

測定項目	測定時期			
	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
含量（%） ［対開始時（%）］	99.9 ［100.0］	99.2 ［99.3］	98.8 ［98.9］	100.4 ［100.5］
溶出性（%）	100.6	100.7	100.5	99.9

② 湿度に対する安定性試験

測定項目	測定時期			
	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
含量（%） ［対開始時（%）］	99.9 ［100.0］	98.0 ［98.1］	99.1 ［99.2］	100.7 ［100.8］
溶出性（%）	100.6	100.4	98.5	99.9

③ 光に対する安定性試験

測定項目	測定時期			
	開始時	30 万 Lux・hr	60 万 Lux・hr	120 万 Lux・hr
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
含量（%） ［対開始時（%）］	99.9 ［100.0］	98.6 ［98.7］	98.9 ［99.0］	100.3 ［100.4］
溶出性（%）	100.6	100.6	99.5	98.8

ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」

① 温度に対する安定性試験

測定項目	測定時期			
	開始時	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
含量（%） ［対開始時（%）］	100.1 ［100.0］	97.0 ［96.9］	97.2 ［97.1］	98.5 ［98.4］
溶出性（%）	99.4	98.3	97.1	96.1

② 湿度に対する安定性試験

測定項目	測定時期			
	開始時	1ヶ月	2ヶ月	3ヶ月
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
含量（%） ［対開始時（%）］	100.1 ［100.0］	97.4 ［97.3］	96.2 ［96.1］	98.6 ［98.5］
溶出性（%）	99.4	97.1	95.0	94.7

③ 光に対する安定性試験

測定項目	測定時期			
	開始時	30万Lux・hr	60万Lux・hr	120万Lux・hr
性状	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠	白色のフィルムコーティング錠
含量（%） ［対開始時（%）］	100.1 ［100.0］	97.7 ［97.6］	97.8 ［97.7］	96.3 ［96.2］
溶出性（%）	99.4	99.0	98.8	98.3

本剤の無包装状態での保存は弊社としては推奨していない。

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）

該当しない

7. 溶出性

溶出挙動[10)～12)]

①ロサルタンＫ錠 25mg「ＶＴＲＳ」

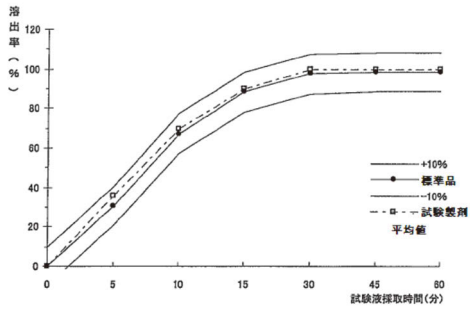
「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」（平成 12 年 2 月 14 日 医薬審第 64 号、平成 18 年 11 月 24 日一部改正 薬食審査発第 1124004 号）に基づき、ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」を標準品としてロサルタンＫ錠 25mg「ＶＴＲＳ」の溶出試験を実施した結果、溶出挙動の同等性が示され、両製剤は生物学的に同等とみなされた。

試験条件

試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	水	900mL	50rpm

n=12

水（50rpm）



試験条件	薬剤	溶出率（%）					
		5 分	10 分	15 分	30 分	45 分	60 分
水 50rpm	ロサルタンＫ錠 25mg「ＶＴＲＳ」	35.8 ±5.2	70.1 ±5.1	89.7 ±5.2	99.5 ±0.8	99.5 ±0.8	99.5 ±0.7
	標準品	30.6 ±3.5	67.4 ±9.4	88.6 ±7.7	97.6 ±0.9	98.5 ±1.0	98.5 ±0.5

平均値±標準偏差　n=12

②ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」

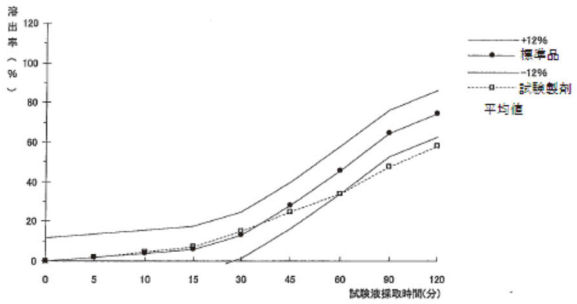
ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」と標準品の溶出試験を実施した結果、ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

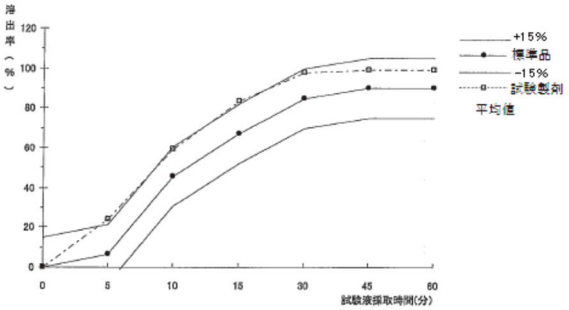
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2（日本薬局方溶出試験第 1 液） pH5.0（薄めた McIlvaine 緩衝液） pH6.8（日本薬局方溶出試験第 2 液） 水	900mL	50rpm
	pH5.0（薄めた McIlvaine 緩衝液）	900mL	100rpm

n=12

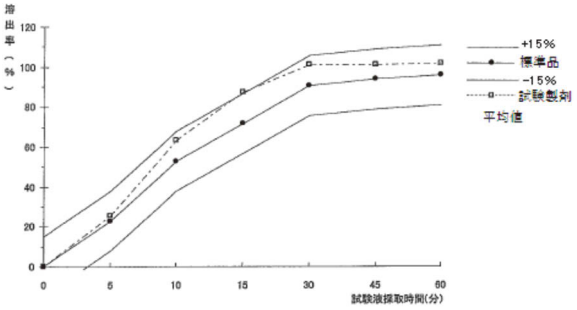
pH1.2（50rpm）



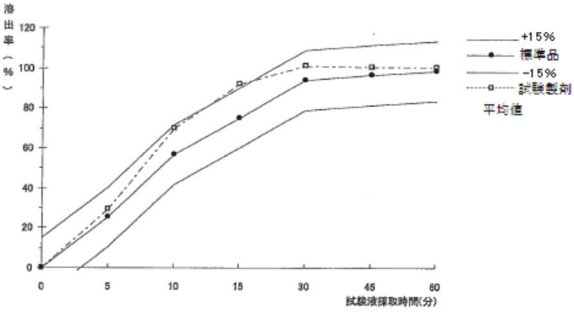
pH5.0（50rpm）



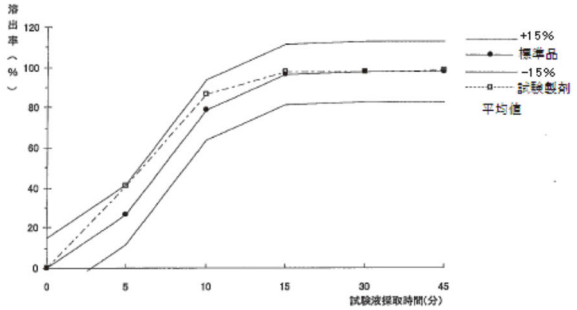
pH6.8（50rpm）



水（50rpm）



pH5.0（100rpm）



試験条件	薬剤	溶出率（%）							
		5分	10分	15分	30分	45分	60分	90分	120分
pH1.2 50rpm	ロサルタンK錠50mg 「ＶＴＲＳ」	2.2 ±0.5	4.3 ±0.5	6.9 ±0.8	15.3 ±1.7	24.6 ±3.1	33.7 ±3.2	47.5 ±3.2	58.1 ±3.4
	標準品	1.8 ±0.2	3.7 ±0.5	5.8 ±0.7	13.0 ±2.3	28.0 ±12.7	45.9 ±21.1	64.6 ±23.0	74.3 ±19.3
pH5.0 50rpm	ロサルタンK錠50mg 「ＶＴＲＳ」	24.2 ±2.9	59.3 ±7.6	83.2 ±7.8	97.9 ±1.8	99.4 ±1.1	99.0 ±1.0	－	－
	標準品	6.6 ±2.7	45.7 ±7.7	67.0 ±9.3	85.0 ±9.6	89.8 ±6.2	90.1 ±5.8	－	－
pH6.8 50rpm	ロサルタンK錠50mg 「ＶＴＲＳ」	25.5 ±2.9	63.2 ±7.5	87.2 ±6.9	100.9 ±0.8	101.4 ±0.7	101.7 ±0.5	－	－
	標準品	22.9 ±8.5	53.1 ±11.7	71.9 ±13.8	90.7 ±10.0	93.8 ±6.7	95.6 ±4.7	－	－
水 50rpm	ロサルタンK錠50mg 「ＶＴＲＳ」	29.1 ±4.1	70.0 ±8.4	91.7 ±7.1	100.9 ±0.7	100.7 ±0.6	100.6 ±0.7	－	－
	標準品	25.7 ±8.3	56.5 ±10.7	74.7 ±10.8	93.7 ±5.8	96.5 ±4.0	98.4 ±3.7	－	－
pH5.0 100rpm	ロサルタンK錠50mg 「ＶＴＲＳ」	41.0 ±3.1	86.6 ±3.3	97.9 ±0.6	98.1 ±0.8	－	－	－	－
	標準品	26.5 ±8.4	79.2 ±11.6	96.5 ±3.9	97.9 ±2.0	－	－	－	－

平均値±標準偏差　n=12

③ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」

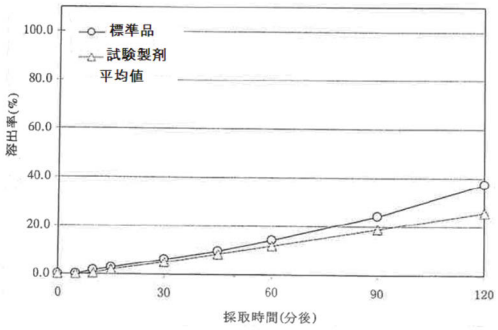
ロサルタン K 錠 100mg「ＶＴＲＳ」と標準品の溶出試験を実施した結果、ロサルタン K 錠 100mg「ＶＴＲＳ」はいずれの試験液においても溶出挙動が類似し、「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の溶出挙動の同等性の判定基準に適合した。

試験条件

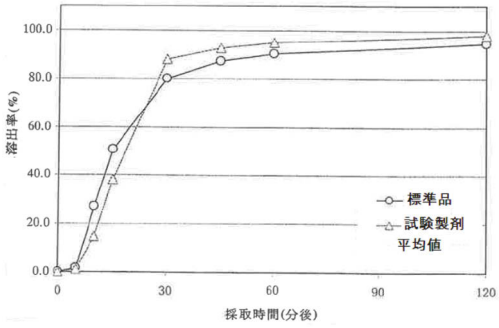
試験法	試験液	試験液量	回転数
パドル法	pH1.2（日本薬局方溶出試験第 1 液） pH5.0（薄めた McIlvaine 緩衝液） pH6.8（日本薬局方溶出試験第 2 液） 水	900mL	50rpm
	pH5.0（薄めた McIlvaine 緩衝液）	900mL	100rpm

n=12

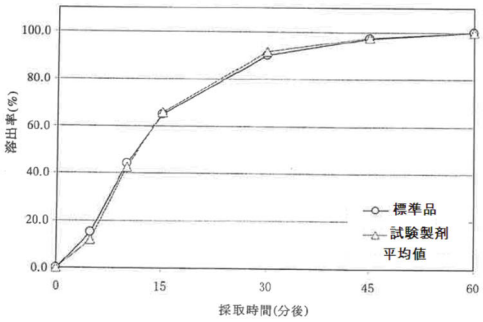
pH1.2（50rpm）



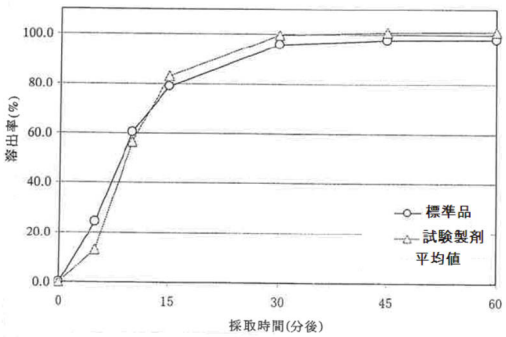
pH5.0（50rpm）



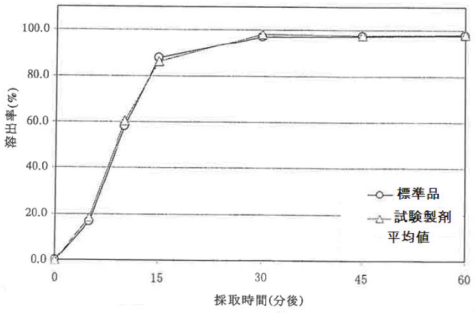
pH6.8（50rpm）



水（50rpm）



pH5.0（100rpm）



試験条件	薬剤	溶出率（%）							
		5分	10分	15分	30分	45分	60分	90分	120分
pH1.2 50rpm	ロサルタンK錠100mg「VTRS」	0.0	0.3	1.9	5.1	8.4	11.8	18.7	25.7
	標準品	0.0	1.5	2.6	6.0	9.8	14.1	24.4	37.5
pH5.0 50rpm	ロサルタンK錠100mg「VTRS」	1.0	14.5	38.2	88.0	92.6	95.1	－	98.0
	標準品	1.7	27.0	50.4	80.0	87.3	90.2	－	94.4
pH6.8 50rpm	ロサルタンK錠100mg「VTRS」	11.8	42.5	65.6	91.5	97.5	99.9	－	－
	標準品	15.0	43.9	65.0	90.1	97.2	100.1	－	－
水 50rpm	ロサルタンK錠100mg「VTRS」	11.5	43.3	69.4	97.7	100.4	101.5	－	－
	標準品	17.6	49.7	70.6	92.3	97.9	99.7	－	－
pH5.0 100rpm	ロサルタンK錠100mg「VTRS」	18.5	60.1	86.0	98.0	97.8	98.0	－	－
	標準品	16.6	57.8	87.6	96.9	97.4	97.5	－	－

平均値　n=12

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

日本薬局方　一般試験法 薄層クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

日本薬局方　一般試験法 液体クロマトグラフィー

11. 力価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報

該当しない

14. その他

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
〇高血圧症
〇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) 探索的試験

1) 有効性検証試験

〈高血圧症〉

①国内臨床試験[13)]

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錠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 13.5%（19 件）に対し、ロサルタンカリウム錠では 0.7%（1 件）認められた。

②海外第Ⅲ相試験[14)]

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。

〈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〉

国際共同第Ⅲ相試験[15)、16)]

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錠（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錠治療群において、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錠を平均 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錠は、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錠治療群（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錠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。

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

A-Ⅱアンタゴニスト

（カンデサルタンシレキセチル、バルサルタン、テルミサルタン、オルメサルタンメドキソミル、イルベサルタン）

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の添付文書を参照すること。

2．薬理作用

（1）作用部位・作用機序[1)、2)]

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の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ギオテンシンⅡ受容体のうちAT1受容体と選択的に結合し、アンギオテンシンⅡの生理作用を阻害することによって降圧作用を現す。なお、ブラジキニンの分解酵素（キニナーゼⅡ）には直接作用しない。

（2）薬効を裏付ける試験成績

1）アンジオテンシン受容体拮抗作用

①A-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、AT1 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[2)、17)、18)]。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[19)]。

②実験動物（ラット、サル等）に対する外因性A-Ⅱ昇圧反応を抑制する[2)、18)]。

2）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[20)、21)]、腎性高血圧ラット[20)、22)]、脳卒中易発症高血圧自然発症ラット[23)]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[19)、23)]。

3）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[24)]。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）[25)]、自然発症インスリン非依存性糖尿病マウス[26)]、5/6腎切除ラット[27)]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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間[28)、29)]

ロサルタン

ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」
1.28±0.44 (hr)
ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」
1.45±0.65 (hr)

カルボン酸体

ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」
3.15±0.59 (hr)
ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」
2.74±1.26 (hr)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

1) 単回投与[30)]

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。

2) 反復投与[31)]

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。

3) 生物学的同等性試験

①ロサルタンＫ錠 25mg「ＶＴＲＳ」[10)]

ロサルタンＫ錠 25mg「ＶＴＲＳ」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 12 年 2 月 14 日 医薬審第 64 号、平成 18 年 11 月 24 日一部改正）に基づき、ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」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。

②ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」[28)]

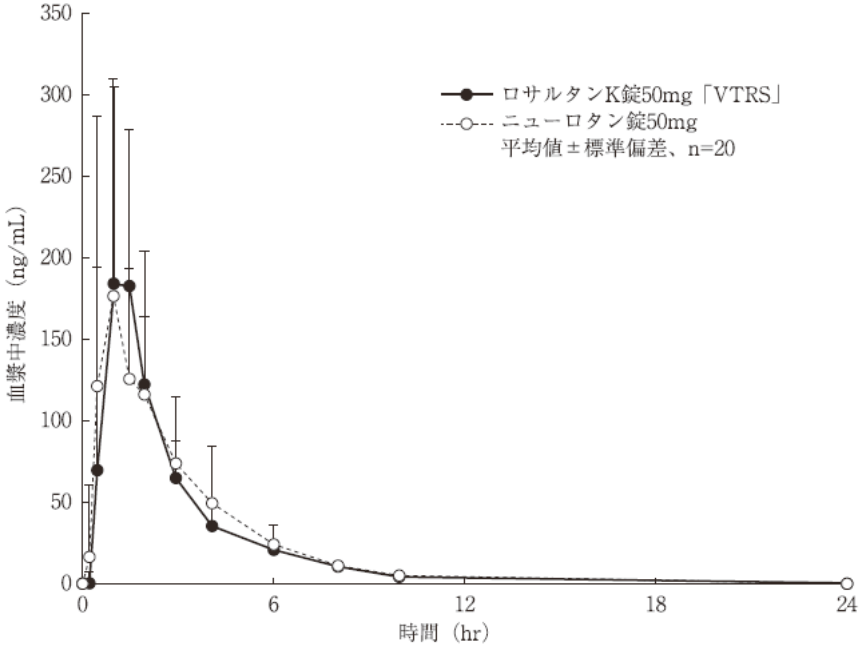
健康成人男子にロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」とニューロタン錠 50mg のそれぞれ 1 錠（ロサルタンカリウムとして 50mg）を、絶食時単回経口投与して血漿中ロサルタン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された（クロスオーバー法）。

ロサルタンの薬物動態パラメータ

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ				
		AUC_{0-24} (ng･hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	AUC_{∞} (ng･hr/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	MRT (hr)	Kel (/hr)
ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」	１錠 (50mg)	516 ±118	260 ±116	498 ±114	1.28 ±0.44	2.08 ±0.34	3.10 ±0.60	0.341 ±0.057
ニューロタン錠 50mg	１錠 (50mg)	536 ±125	268 ±136	522 ±120	1.53 ±0.95	2.22 ±0.94	3.20 ±1.10	0.341 ±0.082

平均値±標準偏差　n=20

血漿中ロサルタンの濃度推移



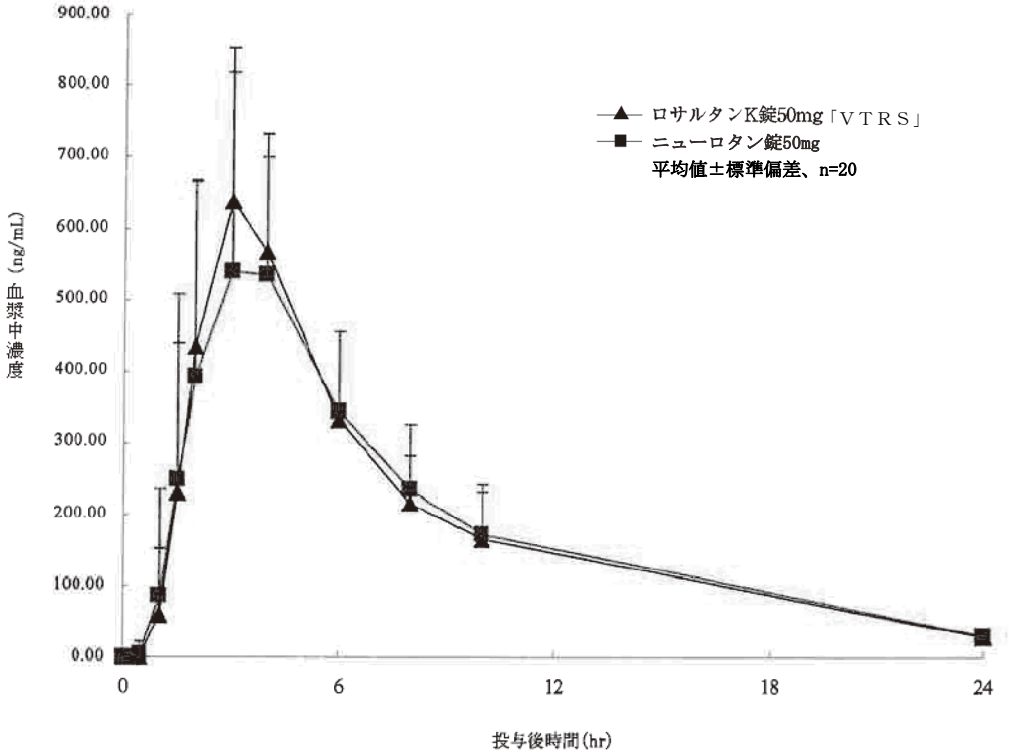
血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

カルボン酸体の薬物動態パラメータ

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ				
		AUC_{0-24} (ng･hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	AUC_{∞} (ng･hr/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	MRT (hr)	Kel (/hr)
ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」	１錠 (50mg)	4594 ±1317	661 ±196	4840 ±1401	3.15 ±0.59	5.59 ±0.54	6.93 ±0.79	0.125 ±0.011
ニューロタン錠 50mg	１錠 (50mg)	4563 ±1017	648 ±194	4805 ±1087	3.40 ±1.30	5.50 ±0.48	7.09 ±1.03	0.127 ±0.010

平均値±標準偏差　n=20

血漿中ロサルタンの濃度推移



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ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」[29)]

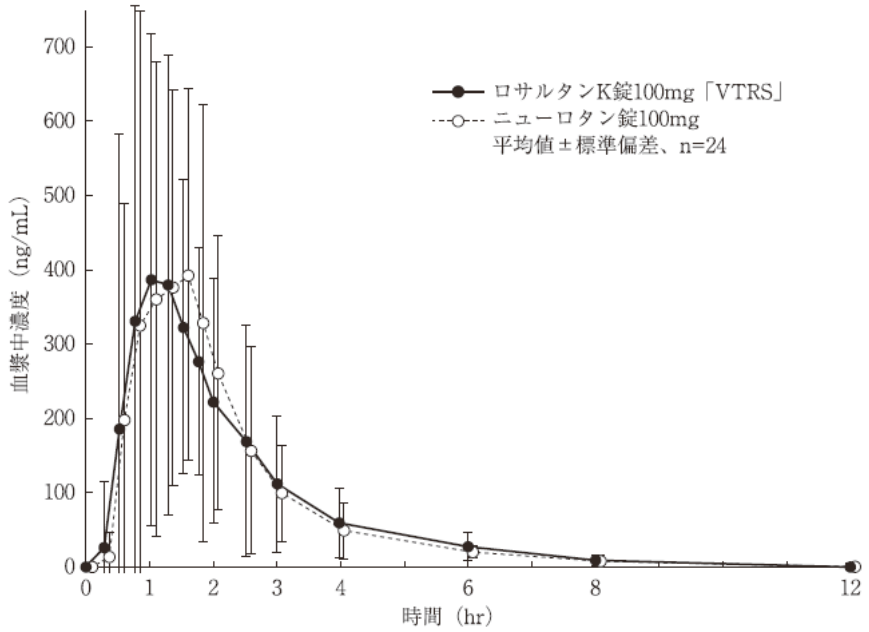
健康成人男子にロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」とニューロタン錠100mgのそれぞれ１錠（ロサルタンカリウムとして100mg）を、絶食時単回経口投与して血漿中ロサルタン濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された（クロスオーバー法）。

ロサルタンの薬物動態パラメータ

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ				
		AUC_{0-12} (ng･hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	AUC_{∞} (ng･hr/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	MRT (hr)	Kel (/hr)
ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」	１錠 (100mg)	915.4 ±310.7	686.9 ±386.7	923.9 ±312.7	1.45 ±0.65	1.96 ±0.52	2.4420 ± 0.7824	0.37874 ± 0.10626
ニューロタン錠100mg	１錠 (100mg)	900.5 ±296.6	715.8 ±368.8	909.3 ±300.0	1.35 ±0.61	2.00 ±0.54	2.3055 ± 0.6147	0.37391 ± 0.11384

平均値±標準偏差　n=24

血漿中ロサルタンの濃度推移



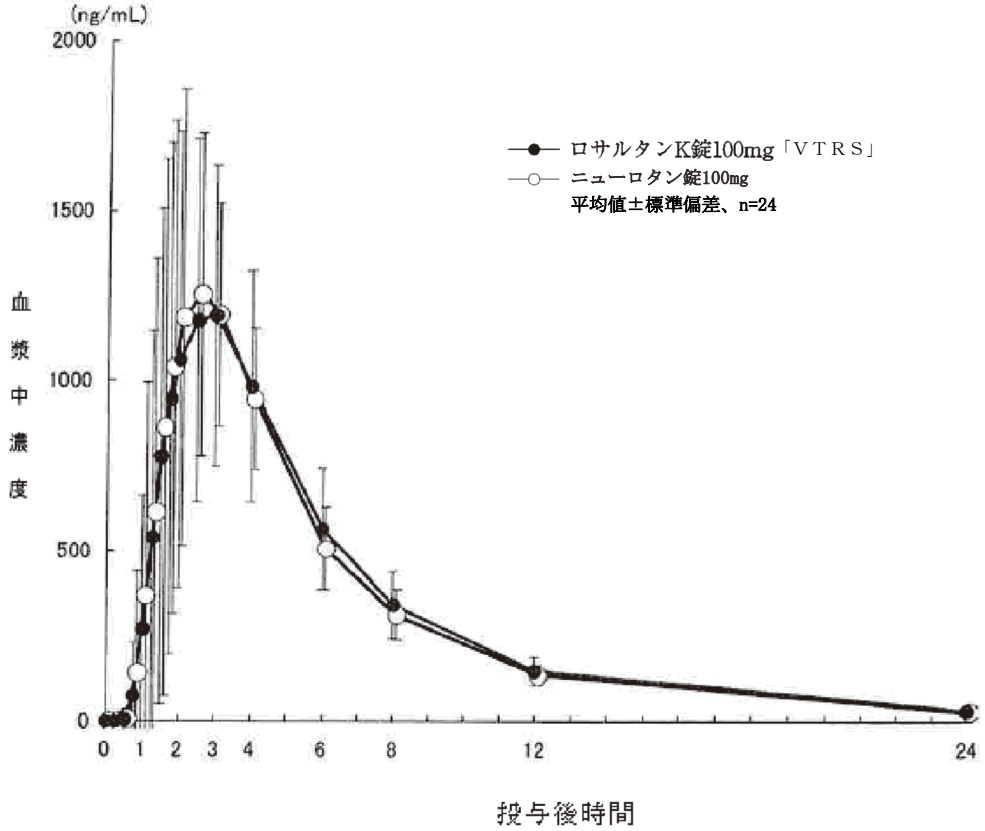
血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

カルボン酸体の薬物動態パラメータ

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ				
		AUC_{0-24} (ng･hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	AUC_{∞} (ng･hr/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	MRT (hr)	Kel (/hr)
ロサルタンK錠100mg「VTRS」	1錠 (100mg)	7508.1 ±1837.8	1449.7 ±488.4	7703.0 ±1883.5	2.74 ±1.26	4.62 ±0.44	6.0327 ± 0.8922	0.15131 ± 0.01384
ニューロタン錠100mg	1錠 (100mg)	7334.1 ±1626.0	1489.0 ±459.7	7513.0 ±1654.6	2.38 ±0.71	4.62 ±0.36	5.8466 ± 0.7616	0.15098 ± 0.01196

平均値±標準偏差　n=24

血漿中ロサルタンの濃度推移



血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

4）腎障害患者[32)]

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。

5）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、健常成人男子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[33)、34)]。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[35)](外国人データ)。（「Ⅷ-6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照）

6）高齢者[36)]

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及び血漿中からの消失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。（「Ⅷ-6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照）

(4) 中毒域

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響

「Ⅷ-7. 相互作用」の項参照

(6) 母集団（ポピュレーション）解析により判明した薬物体内動態変動要因

該当資料なし

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) コンパートメントモデル

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) バイオアベイラビリティ

該当資料なし

(4) 消失速度定数[28)、29)]

ロサルタン

ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」
0.341±0.057（/hr）
ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」
0.37874±0.10626（/hr）

カルボン酸体

ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」
0.125±0.011（/hr）
ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」
0.15131±0.01384（/hr）

(5) クリアランス

該当資料なし

(6) 分布容積

該当資料なし

(7) 血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収[30)]

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。

4. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

(参考)

「Ⅷ-6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(参考)

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。

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

5. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路[30)]

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。

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（CYP450 等）の分子種

主に薬物代謝酵素チトクローム P450 2C9（CYP2C9）により代謝される。

(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比率[1)]

本薬の主代謝物のカルボン酸体も本剤と同様の作用を示す。

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

①ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」

カルボン酸体の薬物動態パラメータ

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ				
		AUC_{0-24} (ng･hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	AUC_{∞} (ng･hr/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	MRT (hr)	Kel (/hr)
ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」	1錠 (50mg)	4594 ±1317	661 ±196	4840 ±1401	3.15 ±0.59	5.59 ±0.54	6.93 ±0.79	0.125 ±0.011
ニューロタン錠 50mg	1錠 (50mg)	4563 ±1017	648 ±194	4805 ±1087	3.40 ±1.30	5.50 ±0.48	7.09 ±1.03	0.127 ±0.010

平均値±標準偏差　n=20

②ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」

カルボン酸体の薬物動態パラメータ

	投与量	判定パラメータ		参考パラメータ				
		AUC_{0-24} (ng･hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	AUC_{∞} (ng･hr/mL)	T_{max} (hr)	$T_{1/2}$ (hr)	MRT (hr)	Kel (/hr)
ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」	1錠 (100mg)	7508.1 ±1837.8	1449.7 ±488.4	7703.0 ±1883.5	2.74 ±1.26	4.62 ±0.44	6.0327 ± 0.8922	0.15131 ± 0.01384
ニューロタン錠 100mg	1錠 (100mg)	7334.1 ±1626.0	1489.0 ±459.7	7513.0 ±1654.6	2.38 ±0.71	4.62 ±0.36	5.8466 ± 0.7616	0.15098 ± 0.01196

平均値±標準偏差　n=24

6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路

該当資料なし

(2) 排泄率[1)、30)]

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。

注）本剤の承認された 1 回用量は 25～100mg である。

(3) 排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率（外国人データ）[35)]

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。（「Ⅶ-1.（3）5）透析患者」及び「Ⅷ-6. 特定の背景を有する患者に関する注意」の項参照）

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[37)、38)]。

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[39)、40)]。

(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。	
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) 副次的薬理試験

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験

該当資料なし

(4) 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Ｋ錠 25mg「ＶＴＲＳ」　処方箋医薬品[注)]
ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」　処方箋医薬品[注)]
ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」　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：日局 ロサルタンカリウム　該当しない

2. 有効期間又は使用期限

有効期間：3 年

「Ⅳ-4. 製剤の各種条件下における安定性」の項を参照

3. 貯法・保存条件

室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱いについて

「Ⅷ-11. 適用上の注意」の項を参照

(2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ-11. 適用上の注意」の項を参照

患者向医薬品ガイド：有り、くすりのしおり：有り

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

〈ロサルタンＫ錠 25mg「ＶＴＲＳ」〉

100 錠［10 錠（PTP）×10］
500 錠［10 錠（PTP）×50］
500 錠［瓶、バラ］

〈ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」〉

100 錠［10 錠（PTP）×10］
500 錠［10 錠（PTP）×50］
500 錠［瓶、バラ］

〈ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」〉

100 錠［10 錠（PTP）×10］

7. 容器の材質

ロサルタンＫ錠25mg「ＶＴＲＳ」、ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」
PTPシート：ポリ塩化ビニル、アルミ
ボトル（バラ）：ボトル：ポリエチレン、キャップ：ポリプロピレン
ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」
PTPシート：ポリ塩化ビニリデン複合、アルミ

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ニューロタン錠25mg・50mg・100mg（オルガノン株式会社）
同 効 薬：A-Ⅱアンタゴニスト(カンデサルタンシレキセチル、バルサルタン、テルミサルタン、オルメサルタンメドキソミル、イルベサルタンなど)

9. 国際誕生年月日

該当しない

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

販売名	製造承認年月日	承認番号
ロサルタンＫ錠25mg「ＶＴＲＳ」	2012年 2月15日	22400AMX00450
ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」		22400AMX00451
ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」		22400AMX00452

11. 薬価基準収載年月日

ロサルタンＫ錠25mg・100mg「ＶＴＲＳ」：2022年6月1日
ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」：2022年6月17日

12. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

2012年8月7日：効能・効果、用法・用量の追加

効能・効果	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
用法・用量	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。

13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

14. 再審査期間

該当しない

15. 投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、厚生労働省告示第 107 号（平成 18 年 3 月 6 日付）による「投薬期間に上限が設けられている医薬品」には該当しない。

16. 各種コード

販売名	HOT（9桁）番号	厚生労働省薬価基準収載医薬品コード	レセプト電算コード
ロサルタンK錠25mg「ＶＴＲＳ」	121468002	統一名：2149039F1015 個　別：2149039F1376	統一名：622473900 個　別：622146802
ロサルタンK錠50mg「ＶＴＲＳ」	121469703	2149039F2372	622146903
ロサルタンK錠100mg「ＶＴＲＳ」	121470302	統一名：2149039F3018 個　別：2149039F3360	統一名：622325700 個　別：622147002

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発医薬品に該当する。

XI. 文献

1. 引用文献

1) 日本薬局方解説書編集委員会編：“（処）ロサルタンカリウム”第十八改正 日本薬局方解説書 廣川書店. 2021：C-6319
2) Wong PC,et al.：J Pharmacol Exp Ther. 1990；255：211-217
3) 中野　泰志ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（1）－明朝体、ゴシック体、ユニバーサルデザイン書体の可読性の比較－」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集. 2009：25
4) 新井　哲也ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（2）－低視力状態での可視性の比較－」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集. 2009：29
5) 山本　亮ほか：「エビデンスに基づいたユニバーサルデザインフォントの開発（3）－低コントラスト状態での可視性の比較－」：第35回感覚代行シンポジウム講演論文集. 2009：33
6) 社内資料：安定性試験（加速試験）（ロサルタンＫ錠25mg「ＶＴＲＳ」）
7) 社内資料：安定性試験（加速試験）（ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」）
8) 社内資料：安定性試験（加速試験）（ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」）
9) 社内資料：無包装状態の安定性（ロサルタンＫ錠「ＶＴＲＳ」）
10) 社内資料：溶出試験（ロサルタンＫ錠25mg「ＶＴＲＳ」）
11) 社内資料：溶出試験（ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」）
12) 社内資料：溶出試験（ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」）
13) 吉永馨ほか：医学のあゆみ. 1995；172：785-823
14) Lacourcière Y,et al.：J Hypertens. 1994；12：1387-1393
15) Brenner BM,et al.：N Engl J Med. 2001；345：861-869
16) RENAAL試験（ニューロタン錠：2006.4.20承認、申請資料概要ト.1）
17) Chiu AT,et al.：J Pharmacol Exp Ther. 1990；252：711-718
18) Wong PC,et al.：J Pharmacol Exp Ther. 1990；252：719-725
19) Mizuno K,et al.：Eur J Pharmacol. 1992；215：305-308
20) 岡田恵ほか：基礎と臨床. 1994；28：4063-4073
21) Wong PC,et al.：Hypertension. 1990；15：459-468
22) Wong PC,et al.：J Pharmacol Exp Ther. 1990；252：726-732
23) Okada M,et al.：Hypertens Res. 1993；16：49-55
24) Anderson S,et al.：Am J Physiol. 1993；265：F477-F486
25) Remuzzi A,et al.：J Am Soc Nephrol. 1993；4：40-49
26) Sasaki M,et al.：Life Sci. 2004；75：869-880
27) Pollock DM,et al.：J Pharmacol Exp Ther. 1993；267：657-663
28) 社内資料：生物学的同等性試験（ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」）
29) 社内資料：生物学的同等性試験（ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」）
30) 中島光好ほか：臨床薬理. 1995；26：671-684
31) 中島光好ほか：臨床薬理. 1995；26：685-696
32) 猿田享男ほか：臨床医薬. 1994；10：157-171
33) 多川斉ほか：臨牀透析. 1995；11：247-264
34) 高血圧症を伴う透析患者（ニューロタン錠：2006.4.20承認、審査報告書）
35) 腎機能障害患者の薬物動態（ニューロタン錠：2006.4.20承認、申請資料概要へ.（3）3））
36) 高齢患者の薬物動態（ニューロタン錠：2006.4.20承認、申請資料概要へ.（1）1））
37) 阿部真也ほか：周産期医学. 2017；47：1353-1355
38) 齊藤大祐ほか：鹿児島産科婦人科学会雑誌. 2021；29：49-54
39) Spence SG,et al.：Teratology. 1995；51：383-397
40) Spence SG,et al.：Teratology. 1995；51：367-382

2. その他の参考文献

参考文献 1）藤島 一郎 監修：内服薬経管投与ハンドブック第 2 版，東京，じほう．2006：37-43

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

妊婦に関する海外情報（オーストラリアの分類）

本邦における禁忌及び特定の背景を有する患者に関する注意の項の記載は以下のとおりであり、オーストラリアの分類とは異なる。

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性［9.5 参照］

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

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］

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[39)、40)]。

	分類
オーストラリアの分類 （The Australian categorisation system for prescribing medicines in pregnancy）	D（2023 年 5 月）

＜参考：分類の概要＞

オーストラリアの分類:(The Australian categorisation system for prescribing medicines in pregnancy)

D：Drugs which have caused, are suspected to have caused or may be expected to cause, an increased incidence of human fetal malformations or irreversible damage. These drugs may also have adverse pharmacological effects. Accompanying texts should be consulted for further details.

XIII. 備考

その他の関連資料

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）

ロサルタンK錠「ＶＴＲＳ」の粉砕後の安定性並びに簡易懸濁法試験（崩壊懸濁試験及び通過性試験）の報告を以下に示す。
なお、ロサルタンK錠「ＶＴＲＳ」を粉砕、簡易懸濁しての投与は、承認された剤形での投与ではなく、適正使用の観点から、弊社としては推奨していない。
錠剤を粉砕あるいは簡易懸濁しての本剤の投与については、各医療担当者の裁量と判断により行うこと。

（1）粉砕

【試験方法】
試料の調整方法：電動コーヒーミルで軽く粉砕した後、乳鉢を用いて均一に粉砕する。

保存条件：①温度　：40℃±1℃、75%R.H.±5%R.H.　褐色ガラス瓶（気密）
②湿度　：25℃±2℃、75%R.H.±5%R.H.　透明プラスチックシャーレ（開放）
③光　　：2500Lux、25℃±2℃、75%R.H.±5%R.H.
透明プラスチックシャーレ（開放）
測定時期：①、②開始時、7日、14日、30日
③開始時、30万Lux・hr時、60万Lux・hr時、120万Lux・hr時
試験項目：外観、含量
試験回数：外観3回、含量3回

ロサルタンＫ錠 25mg「ＶＴＲＳ」

① 温度に対する安定性試験［40℃±1℃、75%R.H.±5%R.H.］

測定項目	測定時期			
	開始時	7 日	14 日	30 日
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量（%） ［対開始時（%）］	99.2 ［100.0］	96.7 ［97.5］	96.2 ［97.0］	96.6 ［97.4］

② 湿度に対する安定性試験［25℃±2℃、75%R.H.±5%R.H.］

測定項目	測定時期			
	開始時	7 日	14 日	30 日
外観	白色の粉末	白色で、 上部表面が固結化	白色で、 上部表面が固結化	白色で、 上部表面が固結化
含量（%） ［対開始時（%）］	99.2 ［100.0］	90.8 ［91.5］	90.5 ［91.2］	91.8 ［92.5］

③ 光に対する安定性試験［2500Lux、25℃±2℃、75%R.H.±5%R.H.］

測定項目	測定時期			
	開始時	30 万 Lux・hr	60 万 Lux・hr	120 万 Lux・hr
外観	白色の粉末	表面に微黄色の 粉末がわずかに 認められた	表面に微黄色の 粉末がわずかに 認められた	表面に微黄色の 粉末がわずかに 認められた
含量（%） ［対開始時（%）］	99.2 ［100.0］	95.4 ［96.2］	93.7 ［94.5］	93.5 ［94.3］

ロサルタンＫ錠 50mg「ＶＴＲＳ」

① 温度に対する安定性試験［40℃±1℃、75%R.H.±5%R.H.］

測定項目	測定時期			
	開始時	7 日	14 日	30 日
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量（%） ［対開始時（%）］	99.3 ［100.0］	99.3 ［100.0］	98.7 ［99.4］	98.1 ［98.8］

② 湿度に対する安定性試験［25℃±2℃、75%R.H.±5%R.H.］

測定項目	測定時期			
	開始時	7 日	14 日	30 日
外観	白色の粉末	白色で、 上部表面が固結化	白色で、 上部表面が固結化	白色で、 上部表面が固結化
含量（%） ［対開始時（%）］	99.3 ［100.0］	94.9 ［95.6］	92.9 ［93.6］	91.7 ［92.3］

③ 光に対する安定性試験［2500Lux、25℃±2℃、75%R.H.±5%R.H.］

測定項目	測定時期			
	開始時	30 万 Lux・hr	60 万 Lux・hr	120 万 Lux・hr
外観	白色の粉末	表面に微黄色の粉末がわずかに認められた	表面に微黄色の粉末がわずかに認められた	表面に微黄色の粉末がわずかに認められた
含量（%） ［対開始時（%）］	99.3 ［100.0］	95.4 ［96.1］	95.9 ［96.6］	95.9 ［96.6］

ロサルタンＫ錠 100mg「ＶＴＲＳ」

① 温度に対する安定性試験［40℃±1℃、75%R.H.±5%R.H.］

測定項目	測定時期			
	開始時	7 日	14 日	30 日
外観	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末	白色の粉末
含量（%） ［対開始時（%）］	99.6 ［100.0］	98.0 ［98.4］	96.7 ［97.1］	96.8 ［97.2］

② 湿度に対する安定性試験［25℃±2℃、75%R.H.±5%R.H.］

測定項目	測定時期			
	開始時	7 日	14 日	30 日
外観	白色の粉末	白色で、 上部表面が固結化	白色で、 上部表面が固結化	白色で、 上部表面が固結化
含量（%） ［対開始時（%）］	99.6 ［100.0］	95.2 ［95.6］	93.1 ［93.5］	91.2 ［91.6］

③ 光に対する安定性試験［2500Lux、25℃±2℃、75%R.H.±5%R.H.］

測定項目	測定時期			
	開始時	30 万 Lux・hr	60 万 Lux・hr	120 万 Lux・hr
外観	白色の粉末	白色の粉末	表面に微黄色の粉末がわずかに認められた	表面に微黄色の粉末がわずかに認められた
含量（%） ［対開始時（%）］	99.6 ［100.0］	96.1 ［96.5］	95.8 ［96.2］	96.1 ［96.5］

(2) 崩壊・懸濁及び経管投与チューブの通過性

【崩壊懸濁試験】

試験方法：「内服薬経管投与ハンドブック第2版」[参考文献1)]に準じて実施。

1錠又は1カプセルをカテーテル用ディスペンサーに入れ、これに55℃の温湯20mLを吸い取り、ディスペンサーの先端に蓋をし、横向きに5分間放置する。5分後、ディスペンサーを手で90度の角度で15回往復横転し、「崩壊・懸濁」を観察する。

5分後に崩壊・懸濁しないものは更に5分間放置し、同様の操作を行う。これでも「崩壊・懸濁」しないものは、この方法による試料調製を中止する。

中止した薬剤は、粉砕可能な錠剤は、シート（PTP、SP）の上から乳棒で数回叩いてコーティング破壊をするか、開封可能なカプセル剤は開封してカテーテル用ディスペンサーに入れ、以下、上記と同様に操作を行う。

【通過性試験】

試験方法：「内服薬経管投与ハンドブック第2版」[参考文献1)]に準じて実施。

ディスペンサー内で、崩壊懸濁試験で得られた試料溶液を経管栄養カテーテルの注入先端より約2～3mL／秒の速度で注入する。カテーテルはベッド上の患者を想定して、体内挿入端から2/3を水平にする。他端（ディスペンサー注入先）は30cmの高さにセットする。経管栄養カテーテルのサイズは「8Fr」を用いる。

薬剤注入後、適量の水（約10mL）で洗浄するとき、薬剤の残存を確認する。

【試験結果】

剤型	崩壊懸濁試験				通過性試験
	温湯（約55℃）		破壊→温湯		通過サイズ
	5分	10分	5分	10分	
ロサルタンＫ錠25mg「ＶＴＲＳ」	×	×	○		8Fr.
ロサルタンＫ錠50mg「ＶＴＲＳ」	×	×	○		8Fr.
ロサルタンＫ錠100mg「ＶＴＲＳ」	×	×	○		8Fr.

×：崩壊・懸濁しなかった　○：錠剤を粉砕することにより良好な懸濁状態を示した

文献請求先･製品情報お問い合わせ先

ヴィアトリス製薬株式会社　メディカルインフォメーション部
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5丁目11番2号
フリーダイヤル　0120-419-043

製造販売元

ヴィアトリス・ヘルスケア合同会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

販売元

ヴィアトリス製薬株式会社
〒105-0001　東京都港区虎ノ門5丁目11番2号

VIATRIS

MIF13C011N