

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2013に準拠して作成

高親和性AT₁レセプターブロッカー

オルメサルタンOD錠5mg「サワイ」 オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」 オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」 オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」

OLMESARTAN OD

オルメサルタン メドキシミル口腔内崩壊錠

剤形	OD錠5mg：素錠(口腔内崩壊錠) OD錠10mg/OD錠20mg/OD錠40mg：割線入り素錠(口腔内崩壊錠)
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	OD錠5mg：1錠中日局オルメサルタン メドキシミル5mg含有 OD錠10mg：1錠中日局オルメサルタン メドキシミル10mg含有 OD錠20mg：1錠中日局オルメサルタン メドキシミル20mg含有 OD錠40mg：1錠中日局オルメサルタン メドキシミル40mg含有
一般名	和名：オルメサルタン メドキシミル 洋名：Olmesartan Medoxomil
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：2017年8月15日 薬価基準収載年月日：2017年12月8日 発売年月日：2017年12月8日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-6394-7355 医療関係者向け総合情報サイト： https://med.sawai.co.jp/

本IFは2020年1月改訂の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、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ<https://www.pmda.go.jp/>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、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IF記載要領2008が策定された。

IF記載要領2008では、IFを紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF等の電磁的データとして提供すること(e-IF)が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版のe-IFが提供されることとなった。

最新版のe-IFは、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ(<http://www.info.pmda.go.jp/>)から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IFを掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせてe-IFの情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008年より年4回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF記載要領の一部改訂を行いIF記載要領2013として公表する運びとなった。

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版、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2013」(以下、「IF記載要領2013」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2013」は、平成25年10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2013」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2013」においては、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ある。

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等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もあり、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、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。

(2013年4月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	30
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	30
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)	30
II. 名称に関する項目	2	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	30
1. 販売名	2	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	30
2. 一般名	2	5. 慎重投与内容とその理由	30
3. 構造式又は示性式	2	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	30
4. 分子式及び分子量	3	7. 相互作用	31
5. 化学名(命名法)	3	8. 副作用	32
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	9. 高齢者への投与	34
7. CAS登録番号	3	10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	34
III. 有効成分に関する項目	4	11. 小児等への投与	34
1. 物理化学的性質	4	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	34
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	13. 過量投与	34
3. 有効成分の確認試験法	4	14. 適用上の注意	35
4. 有効成分の定量法	4	15. その他の注意	35
IV. 製剤に関する項目	5	16. その他	35
1. 剤形	5	IX. 非臨床試験に関する項目	36
2. 製剤の組成	6	1. 薬理試験	36
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	2. 毒性試験	36
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	X. 管理的事項に関する項目	37
5. 調製法及び溶解後の安定性	11	1. 規制区分	37
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	11	2. 有効期間又は使用期限	37
7. 溶出性	12	3. 貯法・保存条件	37
8. 生物学的試験法	16	4. 薬剤取扱い上の注意点	37
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	16	5. 承認条件等	37
10. 製剤中の有効成分の定量法	16	6. 包装	37
11. 力価	16	7. 容器の材質	38
12. 混入する可能性のある夾雑物	16	8. 同一成分・同効薬	38
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	16	9. 国際誕生年月日	38
14. その他	16	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	38
V. 治療に関する項目	17	11. 薬価基準収載年月日	38
1. 効能又は効果	17	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	39
2. 用法及び用量	17	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	39
3. 臨床成績	17	14. 再審査期間	39
VI. 薬効薬理に関する項目	19	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	39
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	19	16. 各種コード	39
2. 薬理作用	19	17. 保険給付上の注意	39
VII. 薬物動態に関する項目	20	XI. 文献	40
1. 血中濃度の推移・測定法	20	1. 引用文献	40
2. 薬物速度論的パラメータ	27	2. その他の参考文献	40
3. 吸収	27	XII. 参考資料	41
4. 分布	28	1. 主な外国での発売状況	41
5. 代謝	28	2. 海外における臨床支援情報	41
6. 排泄	29	XIII. 備考	41
7. トランスポーターに関する情報	29	その他の関連資料	41
8. 透析等による除去率	29		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

オルメサルタンOD錠 5mg/OD錠10mg/OD錠20mg/OD錠40mg「サワイ」は、日局オルメサルタンメドキシミルを含有する高親和性AT₁レセプターブロッカーである。

オルメサルタンメドキシミルは、アンジオテンシンII受容体阻害薬の一つで、血圧降下剤である。¹⁾

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成26年11月21日 薬食発1121第2号
承認	2017年8月
上市	2017年12月

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) 水なし(唾液のみ)でも服用可能な口腔内崩壊錠である。
- 2) 錠剤の両面に製品名及び規格を印字している。
- 3) PTPシートに「高血圧症の薬」及び「口腔内崩壊錠」の文字を記載している。
- 4) 個装箱の一部を切り離し、調剤棚のラベルとして使用可能である。
- 5) アンジオテンシンII受容体のサブタイプAT₁受容体の拮抗薬で、内因性昇圧物質のアンジオテンシンIIに対して受容体レベルで競合的に拮抗することにより降圧作用を現す。¹⁾
- 6) 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、重度の下痢が報告されている(頻度不明)。

II. 名称に関する項目

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」

オルメサルタンOD錠 10mg「サワイ」

オルメサルタンOD錠 20mg「サワイ」

オルメサルタンOD錠 40mg「サワイ」

2) 洋名

OLMESARTAN OD

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

オルメサルタン メドキシミル(JAN)

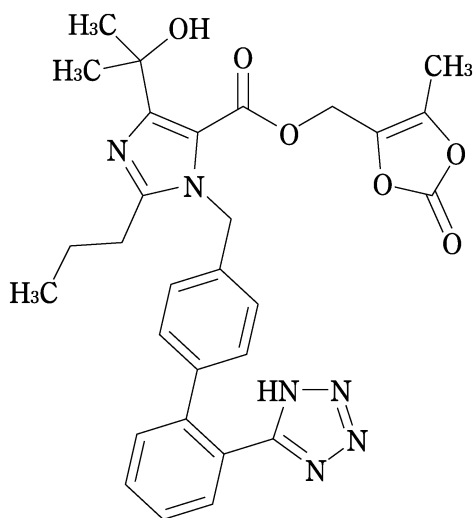
2) 洋名(命名法)

Olmesartan Medoxomil(JAN、INN)

3) ステム

-sartan : angiotensin II receptor antagonist (血圧降下剤)

3. 構造式又は示性式



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)

(5-Methyl-2-oxo-1,3-dioxol-4-yl)methyl 4-(1-hydroxy-1-methylethyl)-2-propyl-1-
 {[2'-(1*H*-tetrazol-5-yl)biphenyl-4-yl]methyl}-1*H*-imidazole-5-carboxylate(IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

特になし

7. CAS登録番号

144689-63-4













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
水分：0.5%以下(0.5g、電量滴定法)
 - 4) 融点(分解点)、沸点、凝固点
融点：177.6℃²⁾
 - 5) 酸塩基解離定数
pKa：4.3(Britton Robinson緩衝液(20℃)、紫外可視吸光度測定法)²⁾
 - 6) 分配係数
1.0(1-オクタノール/リン酸buffer、pH7)³⁾
 - 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……………
日局「オルメサルタン メドキシミル」の確認試験に準ずる。
 - 1) 紫外可視吸光度測定法
 - 2) 赤外吸収スペクトル測定法
4. 有効成分の定量法……………
日局「オルメサルタン メドキシミル」の定量法に準ずる。(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、外観及び性状

品名	剤形	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
オルメサルタン OD錠5mg「サワイ」	素錠 (口腔内崩壊錠)	 7.0	 約115	 2.4	淡黄白色
オルメサルタン OD錠10mg「サワイ」	割線入り素錠 (口腔内崩壊錠)	 7.0	 約115	 2.4	白色
オルメサルタン OD錠20mg「サワイ」	割線入り素錠 (口腔内崩壊錠)	 8.0	 約152	 2.5	白色
オルメサルタン OD錠40mg「サワイ」	割線入り素錠 (口腔内崩壊錠)	 9.5	 約310	 3.6	白色

なお、本剤はにおいはないか、又はわずかに特異なにおいがある。

2) 製剤の物性

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

3) 識別コード

- オルメサルタンOD錠5mg「サワイ」：SW オルメサルタン OD 5
- オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」：SW オルメサルタン OD 10
- オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」：SW オルメサルタン OD 20
- オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」：SW オルメサルタン OD 40

4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量

- **オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」**
1錠中に日局オルメサルタン メドキシミル 5mgを含有する。
- **オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」**
1錠中に日局オルメサルタン メドキシミル10mgを含有する。
- **オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」**
1錠中に日局オルメサルタン メドキシミル20mgを含有する。
- **オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」**
1錠中に日局オルメサルタン メドキシミル40mgを含有する。

2) 添加物

- **オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」**
添加物として、カルメロース、クロスポビドン、結晶セルロース、三二酸化鉄、スクラロース、ステアリン酸Ca、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトール、メタケイ酸アルミン酸Mgを含有する。
- **オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」**
添加物として、カルメロース、クロスポビドン、結晶セルロース、スクラロース、ステアリン酸Ca、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトール、メタケイ酸アルミン酸Mgを含有する。
- **オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」**
添加物として、カルメロース、クロスポビドン、結晶セルロース、スクラロース、ステアリン酸Ca、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトール、メタケイ酸アルミン酸Mgを含有する。
- **オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」**
添加物として、カルメロース、クロスポビドン、結晶セルロース、スクラロース、ステアリン酸Ca、ヒドロキシプロピルセルロース、D-マンニトール、メタケイ酸アルミン酸Mgを含有する。

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

●オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)⁴⁾

オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」をPTP包装(環状ポリオレフィン複合フィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したのものについて、安定性試験を行った。その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	淡黄白色の口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	98.0	96.8

※：表示量に対する含有率(%)

2) PTP包装品の安定性(長期保存試験)⁴⁾

オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」をPTP包装(環状ポリオレフィン複合フィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したのものについて、安定性試験を行った。その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	25°C60%RH・遮光 36ヵ月
性状	淡黄白色の口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	98.0	97.8

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性⁵⁾

オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度の条件下で硬度低下が観察された。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
性状	淡黄白色の 口腔内崩壊 錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	4.4	4.6	2.7	3.6	3.3
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	98.9	99.6	98.8	99.3

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

IV. 製剤に関する項目

●オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)⁶⁾

オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」をPTP包装(環状ポリオレフィン複合フィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したのものについて、安定性試験を行った。その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	97.9	97.2

※：表示量に対する含有率(%)

2) PTP包装品の安定性(長期保存試験)⁶⁾

オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」をPTP包装(環状ポリオレフィン複合フィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したのものについて、安定性試験を行った。その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	25°C60%RH・遮光 36ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	97.9	97.7

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性⁷⁾

オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	5.1	5.0	3.6	4.4	4.1
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.2	99.5	98.3	99.6

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」

1) PTP包装品の安定性(加速試験)⁸⁾

オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」をPTP包装(環状ポリオレフィン複合フィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したのものについて、安定性試験を行った。その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.6	97.8

※：表示量に対する含有率(%)

2) バラ包装品の安定性(加速試験)⁸⁾

オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶、乾燥剤入り)したのものについて、安定性試験を行った。その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.6	98.6

※：表示量に対する含有率(%)

3) PTP包装品の安定性(長期保存試験)⁸⁾

オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」をPTP包装(環状ポリオレフィン複合フィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したのものについて、安定性試験を行った。その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	25°C60%RH・遮光 36ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.6	98.6

※：表示量に対する含有率(%)

IV. 製剤に関する項目

4)バラ包装品の安定性(長期保存試験)⁸⁾

オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」をバラ包装(ポリエチレン瓶、乾燥剤入り)したのについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	25°C60%RH・遮光 24ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.6	99.0

※：表示量に対する含有率(%)

5)無包装下の安定性⁹⁾

オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	5.3	5.0	3.8	4.5	4.6
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.6	100.2	98.4	99.9

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

●オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」

1)PTP包装品の安定性(加速試験)¹⁰⁾

オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」をPTP包装(環状ポリオレフィン複合フィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したのについて、安定性試験を行った。

その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.9	99.3

※：表示量に対する含有率(%)

2) PTP包装品の安定性(長期保存試験)¹⁰⁾

オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」をPTP包装(環状ポリオレフィン複合フィルム、アルミ箔)した後、ピロー包装(アルミ袋、乾燥剤入り)したのものについて、安定性試験を行った。その結果、規格に適合した。

保存条件	イニシャル	25°C60%RH・遮光 36ヵ月
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.9	99.6

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性¹¹⁾

オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験を行った。

その結果、以下の結果が得られた。

保存条件	イニシャル	温度 (40°C 3ヵ月)	湿度 (25°C75%RH 3ヵ月)	光 (総照射量 120万lx・hr)	室温 (25°C60%RH 3ヵ月)
性状	白色の割線入り口腔内崩壊錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	6.7	7.2	5.0	5.7	5.9
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	100.5	100.2	99.1	100.4

日本病院薬剤師会編「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性情報」の基準に準じて試験を行っている。

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

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(物理化学的变化).....

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

7. 溶出性

＜溶出挙動における同等性及び類似性＞

●オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」¹²⁾

通知等	「剤形が異なる製剤の追加のため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	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、3.0、6.8、水)、100rpm(pH3.0)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

＜50rpm：pH1.2＞

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

＜50rpm：pH3.0＞

標準製剤の平均溶出率が40% (15分) 及び85% (240分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

＜50rpm：pH6.8＞

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

＜50rpm：水＞

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(10分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。

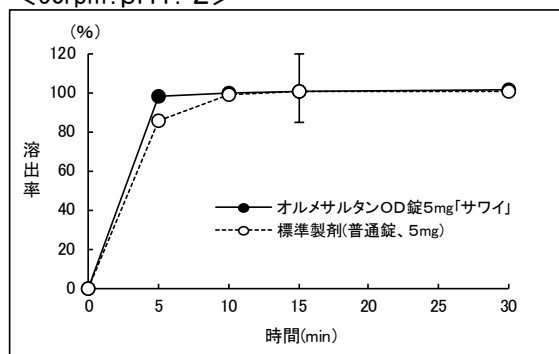
＜100rpm：pH3.0＞

標準製剤の平均溶出率が40% (10分) 及び85% (240分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

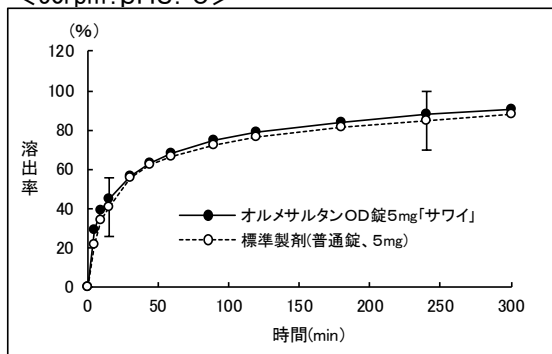
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)

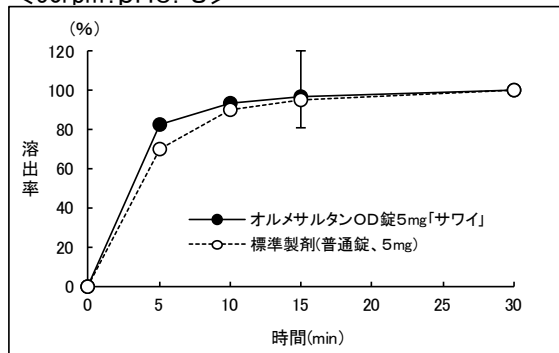
＜50rpm：pH1.2＞



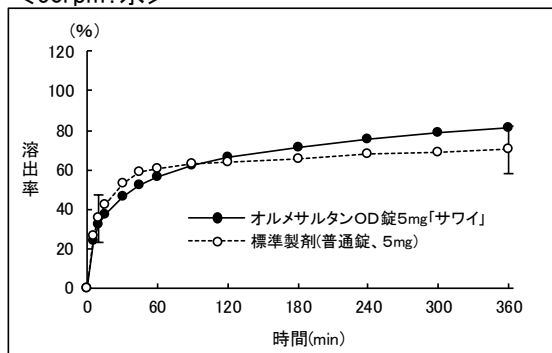
＜50rpm：pH3.0＞



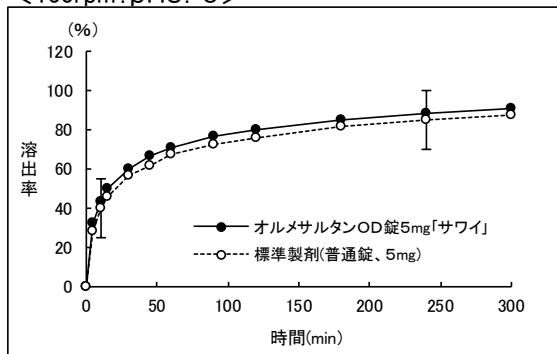
＜50rpm：pH6.8＞



＜50rpm：水＞



<100rpm: pH3. 0>



(I : 判定基準の適合範囲)

●オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」¹³⁾

通知等	「剤形が異なる製剤の追加のため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	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、3.0、6.8、水)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1. 2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH3. 0>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(15分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。

<50rpm : pH6. 8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

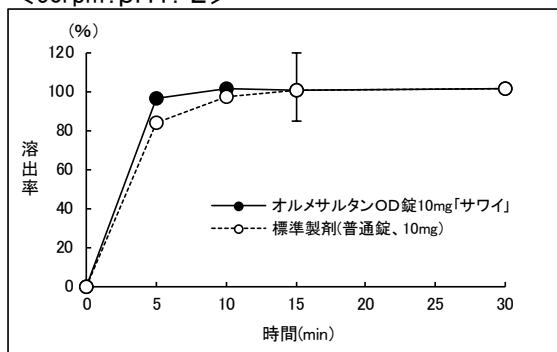
<50rpm : 水>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(10分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。

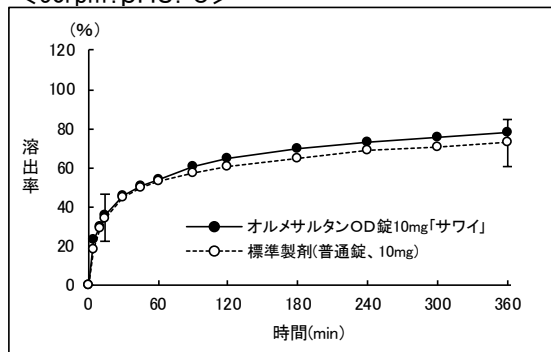
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)

<50rpm: pH1. 2>

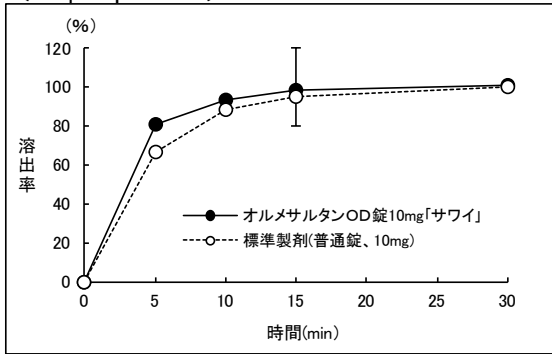


<50rpm: pH3. 0>

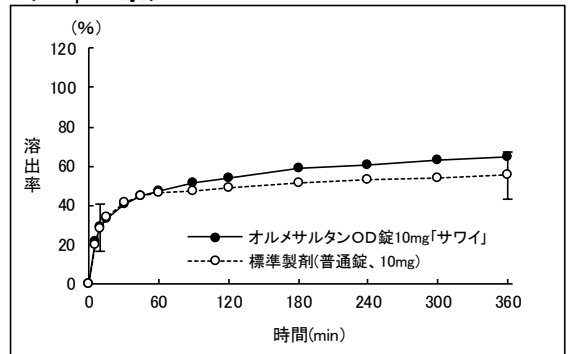


IV. 製剤に関する項目

<50rpm: pH6. 8>



<50rpm: 水>



(I : 判定基準の適合範囲)

●オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」¹⁴⁾

通知等	「剤形が異なる製剤の追加のため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	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1. 2、3. 0、6. 8、水)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm : pH1. 2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm : pH3. 0>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(15分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。

<50rpm : pH6. 8>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

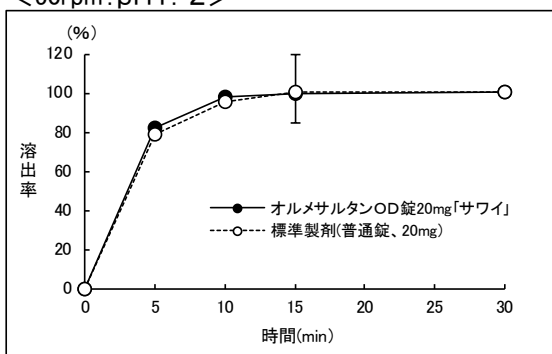
<50rpm : 水>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(10分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

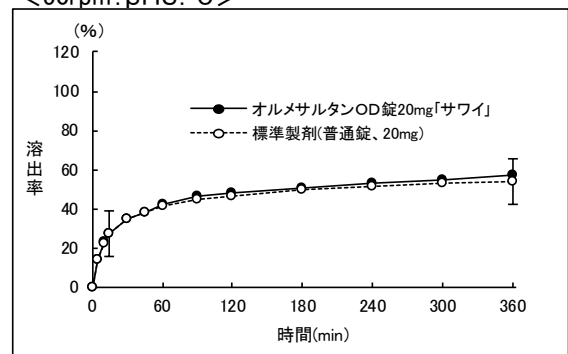
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)

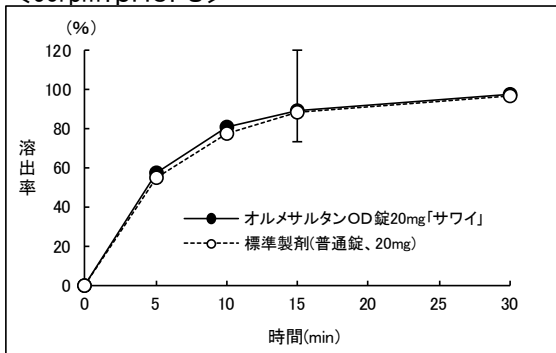
<50rpm: pH1. 2>



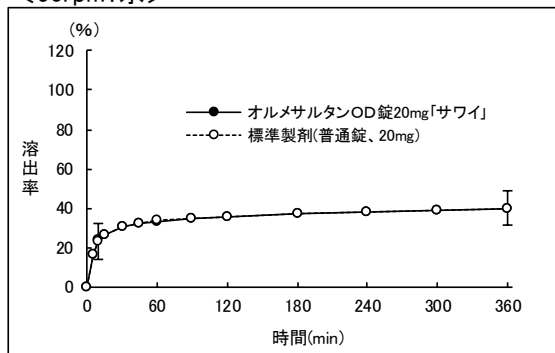
<50rpm: pH3. 0>



<50rpm: pH6. 8>



<50rpm: 水>



(I] : 判定基準の適合範囲)

●オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」¹⁵⁾

通知等	「剤形が異なる製剤の追加のため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	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1. 2、3. 0、6. 8、水)
試験回数	12ベッセル	

【結果及び考察】

<50rpm: pH1. 2>

両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。

<50rpm: pH3. 0>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(10分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

<50rpm: pH6. 8>

標準製剤の平均溶出率が60%(10分)及び85%(15分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。

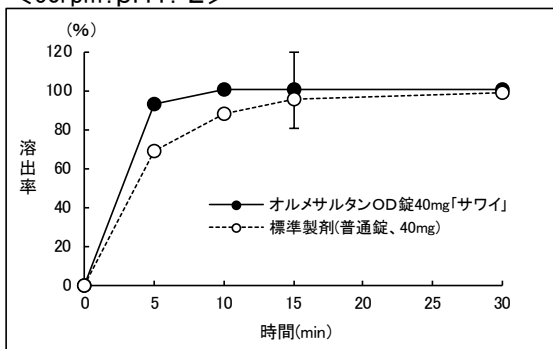
<50rpm: 水>

標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。

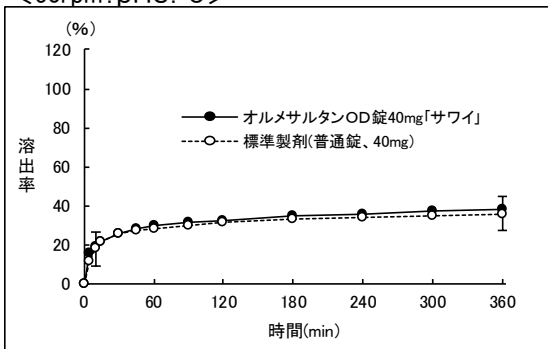
以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

(溶出曲線)

<50rpm: pH1. 2>

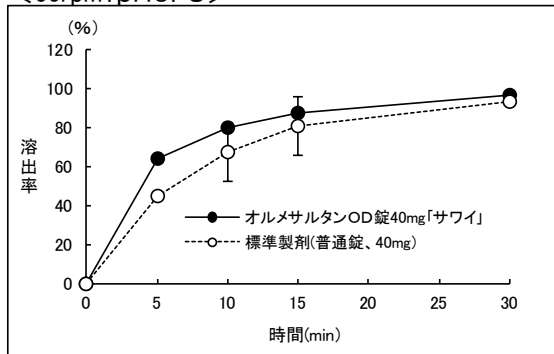


<50rpm: pH3. 0>

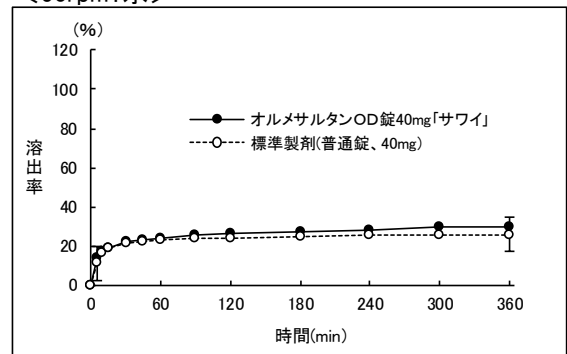


IV. 製剤に関する項目

<50rpm:pH6.8>



<50rpm:水>



(I : 判定基準の適合範囲)

- 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
紫外可視吸光度測定法
- 10. 製剤中の有効成分の定量法
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. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報
該当資料なし
- 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……………
高血圧症

2. 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。

<用法及び用量に関連する使用上の注意>

本剤は口腔内で速やかに崩壊するが、口腔粘膜からの吸収により効果発現を期待する薬剤ではないため、崩壊後は唾液又は水で飲み込むこと。

3. 臨床成績……………

1) 臨床データパッケージ

該当しない

2) 臨床効果

該当資料なし

3) 臨床薬理試験

該当資料なし

4) 探索的試験

該当資料なし

5) 検証的試験

(1) 無作為化並行用量反応試験

該当資料なし

(2) 比較試験

該当資料なし

(3) 安全性試験

該当資料なし

(4) 患者・病態別試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

6) 治療的使用

(1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)

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試験の概要

該当しない

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：ロサルタンカリウム、バルサルタン、カンデサルタン シレキセチル、テルミサルタン、イルベサルタン、アジルサルタン¹⁶⁾

2. 薬理作用

オルメサルタン メドキシミルの薬理作用について以下のとおり報告されている。

1) 作用部位・作用機序

アンジオテンシンⅡ受容体のサブタイプAT₁受容体の拮抗薬である。内因性昇圧物質のアンジオテンシンⅡに対して受容体レベルで競合的に拮抗することにより降圧作用を現す。なお、オルメサルタン メドキシミルはプロドラッグであり、経口投与後、主に小腸上皮においてエステラーゼにより加水分解を受け、活性代謝物であるオルメサルタンに変換される。¹⁾

2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

VII. 薬物動態に関する項目

オルメサルタン メドキシミル製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

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

VII. -1. -3) 参照

3) 臨床試験で確認された血中濃度

<生物学的同等性試験>

●オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」^{17, 21)}

通知等	「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 「剤形が異なる製剤の追加のため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
採血時点	0、0.5、1、1.5、2、2.5、3、4、6、8、12、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

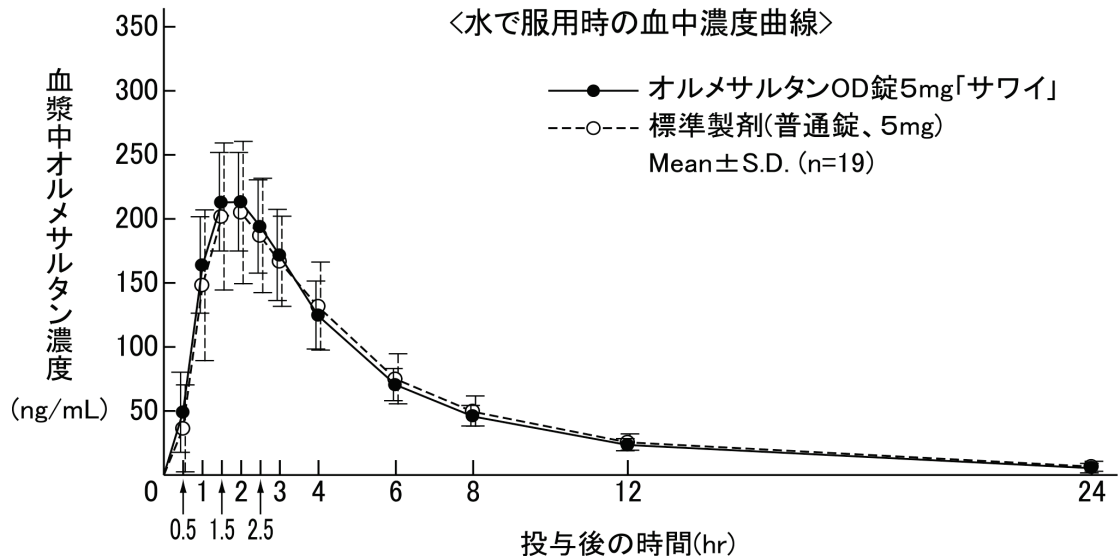
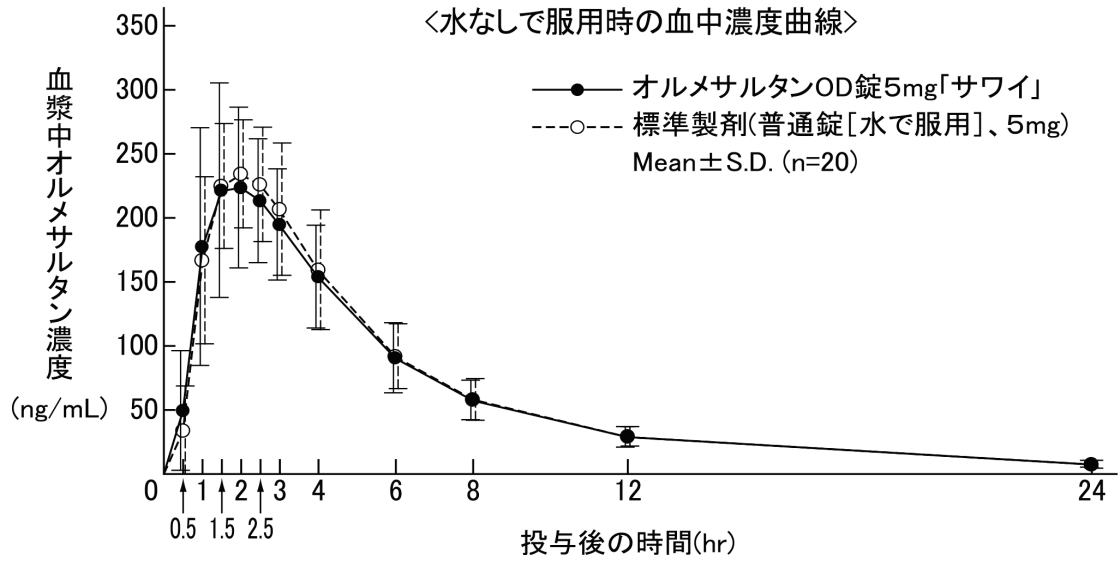
オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」(水なし又は水で服用)と標準製剤[普通錠](水で服用)を健康成人男子にそれぞれ1錠(オルメサルタン メドキシミルとして5mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中オルメサルタン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _t (ng·hr/mL)
※ 水 なし	オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」	258±48	2.0±0.8	5.5±0.9	1439±249
	標準製剤 (普通錠、5mg)	253±42	2.0±0.6	5.4±0.8	1462±309
水 あり	オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」	224±35	1.8±0.4	5.3±1.2	1224±187
	標準製剤 (普通錠、5mg)	222±41	2.1±0.8	5.6±1.4	1245±216

※：標準製剤は水で服用

(Mean±S.D.)



		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
水なし	AUC _t	log(0.99)	log(0.94)~log(1.05)
	Cmax	log(1.02)	log(0.96)~log(1.08)
水あり	AUC _t	log(0.99)	log(0.93)~log(1.05)
	Cmax	log(1.01)	log(0.95)~log(1.07)

VII. 薬物動態に関する項目

●オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」^{18, 21)}

通知等	「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 「剤形が異なる製剤の追加のため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
採血時点	0、0.5、1、1.5、2、2.5、3、4、6、8、12、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

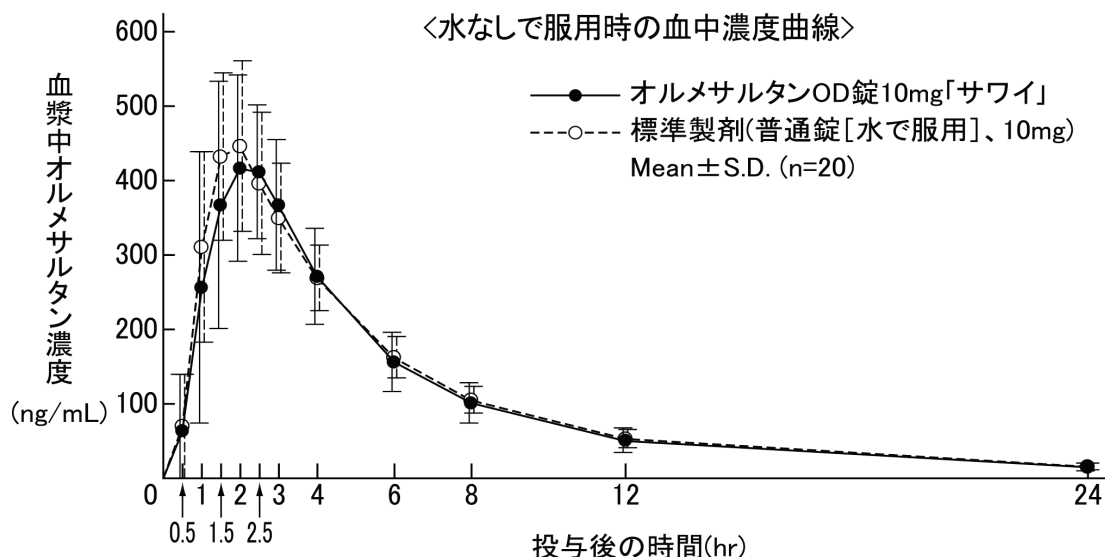
オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」(水なし又は水で服用)と標準製剤[普通錠](水で服用)を健康成人男子にそれぞれ1錠(オルメサルタン メドキシミルとして10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中オルメサルタン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

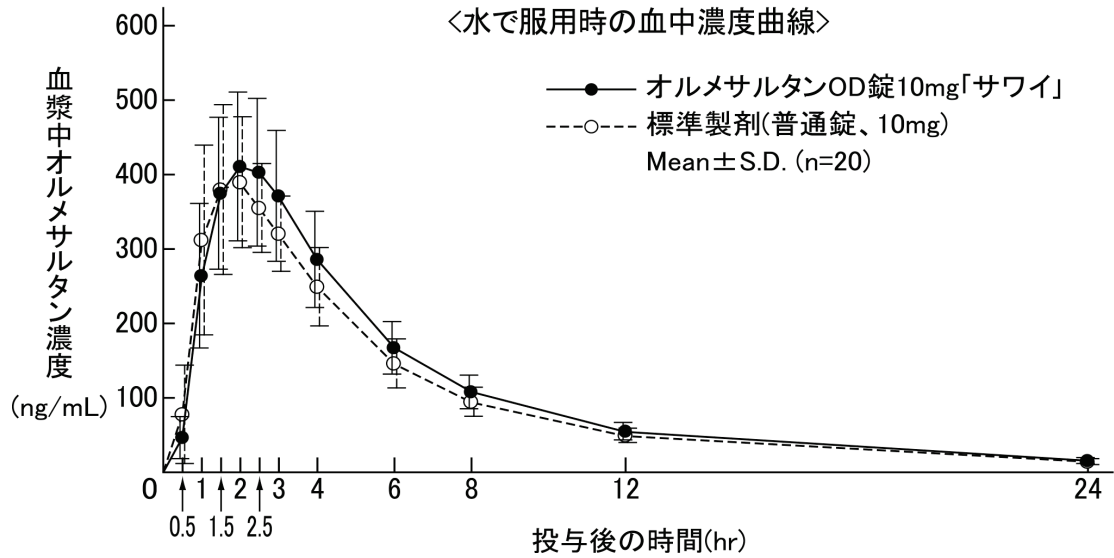
各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _t (ng·hr/mL)
※ 水なし	オルメサルタンOD錠 10mg「サワイ」	469±106	2.0±0.6	5.8±0.5	2533±577
	標準製剤 (普通錠、10mg)	469±93	2.0±1.1	5.9±0.6	2635±443
水あり	オルメサルタンOD錠 10mg「サワイ」	431±100	2.1±0.5	5.8±0.6	2632±479
	標準製剤 (普通錠、10mg)	407±88	2.0±0.6	5.9±0.6	2407±433

※：標準製剤は水で服用

(Mean±S.D.)





		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
水なし	AUC _t	log(0.95)	log(0.90)～log(1.01)
	Cmax	log(1.00)	log(0.91)～log(1.10)
水あり	AUC _t	log(1.09)	log(1.04)～log(1.15)
	Cmax	log(1.05)	log(0.99)～log(1.11)

●オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」^{19, 21)}

通知等	「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 「剤形が異なる製剤の追加のため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
採血時点	0、0.5、1、1.5、2、2.5、3、4、6、8、12、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」(水なし又は水で服用)と標準製剤[普通錠](水で服用)を健康成人男子にそれぞれ1錠(オルメサルタンメドキシミルとして20mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中オルメサルタン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～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。

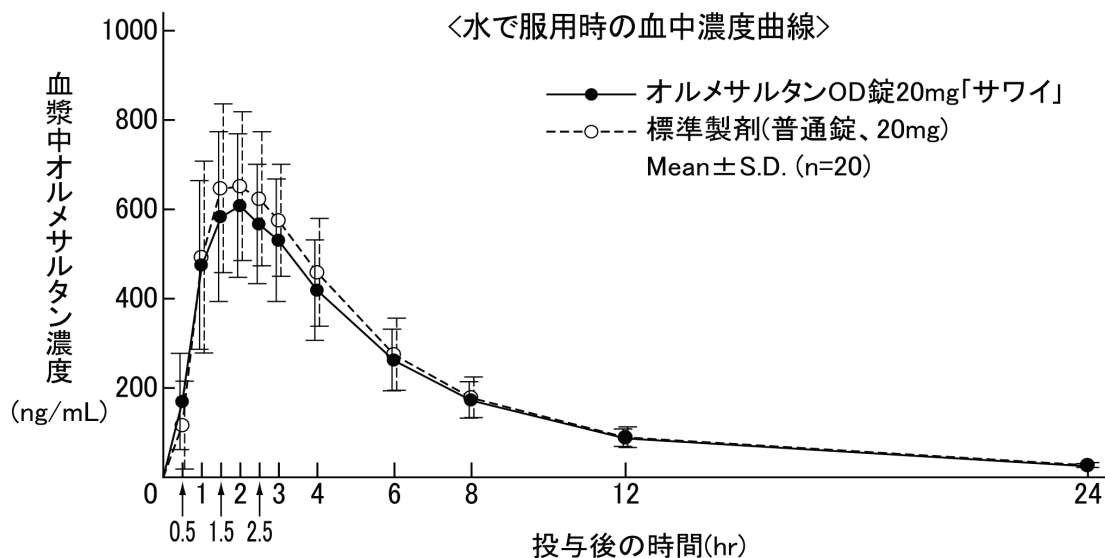
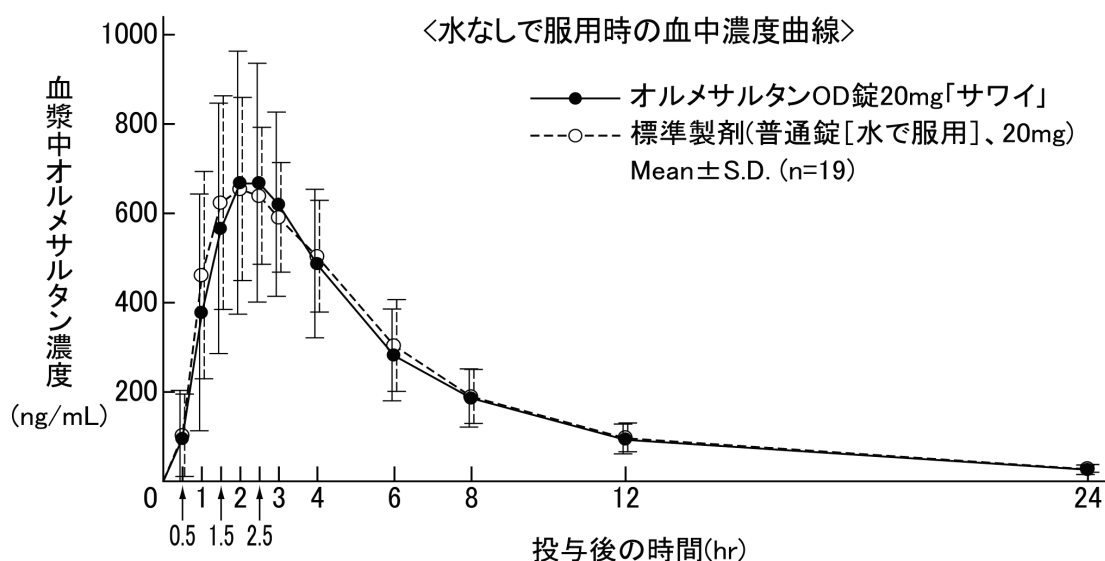
VII. 薬物動態に関する項目

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _t (ng·hr/mL)
※ 水なし	オルメサルタンOD錠 20mg「サワイ」	745±247	2.2±0.8	5.7±0.4	4387±1445
	標準製剤 (普通錠、20mg)	732±151	2.2±0.9	5.9±0.5	4537±1015
水あり	オルメサルタンOD錠 20mg「サワイ」	645±171	1.8±0.4	5.9±0.5	4099± 868
	標準製剤 (普通錠、20mg)	703±166	2.2±0.8	6.0±0.6	4321± 855

※：標準製剤は水で服用

(Mean±S.D.)



VII. 薬物動態に関する項目

		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
水なし	AUC _t	log(0.95)	log(0.88)～log(1.01)
	Cmax	log(0.99)	log(0.91)～log(1.08)
水あり	AUC _t	log(0.95)	log(0.89)～log(1.00)
	Cmax	log(0.91)	log(0.84)～log(0.99)

●オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」^{20, 21)}

通知等	「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 「剤形が異なる製剤の追加のため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
採血時点	0、0.5、1、1.5、2、2.5、3、4、6、8、12、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法

オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」(水なし又は水で服用)と標準製剤[普通錠](水で服用)を健康成人男子にそれぞれ1錠(オルメサルタン メドキシミルとして40mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中オルメサルタン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～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。

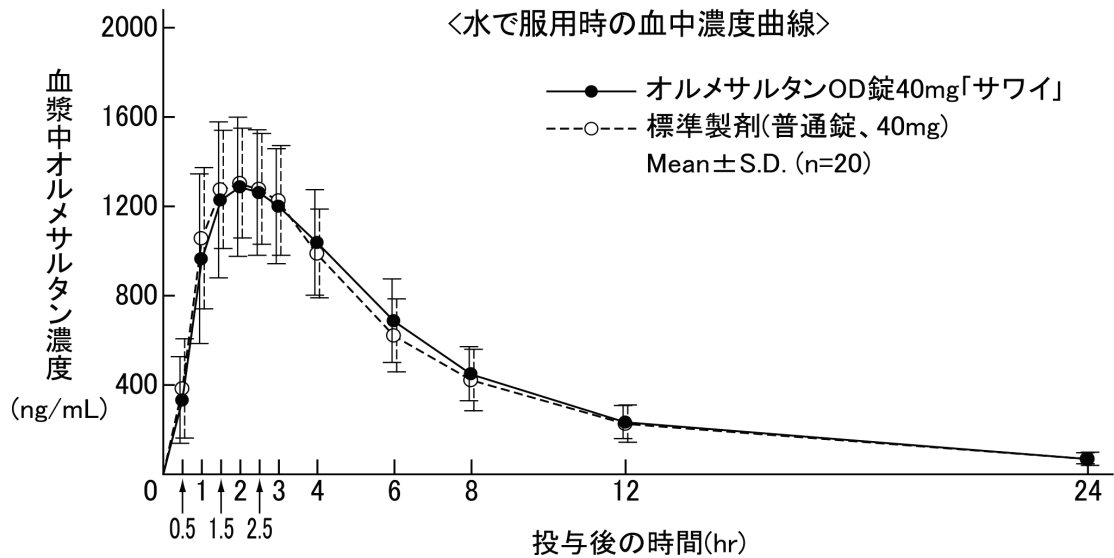
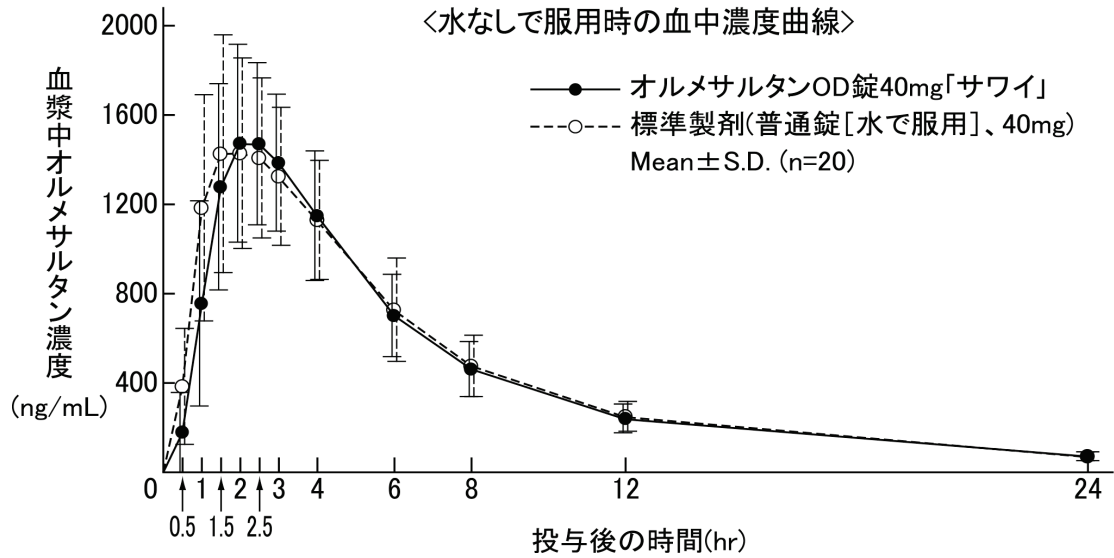
各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _t (ng・hr/mL)
※ 水なし	オルメサルタンOD錠 40mg「サワイ」	1572±446	2.4±0.7	6.0±0.6	10418±2352
	標準製剤 (普通錠、40mg)	1649±367	2.2±1.1	5.9±0.5	10836±2071
水あり	オルメサルタンOD錠 40mg「サワイ」	1376±263	2.3±0.8	6.0±0.8	9941±2160
	標準製剤 (普通錠、40mg)	1368±256	2.0±0.7	6.1±0.6	9716±2237

※：標準製剤は水で服用

(Mean±S.D.)

VII. 薬物動態に関する項目



		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
水なし	AUC _t	log(0.95)	log(0.89)~log(1.02)
	C _{max}	log(0.94)	log(0.87)~log(1.02)
水あり	AUC _t	log(1.03)	log(0.97)~log(1.08)
	C _{max}	log(1.00)	log(0.94)~log(1.08)

血漿中濃度ならびに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) 中毒域

該当資料なし

5) 食事・併用薬の影響

VIII. -7. 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) 解析方法

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

25.6% (外国データ)¹⁾

4) 消失速度定数

● オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」を健康成人男子に1錠 (オルメサルタン メドキシミルとして5mg) 空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{17, 21)}

[水なし] $0.129 \pm 0.027 \text{hr}^{-1}$ 、[水あり] $0.139 \pm 0.042 \text{hr}^{-1}$

● オルメサルタンOD錠 10mg「サワイ」を健康成人男子に1錠 (オルメサルタン メドキシミルとして10mg) 空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{18, 21)}

[水なし] $0.120 \pm 0.010 \text{hr}^{-1}$ 、[水あり] $0.121 \pm 0.011 \text{hr}^{-1}$

● オルメサルタンOD錠 20mg「サワイ」を健康成人男子に1錠 (オルメサルタン メドキシミルとして20mg) 空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{19, 21)}

[水なし] $0.122 \pm 0.009 \text{hr}^{-1}$ 、[水あり] $0.118 \pm 0.010 \text{hr}^{-1}$

● オルメサルタンOD錠 40mg「サワイ」を健康成人男子に1錠 (オルメサルタン メドキシミルとして40mg) 空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{20, 21)}

[水なし] $0.116 \pm 0.011 \text{hr}^{-1}$ 、[水あり] $0.117 \pm 0.015 \text{hr}^{-1}$

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

99%¹⁾

3. 吸収

VII. -1. -3) 参照

VII. 薬物動態に関する項目

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

妊娠中期及び末期にアンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤やアンジオテンシン変換酵素阻害剤を投与された高血圧症の患者で羊水過少症、胎児・新生児の死亡、新生児の低血圧、腎不全、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。

3) 乳汁への移行性

＜参考＞動物実験(ラット)の5 mg/kg/日で乳汁中への移行が認められている。また、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、8 mg/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。

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

オルメサルタンメドキシミルは、経口投与後、腸管、肝臓あるいは血漿において加水分解され、活性代謝物オルメサルタンに代謝される。¹⁾

2) 代謝に関与する酵素(CYP450等)の分子種

ヒト肝ミクロソームを用い、オルメサルタンによるCYP1A1&2、2A6、2C19、2C8&9、2D6、2E1、3A4の活性への影響を検討したところ、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されなかった。

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CYPの誘導は認められなかった。¹⁾

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

VII. -5. -1) 参照

5) 活性代謝物の速度論的パラメータ

VII. -1. -3) 及びVII. -2. -4) 参照

6. 排泄

1) 排泄部位及び経路

健康な成人男子に¹⁴C-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、血漿中には活性代謝物オルメサルタンのみ認められ、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(外国データ)。¹⁾

2) 排泄率

VII. -6. -1) 参照

3) 排泄速度

VII. -6. -1) 参照

7. トランスポーターに関する情報

オルメサルタンの肝取り込みには、相対的な寄与については不明確であるが、OATP1B1、OATP1B3の両方が重要であることが示されている。

MRP2は、オルメサルタンの胆汁排泄に最も重要な役割を果たしていることが明らかとされている。²⁾

8. 透析等による除去率

透析されない。³⁾

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……………
該当しない

2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)……………

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
- 3) 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)[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。](「重要な基本的注意」の項参照)

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由……………
該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由……………
V. -2. 参照

5. 慎重投与内容とその理由……………

慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 1) 両側性腎動脈狭窄のある患者又は片腎で腎動脈狭窄のある患者(「重要な基本的注意」の項参照)
- 2) 高カリウム血症の患者(「重要な基本的注意」の項参照)
- 3) 重篤な腎機能障害のある患者[腎機能を悪化させるおそれがある。血清クレアチニン値が3.0mg/dL以上の患者での十分な使用経験はないので、このような患者に対しては状態を観察しながら慎重に投与すること。]
- 4) 肝機能障害のある患者[外国において、軽度又は中等度の肝機能障害患者でオルメサルタンの血漿中濃度(AUC)が、健康な成人と比較してそれぞれ1.1倍と1.7倍に上昇することが報告されている。]
- 5) 脳血管障害のある患者[過度の降圧が脳血流不全を惹起し、病態を悪化させるおそれがある。]
- 6) 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法……………

重要な基本的注意

- 1) 両側性腎動脈狭窄のある患者又は片腎で腎動脈狭窄のある患者においては、腎血流量の減少や糸球体過剰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ため、治療上やむを得ないと判断される場合を除き、使用は避けること。

- 2) 高カリウム血症の患者においては、高カリウム血症を増悪させるおそれがあるので、治療上やむを得ないと判断される場合を除き、使用は避けること。
また、腎機能障害、コントロール不良の糖尿病等により血清カリウム値が高くなりやすい患者では、高カリウム血症が発現するおそれがあるので、血清カリウム値に注意すること。
- 3) 本剤の投与によって、一過性の急激な血圧低下を起こすおそれがあるので、そのような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。また、特に次の患者では低用量から投与を開始し、増量する場合は患者の状態を十分に観察しながら徐々に行うこと。
- (1) 血液透析中の患者
 - (2) 利尿降圧剤投与中の患者
 - (3) 嚴重な減塩療法中の患者
- 4) アリスキレンフマル酸塩を併用する場合、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ため、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。なお、eGFRが60mL/min/1.73m²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。
- 5) 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。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。
- 6) 手術前24時間は投与しないことが望ましい。
- 7) 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。

7. 相互作用

1) 併用禁忌とその理由

該当しない

2) 併用注意とその理由

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。	併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
リチウム製剤 炭酸リチウム	血中リチウム濃度が上昇し、リチウム中毒を起こすおそれがあるので、血中リチウム濃度に注意すること。	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。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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	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ため、腎機能、血清カリウム値及び血圧を十分に観察すること。なお、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フマル酸塩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。	併用によりレニン-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	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ため、腎機能、血清カリウム値及び血圧を十分に観察すること。	
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。	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

1) 副作用の概要

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

2) 重大な副作用と初期症状

- 1) 重大な副作用(頻度不明)
- (1) **血管浮腫**：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ので観察を十分に行うこと。
 - (2) **腎不全**：腎不全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し、適切な処置を行うこと。
 - (3) **高カリウム血症**：重篤な高カリウム血症があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、直ちに適切な処置を行うこと。
 - (4) **ショック、失神、意識消失**：ショック、血圧低下に伴う失神、意識消失があらわれることがあるので、観察を十分に行い、冷感、嘔吐、意識消失等があらわれた場合には、直ちに適切な処置を行うこと。特に血液透析中、嚴重な減塩療法中、利尿降圧剤投与中の患者では低用量から投与を開始し、増量する場合は患者の状態を十分に観察しながら徐々に行うこと。
 - (5) **肝機能障害、黄疸**：AST(GOT)、ALT(GPT)、 γ -GTPの上昇等の肝機能障害、黄疸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し、適切な処置を行うこと。
 - (6) **血小板減少**：血小板減少があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

- (7) **低血糖**：低血糖があらわれることがある(糖尿病治療中の患者であらわれやすい)ので、観察を十分に行い、脱力感、空腹感、冷汗、手の震え、集中力低下、痙攣、意識障害等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- (8) **横紋筋融解症**：筋肉痛、脱力感、CK(CPK)上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とする横紋筋融解症があらわれることがあるので、観察を十分に行い、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。
- (9) **アナフィラキシー**：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、またアナフィラキシーショックを起こしたとの報告もあるので、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し、適切な処置を行うこと。
- (10) **重度の下痢**：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し、適切な処置を行うこと。なお、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) **間質性肺炎**：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。

3) その他の副作用

2) その他の副作用

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過 敏 症 ^{注)}	そう痒、発疹
血 液	貧血、血小板数減少、白血球数増加
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	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(GPT)上昇、AST(GOT)上昇、 γ -GTP上昇、LDH上昇、Al-P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(CPK)上昇、血清カリウム上昇、尿酸上昇、全身倦怠感、咳嗽、浮腫、CRP上昇、トリグリセリド上昇、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

注) 投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧

該当資料なし

5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度

該当資料なし

6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

副作用

1) 重大な副作用(頻度不明)

(9) アナフィラキシー：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、またアナフィラキシーショックを起こしたとの報告もあるので、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し、適切な処置を行うこと。

2) その他の副作用

下記の副作用があらわれることがあるので、異常が認められた場合には必要に応じ投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

	頻度不明
過敏症 ^{注)}	そう痒、発疹

注) 投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

9. 高齢者への投与

- 1) 高齢者では一般に過度の降圧は好ましくないとされているので、開始用量を遵守し、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。[脳梗塞等が起こるおそれがある。]
- 2) 65歳未満の非高齢者と65歳以上の高齢者において本剤の降圧効果及び副作用に差はみられなかった。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- 1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には投与しないこと。また、投与中に妊娠が判明した場合には、直ちに投与を中止すること。[妊娠中期及び末期にアンジオテンシンII受容体拮抗剤やアンジオテンシン変換酵素阻害剤を投与された高血圧症の患者で羊水過少症、胎児・新生児の死亡、新生児の低血圧、腎不全、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) 授乳中の婦人への投与を避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。[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。また、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。]

11. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない(使用経験がない)。

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

- | |
|---|
| <p>1) 薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。
(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)</p> <p>2) 服用時：</p> <p>(1) 本剤は舌の上に乗せて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。
また、水で服用することもできる。</p> <p>(2) 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。</p> |
|---|

15. その他の注意

該当しない

16. その他

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
VIII. -10. 参照

 - 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

規制区分	
製剤	処方箋医薬品 ^{注)}
有効成分	該当しない

注) 注意—医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年

3. 貯法・保存条件

室温保存(気密容器)

X. -4. 参照

4. 薬剤取扱い上の注意点

1) 薬局での取扱い上の留意点について

・取扱い上の注意

開封後は湿気を避けて保存すること。

2) 薬剤交付時の取扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)

患者向医薬品ガイド：有り、くすりのしおり：有り

VIII. -6. 及びVIII. -14. 参照

3) 調剤時の留意点について

・取扱い上の注意

本剤と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の一包化は避けること。[一包化して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。]

5. 承認条件等

該当しない

6. 包装

●オルメサルタンOD錠5mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)

●オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)、140錠(14錠×10)、500錠(10錠×50)、700錠(14錠×50)

X. 管理的事項に関する項目

●オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)、140錠(14錠×10)、500錠(10錠×50)、700錠(14錠×50)
バラ：200錠

●オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」

PTP：100錠(10錠×10)、140錠(14錠×10)、500錠(10錠×50)

7. 容器の材質

●オルメサルタンOD錠5mg/OD錠10mg/OD錠40mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]環状ポリオレフィン複合フィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミラミネートフィルム

●オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」

PTP：[PTPシート]環状ポリオレフィン複合フィルム、アルミ箔
[ピロー]アルミラミネートフィルム
バラ：[本体]ポリエチレン瓶、[キャップ]ポリプロピレン

8. 同一成分・同効薬

同一成分：オルメテックOD錠5mg/OD錠10mg/OD錠20mg/OD錠40mg

同効薬：アンジオテンシンⅡ受容体拮抗薬

ロサルタンカリウム、バルサルタン、カンデサルタン シレキセチル、テルミサルタン、イルベサルタン、アジルサルタン¹⁶⁾

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

●オルメサルタンOD錠5mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2017年8月15日、承認番号：22900AMX00775000

●オルメサルタンOD錠10mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2017年8月15日、承認番号：22900AMX00776000

●オルメサルタンOD錠20mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2017年8月15日、承認番号：22900AMX00777000

●オルメサルタンOD錠40mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2017年8月15日、承認番号：22900AMX00778000

11. 薬価基準収載年月日

2017年12月8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……………
該当しない

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、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

16. 各種コード……………

品名	HOT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
オルメサルタンOD錠 5mg「サワイ」	125878301	2149044F8010	622587801
オルメサルタンOD錠 10mg「サワイ」	125879001	2149044F5011	622587901
オルメサルタンOD錠 20mg「サワイ」	125880601	2149044F6018	622588001
オルメサルタンOD錠 40mg「サワイ」	125881301	2149044F7014	622588101

17. 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) 日本薬局方解説書編集委員会編, 第十七改正 日本薬局方解説書, 廣川書店, 2016, C-1193-C-1199.
 - 2) 日本薬剤師研修センター編, 第十七改正 日本薬局方 医薬品情報 JPDI 2016, じほう, 2016, p. 168-169.
 - 3) 平田純生他編, 透析患者への投薬ガイドブック 慢性腎臓病(CKD)の薬物治療, 改訂3版, じほう, 2017, p. 451-452.
 - 4) ~11) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験]
 - 12) ~15) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験]
 - 16) 薬剤分類情報閲覧システム<<http://www.iryohoken.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2017/8/4 アクセス)
 - 17) ~20) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験]
 - 21) 高野和彦他, 診療と新薬, 54(10), 930(2017).
 - 22) 高折修二他監訳, グッドマン・ギルマン 薬理書, 第12版, 廣川書店, 2013, p. 137.
2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

2. 海外における臨床支援情報
- 該当資料なし

XIII. 備考

その他の関連資料

