

# 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

HMG-CoA還元酵素阻害剤

**ロスバスタチン錠2.5mg「アメル」**  
**ロスバスタチン錠5mg「アメル」**  
**ロスバスタチンOD錠2.5mg「アメル」**  
**ロスバスタチンOD錠5mg「アメル」**

ROSUVASTATIN tab.2.5mg・tab.5mg・OD tab.2.5mg・OD tab. 5mg 「AMEL」

剤形	ロスバスタチン錠2.5mg「アメル」：フィルムコーティング錠 ロスバスタチン錠5mg「アメル」：フィルムコーティング錠 ロスバスタチンOD錠2.5mg「アメル」：フィルムコーティング錠 ロスバスタチンOD錠5mg「アメル」：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	ロスバスタチン錠2.5mg「アメル」：1錠中、ロスバスタチンカルシウム2.6mg（ロスバスタチンとして2.5mg）を含有する。 ロスバスタチン錠5mg「アメル」：1錠中、ロスバスタチンカルシウム5.2mg（ロスバスタチンとして5mg）を含有する。 ロスバスタチンOD錠2.5mg「アメル」：1錠中、ロスバスタチンカルシウム2.6mg（ロスバスタチンとして2.5mg）を含有する。 ロスバスタチンOD錠5mg「アメル」：1錠中、ロスバスタチンカルシウム5.2mg（ロスバスタチンとして5mg）を含有する。
一般名	和名：ロスバスタチンカルシウム 洋名：Rosuvastatin Calcium
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：共和薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口 TEL.0120-041189(フリーダイヤル) FAX.06-6121-2858 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.kyowayakuhin.co.jp/amel-di/">https://www.kyowayakuhin.co.jp/amel-di/</a>

本IFは2022年8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。この変更に合わせて、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

<b>I. 概要に関する項目</b>		<b>V. 治療に関する項目</b>	
1. 開発の経緯	1	1. 効能又は効果	19
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 用法及び用量	19
		3. 臨床成績	19
<b>II. 名称に関する項目</b>		<b>VI. 薬効薬理に関する項目</b>	
1. 販売名	2	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	21
2. 一般名	2	2. 薬理作用	21
3. 構造式又は示性式	2	<b>VII. 薬物動態に関する項目</b>	
4. 分子式及び分子量	3	1. 血中濃度の推移・測定法	22
5. 化学名（命名法）	3	2. 薬物速度論的パラメータ	26
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3	3. 吸収	26
7. CAS 登録番号	3	4. 分布	26
		5. 代謝	27
<b>III. 有効成分に関する項目</b>		6. 排泄	27
1. 物理化学的性質	4	7. トランスポーターに関する情報	27
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	8. 透析等による除去率	28
3. 有効成分の確認試験法	4	<b>VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目</b>	
4. 有効成分の定量法	5	1. 警告内容とその理由	29
		2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	29
<b>IV. 製剤に関する項目</b>		3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	29
1. 剤形	6	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	29
2. 製剤の組成	7	5. 慎重投与内容とその理由	30
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	7	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	30
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	7. 相互作用	30
5. 調製法及び溶解後の安定性	9	8. 副作用	33
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	9	9. 高齢者への投与	34
7. 溶出性	9	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	35
8. 生物学的試験法	18	11. 小児等への投与	35
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	18	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	35
10. 製剤中の有効成分の定量法	18	13. 過量投与	35
11. 力価	18	14. 適用上の注意	35
12. 混入する可能性のある夾雑物	18		
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	18		
14. その他	18		

15. その他の注意	35
16. その他	35

#### IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	36
2. 毒性試験	36

#### X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	37
2. 有効期間又は使用期限	37
3. 貯法・保存条件	37
4. 薬剤取扱い上の注意点	37
5. 承認条件等	37
6. 包装	38
7. 容器の材質	38
8. 同一成分・同効薬	38
9. 国際誕生年月日	38
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	38
11. 薬価基準収載年月日	39
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
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	39
14. 再審査期間	39
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	39
16. 各種コード	39
17. 保険給付上の注意	39

#### X I. 文献

1. 引用文献	40
2. その他の参考文献	40

#### X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	41
2. 海外における臨床支援情報	41

#### X III. 備考

その他の関連資料	42
----------	----

---

## I. 概要に関する項目

---

### 1. 開発の経緯

ロスバスタチンカルシウムは、HMG-CoA 還元酵素阻害剤である。

ロスバスタチン錠 2.5mg「アメル」、錠 5mg「アメル」、OD 錠 2.5mg「アメル」、OD 錠 5mg「アメル」は、共和薬品工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について(平成 26 年 11 月 21 日 薬食発 1121 第 2 号)」に基づき規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、平成 29 年 8 月に承認を取得して同年 12 月に上市した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1) HMG-CoA のメバロン酸への変換を減少させることにより、コレステロール生合成における早期の律速段階を抑制する。また、肝臓におけるコレステロール生成を抑制することによって血中コレステロール値を低下させるが、その結果、LDL 受容体遺伝子の発現が増加し、最終的には LDL 受容体の合成が増加する。このとき、LDL 受容体の分解も抑制され、肝実質細胞表面の LDL 受容体が増えるため、血液からの LDL の除去が増加し、血漿 LDL-C 値が低下する。<sup>1)</sup>
- 2) OD 錠は、メントール風味の口腔内崩壊錠である。
- 3) 重大な副作用として、横紋筋融解症、ミオパチー、免疫介在性壊死性ミオパチー、肝炎、肝機能障害、黄疸、血小板減少、過敏症状、間質性肺炎、末梢神経障害、多形紅斑があらわれることがある。

## Ⅱ. 名称に関する項目

### 1. 販売名

(1) 和名：

ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」  
ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」  
ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「アメル」  
ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」

(2) 洋名：

ROSUVASTATIN tab.2.5mg 「AMEL」  
ROSUVASTATIN tab.5mg 「AMEL」  
ROSUVASTATIN OD tab.2.5mg 「AMEL」  
ROSUVASTATIN OD tab.5mg 「AMEL」

(3) 名称の由来：

本剤の一般名「ロスバスタチンカルシウム」、共和薬品工業(株)の屋号「アメル」(AMEL)に由来する。

### 2. 一般名

(1) 和名(命名法)：

ロスバスタチンカルシウム(JAN)

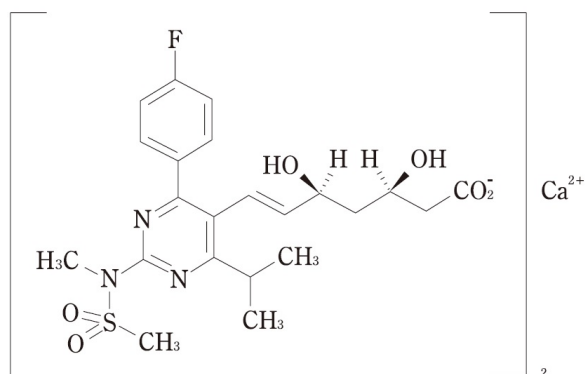
(2) 洋名(命名法)：

Rosuvastatin Calcium (JAN)

(3) ステム：

高脂血症治療薬、HMG-CoA 還元酵素阻害剤：-vastatin

### 3. 構造式又は示性式





4. 分子式及び分子量

分子式 :  $(C_{22}H_{27}FN_3O_6S)_2Ca$

分子量 : 1001.14

5. 化学名(命名法)

Monocalcium bis ((3*R*, 5*S*, 6*E*) -7- {4- (4-fluorophenyl) -6-isopropyl-2-  
[methanesulfonyl (methyl) amino] pyrimidin-5-yl} -3, 5-dihydroxyhept-6-enoate)  
(IUPAC)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

特になし

7. CAS 登録番号

287714-41-4 (rosuvastatin)

147098-20-2 (rosuvastatin calcium)



---

### Ⅲ. 有効成分に関する項目

---

#### 1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状：

白色の粉末である。

(2) 溶解性：

溶 媒	日局表現
メタノール	やや溶けやすい
水	溶けにくい
エタノール(99.5)	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

ロスバスタチン錠

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)

(3) カルシウム塩の定性反応(3)

ロスバスタチン OD 錠

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法(臭化カリウム錠剤法)
- (3) フッ化物の定性反応(1)及び(2)
- (4) カルシウム塩の定性反応(1)(2)(3)



4. 有効成分の定量法

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 :

販売名	剤形・色	外形・大きさ等	識別コード
ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」	フィルムコーティング錠		ロスバ 2.5 アメル
	うすい赤みの黄色からくすんだ赤みの黄色	直径：約 5.7mm 厚さ：約 3.2mm 質量：約 79.0mg	
ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」	フィルムコーティング錠		ロスバ 5 アメル
	うすい赤みの黄色からくすんだ赤みの黄色	直径：約 7.2mm 厚さ：約 3.9mm 質量：約 156.0mg	
ロスバスタチンOD錠 2.5mg 「アメル」	フィルムコーティング錠		ロスバ 2.5 OD アメル
	うすい黄色	直径：約 5.6mm 厚さ：約 3.1mm 質量：約 77.5mg	
ロスバスタチンOD錠 5mg 「アメル」	フィルムコーティング錠		ロスバ 5 OD アメル
	うすい黄色	直径：約 7.2mm 厚さ：約 3.6mm 質量：約 154.0mg	

OD錠：メントール風味

###### (2) 製剤の物性 :

該当資料なし

###### (3) 識別コード :

IV-1-(1) 参照

###### (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

## 2. 製剤の組成

### (1) 有効成分(活性成分)の含量：

ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」：

1 錠中、ロスバスタチンカルシウム 2.6mg (ロスバスタチンとして 2.5mg) を含有する。

ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」：

1 錠中、ロスバスタチンカルシウム 5.2mg (ロスバスタチンとして 5mg) を含有する。

ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「アメル」：

1 錠中、ロスバスタチンカルシウム 2.6mg (ロスバスタチンとして 2.5mg) を含有する。

ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」：

1 錠中、ロスバスタチンカルシウム 5.2mg (ロスバスタチンとして 5mg) を含有する。

### (2) 添加物：

ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」・錠 5mg 「アメル」

D-マンニトール、L-アルギニン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、クロスポビドン、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、濃グリセリン、酸化チタン、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ

ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「アメル」・OD 錠 5mg 「アメル」

D-マンニトール、炭酸水素ナトリウム、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、クロスポビドン、結晶セルロース、アミノアルキルメタクリレートコポリマー E、スクラロース、トメントール、ステアリン酸マグネシウム、ポリビニルアルコール・ポリエチレングリコール・グラフトコポリマー、酸化チタン、黄色三二酸化鉄

### (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

### (1) 長期保存試験での安定性<sup>2)</sup>

ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「アメル」、ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」

保存条件	保存形態*	試験期間	試験項目	試験結果
25±2℃、 60±5%RH	PTP 包装	18 ヶ月	性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、崩壊性、溶出性、定量法	規格内

※ PTP 包装：ポリプロピレンフィルム+アルミニウム箔、アルミニウム袋

(2) 加速試験での安定性<sup>2)</sup>ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」、ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」

保存条件	保存形態*	試験期間	試験項目	試験結果
40±2℃、 75±5%RH	PTP 包装	6 ヶ月	性状、確認試験、製剤均一性、溶出性、定量法	規格内

※PTP 包装：ポリプロピレンフィルム+アルミニウム箔、アルミニウム袋、乾燥剤

ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「アメル」、ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」

保存条件	保存形態*	試験期間	試験項目	試験結果
40±2℃、 75±5%RH	PTP 包装	6 ヶ月	性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、崩壊性、溶出性、定量法	規格内

※PTP 包装：ポリプロピレンフィルム+アルミニウム箔、アルミニウム袋

(3) 無包装下の安定性<sup>3)</sup>ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」、ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」

保存条件	保存形態	試験期間	試験項目	試験結果
25±2℃、 75±5%RH (湿度)	遮光・開放	90 日間	性状、溶出性、定量法、硬度	規格内
40±2℃ (温度)	遮光・気密容器	90 日間	性状、溶出性、定量法、硬度	規格内
25±2℃、 60±5%RH、 120 万 lx・hr (光)	気密容器	1000 lx、 50 日間	性状、溶出性、定量法、硬度	規格内
	ポリセロ分包		性状、溶出性、定量法、硬度	規格内

ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「アメル」、ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」

保存条件	保存形態	試験期間	試験項目	試験結果
25±2℃、 75±5%RH (湿度)	遮光・開放	90 日間	性状、崩壊性、溶出性、定量法、純度試験、硬度	規格内
40±2℃、 75±5%RH (温度)	遮光・気密容器	90 日間	性状、崩壊性、溶出性、定量法、純度試験、硬度	規格内
25±2℃、 45±5%RH、 120 万 lx・hr (光)	開放	2500 lx、 20 日間	性状、崩壊性、溶出性、定量法、純度試験、硬度	規格内

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)

該当しない

7. 溶出性<sup>4)</sup>

(1) 溶出挙動における類似性

ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」

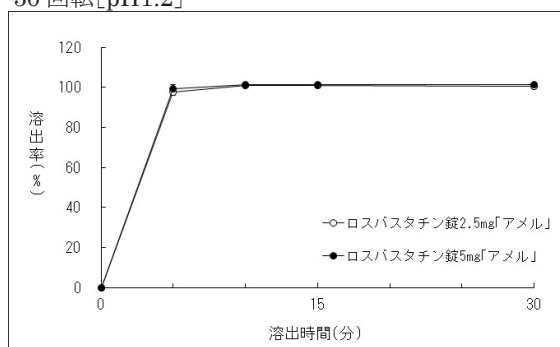
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」及び「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)に基づき、ロスバスタチンカルシウム製剤であるロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」(試験製剤)及びロスバスタチン錠 5mg 「アメル」(標準製剤)の溶出挙動の同等性を評価した。

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、温度：37±0.5℃		
判定基準	回転数	試験液	判定
	50	pH1.2 pH4.0 pH6.8 水	

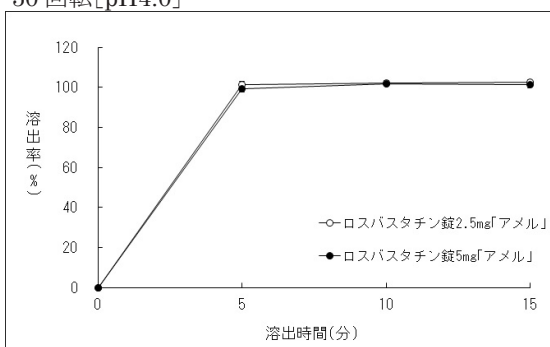
下記の溶出曲線及び試験結果より、両剤の溶出挙動は同等であると判定された。

図. 溶出曲線 (n=12 ; mean ± S.D.)

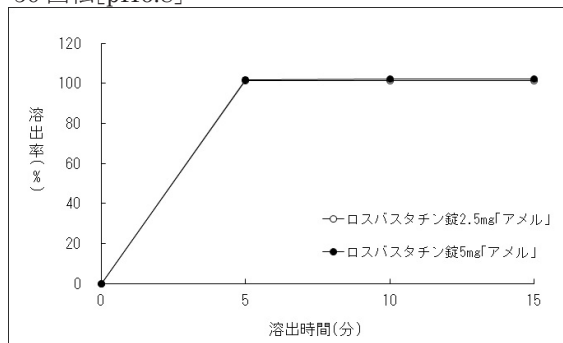
50 回転[pH1.2]



50 回転[pH4.0]



50回転[pH6.8]



50回転[水]

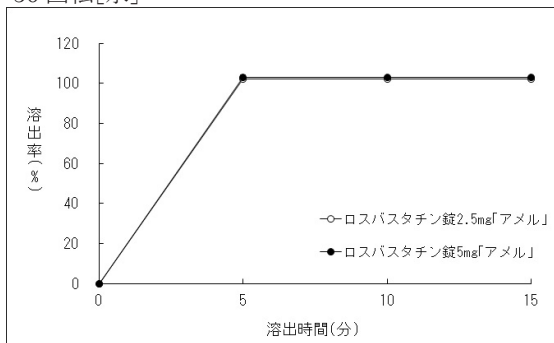


表 1. 溶出挙動における同等性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件			判定基準		平均溶出率(%)		判定結果
試験方法	回転数 (rpm)	試験液	溶出率	判定時間	標準製剤	試験製剤	
パドル法	50	pH1.2	85%以上	15分	101.1	100.8	適合
		pH4.0	85%以上	15分	101.3	102.5	適合
		pH6.8	85%以上	15分	102.0	101.2	適合
		水	85%以上	15分	102.9	102.2	適合

表 2. 溶出挙動の同等性判定(個々の溶出率)

回転数 (rpm)	試験液	判定時点	試験製剤		差 (%)	判定基準	判定
			平均溶出率(%)	個々の溶出率(%)			
50	pH1.2	15分	100.8	100.1 100.7 101.0 102.9 102.0 99.8 98.7 101.3 102.7 99.6 101.5 99.6	-0.7 -0.1 0.2 2.1 1.2 -1.0 -2.1 0.5 1.9 -1.2 0.7 -1.2	個々の溶出率が ±15%を超えるもの:1個以下 ±25%を超えるもの:0個	適合
50	pH4.0	15分	102.5	102.2 100.2 102.1 102.9 102.1 104.2 104.6 104.2 102.8 100.9 103.3 101.0	-0.3 -2.3 -0.4 0.4 -0.4 1.7 2.1 1.7 0.3 -1.6 0.8 -1.5	個々の溶出率が ±15%を超えるもの:1個以下 ±25%を超えるもの:0個	適合



50	pH6.8	15分	101.2	102.2 102.8 100.7 102.4 100.3 101.4 100.6 101.8 98.8 101.5 101.3 100.5	1.0 1.6 -0.5 1.2 -0.9 0.2 -0.6 0.6 -2.4 0.3 0.1 -0.7	個々の溶出率が ±15%を超えるもの：1個以下 ±25%を超えるもの：0個	適合
50	水	15分	102.2	102.2 102.0 102.5 102.5 101.0 101.5 102.5 102.6 102.3 102.4 103.7 101.6	0.0 -0.2 0.3 0.3 -1.2 -0.7 0.3 0.4 0.1 0.2 1.5 -0.6	個々の溶出率が ±15%を超えるもの：1個以下 ±25%を超えるもの：0個	適合

### <参考>

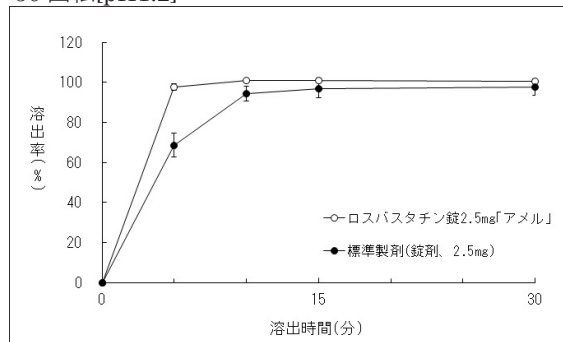
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に基づき、ロスバスタチンカルシウム製剤であるロスバスタチン錠2.5mg「アメル」及び標準製剤の溶出挙動の類似性を評価した。

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、温度：37±0.5℃		
判定基準	回転数	試験液	判定
	50	pH1.2 pH4.0 pH6.8 水	試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出する。

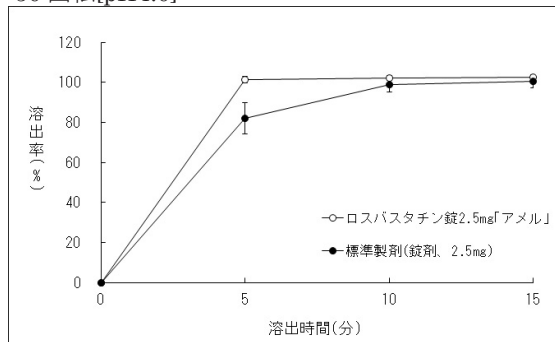
下記の溶出曲線及び試験結果より、両剤の溶出挙動は類似していると判定された。

図. 溶出曲線 (n=12 ; mean±S.D.)

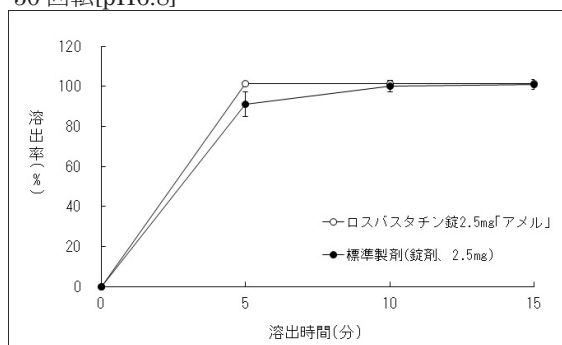
50回転[pH1.2]



50回転[pH4.0]



50 回転[pH6.8]



50 回転[水]

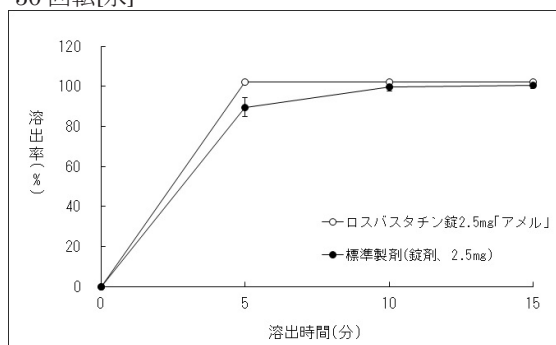


表. 溶出挙動における類似性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件			判定基準		平均溶出率(%)		判定結果
試験方法	回転数 (rpm)	試験液	溶出率	判定時間	標準製剤	試験製剤	
パドル法	50	pH1.2	85%以上	15分	96.9	100.8	適合
		pH4.0	85%以上	15分	100.3	102.5	適合
		pH6.8	85%以上	15分	100.8	101.2	適合
		水	85%以上	15分	100.3	102.2	適合

### ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」に基づき、ロスバスタチンカルシウム製剤であるロスバスタチン錠 5mg 「アメル」及び標準製剤の溶出挙動の類似性を評価した。

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、温度：37±0.5℃		
判定基準	回転数	試験液	判定
	50	pH1.2 pH4.0 pH6.8 水	

下記の溶出曲線及び試験結果より、両剤の溶出挙動は類似していると判定された。

図. 溶出曲線 (n=12 ; mean ± S.D.)

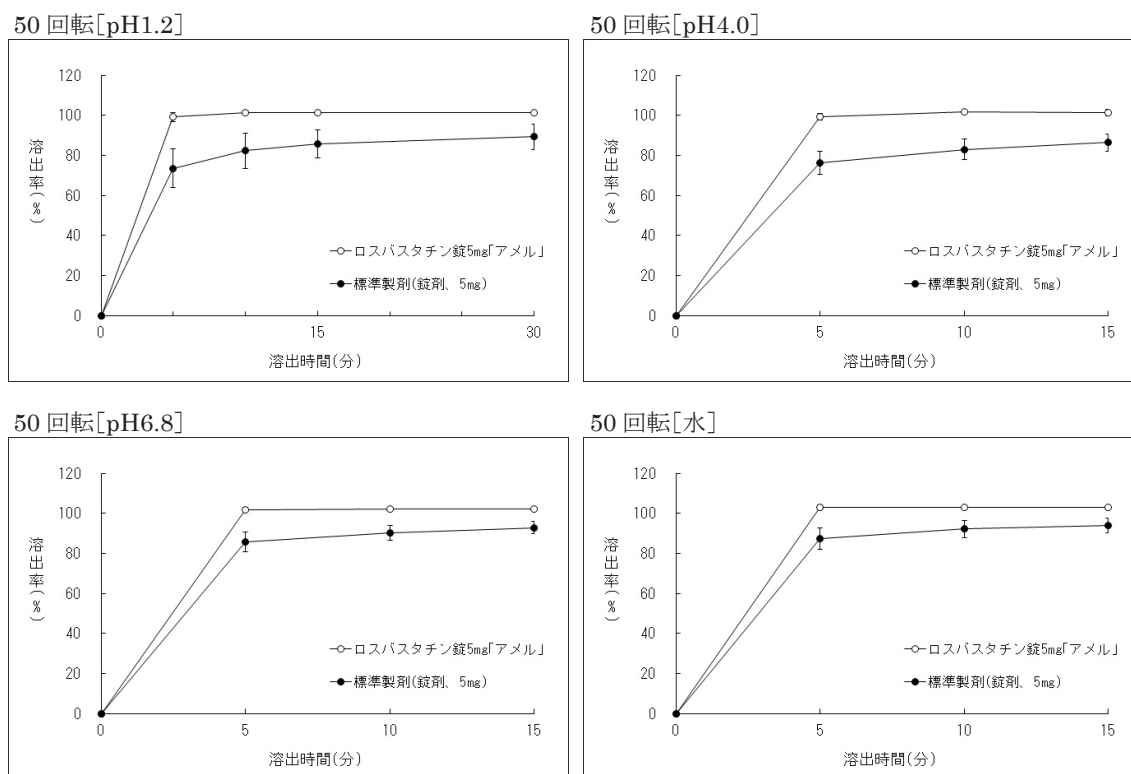


表. 溶出挙動における同等性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件			判定基準		平均溶出率(%)		判定結果
試験方法	回転数 (rpm)	試験液	溶出率	判定時間	標準製剤	試験製剤	
パドル法	50	pH1.2	85%以上	15分	85.5	101.1	適合
		pH4.0	85%以上	15分	86.4	101.3	適合
		pH6.8	85%以上	15分	92.8	102.0	適合
		水	85%以上	15分	94.0	102.9	適合

## ロスバスタチン OD錠 2.5mg 「アメル」

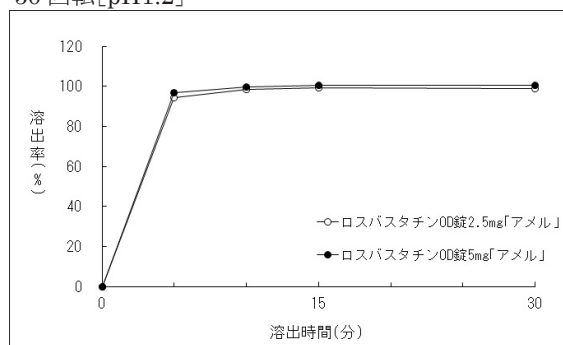
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」及び「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)に基づき、ロスバスタチンカルシウム製剤であるロスバスタチン OD錠 2.5mg 「アメル」(試験製剤)及びロスバスタチン OD錠 5mg 「アメル」(標準製剤)の溶出挙動の同等性を評価した。

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、温度：37±0.5℃		
判定基準	回転数	試験液	判定
	50	pH1.2 pH4.0 pH6.8 水	

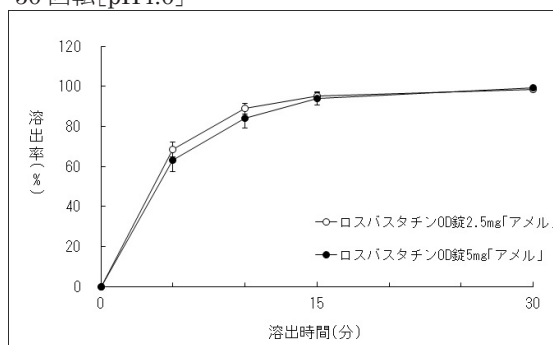
下記の溶出曲線及び試験結果より、両剤の溶出挙動は同等であると判定された。

図. 溶出曲線 (n=12 ; mean±S.D.)

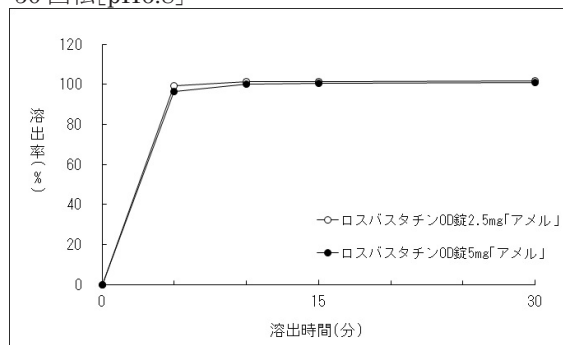
50 回転 [pH1.2]



50 回転 [pH4.0]



50 回転 [pH6.8]



50 回転 [水]

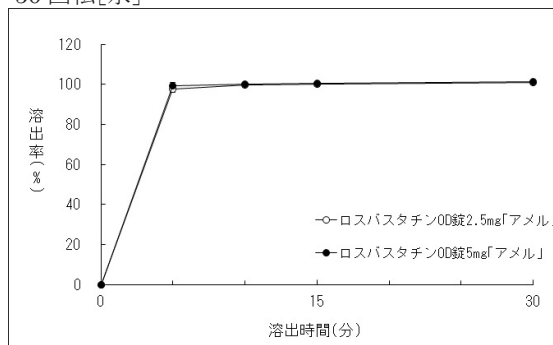


表 1. 溶出挙動における類似性 (試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件			判定基準		平均溶出率(%)		判定結果
試験方法	回転数 (rpm)	試験液	溶出率	判定時間	標準製剤	試験製剤	
パドル法	50	pH1.2	85%以上	15分	100.3	99.2	適合
		pH4.0	85%以上	15分	93.7	95.0	適合
		pH6.8	85%以上	15分	100.5	101.5	適合
		水	85%以上	15分	100.5	100.1	適合

表 2. 溶出挙動の同等性判定 (個々の溶出率)

回転数 (rpm)	試験液	判定時点	試験製剤		差 (%)	判定基準	判定
			平均溶出率(%)	個々の溶出率(%)			
50	pH1.2	15分	92.2	99.8 98.9 99.1 100.1 99.6 99.9 97.7 99.4 98.6 98.9 101.4 97.4	7.6 6.7 6.9 7.9 7.4 7.7 5.5 7.2 6.4 6.7 9.2 5.2	個々の溶出率が ±15%を超えるもの:1個以下 ±25%を超えるもの:0個	適合
50	pH4.0	15分	95.0	94.3 93.3 90.5 96.3 95.1 95.0 95.5 92.8 97.6 96.8 97.3 96.0	-0.7 -1.7 -4.5 1.3 0.1 0.0 0.5 -2.2 2.6 1.8 2.3 1.0	個々の溶出率が ±15%を超えるもの:1個以下 ±25%を超えるもの:0個	適合
50	pH6.8	15分	101.5	102.1 102.8 100.4 101.2 100.6 102.0 102.4 102.1 100.5 100.0 103.9 100.4	0.6 1.3 -1.1 -0.3 -0.9 0.5 0.9 0.6 -1.0 -1.5 2.4 -1.1	個々の溶出率が ±15%を超えるもの:1個以下 ±25%を超えるもの:0個	適合

50	水	15分	100.1	100.1	0.0	個々の溶出率が ±15%を超えるもの：1個以下 ±25%を超えるもの：0個	適合
				99.7	-0.4		
				99.2	-0.9		
				99.3	-0.8		
				101.4	1.3		
				99.2	-0.9		
				99.4	-0.7		
				101.6	1.5		
				99.5	-0.6		
				102.2	2.1		
				98.9	-1.2		
				100.6	0.5		

### ロスバスタチン OD錠 5mg 「アメル」

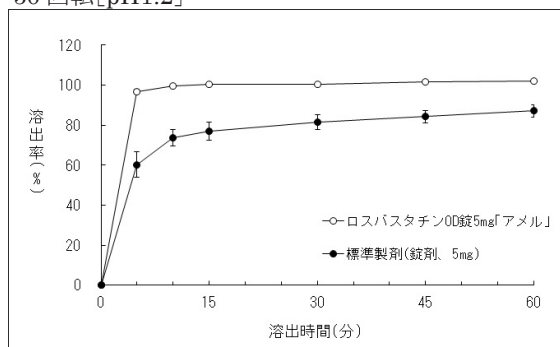
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について」に基づき、ロスバスタチンカルシウム製剤であるロスバスタチン OD錠 5mg 「アメル」及び標準製剤(普通錠)の溶出挙動の類似性を評価した。

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、温度：37±0.5℃		
判定基準	回転数	試験液	判定
	50	pH1.2 pH4.0	規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が85%以上となると、標準製剤の平均溶出率が40%及び85%付近の適当な2時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
		pH6.8	f <sub>2</sub> 関数の値が42以上である。
		水	試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出する。
	100	pH4.0	

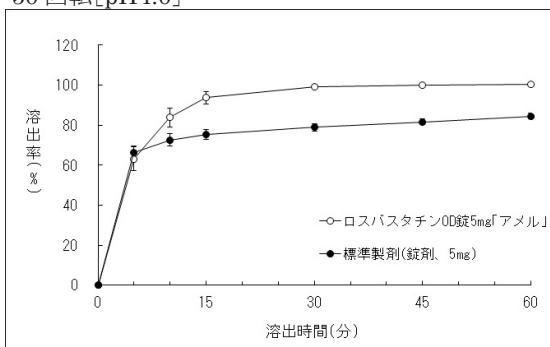
下記の溶出曲線及び試験結果より、両剤の溶出挙動は pH1.2 (50rpm)、pH4.0 (50rpm) で不適となり、類似性が得られなかった。しかし、標準製剤の溶出率は溶出試験 30分時点で液性を問わず約80%に到達していること、またロスバスタチンカルシウムは吸収部位が胃から直腸まで消化管全体の広範囲にわたることから、試験製剤と標準製剤の溶出率の差は生物学的同等性試験に大きく影響しないと考えられた。

図. 溶出曲線 (n=12 ; mean ± S.D.)

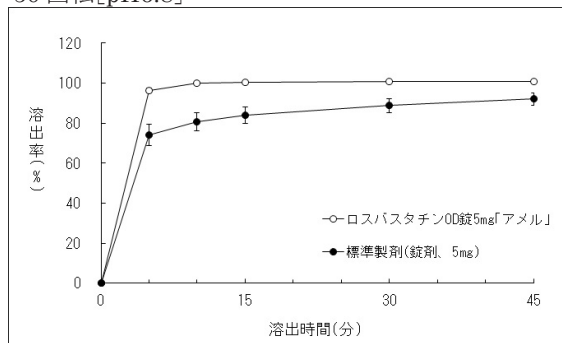
50回転 [pH1.2]



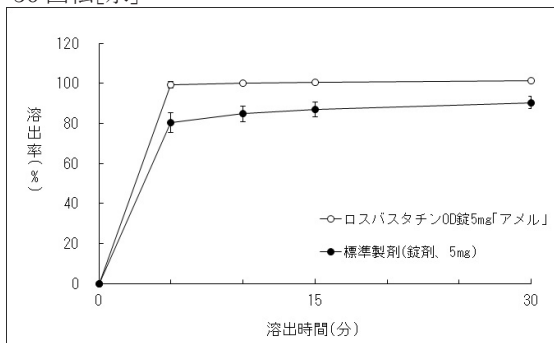
50回転 [pH4.0]



50回転[pH6.8]



50回転[水]



100回転[pH4.0]

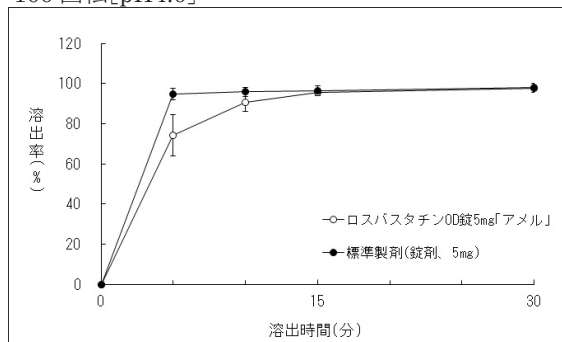


表.溶出挙動における同等性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件			判定基準		平均溶出率(%)		判定結果
試験方法	回転数 (rpm)	試験液	溶出率 又は $f_2$ 値	判定時間	標準製剤	試験製剤	
パドル法	50	pH1.2	40%付近	5分	60.3	96.7	不適
			85%付近	45分	84.3	101.7	
		pH4.0	40%付近	5分	66.4	63.1	不適
			85%付近	60分	84.5	100.4	
		pH6.8	$f_2$ : 42 以上	15分	84.1	100.5	適合
				30分	88.8	100.7	
				45分	92.2	100.8	
				水	85%以上	15分	87.0
	100	pH4.0	85%以上	15分	96.5	95.5	適合



## (2) 溶出規格

日本薬局方一般試験法溶出試験法、パドル法に基づき試験を実施し、以下の溶出規格に適合していることが確認されている。

販売名	表示量	回転数	試験液	規定時間	溶出率
ロスバスタチン錠 2.5mg「アメル」	2.5mg	50rpm	水	15分	85%以上
ロスバスタチン錠 5mg「アメル」	5mg				
ロスバスタチン OD 錠 2.5mg「アメル」	2.5mg			15分	80%以上
ロスバスタチン OD 錠 5mg「アメル」	5mg			30分	85%以上

## 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

ロスバスタチン錠

紫外可視吸光度測定法

ロスバスタチン OD 錠

液体クロマトグラフィー

## 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

高コレステロール血症

〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

適用の前に十分な検査を実施し、高コレステロール血症であることを確認した上で本剤の適用を考慮すること。

### 2. 用法及び用量

通常、成人にはロスバスタチンとして 1 日 1 回 2.5mg より投与を開始するが、早期に LDL-コレステロール値を低下させる必要がある場合には 5mg より投与を開始してもよい。なお、年齢・症状により適宜増減し、投与開始後あるいは増量後、4 週以降に LDL-コレステロール値の低下が不十分な場合には、漸次 10mg まで増量できる。10mg を投与しても LDL-コレステロール値の低下が十分でない重症患者に限り、さらに増量できるが、1 日最大 20mg までとする。

〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

- (1) クレアチニンクリアランスが 30mL/min/1.73m<sup>2</sup> 未満の患者に投与する場合には、2.5mg より投与を開始し、1 日最大投与量は 5mg とする。(「慎重投与」の項参照)
- (2) 特に 20mg 投与時においては腎機能に影響があらわれるおそれがある。20mg 投与開始後 12 週までの間は原則、月に 1 回、それ以降は定期的(半年に 1 回等)に腎機能検査を行うなど、観察を十分に行うこと。
- (3) (OD 錠のみ)  
OD 錠は口腔内で崩壊するが、口腔粘膜からの吸収により効果発現を期待する製剤ではないため、崩壊後は唾液又は水で飲み込むこと。(「適用上の注意」の項参照)

### 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

(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)：

該当しない

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

スタチン：シンバスタチン、プラバスタチンナトリウム、フルバスタチンナトリウム、アトルバスタチン

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序：

HMG-CoA のメバロン酸への変換を減少させることにより、コレステロール生合成における早期の律速段階を抑制する。また、肝臓におけるコレステロール生成を抑制することによって血中コレステロール値を低下させるが、その結果、LDL 受容体遺伝子の発現が増加し、最終的には LDL 受容体の合成が増加する。このとき、LDL 受容体の分解も抑制され、肝実質細胞表面の LDL 受容体が増えるため、血液からの LDL の除去が増加し、血漿 LDL-C 値が低下する。<sup>1)</sup>

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績：

該当資料なし

#### (3) 作用発現時間・持続時間：

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移・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<sup>5)</sup>：

ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」

4.7±0.8 時間(健康成人男子にロスバスタチン錠 5mg 「アメル」を 1 錠投与した場合)

ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」

(水なし) 4.4±1.1 時間(健康成人男子にロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」を 1 錠投与した場合)

(水あり) 4.6±1.0 時間(健康成人男子にロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」を 1 錠投与した場合)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度<sup>5)</sup>：

ロスバスタチンカルシウム製剤であるロスバスタチン錠 5mg 「アメル」、OD 錠 5mg 「アメル」の医薬品製造販売承認申請を行うに当たり、ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」、OD 錠 5mg 「アメル」又は標準製剤を健康成人男子に単回経口投与し、血漿中の未変化体濃度を測定して、薬物動態から両製剤の生物学的同等性を検証した。

治験デザイン	<p>「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について(平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号)」に準じ、非盲検下における 2 剤 2 期のクロスオーバー法を用いた。</p> <p><u>ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」</u> 初めの 4 泊 5 日の入院期間を第 I 期とし、2 回目の入院期間を第 II 期とした。なお、第 I 期と第 II の間の休薬期間は 8 日間以上とした。</p> <p><u>ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」</u> 初めの 3 泊 4 日の入院期間及び 72 時間後までの通所期間を第 I 期とし、2 回目の入院期間及び通所期間を第 II 期とした。なお、第 I 期と第 II の間の休薬期間は 10 日間以上とした。</p>
投与条件	<p><u>ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」</u> 健康成人男子 23 例(1 群 12 例、11 例)に対して 10 時間以上の絶食下において、1 錠中にロスバスタチンとして 5mg 含有するロスバスタチン錠 5mg 「アメル」1 錠又は標準製剤 1 錠を、150mL の水とともに単回経口投与した。</p> <p><u>ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」</u> (水なし) 健康成人男子 20 例(1 群 10 例)に対して 10 時間以上の絶食下において、1 錠中にロスバスタチンとして 5mg 含有するロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」1 錠を、水なしで唾液とともに単回経口投与、又は標準製剤(普通錠)を 150mL の水とともに単回経口投与した。</p> <p>(水あり) 健康成人男子 20 例(1 群 10 例)に対して 10 時間以上の絶食下において、1 錠中にロスバスタチンとして 5mg 含有するロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」1 錠、又は標準製剤(普通錠)を 150mL の水とともに単回経口投与した。</p>

採血時	ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」 第Ⅰ期及び第Ⅱ期ともに治験薬の投与前、投与後 1、2、3、4、5、6、7、8、12、24、48 及び 72 時間後の 13 時点 ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」 第Ⅰ期及び第Ⅱ期ともに治験薬の投与前、投与後 0.5、1、2、3、4、5、6、8、10、12、24、48 及び 72 時間後の 14 時点
分析法	LC/MS/MS 法

### ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」

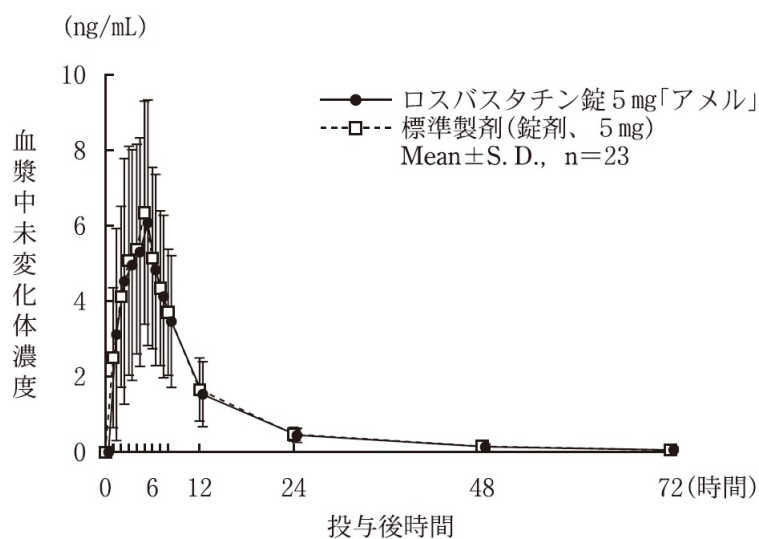
<薬物動態パラメータ>

	AUC <sub>(0→72)</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」	65.96±34.59	6.30±3.50	4.7±0.8	15.95±7.22
標準製剤 (錠剤、5mg)	68.42±30.22	6.54±3.15	4.4±1.1	14.80±3.89

(Mean±S.D.,n=23)

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。

	AUC <sub>(0→72)</sub>	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log(0.93)	log(0.93)
90%信頼区間	log(0.85)～log(1.02)	log(0.85)～log(1.03)



なお、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。

ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」

水なし

<薬物動態パラメータ>

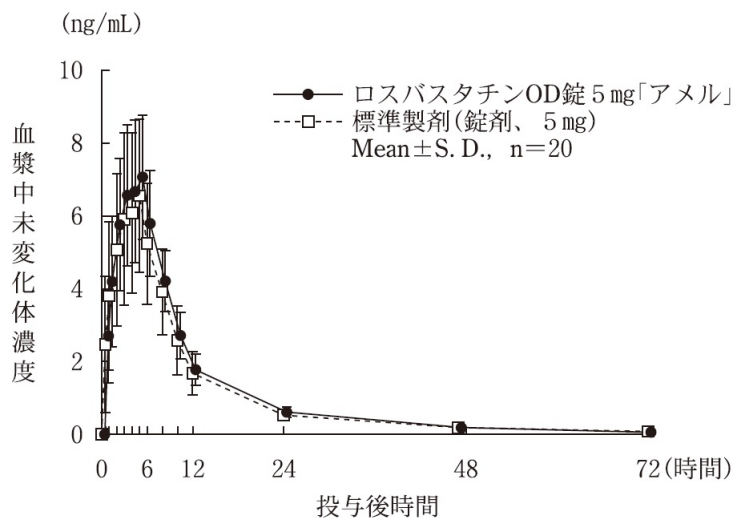
	AUC <sub>(0→72)</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」	81.56±17.09	7.28±1.78	4.4±1.1	14.4±2.9
標準製剤※ (錠剤、5mg)	75.31±23.25	6.87±2.23	4.4±1.2	18.2±6.5

※水で服用

(Mean±S.D.,n=20)

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。

	AUC <sub>(0→72)</sub>	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log(1.11)	log(1.08)
90%信頼区間	log(1.03)～log(1.20)	log(0.97)～log(1.20)



なお、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。



水あり

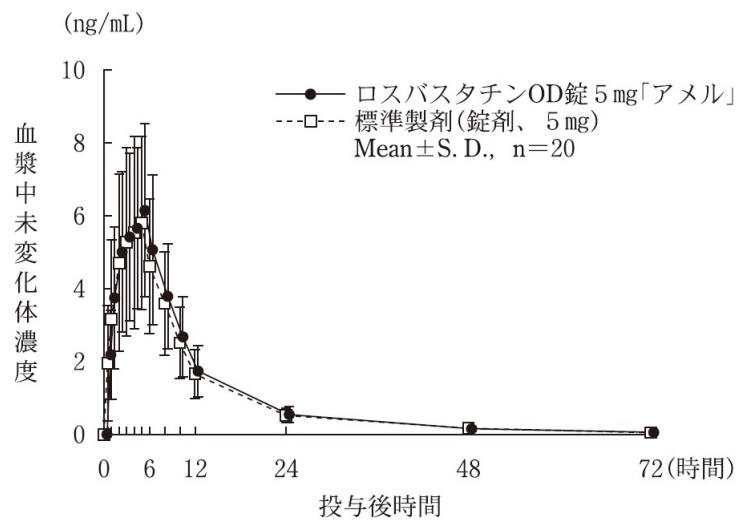
<薬物動態パラメータ>

	AUC <sub>(0→72)</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ロスバスタチン OD錠 5mg 「アメル」	72.76±26.81	6.39±2.34	4.6±1.0	16.2±10.2
標準製剤 (錠剤、5mg)	69.42±25.73	6.26±2.51	4.1±1.1	14.2±3.8

(Mean±S.D.,n=20)

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。

	AUC <sub>(0→72)</sub>	Cmax
2製剤間の対数変換値の差	log(1.06)	log(1.03)
90%信頼区間	log(0.99)～log(1.13)	log(0.95)～log(1.12)



なお、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。

(4) 中毒域：

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響：

「Ⅷ. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 7.相互作用」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 :

該当資料なし

(4) 消失速度定数 :

ロスバスタチン錠 5mg :  $0.04937 \pm 0.01572$  (hr<sup>-1</sup>)

ロスバスタチン OD 錠 5mg : 水なし  $0.0499 \pm 0.0089$  (hr<sup>-1</sup>)

水あり  $0.0511 \pm 0.0169$  (hr<sup>-1</sup>)

(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

該当資料なし

## 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 :

該当資料なし

<参考>

妊娠中の投与に関する安全性は確立していないが、ラットに他の HMG-CoA 還元酵素阻害剤を大量投与した場合に胎児の骨格奇形が報告されている。更にヒトでは、他の HMG-CoA 還元酵素阻害剤で、妊娠 3 ヶ月までの間に服用したとき、胎児に先天性奇形があらわれたとの報告がある。

(3) 乳汁への移行性 :

該当資料なし

<参考:ラット>

ラットで乳汁中への移行が報告されている。

(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 :

該当資料なし

(2) 代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種 :

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比率 :

該当資料なし

(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ :

該当資料なし

## 6. 排泄

(1) 排泄部位及び経路 :

該当資料なし

(2) 排泄率 :

該当資料なし

(3) 排泄速度 :

該当資料なし

## 7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率

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

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) 肝機能が低下していると考えられる以下のような患者  
急性肝炎、慢性肝炎の急性増悪、肝硬変、肝臓、黄疸[これらの患者では、本剤の血中濃度が上昇するおそれがある。また、本剤は主に肝臓に分布して作用するので、肝障害を悪化させるおそれがある。]
- (3) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人及び授乳婦(「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照)
- (4) シクロスポリンを投与中の患者(「相互作用」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

#### 〈効能・効果に関連する使用上の注意〉

適用の前に十分な検査を実施し、高コレステロール血症であることを確認した上で本剤の適用を考慮すること。

### 4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

#### 〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

- (1) クレアチニンクリアランスが  $30\text{mL}/\text{min}/1.73\text{m}^2$  未満の患者に投与する場合には、 $2.5\text{mg}$  より投与を開始し、1日最大投与量は  $5\text{mg}$  とする。(「慎重投与」の項参照)
- (2) 特に  $20\text{mg}$  投与時においては腎機能に影響があらわれるおそれがある。 $20\text{mg}$  投与開始後 12 週までの間は原則、月に 1 回、それ以降は定期的(半年に 1 回等)に腎機能検査を行うなど、観察を十分に行うこと。
- (3) (OD 錠のみ)  
OD 錠は口腔内で崩壊するが、口腔粘膜からの吸収により効果発現を期待する製剤ではないため、崩壊後は唾液又は水で飲み込むこと。(「適用上の注意」の項参照)

## 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) 腎障害又はその既往歴のある患者[重度の腎障害のある患者では、本剤の血中濃度が高くなるおそれがある。一般に、HMG-CoA還元酵素阻害剤投与時にみられる横紋筋融解症の多くが腎機能障害を有する患者であり、また、横紋筋融解症に伴って急激な腎機能悪化があらわれることがある。](「用法・用量に関連する使用上の注意」の項参照)
- (2) アルコール中毒患者、肝障害又はその既往歴のある患者[本剤は主に肝臓に分布して作用するので、肝障害を悪化させるおそれがある。また、アルコール中毒患者では、横紋筋融解症があらわれやすいとの報告がある。](「禁忌」の項参照)
- (3) フィブラート系薬剤(ベザフィブラート等)、ニコチン酸、アゾール系抗真菌薬(イトラコナゾール等)、マクロライド系抗生物質(エリスロマイシン等)を投与中の患者[一般にHMG-CoA還元酵素阻害剤との併用で横紋筋融解症があらわれやすい。](「相互作用」の項参照)
- (4) 甲状腺機能低下症の患者、遺伝性の筋疾患(筋ジストロフィー等)又はその家族歴のある患者、薬剤性の筋障害の既往歴のある患者[横紋筋融解症があらわれやすいとの報告がある。]
- (5) 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) あらかじめ高コレステロール血症治療の基本である食事療法を行い、更に運動療法や高血圧、喫煙等の虚血性心疾患のリスクファクターの軽減等も十分考慮すること。
- (2) 腎機能に関する臨床検査値に異常が認められる患者に、本剤とフィブラート系薬剤を併用する場合には、治療上やむを得ないと判断される場合にのみ併用すること。急激な腎機能悪化を伴う横紋筋融解症があらわれやすい。やむを得ず併用する場合には、定期的に腎機能検査等を実施し、自覚症状(筋肉痛、脱力感)の発現、CK(CPK)上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇並びに血清クレアチニン上昇等の腎機能の悪化を認めた場合は直ちに投与を中止すること。
- (3) 投与中は血中脂質値を定期的に検査し、治療に対する反応が認められない場合には投与を中止すること。
- (4) 近位筋脱力、CK(CPK)高値、炎症を伴わない筋線維の壊死、抗HMG-CoA還元酵素(HMGCR)抗体陽性等を特徴とする免疫介在性壊死性ミオパチーがあらわれ、投与中止後も持続する例が報告されているので、患者の状態を十分に観察すること。なお、免疫抑制剤投与により改善がみられたとの報告例がある。(「重大な副作用」の項参照)
- (5) 投与開始又は増量後12週までの間は原則、月に1回、それ以降は定期的(半年に1回等)に肝機能検査を行うこと。

## 7. 相互作用

本剤は、OATP1B1及びBCRPの基質である。

(1) 併用禁忌とその理由：

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
シクロスポリン (サンディミュン、ネオオーラル等)	シクロスポリンを投与されている心臓移植患者に併用したとき、シクロスポリンの血中濃度に影響はなかったが、ロスバスタチンのAUC <sub>0-24h</sub> が健康成人に単独で反復投与したときに比べて約7倍上昇したとの報告がある。	シクロスポリンが OATP1B1 及び BCRP 等の機能を阻害する可能性がある。

(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
フィブラート系薬剤 ベザフィブラート等	フェノフィブラートとの併用においては、いずれの薬剤の血中濃度にも影響はみられていない。しかし一般に、HMG-CoA 還元酵素阻害剤との併用で、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し、急激な腎機能悪化を伴う横紋筋融解症があらわれやすい。	両剤共に横紋筋融解症の報告がある。 危険因子：腎機能に関する臨床検査値に異常が認められる患者
ニコチン酸	一般に、HMG-CoA 還元酵素阻害剤との併用で、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し、急激な腎機能悪化を伴う横紋筋融解症があらわれやすい。	危険因子：腎機能障害のある患者
アゾール系抗真菌薬 イトラコナゾール等		
マクロライド系抗生物質 エリスロマイシン等		
クマリン系抗凝血剤 ワルファリン	抗凝血作用が増強することがある。本剤を併用する場合は、本剤の投与開始時及び用量変更時にも頻回にプロトロンビン時間国際標準比 (INR) 値等を確認し、必要に応じてワルファリンの用量を調節する等、注意深く投与すること。	機序は不明
制酸剤 水酸化マグネシウム・水酸化アルミニウム	ロスバスタチンの血中濃度が約50%に低下することが報告されている。ロスバスタチン投与後2時間経過後に制酸剤を投与した場合には、ロスバスタチンの血中濃度は非併用時の約80%であった。	機序は不明

ロピナビル・リトナビル アタザナビル/リトナビル ダルナビル/リトナビル グレカプレビル・ピブレン タスビル	ロスバスタチンとロピナビル・リトナビルを併用したときロスバスタチンの AUC が約 2 倍、Cmax が約 5 倍、アタザナビル及びリトナビル両剤とロスバスタチンを併用したときロスバスタチンの AUC が約 3 倍、Cmax が 7 倍、ダルナビル及びリトナビル両剤とロスバスタチンを併用したときロスバスタチンの AUC が約 1.5 倍、Cmax が約 2.4 倍上昇したとの報告がある。またロスバスタチンとグレカプレビル・ピブレンタスビル <sup>注</sup> を併用したとき、ロスバスタチンの AUC が約 2.2 倍、Cmax が約 5.6 倍上昇したとの報告がある。	左記薬剤が OATP1B1 及び BCRP の機能を阻害する可能性がある。
ダクラタスビル アスナプレビル ダクラタスビル・アスナプレ ビル・ベクラブビル	ロスバスタチンとダクラタスビル、アスナプレビル、またはダクラタスビル・アスナプレビル・ベクラブビル <sup>注</sup> を併用したとき、ロスバスタチンの血中濃度が上昇したとの報告がある。	ダクラタスビル、ベクラブビルが OATP1B1、1B3 及び BCRP の機能を阻害する可能性がある。また、アスナプレビルが OATP1B1、1B3 の機能を阻害する可能性がある。
グラゾプレビル/エルバス ビル	ロスバスタチンとグラゾプレビル <sup>注</sup> 及びエルバスビルを併用したとき、本剤の AUC が約 2.3 倍、Cmax が約 5.5 倍上昇したとの報告がある。	左記薬剤が BCRP の機能を阻害する可能性がある。
ソホスビル・ベルパタ スビル	ロスバスタチンとベルパタスビルを併用したとき、本剤の AUC が約 2.7 倍、Cmax が約 2.6 倍上昇したとの報告がある。	ベルパタスビルが OATP1B1、1B3 及び BCRP の機能を阻害する可能性がある。
ダロルタミド	ロスバスタチンとダロルタミドを併用したとき、本剤の AUC が 5.2 倍 <sup>6)</sup> 、Cmax が 5.0 倍上昇したとの報告がある。	ダロルタミドが OATP1B1、1B3 及び BCRP の機能を阻害する可能性がある。
レゴラフェニブ	ロスバスタチンとレゴラフェニブを併用したとき、ロスバスタチンの AUC が 3.8 倍、Cmax が 4.6 倍上昇したとの報告がある。	レゴラフェニブが BCRP の機能を阻害する可能性がある。
カプマチニブ塩酸塩水和物	ロスバスタチンとカプマチニブ塩酸塩水和物を併用したとき、ロスバスタチンの AUC が約 2.1 倍、Cmax が約 3.0 倍上昇したとの報告がある。	カプマチニブ塩酸塩が BCRP の機能を阻害することにより、ロスバスタチンの血中濃度が増加する可能性がある。
バダデュスタット	ロスバスタチンとバダデュスタットを併用したとき、ロスバスタチンの AUC が約 2.5 倍、Cmax が約 2.7 倍上昇したとの報告がある。	バダデュスタットが BCRP の機能を阻害することにより、ロスバスタチンの血中濃度が増加する可能性がある。
フェブキソスタット	本剤とフェブキソスタットを併用したとき、本剤の AUC が約 1.9 倍、Cmax が約 2.1 倍上昇したとの報告がある。	フェブキソスタットが BCRP の機能を阻害することにより、本剤の血中濃度が増加する可能性がある。



エルトロンボパグ	ロスバスタチンとエルトロンボパグを併用したとき、ロスバスタチンのAUCが約1.6倍上昇したとの報告がある。	エルトロンボパグがOATP1B1及びBCRPの機能を阻害する可能性がある。
----------	-------------------------------------------------------	---------------------------------------

注) 承認用量外の用量における試験結果に基づく。

## 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：

#### 重大な副作用(頻度不明)

- 1)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、急性腎障害等の重篤な腎障害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すること。
- 2)ミオパチー：ミオパチーがあらわれることがあるので、広範な筋肉痛、高度な脱力感や著明なCK（CPK）の上昇があらわれた場合には投与を中止すること。
- 3)免疫介在性壊死性ミオパチー：免疫介在性壊死性ミオパチー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。
- 4)肝炎、肝機能障害、黄疸：肝炎、AST（GOT）、ALT（GPT）の上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、定期的に肝機能検査等の観察を十分に行い、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。
- 5)血小板減少：血小板減少があらわれることがあるので、血液検査等の観察を十分に行い、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)過敏症状：血管浮腫を含む過敏症状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、適切な処置を行うこと。
- 7)間質性肺炎：間質性肺炎があらわれることがあるので、長期投与であっても、発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X線異常等が認められた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。
- 8)末梢神経障害：四肢の感覚鈍麻、しびれ感等の感覚障害、疼痛、あるいは筋力低下等の末梢神経障害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投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 9)多形紅斑：多形紅斑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) その他の副作用：

その他の副作用	
	頻度不明
皮膚 <sup>注1)</sup>	そう痒症、発疹、蕁麻疹
消化器	腹痛、便秘、嘔気、下痢、膵炎、口内炎
筋・骨格系	CK（CPK）上昇、無力症、筋肉痛、関節痛、筋痙攣
精神神経系	頭痛、浮動性めまい、健忘、睡眠障害（不眠、悪夢等）、抑うつ
内分泌	女性化乳房
代謝異常	HbA1c 上昇、血糖値上昇
肝臓	肝機能異常（AST（GOT）上昇、ALT（GPT）上昇）
腎臓	蛋白尿 <sup>注2)</sup> 、腎機能異常（BUN 上昇、血清クレアチニン上昇）

注 1) 症状が認められた場合には投与を中止すること。  
注 2) 通常一過性であるが、原因不明の蛋白尿が持続する場合には減量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

**重大な副作用（頻度不明）**

6) 過敏症状：血管浮腫を含む過敏症状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、適切な処置を行うこと。

9. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下していることが多いので、患者の状態を観察しながら投与すること。また、横紋筋融解症があらわれやすいとの報告がある。  
なお、他社が実施した臨床試験では高齢者と非高齢者においてロスバスタチンの血漿中濃度に明らかな差は認められていない。

#### 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。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していないが、ラットに他の HMG-CoA 還元酵素阻害剤を大量投与した場合に胎児の骨格奇形が報告されている。更にヒトでは、他の HMG-CoA 還元酵素阻害剤で、妊娠 3 ヶ月までの間に服用したとき、胎児に先天性奇形があらわれたとの報告がある。]
- (2) 授乳中の婦人には投与しないこと。[ラットで乳汁中への移行が報告されている。]

#### 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(使用経験が少ない)。

#### 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

##### (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、更には穿孔を起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。]

##### (2) 服用時(OD 錠のみ)：

OD 錠は舌の上に乗せ、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。

#### 15. その他の注意

海外において、ロスバスタチンを含む HMG-CoA 還元酵素阻害剤投与中の患者では、糖尿病発症のリスクが高かったとの報告がある。

#### 16. その他

該当資料なし

---

## 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) :

該当資料なし

(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：処方箋医薬品(注意－医師等の処方箋により使用すること)

有効成分：該当しない

### 2. 有効期間又は使用期限

使用期限(安定性試験結果に基づく)

錠 : 3年

OD錠 : 2年

### 3. 貯法・保存条件

錠 : 気密容器、室温保存(開封後は湿気を避けて保存すること)

OD錠 : 遮光、気密容器、室温保存(開封後は光、湿気を避けて保存すること)

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱い上の留意点について :

〈安定性試験)<sup>2)</sup>

錠 : 最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月)の結果、ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」・錠 5mg 「アメル」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。

OD錠 : 最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度 60%、18 ヶ月)及び加速試験(40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月)の結果、ロスバスタチン OD錠 2.5mg 「アメル」・OD錠 5mg 「アメル」は通常の市場流通下において 2 年間安定であることが推測された。

#### (2) 薬剤交付時の取り扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等) :

くすりのしおり : 有り、患者向医薬品ガイド : 有り

「VIII. 安全性(使用上の注意等)」に関する項目 14.適用上の注意」参照

#### (3) 調剤時の留意点について :

該当資料なし

### 5. 承認条件等

該当しない

## 6. 包装

ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」 : PTP100 錠(10 錠×10)  
ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」 : PTP100 錠(10 錠×10)  
ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「アメル」 : PTP100 錠(10 錠×10) 、 PTP140 錠(14 錠×10)  
ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「アメル」 : PTP100 錠(10 錠×10) 、 PTP140 錠(14 錠×10)

## 7. 容器の材質

錠

PTP 包装:ポリプロピレンフィルム+アルミニウム箔、アルミニウム袋、乾燥剤

OD 錠

PTP 包装:ポリプロピレンフィルム+アルミニウム箔、アルミニウム袋

PTP サイズ

	10 錠シート (mm)	14 錠シート (mm)
ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」	31×83	—
ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」	35×88	—
ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「アメル」	31×84	31×114
ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」	37×94	37×114

## 8. 同一成分・同効薬

同一成分 : クレストール錠 2.5mg・錠 5mg、クレストール OD 錠 2.5mg・OD 錠 5mg  
(アストラゼネカ(株)=塩野義製薬(株))

同効薬 : シンバスタチン、プラバスタチンナトリウム、フルバスタチンナトリウム、アトルバスタチン、ピタバスタチン

## 9. 国際誕生年月日

2002 年 11 月 6 日

## 10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日

2017 年 8 月 15 日

承認番号

ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」 : 22900AMX00665  
ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」 : 22900AMX00666  
ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「アメル」 : 22900AMX00846  
ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」 : 22900AMX00847

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、投薬期間に関する制限は定められていない。

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
ロスバスタチン錠 2.5mg「アメル」	126006901	2189017F1090	622600601
ロスバスタチン錠 5mg「アメル」	126007601	2189017F2096	622600701
ロスバスタチン OD 錠 2.5mg「アメル」	126008301	2189017F3017	622600801
ロスバスタチン OD 錠 5mg「アメル」	126009001	2189017F4013	622600901

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

---

## X I . 文献

---

### 1. 引用文献

- 1) グッドマン・ギルマン薬理書 第12版, 廣川書店, 1136 (2013)
- 2) 共和薬品工業株式会社 社内資料: 安定性試験
- 3) 共和薬品工業株式会社 社内資料: 安定性試験(無包装)
- 4) 共和薬品工業株式会社 社内資料: 溶出試験
- 5) 共和薬品工業株式会社 社内資料: 生物学的同等性試験
- 6) Zurth, C., et al. : Eur J Drug Metab Pharmacokinet., 44 (6), 747-59 (2019)

### 2. その他の参考文献

該当資料なし



---

## X II. 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

該当資料なし

### XIII. 備考

#### その他の関連資料

調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

#### (1) 粉砕

##### ロスバスタチン錠 2.5mg 「アメル」

粉砕状態における安定性は、25°C75%RHの湿度条件下において90日目までいずれの試験項目においても規格値の範囲内であったが、光条件下において、6000 lx・hrで含量が規格外となった。

湿度(25±2°C、75±5%RH、遮光・ポリセロ分包)

試験項目	錠剤の規格値	開始時	30日目	60日目	90日目
性状	うすい赤みの黄色からくすんだ赤みの黄色のフィルムコーティング錠	くすんだ赤みの黄色の被膜及び白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量法 <sup>*1</sup>	95.0～105.0%	100.7	100.7	98.6	99.8

※1.3回の平均値(%)

光(25±2°C、48000 lx・hr、ポリセロ分包)

試験項目	錠剤の規格値	開始時	6時間 (6000 lx・hr)	18時間 (18000 lx・hr)	24時間 (24000 lx・hr)	48時間 (48000 lx・hr)
性状	うすい赤みの黄色からくすんだ赤みの黄色のフィルムコーティング錠	くすんだ赤みの黄色の被膜及び白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
定量法 <sup>*1</sup>	95.0～105.0%	100.7	93.1 (規格外)	88.1 (規格外)	86.8 (規格外)	76.9 (規格外)

※1.3回の平均値(%)

**ロスバスタチン錠 5mg 「アメル」**

粉碎状態における安定性は、25°C75%RHの湿度条件下において90日目までいずれの試験項目においても規格値の範囲内であったが、光条件下において、6000 lx・hrで含量が規格外となった。

**湿度(25±2°C、75±5%RH、遮光・ポリセロ分包)**

試験項目	錠剤の規格値	開始時	30日目	60日目	90日目
性状	うすい赤みの黄色からくすんだ赤みの黄色のフィルムコーティング錠	くすんだ赤みの黄色の被膜及び白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
定量法 <sup>※1</sup>	95.0～105.0%	97.7	97.3	99.8	100.0

※1.3回の平均値(%)

**光(25±2°C、48000 lx・hr、ポリセロ分包)**

試験項目	錠剤の規格値	開始時	6時間 (6000 lx・hr)	18時間 (18000 lx・hr)	24時間 (24000 lx・hr)	48時間 (48000 lx・hr)
性状	うすい赤みの黄色からくすんだ赤みの黄色のフィルムコーティング錠	くすんだ赤みの黄色の被膜及び白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
定量法 <sup>※1</sup>	95.0～105.0%	97.7	94.5 (規格外)	91.2 (規格外)	86.5 (規格外)	84.3 (規格外)

※1.3回の平均値(%)

### ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「アメル」

粉砕状態における安定性は、湿度(25°C75%RH、30日)、温度(40°C、30日)の各条件下において、いずれの試験項目においても規格値の範囲内であったが、光(3000 lx・hr)条件下で純度試験が規格外となった。

#### 湿度(25±2°C、75±5%RH、遮光・開放)

試験項目	錠剤の規格値	開始時	7日目	14日目	30日目
性状	うすい黄色のフィルムコーティング錠	うすい黄色のフィルム片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	類縁物質 <sup>※1</sup>	適合	適合	適合	適合
定量法 <sup>※2</sup>	95.0～105.0%	98.8	96.2	96.3	96.1

※1. 規格値：RRT 約 1.6 及び約 1.8：0.3%以下、その他：0.2%以下、総類縁物質：1.0%以下

※2. 3回の平均値(%)

#### 温度(40±2°C、75±5%RH、遮光・気密容器)

試験項目	錠剤の規格値	開始時	7日目	14日目	30日目
性状	うすい黄色のフィルムコーティング錠	うすい黄色のフィルム片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	類縁物質 <sup>※1</sup>	適合	適合	適合	適合
定量法 <sup>※2</sup>	95.0～105.0%	98.8	98.5	98.8	98.9

※1. 規格値：RRT 約 1.6 及び約 1.8：0.3%以下、その他：0.2%以下、総類縁物質：1.0%以下

※2. 3回の平均値(%)

#### 光(25±2°C、45±5%RH、3000 lx・hr、開放)

試験項目	錠剤の規格値	開始時	1時間 (1000 lx・hr)	2時間 (2000 lx・hr)	3時間 (3000 lx・hr)
性状	うすい黄色のフィルムコーティング錠	うすい黄色のフィルム片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	類縁物質 <sup>※1</sup>	適合	適合	適合	不適 (規格外)
定量法 <sup>※2</sup>	95.0～105.0%	98.8	97.7	97.3	96.5

※1. 規格値：RRT 約 1.6 及び約 1.8：0.3%以下、その他：0.2%以下、総類縁物質：1.0%以下

※2. 3回の平均値(%)

### ロスバスタチン OD 錠 5mg 「アメル」

粉砕状態における安定性は、湿度(25°C75%RH、30日)、温度(40°C、30日)の各条件下において、いずれの試験項目においても規格値の範囲内であったが、光(3000 lx・hr)条件下で純度試験が規格外となった。

#### 湿度(25±2°C、75±5%RH、遮光・開放)

試験項目	錠剤の規格値	開始時	7日目	14日目	30日目
性状	うすい黄色のフィルムコーティング錠	うすい黄色のフィルム片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	類縁物質 <sup>※1</sup>	適合	適合	適合	適合
定量法 <sup>※2</sup>	95.0～105.0%	99.0	96.4	96.8	96.7

※1. 規格値：RRT 約 1.6 及び約 1.8：0.3%以下、その他：0.2%以下、総類縁物質：1.0%以下

※2. 3回の平均値(%)

#### 温度(40±2°C、75±5%RH、遮光・気密容器)

試験項目	錠剤の規格値	開始時	7日目	14日目	30日目
性状	うすい黄色のフィルムコーティング錠	うすい黄色のフィルム片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	類縁物質 <sup>※1</sup>	適合	適合	適合	適合
定量法 <sup>※2</sup>	95.0～105.0%	99.0	98.9	98.8	99.5

※1. 規格値：RRT 約 1.6 及び約 1.8：0.3%以下、その他：0.2%以下、総類縁物質：1.0%以下

※2. 3回の平均値(%)

#### 光(25±2°C、45±5%RH、3000 lx・hr、開放)

試験項目	錠剤の規格値	開始時	1時間 (1000 lx・hr)	2時間 (2000 lx・hr)	3時間 (3000 lx・hr)
性状	うすい黄色のフィルムコーティング錠	うすい黄色のフィルム片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	類縁物質 <sup>※1</sup>	適合	適合	適合	不適 (規格外)
定量法 <sup>※2</sup>	95.0～105.0%	99.0	98.2	97.4	98.0

※1. 規格値：RRT 約 1.6 及び約 1.8：0.3%以下、その他：0.2%以下、総類縁物質：1.0%以下

※2. 3回の平均値(%)

## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

試験方法等は「経管投与ハンドブック第2版」(執筆 倉田なおみ(昭和大学薬学部教育推進センター准教授)、(株)じほう、2006)を参考にした。

使用器具：

### ロスバスタチン錠

テルモシリンジラテックスフリー(20 mL)(テルモ製)

ニューエンテラルフィーディングチューブ(8 Fr.、120 cm)(日本シャーウッド製)

### ロスバスタチン OD 錠

ディスペンサー

経管栄養チューブ(8 Fr.)

試験方法：

シリンジ内に錠剤をそのまま1個入れてピストンを戻し、シリンジに55℃の湯20 mLを吸い取り放置し、5分及び10分後にシリンジを手で90度15往復横転し、崩壊懸濁の状況を観察する。

得られた懸濁液を経管栄養用カテーテルの注入端より、約2～3 mL/secの速度で注入し、通過性を観察する。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端から3分の2を水平にし、他端(注入端)を30 cmの高さにセットする。注入後に適量の水を注入してチューブ内を洗うとき、チューブ内に残存物がみられなければ、通過性に問題なしとする。

結果：

ロスバスタチン錠 2.5mg「アメル」：水(約55℃)、5分、8 Fr.チューブを通過した。

ロスバスタチン錠 5mg「アメル」：水(約55℃)、5分、8 Fr.チューブを通過した。

ロスバスタチン OD 錠 2.5mg「アメル」：水(約55℃)、5分、8 Fr.チューブを通過した。

ロスバスタチン OD 錠 5mg「アメル」：水(約55℃)、5分、8 Fr.チューブを通過した。