

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 に準拠し作成

HMG-CoA 還元酵素阻害剤

日本薬局方 ロスバスタチンカルシウム錠
ロスバスタチン錠2.5mg「科研」
ロスバスタチン錠5mg「科研」

ロスバスタチンOD錠2.5mg「科研」
ロスバスタチンOD錠5mg「科研」

ROSUVASTATIN

剤形	ロスバスタチン錠「科研」：フィルムコーティング錠 ロスバスタチン OD 錠「科研」：フィルムコーティング錠 (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	ロスバスタチン錠 2.5mg「科研」・ロスバスタチン OD 錠 2.5mg「科研」： 1錠中に日本薬局方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「科研」・ロスバスタチン OD 錠 5mg「科研」： 1錠中に日本薬局方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 (JAN) 洋名：Rosuvastatin Calcium (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：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	発売元：科研製薬株式会社 製造販売元：ダイト株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問合せ窓口	科研製薬株式会社 医薬品情報サービス室 TEL：0120-519-874 受付時間：9:00～17:00（土、日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ： https://www.kaken.co.jp/

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、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 ー日本病院薬剤師会ー

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 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、医薬品医療機器総合機構ホームページ (<https://www.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、薬価基準収載に合わせて 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	9. 製剤中の有効成分の確認試験法	11
1. 開発の経緯	1	10. 製剤中の有効成分の定量法	11
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	11. 力価	11
II. 名称に関する項目	2	12. 混入する可能性のある夾雑物	12
1. 販売名	2	13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	12
(1) 和名	2	14. その他	12
(2) 洋名	2	V. 治療に関する項目	13
(3) 名称の由来	2	1. 効能又は効果	13
2. 一般名	2	2. 用法及び用量	13
(1) 和名(命名法)	2	3. 臨床成績	13
(2) 洋名(命名法)	2	(1) 臨床データパッケージ	13
(3) ステム	2	(2) 臨床効果	13
3. 構造式又は示性式	2	(3) 臨床薬理試験	13
4. 分子式及び分子量	2	(4) 探索的試験	13
5. 化学名(命名法)	2	(5) 検証的試験	13
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	(6) 治療的使用	13
7. CAS登録番号	3	VI. 薬効薬理に関する項目	14
III. 有効成分に関する項目	4	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	14
1. 物理化学的性質	4	2. 薬理作用	14
(1) 外観・性状	4	(1) 作用部位・作用機序	14
(2) 溶解性	4	(2) 薬効を裏付ける試験成績	14
(3) 吸湿性	4	(3) 作用発現時間・持続時間	14
(4) 融点(分解点)、沸点、凝固点	4	VII. 薬物動態に関する項目	15
(5) 酸塩基解離定数	4	1. 血中濃度の推移・測定法	15
(6) 分配係数	4	(1) 治療上有効な血中濃度	15
(7) その他の主な示性値	4	(2) 最高血中濃度到達時間	15
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	15
3. 有効成分の確認試験法	4	(4) 中毒域	17
4. 有効成分の定量法	4	(5) 食事・併用薬の影響	17
IV. 製剤に関する項目	5	(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	17
1. 剤形	5	2. 薬物速度論的パラメータ	17
(1) 剤形の区別、外観及び性状	5	(1) 解析方法	17
(2) 製剤の物性	5	(2) 吸収速度定数	17
(3) 識別コード	5	(3) バイオアベイラビリティ	18
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び安定なpH域等	5	(4) 消失速度定数	18
2. 製剤の組成	5	(5) クリアランス	18
(1) 有効成分(活性成分)の含量	5	(6) 分布容積	18
(2) 添加物	6	(7) 血漿蛋白結合率	18
(3) その他	6	3. 吸収	18
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	6	4. 分布	18
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	(1) 血液-脳関門通過性	18
5. 調製法及び溶解後の安定性	6	(2) 血液-胎盤関門通過性	18
6. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	6	(3) 乳汁への移行性	18
7. 溶出性	7	(4) 髄液への移行性	19
8. 生物学的試験法	11		

(5) その他の組織への移行性	19	2. 毒性試験	26
5. 代謝	19	(1) 単回投与毒性試験	26
(1) 代謝部位及び代謝経路	19	(2) 反復投与毒性試験	26
(2) 代謝に関与する酵素 (CYP450 等) の分子種	19	(3) 生殖発生毒性試験	26
(3) 初回通過効果の有無及びその割合	19	(4) その他の特殊毒性	26
(4) 代謝物の活性の有無及び比率	19	X. 管理的事項に関する項目	27
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ	19	1. 規制区分	27
6. 排泄	19	2. 有効期間又は使用期限	27
(1) 排泄部位及び経路	19	3. 貯法・保存条件	27
(2) 排泄率	19	4. 薬剤取扱い上の注意点	27
(3) 排泄速度	19	(1) 薬局での取扱い上の留意点について	27
7. トランスポーターに関する情報	19	(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)	27
8. 透析等による除去率	19	(3) 調剤時の留意点について	27
VIII. 安全性 (使用上の注意等) に関する項目	20	5. 承認条件等	27
1. 警告内容とその理由	20	6. 包装	27
2. 禁忌内容とその理由 (原則禁忌を含む)	20	7. 容器の材質	28
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	20	8. 同一成分・同効薬	28
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	20	9. 国際誕生年月日	28
5. 慎重投与内容とその理由	20	10. 製造販売承認年月日及び承認番号	28
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	20	11. 薬価基準収載年月日	28
7. 相互作用	21	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	28
(1) 併用禁忌とその理由	21	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	28
(2) 併用注意とその理由	21	14. 再審査期間	28
8. 副作用	23	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	28
(1) 副作用の概要	23	16. 各種コード	29
(2) 重大な副作用と初期症状	23	17. 保険給付上の注意	29
(3) その他の副作用	23	XI. 文献	30
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧	23	1. 引用文献	30
(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	24	2. その他の参考文献	30
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法	24	XII. 参考資料	31
9. 高齢者への投与	24	1. 主な外国での発売状況	31
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与	24	2. 海外における臨床支援情報	31
11. 小児等への投与	24	XIII. 備考	32
12. 臨床検査結果に及ぼす影響	24	1. その他の関連資料	32
13. 過量投与	24	(1) GS1 コード	32
14. 適用上の注意	24		
15. その他の注意	25		
16. その他	25		
IX. 非臨床試験に関する項目	26		
1. 薬理試験	26		
(1) 薬効薬理試験	26		
(2) 副次的薬理試験	26		
(3) 安全性薬理試験	26		
(4) その他の薬理試験	26		

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 還元酵素阻害剤に分類される高脂血症治療剤であり、本邦においては 2005 年に上市され、広く臨床で使用されている。

ロスバスタチン錠 2.5mg「科研」、同錠 5mg「科研」及びロスバスタチン OD 錠 2.5mg「科研」、同 OD 錠 5mg「科研」は、ロスバスタチンカルシウムを主成分とする後発医薬品としてダイト株式会社が開発を企画し、薬食発 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき、規格及び試験方法を設定、加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2017 年 8 月に製造販売承認を取得した。

なお、ロスバスタチンカルシウム及びロスバスタチンカルシウム錠は第十八改正日本薬局方に収載された。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- 1)錠剤には識別性向上のため「製品名」、「含量」を印字している。
- 2)ロスバスタチン OD 錠 2.5mg・5mg「科研」は水なしでも服用可能な口腔内崩壊錠であり、フィルムコーティング錠とすることで光安定性が向上している。
- 3)PTP シートはピッチ印刷の採用により 1 錠単位で「製品名」、「含量」を判りやすく表示しており、PTP シート裏面は視認性を高めるため白地にして GS-1 コードを表示している。

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

(2) 洋 名

Rosuvastatin Calcium Tablets 2.5mg 「KAKEN」
Rosuvastatin Calcium Tablets 5mg 「KAKEN」
Rosuvastatin Calcium OD Tablets 2.5mg 「KAKEN」
Rosuvastatin Calcium OD Tablets 5mg 「KAKEN」

(3) 名称の由来

「有効成分名」 + 「剤形」 + 「規格」 + 「屋号」 より命名。

2. 一般名

(1) 和 名 (命名法)

ロスバスタチンカルシウム (JAN)

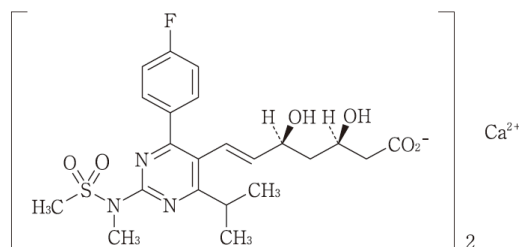
(2) 洋 名 (命名法)

Rosuvastatin Calcium (JAN, INN)

(3) ステム

-vastatin (HMG-CoA 還元酵素阻害作用を有する高脂血症治療剤)

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $(\text{C}_{22}\text{H}_{27}\text{FN}_3\text{O}_6\text{S})_2\text{Ca}$

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-(1-methylethyl)-2- [methyl (methylsulfonyl) 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

アセトニトリルに溶けやすく、メタノールにやや溶けやすく、水又はエタノール (99.5) に溶けにくい。

(3) 吸湿性

本品は吸湿性である。

(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

日本薬局方「ロスバスタチンカルシウム」の確認試験法による。

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

4. 有効成分の定量法













日本薬局方「ロスバスタチンカルシウム」の定量法による。

- ・液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別、外観及び性状

製品名	性状	外形			サイズ・重量
		表面	裏面	側面	
ロスバスタチン錠 2.5mg「科研」	白色から帯黄白色のフィルムコーティング錠				直径：6.1mm 厚さ：2.5mm 重量：80mg
ロスバスタチン錠 5mg「科研」	白色から帯黄白色のフィルムコーティング錠				直径：7.1mm 厚さ：3.6mm 重量：158mg
ロスバスタチン OD錠2.5mg「科研」	うすい黄色のフィルムコーティング錠				直径：5.6mm 厚さ：3.1mm 重量：77.5mg
ロスバスタチン OD錠5mg「科研」	うすい黄色のフィルムコーティング錠				直径：7.2mm 厚さ：3.6mm 重量：154mg

(2) 製剤の物性

[ロスバスタチン錠 2.5mg「科研」、同錠 5mg「科研」]

該当資料なし

[ロスバスタチン OD錠 2.5mg「科研」、同 OD錠 5mg「科研」]

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の「即放性製剤」の項により試験を行うとき、1分以内に崩壊する。

(3) 識別コード

該当しない

(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

[ロスバスタチン錠 2.5mg「科研」、同 OD錠 2.5mg「科研」]

1錠中に日本薬局方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「科研」、同 OD錠 5mg「科研」]

1錠中に日本薬局方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 「科研」、同錠 5mg 「科研」]

乳糖水和物、リン酸水素カルシウム水和物、結晶セルロース、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、プロピレングリコール、酸化チタン、カルナウバロウ

[ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」、同 OD 錠 5mg 「科研」]

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、1-メントール、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、ステアリン酸マグネシウム

(3) その他

特になし

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

[ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」、同錠 5mg 「科研」]

最終包装製品を用いた長期保存試験及び加速試験の結果、通常の流通過程で少なくとも3年間の品質保証は可能であると判断した¹⁾。

製品名	保存条件	包装形態	保存期間	結果
ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」 ロスバスタチン錠 5mg 「科研」	40±1℃ 75±5%RH	PTP 包装	6 ヶ月	適合 ^{*1}
	25±2℃ 60±5%RH	PTP 包装	36 ヶ月	適合 ^{*1}

※1: 性状、確認試験、純度試験、製剤均一性試験 (含量均一性試験)、溶出性、定量

[ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」、同 OD 錠 5mg 「科研」]

最終包装製品を用いた長期保存試験及び加速試験の結果、通常の市場流通下において2年間安定であることが推定された¹⁾。

製品名	保存条件	包装形態	保存期間	結果
ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」 ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」	40±2℃ 75±5%RH	PTP 包装	6 ヶ月	適合 ^{*2}
	25±2℃ 60±5%RH	PTP 包装	18 ヶ月	適合 ^{*2}

※2: 性状、確認試験、純度試験、製剤均一性試験 (含量均一性試験)、崩壊性、溶出性、定量

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当資料なし

6. 他剤との配合変化 (物理化学的変化)

該当資料なし

7. 溶出性

[日本薬局方に基づく試験]

ロスバスタチン錠 2.5mg「科研」及びロスバスタチン錠 5mg「科研」は、日本薬局方医薬品各条に定められたロスバスタチンカルシウム錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

[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 日改正 薬食審査発 0229 第 10 号 別紙 1）（錠 5mg、OD 錠 5mg）、及び含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日改正 薬食審査発 0229 第 10 号 別紙 2）（錠 2.5mg、OD 錠 2.5mg）に基づく試験]

(1) ロスバスタチン錠 5mg「科研」

①被験薬剤

試験製剤：ロスバスタチン錠 5mg「科研」

標準製剤：1 錠中にロスバスタチン 5mg を含有する製剤

②試験条件

試験法：日本薬局方一般試験法溶出試験法 パドル法

試験液量：900mL

測定方法：液体クロマトグラフィー

各種条件：

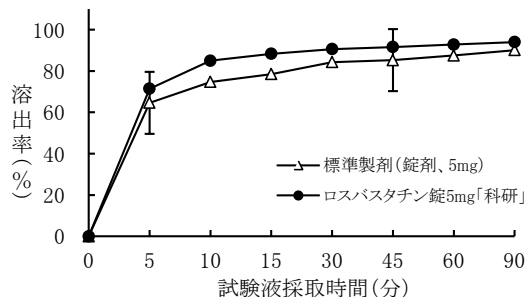
試験液	サンプリング時間（分）	回転数
pH1.2	5,10,15,30,45,60,90	50rpm
pH3.0	5,10,15,30,45,60,90,120,180	
pH6.8	5,10,15,30,45	
水	5,10,15,30,45	
pH3.0	5,10,15	100rpm
試験液温	37.0±0.5℃	
ベッセル数	12 ベッセル	

③試験結果：ロスバスタチン錠 5mg「科研」の溶出挙動は、いずれの試験液においても「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の基準の範囲内であり、試験製剤と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断された²⁾。

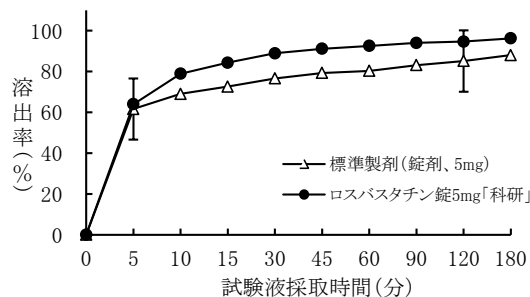
IV. 製剤に関する項目

[ロスバスタチン錠 5mg 「科研」と標準製剤の各種条件下における溶出挙動]

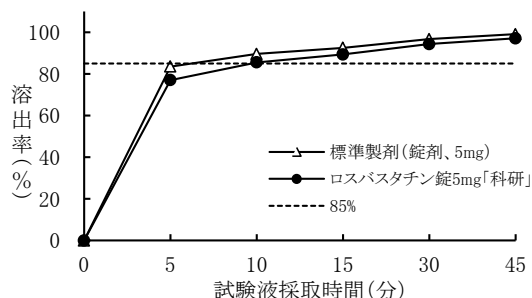
pH1.2, 50rpm



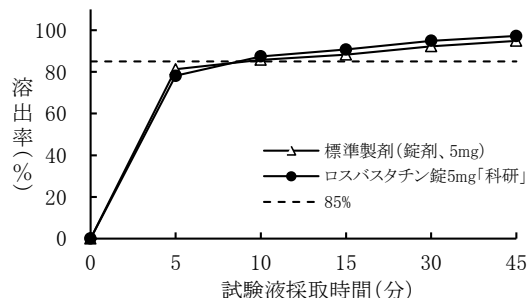
pH3.0, 50rpm



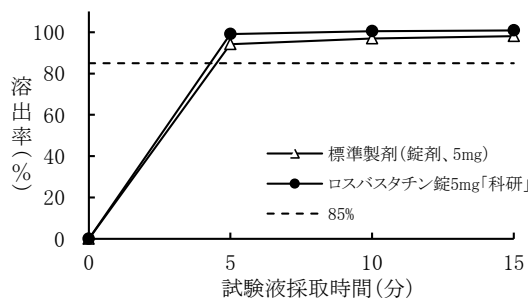
pH6.8, 50rpm



水, 50rpm



pH3.0, 100rpm



(2) ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」

①被験薬剤

試験製剤：ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」

標準製剤：ロスバスタチン錠 5mg 「科研」

②試験条件

試験法：日本薬局方一般試験法溶出試験法 パドル法

試験液量：900mL

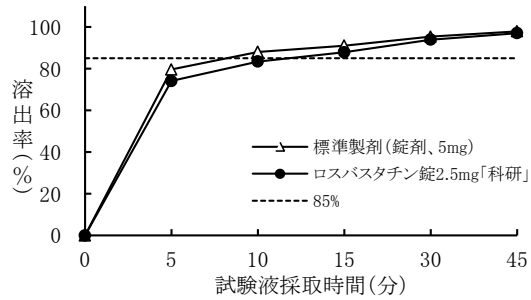
測定方法：液体クロマトグラフィー

各種条件：

試験液	サンプリング時間 (分)	回転数
pH6.8	5,10,15,30,45	50rpm
試験液温	37.0±0.5℃	
ベッセル数	12 ベッセル	

③試験結果：ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」は、「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」に基づき、ロスバスタチン錠 5mg 「科研」を標準製剤としたとき、全ての試験条件において溶出挙動が同等と判定されたため、生物学的に同等とみなされた²⁾。

[ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」と標準製剤の各種条件下における溶出挙動]
pH6.8, 50rpm



(3) ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」

①被験薬剤

試験製剤：ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」

標準製剤：1錠中にロスバスタチン 5mg を含有する製剤

②試験条件

試験法：日本薬局方一般試験法溶出試験法 パドル法

試験液量：900mL

測定方法：液体クロマトグラフィー

各種条件：

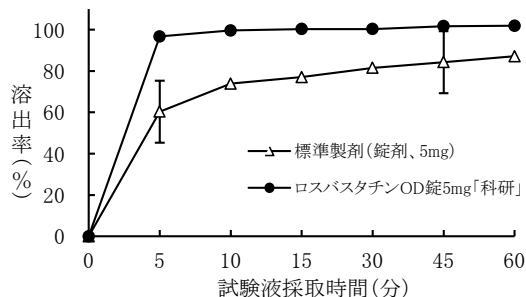
試験液	サンプリング時間 (分)	回転数
pH1.2	5,10,15,30,45,60	50rpm
pH4.0	5,10,15,30,45,60,90	
pH6.8	5,10,15,30,45	
水	5,10,15,30	
pH4.0	5,10,15,30	100rpm
試験液温	37.0±0.5℃	
ベッセル数	12 ベッセル	

③試験結果：「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」に従って溶出試験を実施した結果、ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」は標準製剤と溶出挙動の類似性が得られなかった²⁾。しかしながら、前述のガイドラインにおいて、「溶出試験による類似性の判定は、生物学的に同等であることを意味するものではない」とされており、健康成人男子を対象とした生物学的同等性試験（「VII-1. (3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照）にて、両製剤は生物学的に同等であることが確認されている³⁾。

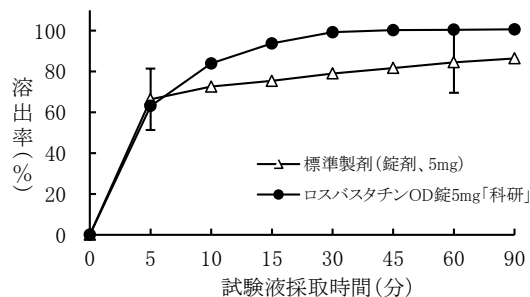
IV. 製剤に関する項目

[ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」 と標準製剤の各種条件下における溶出挙動]

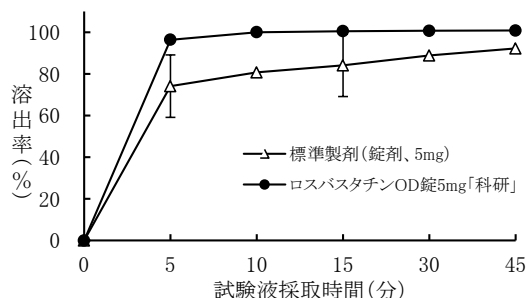
pH1.2, 50rpm



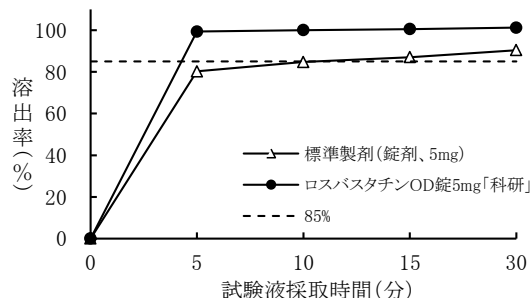
pH4.0, 50rpm



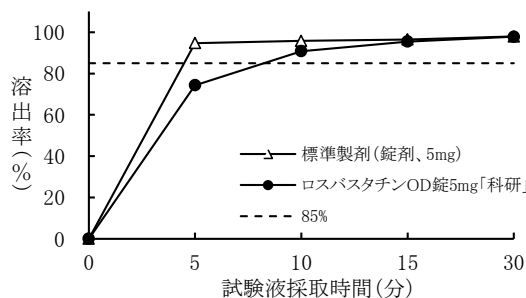
pH6.8, 50rpm



水, 50rpm



pH4.0, 100rpm



(4) ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」

①被験薬剤

試験製剤：ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」

標準製剤：ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」

②試験条件

試験法：日本薬局方一般試験法溶出試験法 パドル法

試験液量：900mL

測定方法：液体クロマトグラフィー

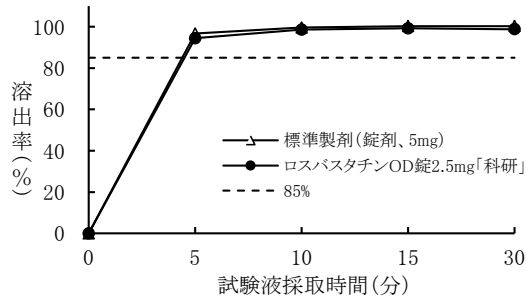
各種条件：

試験液	サンプリング時間 (分)	回転数
pH1.2	5,10,15,30	50rpm
pH4.0	5,10,15,30	
pH6.8	5,10,15,30	
水	5,10,15,30	
試験液温	37.0±0.5℃	
ベッセル数	12 ベッセル	

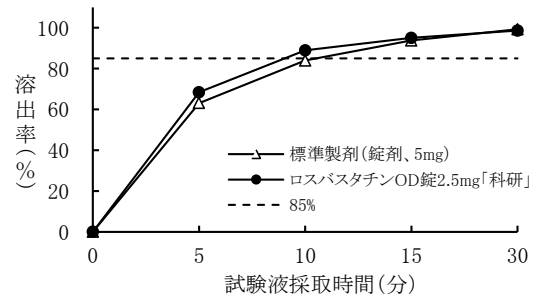
③試験結果：ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」を標準製剤としたとき、全ての試験条件において溶出挙動が同等と判定されたため、生物学的に同等とみなされた²⁾。

[ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」 と標準製剤の各種条件下における溶出挙動]

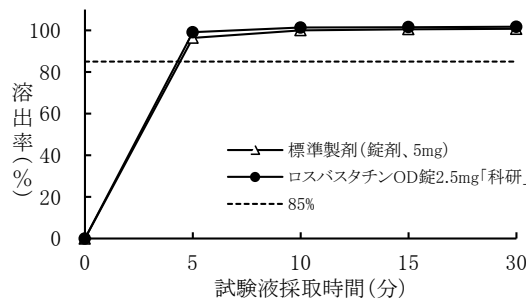
pH1.2, 50rpm



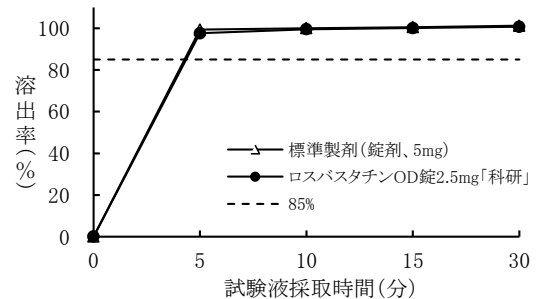
pH4.0, 50rpm



pH6.8, 50rpm



水, 50rpm



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 2.5mg 「科研」、同錠 5mg 「科研」]

日本薬局方「ロスバスタチンカルシウム錠」の確認試験法による。

・液体クロマトグラフィー

[ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」、同 OD 錠 5mg 「科研」]

・液体クロマトグラフィー

10. 製剤中の有効成分の定量法

[ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」、同錠 5mg 「科研」]

日本薬局方「ロスバスタチンカルシウム錠」の定量法による。

・液体クロマトグラフィー

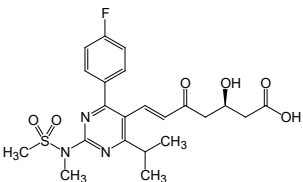
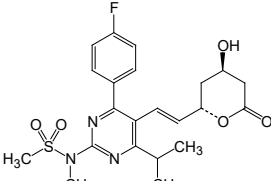
[ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」、同 OD 錠 5mg 「科研」]

・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

類縁物質名、化学式	構造式
5-ケト体 (3R,6E)-7-{4-(4-フルオロフェニル)-6-(1-メチルエチル)-2-[メチル(メチルスルホニル)アミノ]ピリミジン-5-イル}-3-ヒドロキシ-5-オキソヘプト-6-エン酸	
ラクトン体 N-(4-(4-フルオロフェニル)-5-{(E)-2-[(2S,4R)-4-ヒドロキシ-6-オキソテトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル]エチニル}-6-(1-メチルエチル)ピリミジン-2-イル)-N-メチルメタンサルホンアミド	

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

特になし

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/1.73m²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。（「VIII-5. 慎重投与内容とその理由」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。（「VIII-14. 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

該当資料なし

（6）治療的使用

該当資料なし

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

HMG-CoA 還元酵素阻害剤（プラバスタチンナトリウム、シンバスタチン、フルバスタチンナトリウム、アトルバスタチンナトリウム、ピタバスタチンカルシウム）

2. 薬理作用

（1）作用部位・作用機序

本剤は肝臓でのコレステロール生合成の律速酵素であるヒドロキシメチルグルタリル CoA（HMG-CoA）還元酵素を選択的かつ競合的に阻害し、コレステロール生合成を強力に抑制する。その結果、肝臓内のコレステロール含量が低下し、これを補うために低比重リポタンパク質（LDL）受容体の発現が誘導される。そして、この LDL 受容体を介して、コレステロール含有率の高いリポタンパクである LDL の肝臓への取り込みが増加し、血中コレステロールが低下する⁴⁾。

（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

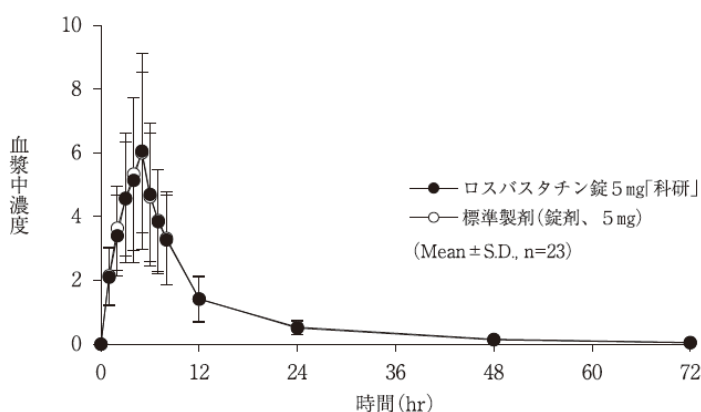
「(3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照。

(3) 臨床試験で確認された血中濃度

1) ロスバスタチン錠 5mg 「科研」

(「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 日改正 薬食審査発 0229 第 10 号 別紙 1) に準拠し実施)

ロスバスタチン錠 5mg 「科研」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (ロスバスタチンとして 5mg) 健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中ロスバスタチン未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された³⁾。



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差、n=23)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ロスバスタチン錠 5mg 「科研」	62.24 ± 24.72	6.35 ± 3.13	4.7 ± 0.7	13.5 ± 2.5
標準製剤 (錠剤、5mg)	63.43 ± 25.27	6.08 ± 2.49	4.6 ± 1.0	14.1 ± 2.6

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。

2) ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」

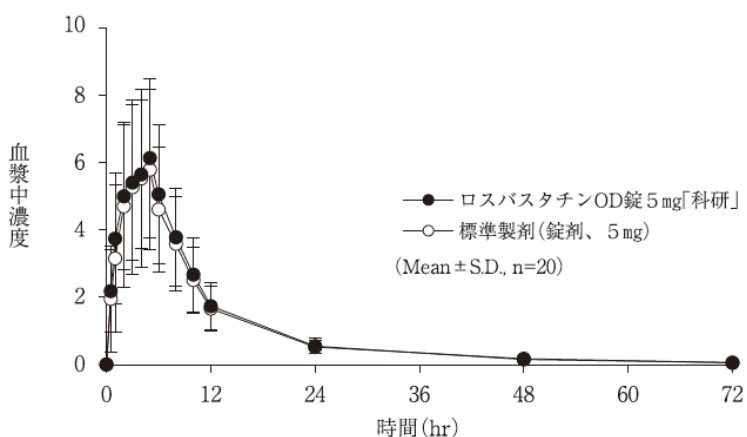
ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン」に基づき、ロスバスタチン錠 5mg 「科研」を標準製剤としたとき、全ての試験条件において溶出挙動が同等と判定されたため、生物学的に同等とみなされた³⁾。

3) ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」

(「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 日改正 薬食審査発 0229 第 10 号 別紙 1) に準拠し実施)

ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (ロスバスタチンとして 5mg) 健康成人男子に絶食後、水あり及び水なし単回経口投与して血漿中ロスバスタチン未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、Cmax) について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log (0.80) \sim \log (1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された³⁾。

①水あり投与

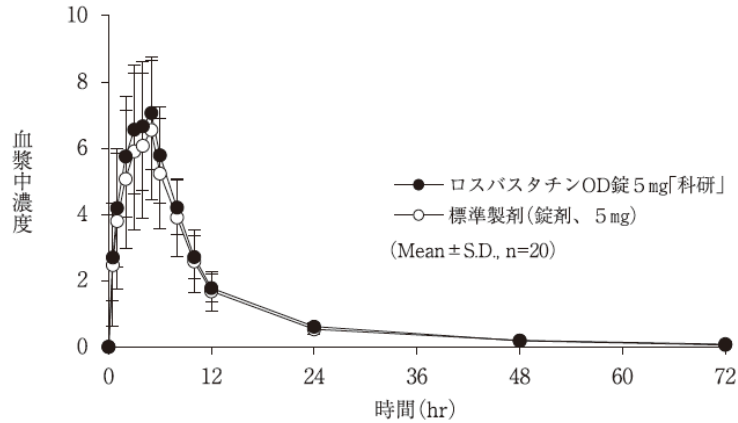


薬物動態パラメータ (平均±標準偏差、n=20)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」	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

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。

②水なし投与



薬物動態パラメータ (平均±標準偏差, n=20)

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」	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

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) ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」

ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」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」に基づき、ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」を標準製剤としたとき、全ての試験条件において溶出挙動が同等と判定されたため、生物学的に同等とみなされた³⁾。

(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) 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 「科研」]

投与量	5.2mg (ロスバスタチンとして 5mg)
Kel (hr ⁻¹)	0.0533±0.0099

(平均±標準偏差)

[ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」]

投与量	5.2mg (ロスバスタチンとして 5mg)	
	水あり (n=20)	水なし (n=20)
Kel (hr ⁻¹)	0.0511±0.0169	0.0499±0.0089

(平均±標準偏差)

(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（「VIII-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）。

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

<参考>

ラットで乳汁中への移行が報告されている（「VIII-10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）。

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

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

本剤は、OATP1B1 及び BCRP の基質である。

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、肝癌、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

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること。

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

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 _{0-24h} 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 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	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
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

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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 ^{注)} 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 ^{注)} 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 ^{注)} 及びエルバスビルを併用したとき、ロスバスタチンの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。
ソホスブビル / 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、ロスバスタチンの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、ロスバスタチンのAUCが5.2倍 ⁵⁾ 、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	ロスバスタチンとフェブキソスタットを併用したとき、ロスバスタチンの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、ロスバスタチン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) 他社が実施した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（以下、全て頻度不明）

- 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

分類	頻度	頻度不明
皮膚 ^{注1)}		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 ^{注2)} 、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

該当資料なし

9. 高齢者への投与

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

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

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

適用上の注意

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。)

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

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

特になし

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

(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

[ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」、同錠 5mg 「科研」]

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

[ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」、同 OD 錠 5mg 「科研」]

使用期限：2年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

[ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」、同錠 5mg 「科研」]

気密容器、室温保存

[ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」、同 OD 錠 5mg 「科研」]

気密容器、遮光、室温保存

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

[ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」、同錠 5mg 「科研」]

開封後は湿気を避けて保存すること。

[ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」、同 OD 錠 5mg 「科研」]

開封後は光、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）

「VIII-6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法」及び「VIII-14. 適用上の注意」参照

くすりのしおり：あり

患者向医薬品ガイド：あり

（3）調剤時の留意点について

特になし

5. 承認条件等

なし

6. 包 装

（全規格共通）

P T P：100錠（10錠×10）

7. 容器の材質

[ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」、同錠 5mg 「科研」]

[PTP 包装製品]

PTP…………… ポリプロピレン・環状オレフィン、アルミニウム
 ピロー…………… アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム
 個装箱…………… 紙

[ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」、同錠 5mg 「科研」]

[PTP 包装製品]

PTP…………… ポリプロピレン、アルミニウム
 ピロー…………… アルミニウム・ポリエチレンラミネートフィルム
 個装箱…………… 紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：クレストール錠、クレストール OD 錠

同 効 薬：プラバスタチンナトリウム、シンバスタチン、フルバスタチンナトリウム、アトルバスタチンカルシウム、ピタバスタチンカルシウム

9. 国際誕生年月日

2002 年 11 月 6 日（オランダ）

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」	2017 年 8 月 15 日	22900AMX00940000
ロスバスタチン錠 5mg 「科研」		22900AMX00941000
ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」		22900AMX00832000
ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」		22900AMX00833000

11. 薬価基準収載年月日

製品名	薬価基準収載年月日
ロスバスタチン錠 2.5mg 「科研」	2017 年 12 月 8 日
ロスバスタチン錠 5mg 「科研」	
ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」	
ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」	

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

製品名	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 「科研」	126012001	2189017F1111	622601201
ロスバスタチン錠 5mg 「科研」	126013701	2189017F2118	622601301
ロスバスタチン OD 錠 2.5mg 「科研」	126014401	2189017F3114	622601401
ロスバスタチン OD 錠 5mg 「科研」	126015101	2189017F4110	622601501

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) ダイト株式会社 社内資料（安定性に関する資料）
- 2) ダイト株式会社 社内資料（溶出試験に関する資料）
- 3) ダイト株式会社 社内資料（生物学的同等性試験に関する資料）
- 4) 第十八改正日本薬局方解説書（廣川書店）
- 5) Zurth, C., et al. : Eur J Drug Metab Pharmacokinet., 44, 747,2019

2. その他の参考文献

特になし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

XIII. 備考

1. その他の関連資料

(1) GS1コード

製品名	包装	GS1コード	
		販売包装単位	調剤包装単位
ロスバスタチン錠 2.5mg「科研」	PTP100錠	(01)14987042 466014	(01)04987042 466512
ロスバスタチン錠 5mg「科研」	PTP100錠	(01)14987042 466083	(01)04987042 466611
ロスバスタチンOD錠 2.5mg「科研」	PTP100錠	(01)14987042 466236	(01)04987042 466710
ロスバスタチンOD錠 5mg「科研」	PTP100錠	(01)14987042 466304	(01)04987042 466819