

## 医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会の IF 記載要領 2018(2019年更新版)に準拠して作成

持続性AT<sub>1</sub>レセプターブロッカー

アジルサルタン口腔内崩壊錠

**アジルサルタンOD錠10mg「杏林」**

**アジルサルタンOD錠20mg「杏林」**

**アジルサルタンOD錠40mg「杏林」**

AZILSARTAN OD Tablets

剤形	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 <sup>注）</sup> 注）注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	アジルサルタン OD 錠 10mg 「杏林」：1錠中、アジルサルタン 10mg 含有 アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」：1錠中、アジルサルタン 20mg 含有 アジルサルタン OD 錠 40mg 「杏林」：1錠中、アジルサルタン 40mg 含有
一般名	和名：アジルサルタン（JAN） 洋名：Azilsartan（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2023年2月15日 薬価基準収載年月日：2023年6月16日 販売開始年月日：2023年6月16日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：キョーリンリメディオ株式会社 販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	キョーリンリメディオ株式会社 学術部 TEL：0120-960189 FAX：0120-189099 受付時間：8時～22時（日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="https://www.med.kyorin-rmd.com/">https://www.med.kyorin-rmd.com/</a>

本 IF は 2023 年 5 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

## 1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書（以下、添付文書）がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、IFと略す）が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構（以下、PMDA）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

## 2. IFとは

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

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

## 3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V.5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

## 4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日

病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

# 目次

I. 概要に関する項目	1	9. 透析等による除去率	28
1. 開発の経緯	1	10. 特定の背景を有する患者	28
2. 製品の治療学的特性	1	11. その他	29
3. 製品の製剤学的特性	1		
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	30
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1. 警告内容とその理由	30
6. RMP の概要	1	2. 禁忌内容とその理由	30
		3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	30
II. 名称に関する項目	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	30
1. 販売名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	30
2. 一般名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	30
3. 構造式又は示性式	2	7. 相互作用	32
4. 分子式及び分子量	2	8. 副作用	33
5. 化学名(命名法)又は本質	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	33
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	3	10. 過量投与	34
		11. 適用上の注意	34
III. 有効成分に関する項目	4	12. その他の注意	34
1. 物理化学的性質	4		
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	IX. 非臨床試験に関する項目	35
3. 有効成分の確認試験法、定量法	4	1. 薬理試験	35
		2. 毒性試験	35
IV. 製剤に関する項目	5		
1. 剤形	5	X. 管理的事項に関する項目	36
2. 製剤の組成	5	1. 規制区分	36
3. 添付溶解液の組成及び容量	6	2. 有効期間	36
4. 力価	6	3. 包装状態での貯法	36
5. 混入する可能性のある夾雑物	6	4. 取扱い上の注意	36
6. 製剤の各種条件下における安定性	7	5. 患者向け資材	36
7. 調製法及び溶解後の安定性	13	6. 同一成分・同効薬	36
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	13	7. 国際誕生年月日	36
9. 溶出性	13	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	36
10. 容器・包装	17	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容	37
11. 別途提供される資材類	18	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	37
12. その他	18	11. 再審査期間	37
		12. 投薬期間制限に関する情報	37
V. 治療に関する項目	19	13. 各種コード	37
1. 効能又は効果	19	14. 保険給付上の注意	37
2. 効能又は効果に関連する注意	19		
3. 用法及び用量	19	XI. 文献	38
4. 用法及び用量に関連する注意	19	1. 引用文献	38
5. 臨床成績	19	2. その他の参考文献	39
VI. 薬効薬理に関する項目	22	XII. 参考資料	40
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	22	1. 主な外国での発売状況	40
2. 薬理作用	22	2. 海外における臨床支援情報	40
VII. 薬物動態に関する項目	23	XIII. 備考	41
1. 血中濃度の推移	23	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	41
2. 薬物速度論的パラメータ	26	2. その他の関連資料	44
3. 母集団(ポピュレーション)解析	27		
4. 吸収	27		
5. 分布	27		
6. 代謝	28		
7. 排泄	28		
8. トランスポーターに関する情報	28		

## 略語表

略語	略語内容
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
BUN	血中尿素窒素
CK	クレアチンキナーゼ
$C_{max}$	最高血中濃度
CYP	チトクロム P450
eGFR	推算糸球体濾過量
$\gamma$ -GTP	$\gamma$ -グルタミルトランスフェラーゼ
IC <sub>50</sub>	50%抑制濃度
INR	国際標準比
PT	プロトロンビン時間
S. D.	標準偏差
$t_{1/2}$	消失半減期
Tmax	最高血中濃度到達時間

# I. 概要に関する項目

## 1. 開発の経緯

アジルサルタン OD 錠 10mg/20mg/40mg「杏林」は、後発医薬品として薬食発 1121 第 2 号(平成 26 年 11 月 21 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を行い承認申請し、2023 年 2 月に承認を取得、2023 年 6 月に薬価収載した。

なお、本剤は、後発医薬品として、キョーリン リメディオ株式会社、第一三共エスファ株式会社、ダイト株式会社、日新製薬株式会社、日本ケミファ株式会社、Meiji Seika ファルマ株式会社の 6 社で共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得て上市に至った。

## 2. 製品の治療学的特性

- 本剤は持続性 AT<sub>1</sub> レセプターブロッカーであり、高血圧症の効能又は効果を有している。  
(「V. 1. 効能又は効果」の項参照)
- 重大な副作用として、血管浮腫、ショック、失神、意識消失、急性腎障害、高カリウム血症、肝機能障害、横紋筋融解症がある。  
(「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照)

## 3. 製品の製剤学的特性

- 錠剤両面にインクジェット印字

アジルサルタン OD 錠 10mg「杏林」	アジルサルタン OD 錠 20mg「杏林」	アジルサルタン OD 錠 40mg「杏林」
		

- 水なしでも服用できるフィルムコーティングを施した口腔内崩壊錠である。

## 4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

## 5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

- (1) 承認条件  
該当しない
- (2) 流通・使用上の制限事項  
該当しない

## 6. RMP の概要

該当しない

## Ⅱ. 名称に関する項目

### 1. 販売名

#### (1) 和名

アジルサルタン OD 錠 10mg 「杏林」

アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」

アジルサルタン OD 錠 40mg 「杏林」

#### (2) 洋名

AZILSARTAN OD Tablets 10mg “KYORIN”

AZILSARTAN OD Tablets 20mg “KYORIN”

AZILSARTAN OD Tablets 40mg “KYORIN”

#### (3) 名称の由来

「一般の名称」＋「剤形」＋「含量」＋「屋号」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」(平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号)に基づく〕

### 2. 一般名

#### (1) 和名 (命名法)

アジルサルタン (JAN)

#### (2) 洋名 (命名法)

Azilsartan (JAN)

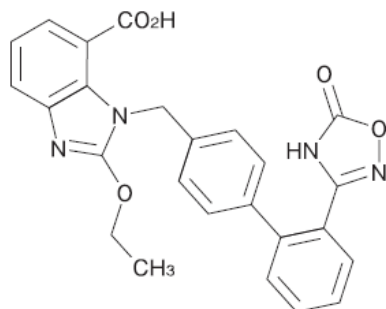
azilsartan (INN)

#### (3) ステム

アンジオテンシンⅡ受容体拮抗薬：-sartan

### 3. 構造式又は示性式

化学構造式：



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>25</sub>H<sub>20</sub>N<sub>4</sub>O<sub>5</sub>

分子量：456.45

## 5. 化学名（命名法）又は本質

化学名：2-Ethoxy-1-([2'-(5-oxo-4, 5-dihydro-1, 2, 4-oxadiazol-3-yl)biphenyl-4-yl]methyl)-1H-benzo[d]imidazole-7-carboxylic acid (IUPAC)

## 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない



### Ⅲ. 有効成分に関する項目

#### 1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

*N,N*-ジメチルアセトアミドに溶けやすく、メタノールにやや溶けにくく、エタノール (99.5) に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点

該当資料なし

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

該当資料なし

#### 2. 有効成分の各種条件下における安定性

該当資料なし

#### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

● 確認試験法

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法 (臭化カリウム錠剤法)

● 定量法

電位差滴定法




## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠（口腔内崩壊錠）

#### (2) 製剤の外観及び性状

販売名	アジルサルタン OD 錠 10mg「杏林」	アジルサルタン OD 錠 20mg「杏林」	アジルサルタン OD 錠 40mg「杏林」
剤形	フィルムコーティング錠	割線入りの フィルムコーティング錠	割線入りの フィルムコーティング錠
色調	微黄赤色	微赤色	黄色
外形			
直径 (mm)	5.6	7.1	8.1
厚さ (mm)	2.8	3.5	3.6
質量 (mg)	72	143	184

#### (3) 識別コード

該当しない

#### (4) 製剤の物性

該当資料なし

#### (5) その他

該当資料なし

### 2. 製剤の組成

#### (1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

販売名	アジルサルタン OD 錠 10mg「杏林」	アジルサルタン OD 錠 20mg「杏林」	アジルサルタン OD 錠 40mg「杏林」
有効成分 (1錠中)	アジルサルタン 10mg	アジルサルタン 20mg	アジルサルタン 40mg
添加剤	D-マンニトール、クロスポビドン、ヒドロキシプロピルセルロース、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、マクロゴール 6000、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、酸化チタン、サッカリンナトリウム水和物、三二酸化鉄、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ、軽質無水ケイ酸、ポリビニルアルコール（部分けん化物）	D-マンニトール、クロスポビドン、ヒドロキシプロピルセルロース、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、マクロゴール 6000、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、酸化チタン、サッカリンナトリウム水和物、三二酸化鉄、カルナウバロウ、軽質無水ケイ酸、ポリビニルアルコール（部分けん化物）	D-マンニトール、クロスポビドン、ヒドロキシプロピルセルロース、乳糖水和物、トウモロコシデンプン、マクロゴール 6000、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウム、酸化チタン、サッカリンナトリウム水和物、黄色三二酸化鉄、カルナウバロウ軽質無水ケイ酸、ポリビニルアルコール（部分けん化物）

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

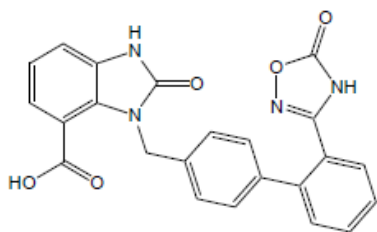
該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

原薬由来の副生成物（類縁物質 D）



## 6. 製剤の各種条件下における安定性

### 1) 加速試験<sup>1)</sup>

[保存条件]

40°C±1°C、75%RH±5%RH

[試験検体]

PTP 包装品：PTP 包装(ポリ塩化ビニル・ポリ塩化ビニリデン・ポリエチレン多層フィルム及びアルミニウム箔)、ピロー包装(ポリエチレンラミネートアルミニウムフィルム)、紙箱

バラ包装品：ポリエチレン製容器、乾燥剤(シリカゲル系)、ポリプロピレン製栓、紙箱

[試験項目及び規格]

試験項目	規 格
性状	[10mg]微黄赤色のフィルムコーティング錠 [20mg]微赤色の割線入りのフィルムコーティング錠 [40mg]黄色の割線入りのフィルムコーティング錠
確認試験	紫外可視吸光度測定法:波長 245~249nm に吸収極大を示す。
純度試験 (類縁物質)	類縁物質 D:0.8%以下 上記以外の個々の類縁物質:0.5%以下 類縁物質の合計:2.0%以下
製剤均一性	含量均一性試験:判定値 15.0%以下
崩壊性	2分以内
溶出性	溶出試験第2液/900mL/バドル法/毎分 50 回転/15 分間/80%以上
定量法	含量:95.0~105.0%

[結果]

#### 〈アジルサルタン OD 錠 10mg 「杏林」〉

PTP 包装品

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適	適	適	適
崩壊性	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量) <sup>*</sup>	100.39%	99.64%	99.02%	99.21%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

#### 〈アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」〉

PTP 包装品

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適	適	適	適
崩壊性	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量) <sup>*</sup>	100.58%	100.12%	99.65%	99.96%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

バラ包装品

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適	適	適	適
崩壊性	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量) <sup>※</sup>	100.58%	100.43%	99.21%	100.26%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

〈アジルサルタン OD 錠 40mg 「杏林」〉

PTP 包装品

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適	適	適	適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適	適	適	適
崩壊性	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量) <sup>※</sup>	100.58%	99.78%	99.13%	99.84%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

2) 長期保存試験<sup>2)</sup>

[保存条件]

25°C±2°C、60%RH±5%RH

[試験検体]

PTP 包装品：PTP 包装(ポリ塩化ビニル・ポリ塩化ビニリデン・ポリエチレン多層フィルム及びアルミニウム箔)、ピロー包装(ポリエチレンラミネートアルミニウムフィルム)、紙箱

バラ包装品：ポリエチレン製容器、乾燥剤(シリカゲル系)、ポリプロピレン製栓、紙箱

[試験項目及び規格]

加速試験 参照

[結果]

〈アジルサルタン OD 錠 10mg 「杏林」〉

PTP 包装品

試験項目	開始時	24 ヶ月
性状	適	適
確認試験	適	適
純度試験	適	適
製剤均一性	適	適
崩壊性	適	適
溶出性	適	適
定量法(含量) <sup>※</sup>	100.39%	99.21%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

〈アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」〉

PTP 包装品

試験項目	開始時	24 ヶ月
性状	適	適
確認試験	適	適
純度試験	適	適
製剤均一性	適	適
崩壊性	適	適
溶出性	適	適
定量法(含量)※	100.58%	99.87%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

バラ包装品

試験項目	開始時	24 ヶ月
性状	適	適
確認試験	適	適
純度試験	適	適
製剤均一性	適	適
崩壊性	適	適
溶出性	適	適
定量法(含量)※	100.58%	99.67%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

〈アジルサルタン OD 錠 40mg 「杏林」〉

PTP 包装品

試験項目	開始時	24 ヶ月
性状	適	適
確認試験	適	適
純度試験	適	適
製剤均一性	適	適
崩壊性	適	適
溶出性	適	適
定量法(含量)※	100.58%	99.62%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

3) 無包装状態での安定性

〈アジルサルタン OD 錠 10mg 「杏林」〉<sup>3)</sup>

保存条件	結 果					
	性状	純度試験	崩壊性	溶出性	定量法	硬度
温度苛酷条件下 [60℃、成り行き湿度、3 ヶ月、 褐色ガラス瓶(密栓)]	変化なし	変化あり (規格外) <sup>※3</sup>	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
温度苛酷条件下 [40℃、成り行き湿度、3 ヶ月、 褐色ガラス瓶(密栓)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度苛酷条件下 [30℃、75%RH、6 ヶ月、 褐色ガラス瓶(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※4</sup>
光苛酷条件下 <sup>※1</sup> [曝光量 120 万 lx・hr、成り行き 温度・湿度、シヤール(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
通常的环境下 <sup>※2</sup> [成り行き温度・湿度、室内散乱 光、6 ヶ月、シヤール(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※</sup>

[規格] 性状：微黄赤色のフィルムコーティング錠、純度試験：類縁物質 D 1.0%以下、左記以外の類縁物質 0.5%以下、類縁物質の合計 2.0%以下、崩壊性：2 分以内、溶出性：15 分間 75%以上、定量法：95.0～105.0%、硬度：参考値

※1 保存期間中の温度：20.7～23.2℃、湿度：24.0～64.8%、照度：903～1098lx

※2 保存期間中の温度：19.0～26.0℃、湿度：23.0～98.0%、照度：178～324 lx

※3 規格内(1 ヶ月、2 ヶ月)、規格外(3 ヶ月)

※4 58.2N(開始時)→28.2N(1 ヶ月)、25.6N(2 ヶ月)、24.9N(3 ヶ月)、23.8N(6 ヶ月)

※5 54.7N(開始時)→45.2N(1 ヶ月)、39.2N(2 ヶ月)、31.8N(3 ヶ月)、35.6N(6 ヶ月)

〈アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」〉<sup>4)</sup>

保存条件	結 果					
	性状	純度試験	崩壊性	溶出性	定量法	硬度
温度苛酷条件下 [60℃、成り行き湿度、3 ヶ月、 褐色ガラス瓶(密栓)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
温度苛酷条件下 [40℃、成り行き湿度、3 ヶ月、 褐色ガラス瓶(密栓)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度苛酷条件下 [30℃、75%RH、6 ヶ月、 褐色ガラス瓶(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※3</sup>
光苛酷条件下 <sup>※1</sup> [曝光量 120 万 lx・hr、成り行き 温度・湿度、シヤール(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※4</sup>
通常的环境下 <sup>※2</sup> [成り行き温度・湿度、室内散乱 光 6 ヶ月、シヤール(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※5</sup>

[規格] 性状：微赤色の割線入りのフィルムコーティング錠、純度試験：類縁物質 D 1.0%以下、左記以外の類縁物質 0.5%以下、類縁物質の合計 2.0%以下、崩壊性：2 分以内、溶出性：15 分間 75%以上、定量法：95.0～105.0%、硬度：参考値

※1 保存期間中の温度：20.7～24.3℃、湿度：27.5～66.9%、照度：903～1098 lx

※2 保存期間中の温度：19.0～26.0℃、湿度：23.0～98.0%、照度：178～324 lx

※3 55.2N(開始時)→25.7N(1 ヶ月)、24.4N(2 ヶ月)、24.3N(3 ヶ月)、24.4N(6 ヶ月)

※4 55.2N(開始時)→44.6N(60 万 lx・hr)、37.8N(120 万 lx・hr)

※5 55.2N(開始時)→46.2N(1 ヶ月)、39.8N(2 ヶ月)、29.4N(3 ヶ月)、37.9N(6 ヶ月)

〈アジルサルタン OD 錠 40mg 「杏林」〉<sup>5)</sup>

保存条件	結 果					
	性状	純度試験	崩壊性	溶出性	定量法	硬度
温度苛酷条件下 [60℃、成り行き湿度、3 ヶ月、 褐色ガラス瓶(密栓)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
温度苛酷条件下 [40℃、成り行き湿度、3 ヶ月、 褐色ガラス瓶(密栓)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度苛酷条件下 [30℃、75%RH、6 ヶ月、 褐色ガラス瓶(開栓)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※3</sup>
光苛酷条件下 <sup>※1</sup> [曝光量 120 万 lx・hr、成り行き 温度・湿度、シャーレ(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
通常的环境下 <sup>※2</sup> [成り行き温度・湿度、室内散乱 光 6 ヶ月、シャーレ(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※4</sup>

[規格] 性状：黄色の割線入りのフィルムコーティング錠、純度試験：類縁物質 D 1.0%以下、左記以外の類縁物質 0.5%以下、類縁物質の合計 2.0%以下、崩壊性：2 分以内、溶出性：15 分間 75%以上、定量法：95.0～105.0%、硬度：参考値

※1 保存期間中の温度：20.7～23.2℃、湿度：24.0～64.8%、照度：903～1098 lx

※2 保存期間中の温度：19.0～26.0℃、湿度：23.0～98.0%、照度：178～324 lx

※3 48.2N(開始時)→22.5N(1 ヶ月)、20.8N(2 ヶ月)、20.3N(3 ヶ月)、22.7N(6 ヶ月)

※4 46.7N(開始時)→39.6N(1 ヶ月)、35.1N(2 ヶ月)、26.8N(3 ヶ月)、35.1N(6 ヶ月)

〈参考〉評価基準

分類	性状	純度試験 崩壊性 溶出性	定量法	硬度
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	規格値内の場合	含量低下が 3%未満の場合	硬度変化が 30%未満の場合
変化あり (規格内)	わずかな色調変化（退色等）等を認めるが、品質上、問題とならない程度の変化であり、規格を満たしている場合	/	含量低下が 3%以上で、規格値内の場合	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kgf(≒19.6N)以上の場合
変化あり (規格外)	形状変化や著しい色調変化等を認め、規格を逸脱している場合		規格値外の場合	規格値外の場合

本試験は、「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）、平成 11 年 8 月 20 日」を参考に評価しました。本剤の安定性に関する結果であり、無包装で保存した本剤を使用した場合の有効性・安全性についての評価は実施していません。



#### 4) 二分割後の安定性

〈アジルサルタン OD錠 20mg「杏林」〉<sup>6)</sup>

保存条件	結 果					
	純度試験	溶出性	定量法	外 観		
				フィルム面 色	分割面 色 分割面	
加速条件下 [40℃、75%RH、6 ヶ月、 バラ包装(密栓)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
温度苛酷条件下 [60℃、成り行き湿度、3 ヶ月、 褐色ガラス瓶(密栓)]	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※2</sup>	変化なし	変化なし	変化なし
湿度苛酷条件下 [30℃、75%RH、3 ヶ月、 褐色ガラス瓶(開栓)]	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※3</sup>	変化なし	変化なし	変化なし
光苛酷条件下 <sup>※1</sup> [曝光量 120 万 lx・hr、成り行き 温度・湿度、シャーレ(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり <sup>※4</sup>	変化あり <sup>※5</sup>	変化なし

[規格] 純度試験：類縁物質 D 1.0%以下、左記以外の類縁物質 0.5%以下、類縁物質の合計 2.0%以下

溶出性：15 分間 75%以上

定量法：95.0～105.0%

外観：参考データ (開始時 フィルム面の色：白色、分割面の色：白色、分割面：凹凸が認められた)

※1 保存期間中の温度：20.7～24.3℃、湿度：27.5～66.9%、照度：903～1098 lx

※2 101.21%(開始時)→99.26%(1 ヶ月)、98.81%(2 ヶ月)、97.81%(3 ヶ月)

※3 101.21%(開始時)→97.61%(1 ヶ月)、96.55%(2 ヶ月)、96.69%(3 ヶ月)

※4 微赤色(開始時)→微赤色(60 万 lx・hr)、わずかに黄色味を帯びていたが、微赤色の範疇であった(120 万 lx・hr)

※5 白色(開始時)→わずかに黄変した(60 万 lx・hr)、わずかに黄変した(120 万 lx・hr)

〈アジルサルタン OD錠 40mg「杏林」〉<sup>7)</sup>

保存条件	結 果					
	純度試験	溶出性	定量法	外 観		
				フィルム面 色	分割面 色 分割面	
加速条件下 [40℃、75%RH、6 ヶ月、 バラ包装(密栓)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
温度苛酷条件下 [60℃、成り行き湿度、3 ヶ月、 褐色ガラス瓶(密栓)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度苛酷条件下 [30℃、75%RH、3 ヶ月、 褐色ガラス瓶(開栓)]	変化なし	変化なし	変化あり (規格内) <sup>※2</sup>	変化なし	変化なし	変化なし
光苛酷条件下 <sup>※1</sup> [曝光量 120 万 lx・hr、成り行き 温度・湿度、シャーレ(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化あり <sup>※3</sup>	変化あり <sup>※4</sup>	変化なし

[規格] 純度試験：類縁物質 D 1.0%以下、左記以外の類縁物質 0.5%以下、類縁物質の合計 2.0%以下

溶出性：15 分間 75%以上

定量法：95.0～105.0%

外観：参考データ (開始時 フィルム面の色：黄色、分割面の色：白色、分割面：凹凸が認められた)

※1 保存期間中の温度：20.7～24.3℃、湿度：27.5～66.9%、照度：903～1098 lx

※2 100.68%(開始時)→96.96%(1 ヶ月)、97.29(2 ヶ月)、96.70%(3 ヶ月)

※3 黄色(開始時)→黄色(60 万 lx・hr)、わずかに退色が認められたが、黄色の範疇であった(120 万 lx・hr)

※4 白色(開始時)→わずかに黄変した(60 万 lx・hr)、わずかに黄変した(120 万 lx・hr)

<参考>評価基準

分類	純度試験、溶出性	定量法
変化なし	規格値内の場合	含量低下が3%未満の場合
変化あり（規格内）		含量低下が3%以上で、規格値内の場合
変化あり（規格外）	規格値外の場合	規格値外の場合

本試験は、「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答申）、平成11年8月20日」を参考に評価しました。本剤の安定性に関する結果であり、分割、無包装で保存した本剤を使用した場合の有効性・安全性についての評価は実施しておりません。

## 7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

## 8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）

該当資料なし

## 9. 溶出性

### 1) 溶出挙動における類似性及び同等性<sup>8)</sup>

<アジルサルタン OD 錠 10mg 「杏林」>

含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン(令和2年3月19日 薬生薬審発 0319 第1号)のB水準に準じて試験を実施した。

標準製剤	アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」			
試験方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)			
試験条件	試験液量：900mL 試験液の温度：37℃±0.5℃			
	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	溶出試験第1液
			pH5.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	溶出試験第2液
水			水	

①平均溶出率

[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±6%の範囲にあるか、又はf2関数の値が61以上である。
	pH5.0	
	pH6.8	試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出するか、又は15分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にある。
	水	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±6%の範囲にあるか、又はf2関数の値が61以上である。

[結果]

回転数	試験液	判定時点 (分)	12 ベッセルの平均溶出率(%)			判定
			アジルサルタン OD 錠 10mg 「杏林」	標準製剤	差	
50rpm	pH1.2	15	8.9	8.7	0.2	適合
		120	17.8	18.1	0.3	
	pH5.0	20	17.6	17.2	0.4	適合
		360	37.7	36.3	1.4	
	pH6.8	15	97.2	99.3	-	適合
	水	10	23.3	22.7	0.6	適合
360		42.3	41.3	1.0		

②個々の溶出率

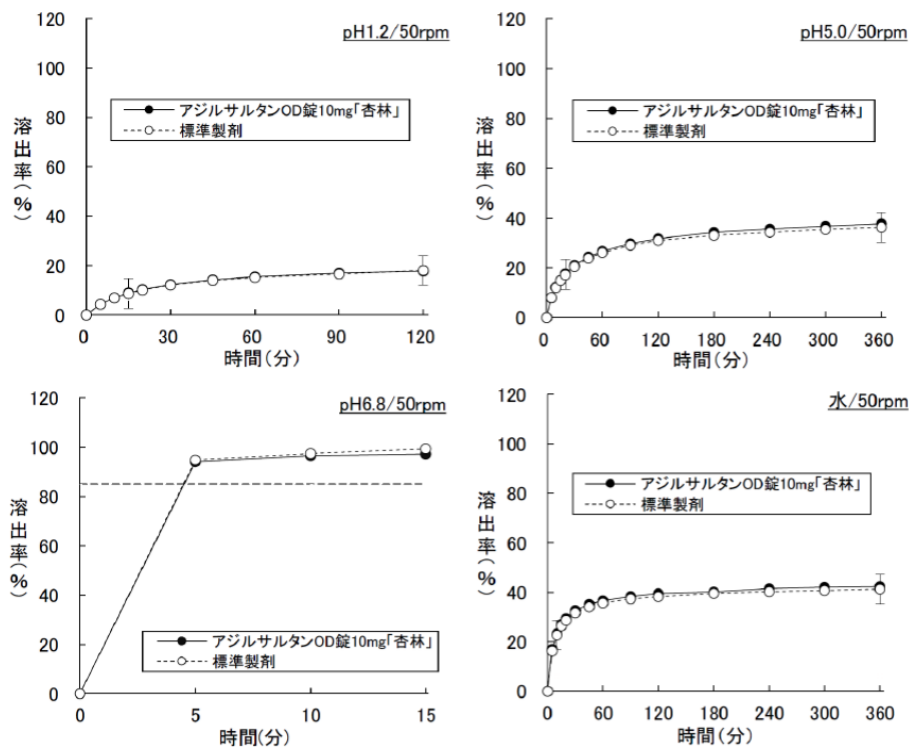
[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	試験製剤の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがない。
	pH5.0	
	pH6.8	試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±25%の範囲を超えるものがない。
	水	試験製剤の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが12個中1個以下で、±15%の範囲を超えるものがない。

[結果]

回転数	試験液	判定時点 (分)	12 ベッセルの溶出率(%)		判定
			平均値	範囲 (最小値～最大値)	
50rpm	pH1.2	120	17.8	17.0～18.4	適合
	pH5.0	360	37.7	37.0～38.4	適合
	pH6.8	15	97.2	93.9～100.0	適合
	水	360	42.3	40.7～45.0	適合

以上の結果より、平均溶出率、個々の溶出率ともに溶出挙動の同等性の判定基準に適合したため、アジルサルタン OD 錠 10mg 「杏林」は標準製剤と溶出挙動が同等であると判定された。



〈アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」〉

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(令和2年3月19日 薬生薬審発 0319 第1号)に準じて試験を実施した。

標準製剤	アジルバ錠 20mg			
試験方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)			
試験条件	試験液量：900mL 試験液の温度：37℃±0.5℃			
	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	溶出試験第1液
			pH5.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	溶出試験第2液
		水	水	

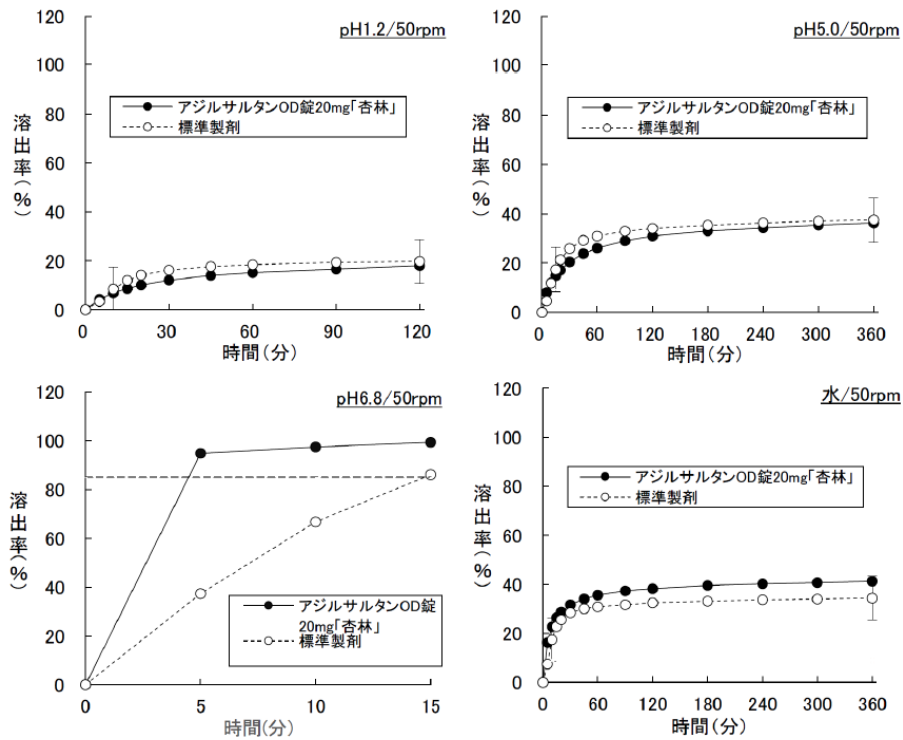
[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 53 以上である。
	pH5.0	
	pH6.8	試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
	水	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 53 以上である。

[結果]

回転数	試験液	判定時点 (分)	12 ベッセルの平均溶出率(%)			判定
			アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」	標準製剤	差	
50rpm	pH1.2	10	6.9	8.5	1.6	適合
		120	18.1	19.8	1.7	
	pH5.0	15	14.9	17.3	2.4	適合
		360	36.3	37.5	1.2	
	pH6.8	15	99.3	86.0	-	適合
	水	10	22.7	17.4	5.3	適合
360		41.3	34.4	6.9		

以上の結果より、すべての試験条件において溶出挙動の類似性の判定基準に適合したため、アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」は標準製剤と溶出挙動が類似していると判定された。



#### 〈アジルサルタン OD錠 40mg 「杏林」〉

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(令和2年3月19日 薬生薬審発 0319 第1号)に準じて試験を実施した。

標準製剤	アジルバ錠 40mg		
試験方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)		
試験条件	試験液量：900mL 試験液の温度：37℃±0.5℃		
	回転数/試験液	50rpm	pH1.2 溶出試験第1液
			pH5.0 薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8 溶出試験第2液
			水 水

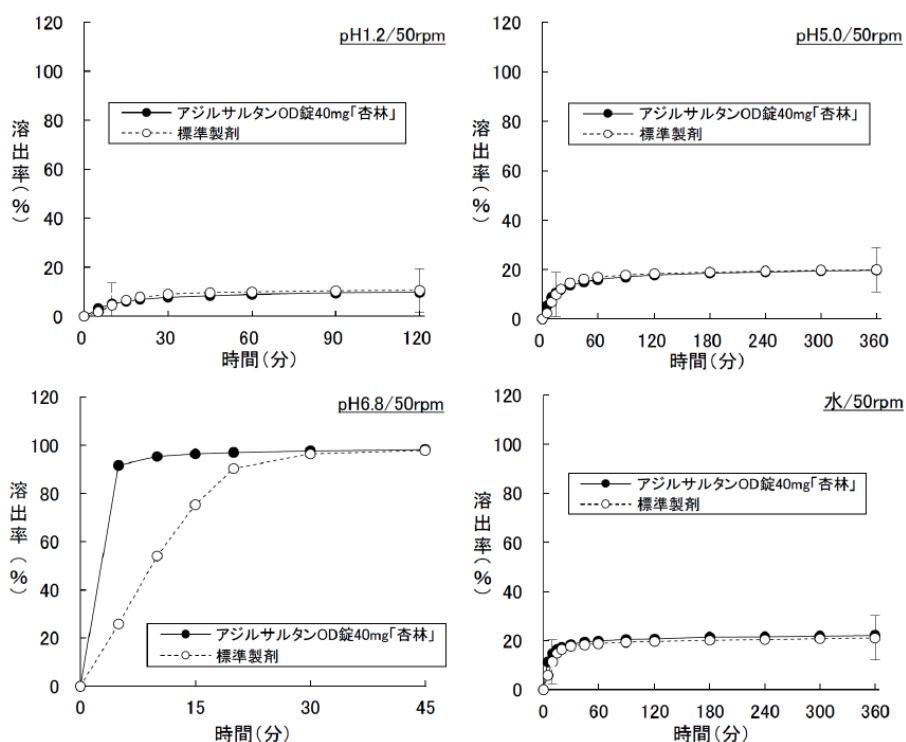
[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 53 以上である。
	pH5.0	
	pH6.8	標準製剤の平均溶出率が 60%及び 85%付近となる適当な 2 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 42 以上である。
	水	標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 53 以上である。

[結果]

回転数	試験液	判定時点 (分)	12 ベッセルの平均溶出率 (%)				判定
			アジルサルタン OD錠 40mg「杏林」	標準製剤	差	f2 関数の値	
50rpm	pH1.2	10	5.1	4.6	0.5	46	適合
		120	9.8	10.6	0.8		
	pH5.0	15	10.6	9.9	0.7		適合
		360	19.7	19.9	0.2		
	pH6.8	15	96.4	75.3			適合
		30	97.7	96.4			
		45	98.2	97.9			
	水	10	14.7	11.4	3.3		適合
		360	22.1	21.1	1.0		

以上の結果より、すべての試験条件において溶出挙動の類似性の判定基準に適合したため、アジルサルタン OD錠 40mg「杏林」は標準製剤と溶出挙動が類似していると判定された。



## 10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

〈アジルサルタン OD錠 10mg「杏林」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

〈アジルサルタン OD錠 20mg「杏林」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

300錠 [瓶、バラ、乾燥剤入り]

〈アジルサルタン OD錠 40mg「杏林」〉

100錠 [10錠 (PTP) ×10]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

[PTP 包装品]

PTP 包装：ポリ塩化ビニル・ポリ塩化ビニリデン・ポリエチレン多層フィルム、アルミニウム箔

ピロー包装：ポリエチレンラミネートアルミニウムフィルム

箱：紙

[バラ包装品]

容器：ポリエチレン

キャップ：ポリプロピレン

箱：紙

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当資料なし

## V. 治療に関する項目

### 1. 効能又は効果

#### 4.効能又は効果

高血圧症

### 2. 効能又は効果に関連する注意

設定されていない

### 3. 用法及び用量

#### (1) 用法及び用量の解説

#### 6.用法及び用量

通常、成人にはアジルサルタンとして 20mg を 1 日 1 回経口投与する。なお、年齢、症状により適宜増減するが、1 日最大投与量は 40mg とする。

#### (2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

### 4. 用法及び用量に関連する注意

#### 7.用法及び用量に関連する注意

本剤の降圧効果を考慮し、本剤適用の可否を慎重に判断するとともに、20mg より低用量からの開始も考慮すること。[17.1.1 参照]

### 5. 臨床成績

#### (1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

#### (2) 臨床薬理試験

該当資料なし

#### (3) 用量反応探索試験

該当資料なし

#### (4) 検証的試験

##### 1) 有効性検証試験

#### 17.1.1 国内第Ⅱ相試験

成人のⅠ度又はⅡ度本態性高血圧症患者を対象にアジルサルタンを 1 日 1 回 12 週間経口投与したプラセボ対照二重盲検比較試験の結果は以下のとおりであった<sup>9)</sup>。

トラフ時座位血圧変化量<sup>注 1)</sup> はいずれの投与群においてもプラセボ投与群に比べ有意な差が認められた (p < 0.0001、対比検定)。



表 17-1 治療期終了時におけるトラフ時座位血圧の変化量

投与群	n	トラフ時座位血圧 (mmHg)			
		拡張期		収縮期	
		投与前値	変化量	投与前値	変化量
プラセボ	82	100.8±4.21	-4.1±9.12 <sup>注3)</sup>	160.0±7.66	-8.2 ±14.63 <sup>注3)</sup>
アジルサルタン 10mg	83	100.2±4.07	-10.8±7.76 <sup>注3)</sup>	158.5±6.96	-17.6±14.20 <sup>注3)</sup>
アジルサルタン 20mg	85	101.5±4.72	-12.5±9.60	159.2±6.71	-20.5±13.71
アジルサルタン 40mg	82	100.4±4.14	-14.3±9.92	159.2±7.04	-22.2±16.83
カンデサルタン シレキセチル 8~12mg <sup>注2)</sup>	82	101.0±4.40	-10.9±10.13 <sup>注4)</sup>	159.6±7.68	-18.3±15.88 <sup>注4)</sup>

(平均値±標準偏差)

注 1) LOCF 法 (Last observation carried forward 法)

注 2) 参考として設定した群であり、統計学的な比較対照群ではない。(1日1回8mgを4週間及び12mgを8週間、計12週間投与)

注 3) n=80

注 4) n=81

副作用発現頻度は、アジルサルタン 10mg 投与群で 15.7% (13/83 例)、アジルサルタン 20mg 投与群で 16.5% (14/85 例) 及びアジルサルタン 40mg 投与群で 13.4% (11/82 例) であった。主な副作用は、10mg 投与群で尿中血陽性 3.6% (3/83 例)、20mg 投与群で浮動性めまい 2.4% (2/85 例) 及び血中クレアチンホスホキナーゼ増加 2.4% (2/85 例) であった<sup>9)</sup>。[7. 参照]

#### 17.1.2 国内第Ⅲ相試験

成人のⅠ度又はⅡ度本態性高血圧症患者を対象にアジルサルタン投与群に1日1回20mg(8週間)及び40mg(8週間)の計16週間投与、並びにカンデサルタン シレキセチル投与群に8mg及び12mgを同一用法にて経口投与した二重盲検比較試験の結果は以下のとおりであった<sup>10)</sup>。

トラフ時座位血圧変化量 (LOCF 法) は、アジルサルタン投与群 (n=311) において対照群のカンデサルタン シレキセチル投与群 (n=309) に比べ有意な差が認められた。

なお、トラフ時座位血圧の投与前値 (拡張期/収縮期: 平均値±標準偏差) は、アジルサルタン投与群 (n=313) は 100.3±4.26mmHg/160.0±7.70mmHg、カンデサルタン シレキセチル投与群 (n=309) は 100.4±4.11mmHg/159.6±7.27mmHg であった。

表 17-2 治療期終了時におけるトラフ時座位血圧の変化量

投与群	トラフ時座位血圧 (mmHg)			
	拡張期		収縮期	
	変化量 <sup>注1)</sup>	群間差 <sup>注2)</sup>	変化量 <sup>注1)</sup>	群間差 <sup>注2)</sup>
投与 8 週時点				
アジルサルタン 20mg	-11.0±8.87	-2.0 [-3.21, -0.69] p=0.0024	-19.9±14.30	-2.6 [-4.62, -0.60] p=0.0109
カンデサルタン シレキセチル 8mg	-9.0±7.43		-17.3±11.75	
投与 16 週時点 (最終評価時)				
アジルサルタン 20~40mg	-12.4±9.87	-2.6 [-4.08, -1.22] p=0.0003	-21.8±15.30	-4.4 [-6.53, -2.20] p<0.0001
カンデサルタン シレキセチル 8~12mg	-9.8±8.50		-17.5±12.69	

注 1) 平均値±標準偏差

注 2) 投与前の血漿中レニン活性区分及び投与群を独立変数とした二元配置分散分析 (各投与群の調整済み平均値の投与群間差の点推定値、[ ] は両側 95%信頼区間)

副作用発現頻度はアジルサルタン投与群で 7.3% (23/313 例) であった。主な副作用は、アジルサルタン群で血中尿酸増加 1.6% (5/313 例)、体位性めまい 1.6% (5/313 例) 及び浮動性めまい 1.0% (3/313 例) であった<sup>10)</sup>。

## 2) 安全性試験

### 17.1.3 国内第Ⅲ相試験（長期投与試験）

成人のⅠ度又はⅡ度本態性高血圧症患者（362例）を対象にアジルサルタン 10～40mg（10mgより開始）を1日1回52週間単独経口投与、利尿降圧剤又はカルシウム拮抗剤と併用投与した時、いずれも安定した降圧効果が得られた<sup>11)</sup>。

副作用発現頻度は、10.8%（39/362例）であった。主な副作用は、血圧低下 2.8%（10/362例）、浮動性めまい 2.5%（9/362例）及び高尿酸血症 1.4%（5/362例）であった<sup>11)</sup>。

## (5) 患者・病態別試験

### 17.1.4 国内第Ⅲ相試験

成人のⅢ度高血圧症患者（25例）を対象にアジルサルタン 20～40mg（20mgより開始）を1日1回8週間経口投与した時、安定した降圧効果が得られた<sup>12)</sup>。

副作用発現頻度は、4.0%（1/25例）であった。主な副作用は、血中乳酸脱水素酵素増加 4.0%（1/25例）及び血中カリウム増加 4.0%（1/25例）であった<sup>13)</sup>。

### 17.1.5 国内第Ⅲ相試験

成人の腎障害を伴う高血圧症患者（41例）を対象にアジルサルタン 10～40mg（10mgより開始）を1日1回10週間経口投与した時、安定した降圧効果が得られた<sup>14)</sup>。

副作用発現頻度は、重度腎障害患者で 15.8%（3/19例）及び中等度腎障害患者で 18.2%（4/22例）であった。主な副作用は重度腎障害患者で血中カリウム増加 5.3%（1/19例）、高カリウム血症 5.3%（1/19例）及び頭痛 5.3%（1/19例）であり、中等度腎障害患者で肝機能異常 4.5%（1/22例）、血中カリウム増加 4.5%（1/22例）、頭痛 4.5%（1/22例）及び浮動性めまい 4.5%（1/22例）であった<sup>13)</sup>。

## (6) 治療的使用

- 1) 使用成績調査（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容  
該当資料なし

- 2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要  
該当資料なし

## (7) その他

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

アンジオテンシンⅡ受容体拮抗薬：

イルベサルタン、オルメサルタン メドキシミル、カンデサルタン シレキセチル、テルミサルタン、バルサルタン、ロサルタンカリウム

注意：関連のある化合物の効能・効果等は、最新の電子添文を参照すること。

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序

##### 18.1 作用機序

アジルサルタンはアンジオテンシンⅡタイプ1(AT<sub>1</sub>)受容体に結合してアンジオテンシンⅡと拮抗し、主にその強力な血管収縮作用を抑制することによって生ずる末梢血管抵抗の低下により降圧作用を示す<sup>15)</sup>。

#### (2) 薬効を裏付ける試験成績

##### 18.2 AT<sub>1</sub>受容体に対する阻害作用

ヒトAT<sub>1</sub>受容体の活性を濃度依存的に阻害し(IC<sub>50</sub>値：0.62～2.6nmol/L)、AT<sub>1</sub>受容体からの解離は極めて緩やかであった(*in vitro*)<sup>16)</sup>。

##### 18.3 レニン-アンジオテンシン系に及ぼす影響

健康成人(12例)にアジルサルタン20mgを1日1回7日間投与した時、血漿レニン活性、血漿アンジオテンシンⅠ濃度及びアンジオテンシンⅡ濃度の増加が認められた<sup>17)</sup>。

##### 18.4 降圧作用

高血圧自然発症ラット(SHR)及び腎性高血圧(2K-1C)イヌにそれぞれ単回投与した時、24時間後まで降圧作用は持続した<sup>18)</sup>。

#### (3) 作用発現時間・持続時間

該当資料なし

## VII. 薬物動態に関する項目

### 1. 血中濃度の推移

#### (1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

#### (2) 臨床試験で確認された血中濃度

##### 16.1 血中濃度

##### 16.1.1 単回投与

健康成人にアジルサルタン 20mg (9 例) 及び 40mg (9 例) を単回経口投与した時、未変化体の薬物動態学的パラメータは以下のとおりであった<sup>19)</sup>。

表 16-1 薬物動態パラメータ

投与量	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (h)	AUC <sub>0-inf</sub> (ng・h/mL)	T <sub>1/2</sub> (h)
20mg	2,020.1±496.1	1.50 (1.0-3.0)	15,475.8±4,413.8	13.2±1.4
40mg	4,707.8±1,048.3	2.50 (1.5-3.0)	33,892.0±8,109.3	12.8±1.3

(平均値±標準偏差、T<sub>max</sub> は中央値 (最小値-最大値))

##### 16.1.2 反復投与

健康成人にアジルサルタン 20mg (12 例) 及び 40mg (12 例) を 1 日 1 回 7 日間経口投与した時、未変化体の血漿中濃度は投与開始から 4 日後までに定常状態に達し、蓄積性はなかった<sup>17)</sup>。

生物学的同等性試験<sup>20)</sup>

〈アジルサルタン OD錠 10mg 「杏林」〉

アジルサルタン OD錠 10mg 「杏林」は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン(令和2年3月19日 薬生薬審発 0319 第1号)」に基づき、アジルサルタン OD錠 20mg 「杏林」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

(「IV. 9. 溶出性」の項参照)

〈アジルサルタン OD錠 20mg 「杏林」〉

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(令和2年3月19日 薬生薬審発 0319 第1号)に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

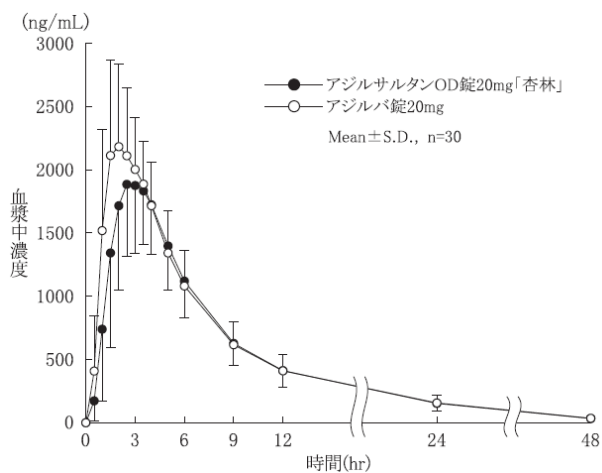
アジルサルタン OD錠 20mg 「杏林」とアジルバ錠 20mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠(アジルサルタンとして 20mg)健康成人男子に絶食時単回経口投与(水で服用及び水なしで服用)して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、C<sub>max</sub>)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両製剤の生物学的同等性が確認された。

—水で服用—

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48</sub> (ng・h/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (h)	T <sub>1/2</sub> (h)
アジルサルタン OD錠 20mg 「杏林」	17817.9±4198.3	2133.3±401.4	2.7±0.9	9.9±1.1
アジルバ錠 20mg	19050.3±4403.7	2459.8±417.0	2.2±0.9	10.1±1.0

(平均値±標準偏差, n=30)

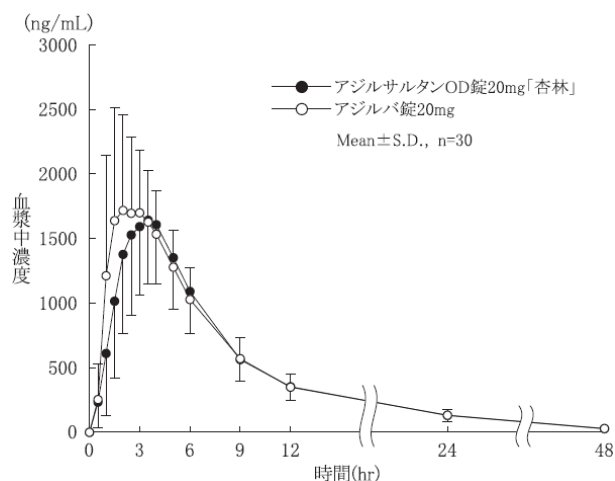


—水なしで服用(アジルバ錠 20mg は水で服用)—

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48</sub> (ng・h/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (h)	T <sub>1/2</sub> (h)
アジルサルタン OD錠 20mg 「杏林」	15744.0±3863.9	1891.7±412.8	3.0±1.0	9.8±1.0
アジルバ錠 20mg	16440.1±3686.1	2055.8±508.0	2.7±1.2	10.0±1.1

(平均値±標準偏差, n=30)



血漿中濃度並びに AUC、C<sub>max</sub> 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。

### 〈アジルサルタン OD 錠 40mg 「杏林」〉

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン(令和 2 年 3 月 19 日 薬生薬審発 0319 第 1 号)に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

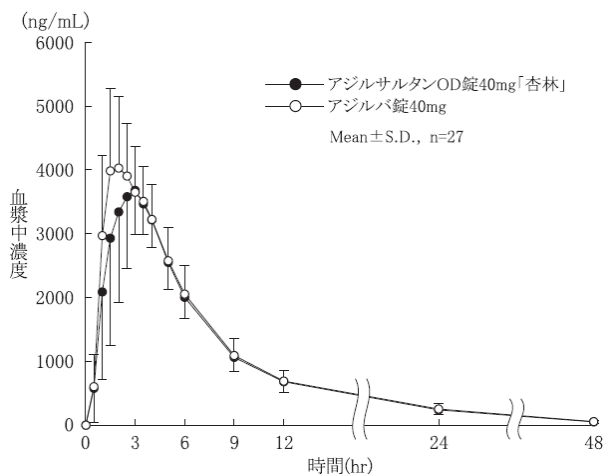
アジルサルタン OD 錠 40mg 「杏林」とアジルバ錠 40mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠 (アジルサルタンとして 40mg) 健康成人男子に絶食時単回経口投与 (水で服用及び水なしで服用) して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ (AUC、C<sub>max</sub>) について 90% 信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$  の範囲内であり、両製剤の生物学的同等性が確認された。

—水で服用—

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48</sub> (ng・h/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (h)	T <sub>1/2</sub> (h)
アジルサルタン OD 錠 40mg 「杏林」	32038.2 ± 5389.5	4156.3 ± 697.4	2.6 ± 0.9	9.8 ± 1.0
アジルバ錠 40mg	34108.8 ± 5342.5	4532.4 ± 775.7	2.2 ± 1.0	10.0 ± 1.0

(平均値 ± 標準偏差, n=27)

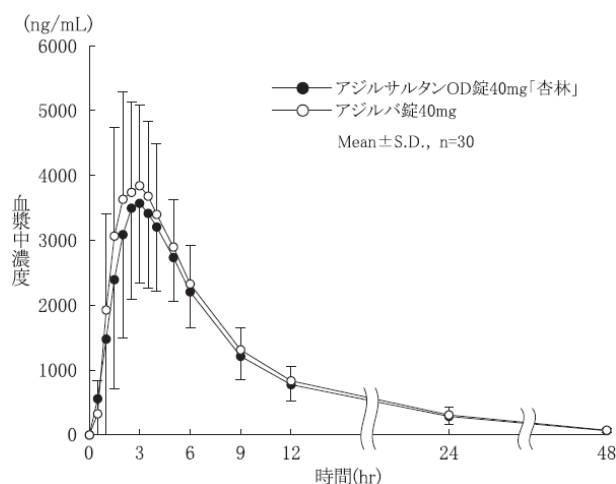


—水なしで服用（アジルバ錠 40mg は水で服用）—

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0-48</sub> (ng・h/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (h)	T <sub>1/2</sub> (h)
アジルサルタン OD錠 40mg 「杏林」	33980.9±8196.2	4173.6±930.4	2.8±1.2	10.2±1.1
アジルバ錠 40mg	36862.6±8004.5	4646.7±1006.3	2.7±1.2	10.2±1.1

(平均値±標準偏差, n=30)



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

### (3) 中毒域

該当資料なし

### (4) 食事・併用薬の影響

#### 1) 食事の影響

「VII. 4. 吸収」の項参照

#### 2) 併用薬の影響

## 16.7 薬物相互作用

### 16.7.1 フルコナゾール

健康成人（18 例）にフルコナゾール（CYP2C9 阻害剤）200mg を 1 日 1 回 7 日間反復投与及びアジルサルタン 40mg を単回経口併用投与（フルコナゾール投与 7 日目）した時、アジルサルタンの C<sub>max</sub>、AUC は、単独投与時と比較してそれぞれ 14.1%、42.1%増加した<sup>21)</sup>（外国人データ）。

## 2. 薬物速度論的パラメータ

### (1) 解析方法

該当資料なし

### (2) 吸収速度定数

該当資料なし

### (3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

該当資料なし

(6) その他

該当資料なし

### 3. 母集団（ポピュレーション）解析

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) パラメータ変動要因

該当資料なし

### 4. 吸収

#### 16.2 吸収

健康成人（12例）にアジルサルタン 40mg を食後経口投与した時、未変化体の  $C_{max}$ 、AUC は絶食下投与した時と比較して、それぞれ 3.0%、8.4%減少した<sup>22)</sup>。

### 5. 分布

(1) 血液－脳関門通過性

該当資料なし

(2) 血液－胎盤関門通過性

「VIII. 6. (5) 妊婦」の項参照

(3) 乳汁への移行性

「VIII. 6. (6) 授乳婦」の項参照

(4) 髄液への移行性

該当資料なし

(5) その他の組織への移行性

該当資料なし

(6) 血漿蛋白結合率

#### 16.3 分布

[<sup>14</sup>C] アジルサルタンを 0.3、3、30  $\mu$ g/mL 濃度でヒト血漿に添加した時、いずれも蛋白結合率は 99.5%であった (*in vitro*)<sup>23)</sup>。



## 6. 代謝

### (1) 代謝部位及び代謝経路

#### 16.4 代謝

アジルサルタンは脱炭酸により代謝物 M-I に、また、CYP2C9 により代謝物 M-II に代謝される。なお、M-I 及び M-II の AT<sub>1</sub> 受容体の阻害作用は未変化体の約 1/1,000 であった (*in vitro*)<sup>24)</sup>、<sup>16)</sup>。

アジルサルタンは CYP1A2、CYP2B6、CYP2C8、CYP2C9、CYP2C19、CYP2D6、CYP2E1 及び CYP3A4 を阻害せず、CYP3A を誘導しなかった (*in vitro*)<sup>24)</sup>。

### (2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

「VII. 6. (1) 代謝部位及び代謝経路」の項参照

### (3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

### (4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

## 7. 排泄

#### 16.5 排泄

健康成人にアジルサルタン 20mg (12 例) 及び 40mg (12 例) を 1 日 1 回 7 日間反復経口投与した時、初回投与から 168 時間までの未変化体の累積尿中排泄率はそれぞれ 15.1%、14.6%であった<sup>17)</sup>。

## 8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

## 9. 透析等による除去率

アジルサルタン及び代謝物 M-II は、透析により除去されない。(「VIII. 10. 過量投与」の項参照)

## 10. 特定の背景を有する患者

#### 16.6 特定の背景を有する患者

##### 16.6.1 腎機能障害患者

成人の腎機能の程度が異なる高血圧症患者 (eGFR<sup>注1)</sup> が 15~30 未満の重度腎機能障害者 4 例、30~60 未満の中等度腎機能障害者 10 例、60 以上の正常~軽度腎機能障害者 8 例) にアジルサルタン 20mg を 1 日 1 回 7 日間反復経口投与した時、成人の正常~軽度腎機能障害者と比較して中等度腎機能障害者の C<sub>max</sub>、AUC はそれぞれ 17.3%、16.7%増加し、重度腎機能障害者の C<sub>max</sub>、AUC はそれぞれ 8.9%、39.3%増加した<sup>25)</sup>。

また、成人の腎機能障害を伴う高血圧症患者を対象とした試験において、中等度腎機能障害者 (22 例) と比較して重度腎機能障害者 (19 例) のトラフ時血漿中薬物濃度は 35.1~61.3%増加し、重篤な腎機能障害者 (eGFR<sup>注1)</sup> が 15 未満 (4 例) のトラフ時血漿中薬物濃度は 51.0~91.9%増加した<sup>26)</sup>。[9.2.1 参照]

注 1) 男性の eGFR (mL/min/1.73m<sup>2</sup>) = 194 × Cr<sup>-1.094</sup> × Age<sup>-0.287</sup>

女性の eGFR (mL/min/1.73m<sup>2</sup>) = 194 × Cr<sup>-1.094</sup> × Age<sup>-0.287</sup> × 0.739

##### 16.6.2 肝機能障害患者

成人の軽度~中等度肝機能障害者 (Child-Pugh<sup>注2)</sup> スコアが 5~6 の軽度肝機能障害者 8 例、7~9 の中等度肝機能障害者 8 例、計 16 例) 及び健康成人 (16 例) にアジルサルタンメドキシミル<sup>注3)</sup> として 40mg を 5 日間反復経口投与した時、健康成人と比較して軽度肝機能障害者の C<sub>max</sub> は 7.7%減少、AUC は 27.9%増加、中等度肝機能障害者の C<sub>max</sub>、AUC はそれぞれ 17.9%、64.4%増加した<sup>27)</sup> (外国人データ)。[9.3 参照]

注2) ビリルビン、アルブミン、PT 又は INR、肝性脳症、腹水症の状態からスコア化する分類

注3) アジルサルタンのプロドラッグ体（国内未承認）

#### 16.6.3 高齢者

健康な高齢者（65 歳以上 85 歳以下、24 例）及び非高齢者（18 歳以上 45 歳以下、24 例）にアジルサルタン 40mg を 1 日 1 回 5 日間反復経口投与した時、高齢者の  $C_{max}$ 、AUC（初回投与から 8 日目）は、非高齢者と比較してそれぞれ 15.6%、9.0%減少した<sup>28)</sup>（外国人データ）。

## 11. その他

該当資料なし

## VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目

### 1. 警告内容とその理由

設定されていない

### 2. 禁忌内容とその理由

#### 2.禁忌（次の患者には投与しないこと）

2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

2.2 妊婦又は妊娠している可能性のある女性 [9.5 参照]

2.3 アリスキレンフマル酸塩を投与中の糖尿病患者（ただし、他の降圧治療を行ってもなお血圧のコントロールが著しく不良の患者を除く） [10.1 参照]

### 3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

設定されていない

### 4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

「V. 4. 用法及び用量に関連する注意」を参照すること。

### 5. 重要な基本的注意とその理由

#### 8.重要な基本的注意

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

8.2 手術前 24 時間は投与しないことが望ましい。アンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤投与中の患者は、麻酔及び手術中にレニン-アンジオテンシン系の抑制作用による高度な血圧低下を起こす可能性がある。

### 6. 特定の背景を有する患者に関する注意

#### (1) 合併症・既往歴等のある患者

##### 9.1 合併症・既往歴等のある患者

##### 9.1.1 両側性腎動脈狭窄のある患者又は片腎で腎動脈狭窄のある患者

治療上やむを得ないと判断される場合を除き、使用は避けること。腎血流量の減少や糸球体ろ過圧の低下により急速に腎機能を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.2 高カリウム血症の患者

治療上やむを得ないと判断される場合を除き、使用は避けること。高カリウム血症を増悪させるおそれがある。また、腎機能障害、コントロール不良の糖尿病等により血清カリウム値が高くなりやすい患者では、血清カリウム値に注意すること。

##### 9.1.3 脳血管障害のある患者

過度の降圧が脳血流不全を引き起こし、病態を悪化させるおそれがある。

##### 9.1.4 厳重な減塩療法中の患者

低用量から投与を開始するなど、慎重に投与すること。急激な血圧の低下を起こすおそれがある。 [11.1.2 参照]

### 9.1.5 薬剤過敏症の既往歴のある患者

## (2) 腎機能障害患者

### 9.2 腎機能障害患者

#### 9.2.1 重篤な腎機能障害（eGFR 15mL/min/1.73m<sup>2</sup>未満）のある患者

低用量から投与を開始し、増量する場合は徐々に行うなど慎重に投与すること。腎機能を悪化させるおそれがある。血中濃度の上昇が認められた。[16.6.1 参照]

#### 9.2.2 血液透析中の患者

低用量から投与を開始するなど、慎重に投与すること。急激な血圧の低下を起こすおそれがある。[11.1.2 参照]

## (3) 肝機能障害患者

### 9.3 肝機能障害患者

中等度の肝機能障害患者（Child-Pugh 分類スコア：7～9）で血中濃度の上昇が報告されている。臨床試験では、高度な肝機能障害患者（Child-Pugh 分類スコア：10 以上）は除外されていた。[16.6.2 参照]

## (4) 生殖能を有する者

### 9.4 生殖能を有する者

#### 9.4.1 妊娠する可能性のある女性

妊娠していることが把握されずアンジオテンシン変換酵素阻害剤又はアンジオテンシン II 受容体拮抗剤を使用し、胎児・新生児への影響（腎不全、頭蓋・肺・腎の形成不全、死亡等）が認められた例が報告されている<sup>29)、30)</sup>。

本剤の投与に先立ち、代替薬の有無等も考慮して本剤投与の必要性を慎重に検討し、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。また、投与が必要な場合には次の注意事項に留意すること。  
[9.5 参照]

(1) 本剤投与開始前に妊娠していないことを確認すること。本剤投与中も、妊娠していないことを定期的に確認すること。投与中に妊娠が判明した場合には、直ちに投与を中止すること。

(2) 次の事項について、本剤投与開始時に患者に説明すること。また、投与中も必要に応じ説明すること。

- ・妊娠中に本剤を使用した場合、胎児・新生児に影響を及ぼすリスクがあること。
- ・妊娠が判明した又は疑われる場合は、速やかに担当医に相談すること。
- ・妊娠を計画する場合は、担当医に相談すること。

## (5) 妊婦

### 9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないこと。投与中に妊娠が判明した場合には、直ちに投与を中止すること。妊娠中期及び末期にアンジオテンシン II 受容体拮抗剤又はアンジオテンシン変換酵素阻害剤を投与された患者で羊水過少症、胎児・新生児の死亡、新生児の低血圧、腎不全、高カリウム血症、頭蓋の形成不全及び羊水過少症によると推測される四肢の拘縮、頭蓋顔面の変形、肺の低形成等があらわれたとの報告がある。[2.2、9.4.1 参照]

## (6) 授乳婦

### 9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。ラットの周産期及び授乳期に本剤を強制経口投与すると、0.3mg/kg/日以上で群で出生児に腎盂拡張が認められ、10mg/kg/日以上で体重増加の抑制が認められている。

(7) 小児等

**9.7 小児等**

小児等を対象とした臨床試験は実施していない。

(8) 高齢者

**9.8 高齢者**

低用量から投与を開始するなど慎重に投与すること。一般に過度の降圧は好ましくないとされている。脳梗塞等が起こるおそれがある。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由

**10.1 併用禁忌（併用しないこと）**

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
アリスキレンフマル酸塩 ラジレス (糖尿病患者に使用する場合。ただし、他の降圧治療を行ってもなお血圧のコントロールが著しく不良の患者を除く。) [2.3 参照]	非致死性脳卒中、腎機能障害、高カリウム血症及び低血圧のリスク増加が報告されている。	レニン-アンジオテンシン系阻害作用が増強される可能性がある。

(2) 併用注意とその理由

**10.2 併用注意（併用に注意すること）**

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
カリウム保持性利尿剤 スピロラクトン、 トリアムテレン、 エプレレノン等 カリウム補給剤 塩化カリウム等	血清カリウム値が上昇することがある。	本剤のアルドステロン分泌抑制作用によりカリウム貯留作用が増強することによる。 危険因子：特に腎機能障害のある患者
利尿降圧剤 フロセミド、 トリクロルメチアジド等 [11.1.2 参照]	本剤を初めて投与する場合、降圧作用が増強するおそれがある。本剤の投与を低用量から開始するなど、注意すること。	利尿降圧剤で治療を受けている患者にはレニン活性が亢進している患者が多く、本剤が奏効しやすい。
アリスキレンフマル酸塩	腎機能障害、高カリウム血症及び低血圧を起こすおそれがある。eGFR が60mL/min/1.73m <sup>2</sup> 未満の腎機能障害のある患者へのアリスキレンフマル酸塩との併用については、治療上やむを得ないと判断される場合を除き避けること。	レニン-アンジオテンシン系阻害作用が増強される可能性がある。
アンジオテンシン変換酵素阻害剤	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。	

リチウム	リチウム中毒が起こるおそれがある。	腎尿細管におけるリチウムの再吸収が促進される。
非ステロイド性消炎鎮痛剤 (NSAIDs) インドメタシン等	降圧作用が減弱することがある。	非ステロイド性消炎鎮痛剤は血管拡張作用を有するプロスタグランジンの合成を阻害することから、降圧作用を減弱させる可能性がある。
	腎機能障害のある患者では、さらに腎機能が悪化するおそれがある。	非ステロイド性消炎鎮痛剤のプロスタグランジン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ている。

## 8. 副作用

### 11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

#### (1) 重大な副作用と初期症状

##### 11.1 重大な副作用

###### 11.1.1 血管浮腫（頻度不明）

顔面、口唇、舌、咽・喉頭等の腫脹を症状とする血管浮腫があらわれることがある。

###### 11.1.2 ショック、失神、意識消失（頻度不明）

冷感、嘔吐、意識消失等があらわれた場合には、直ちに適切な処置を行うこと。[9.1.4、9.2.2、10.2 参照]

###### 11.1.3 急性腎障害（頻度不明）

###### 11.1.4 高カリウム血症（頻度不明）

###### 11.1.5 肝機能障害（頻度不明）

AST、ALT、 $\gamma$ -GTP の上昇等を伴う肝機能障害があらわれることがある。

###### 11.1.6 横紋筋融解症（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK 上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇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。横紋筋融解症による急性腎障害の発症に注意すること。

#### (2) その他の副作用

##### 11.2 その他の副作用

	0.1～5%未満	頻度不明
過敏症		発疹、湿疹、そう痒
循環器	めまい	
精神神経系	頭痛	
代謝異常	血中カリウム上昇、血中尿酸上昇	
消化器	下痢	
肝臓	ALT、AST の上昇	
腎臓	BUN、クレアチニンの上昇	
その他	血中 CK 上昇	咳嗽

## 9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

## 10. 過量投与

### 13. 過量投与

#### 13.1 処置

アジルサルタン及び代謝物 M-II は、透析により除去されない。

## 11. 適用上の注意

### 14. 適用上の注意

#### 14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

14.1.2 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。

14.1.3 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

## 12. その他の注意

### (1) 臨床使用に基づく情報

設定されていない

### (2) 非臨床試験に基づく情報

設定されていない

## Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

### 1. 薬理試験

- (1) 薬効薬理試験  
「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照
- (2) 安全性薬理試験  
該当資料なし
- (3) その他の薬理試験  
該当資料なし

### 2. 毒性試験

- (1) 単回投与毒性試験  
該当資料なし
- (2) 反復投与毒性試験  
該当資料なし
- (3) 遺伝毒性試験  
該当資料なし
- (4) がん原性試験  
該当資料なし
- (5) 生殖発生毒性試験  
該当資料なし
- (6) 局所刺激性試験  
該当資料なし
- (7) その他の特殊毒性  
該当資料なし



## X. 管理的事項に関する項目

### 1. 規制区分

製 剤：アジルサルタン OD 錠 10mg/20mg/40mg 「杏林」 処方箋医薬品<sup>注)</sup>  
注) 注意－医師等の処方箋により使用すること  
有効成分：アジルサルタン 該当しない

### 2. 有効期間

有効期間：3年

### 3. 包装状態での貯法

室温保存

### 4. 取扱い上の注意

設定されていない

### 5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり

くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材：

キョーリンリメディオの ACE 阻害薬、ARB のお薬を使用する女性の患者さんへ

(キョーリンリメディオ株式会社 医療関係者向けサイト <https://www.med.kyorin-rmd.com/> に掲載)

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アジルバ錠 10mg/20mg/40mg

同 効 薬：アンジオテンシンⅡ受容体拮抗薬（イルベサルタン、オルメサルタン メドキシミル、カンデサルタン シレキセチル、テルミサルタン、バルサルタン、ロサルタンカリウム）

### 7. 国際誕生年月日

2012年1月18日

### 8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
アジルサルタン OD 錠 10mg 「杏林」	2023年2月15日	30500AMX00047000	2023年6月16日	2023年6月16日
アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」	2023年2月15日	30500AMX00048000	2023年6月16日	2023年6月16日
アジルサルタン OD 錠 40mg 「杏林」	2023年2月15日	30500AMX00049000	2023年6月16日	2023年6月16日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT (9桁) 番号	レセプト電算処理 システム用コード
アジルサルタン OD 錠 10mg 「杏林」	2149048F4030	2149048F4030	129390601	622939001
アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」	2149048F5036	2149048F5036	129391301	622939101
アジルサルタン OD 錠 40mg 「杏林」	2149048F6032	2149048F6032	129392001	622939201

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 10mg「杏林」・20mg「杏林」・40mg「杏林」の安定性試験に関する資料（加速試験）
- 2) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 10mg「杏林」・20mg「杏林」・40mg「杏林」の安定性試験に関する資料（長期保存試験）
- 3) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 10mg「杏林」の安定性試験に関する資料（無包装状態での安定性）
- 4) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 20mg「杏林」の安定性試験に関する資料（無包装状態での安定性）
- 5) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 40mg「杏林」の安定性試験に関する資料（無包装状態での安定性）
- 6) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 20mg「杏林」の安定性試験に関する資料（二分割後の安定性試験）
- 7) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 40mg「杏林」の安定性試験に関する資料（二分割後の安定性試験）
- 8) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 10mg「杏林」・20mg「杏林」・40mg「杏林」の溶出性に関する資料
- 9) アジルサルタンの臨床試験成績②（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.6.26）
- 10) アジルサルタンの臨床試験成績③（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.6.27）
- 11) アジルサルタンの臨床試験成績④（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.6.28）
- 12) アジルサルタンの臨床試験成績⑤（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.6.29）
- 13) アジルサルタンの臨床試験成績⑥（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.4.5）
- 14) アジルサルタンの臨床試験成績⑦（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.6.30）
- 15) アジルサルタンの薬理作用（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.6.1）
- 16) アジルサルタンの代謝に関する検討②（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.6.2.1）
- 17) アジルサルタンの薬物動態試験成績②（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.6.5）
- 18) アジルサルタンの降圧作用に関する検討（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
- 19) アジルサルタンの薬物動態試験成績①（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.6.3）
- 20) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 10mg「杏林」・20mg「杏林」・40mg「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料
- 21) フルコナゾールとの薬物相互作用試験成績（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.6.18）
- 22) アジルサルタンの薬物動態試験成績③（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.6.1）
- 23) アジルサルタンの蛋白結合に関する検討（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.6.4.4）
- 24) アジルサルタンの代謝に関する検討①（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.6.4.1）
- 25) 腎機能障害患者における薬物動態試験成績（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.16）
- 26) アジルサルタンの臨床試験成績①（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.2.2、2.7.6.30）
- 27) 肝機能障害患者における薬物動態試験成績（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.6.17）
- 28) アジルサルタンの薬物動態試験成績④（アジルバ錠：2012年1月18日承認、申請資料概要 2.7.6.15）
- 29) 阿部真也ほか：周産期医学. 2017；47：1353-1355.
- 30) 齊藤大祐ほか：鹿児島産科婦人科学会雑誌. 2021；29：49-54.
- 31) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 10mg「杏林」の安定性試験に関する資料（粉碎後の安定性試験）
- 32) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 20mg「杏林」の安定性試験に関する資料（粉碎後の安定性試験）

- 33) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 40mg「杏林」の安定性試験に関する資料（粉碎後の安定性試験）
- 34) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 10mg「杏林」の経管投与試験に関する資料
- 35) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 20mg「杏林」の経管投与試験に関する資料
- 36) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：  
アジルサルタン OD錠 40mg「杏林」の経管投与試験に関する資料

## 2. その他の参考文献

該当資料なし

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

## XII. 備考

### 1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：

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

掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関するQ&Aについて（その3）」

令和元年9月6日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡

#### (1) 粉砕

〈アジルサルタン OD錠 10mg「杏林」〉<sup>31)</sup>

①保存条件：成り行き温度・湿度、室内散乱光、シャーレ（上部をサランラップで軽く覆ったもの）

（温度：19.0～26.0℃、湿度：35.0～98.0%、照度：204～321 lx）

試験項目 <sup>※1</sup>		開始時	0.5 ヶ月	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
外観		微黄赤色のフィルム混在する白色の粉末	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。
純度試験 (%)	類縁物質 D	0.142	0.167	0.167	0.165	0.175
	個々最大	0.090	0.107	0.107	0.106	0.111
	合計	0.257	0.315	0.317	0.331	0.353
溶出性 (%) <sup>※2</sup>		89.3～94.7	93.3～95.1	95.0～97.1	93.8～96.2	92.4～93.4
定量法 (%) <sup>※3</sup>		100.24	98.27	98.22	98.27	97.31
乾燥減量 (%)		1.8	3.7	3.4	4.4	5.1

②保存条件：30℃±2℃、75%RH±5%RH、シャーレ（上部をサランラップで軽く覆ったもの）

試験項目 <sup>※1</sup>		開始時	0.5 ヶ月	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
外観		微黄赤色のフィルム混在する白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験 (%)	類縁物質 D	0.142	0.152	0.166	0.194	0.221
	個々最大	0.090	0.099	0.107	0.125	0.142
	合計	0.257	0.292	0.313	0.370	0.428
溶出性 (%) <sup>※2</sup>		89.3～94.7	89.3～94.7	95.3～96.8	92.4～96.7	94.6～95.6
定量法 (%) <sup>※3</sup>		100.24	97.94	96.78	97.84	97.02
乾燥減量 (%)		1.8	5.3	5.3	5.2	4.8

③保存条件：成り行き温度・湿度、約1000lx照射、シャーレ（上部をサランラップで軽く覆ったもの）

（温度：20.7～27.5℃、湿度：23.4～64.8%、照度：903～1098 lx）

試験項目 <sup>※1</sup>		開始時	約13日(30万lx・hr)	約25日(60万lx・hr)
外観		微黄赤色のフィルム混在する白色の粉末	光照射面についてのみ、黄変した。	光照射面についてのみ、黄変した。
純度試験 (%)	類縁物質 D	0.142	0.165	0.165
	個々最大	0.090	0.103	0.102
	合計	0.257	0.352	0.386
溶出性 (%) <sup>※2</sup>		89.3～94.7	96.7～98.4	97.0～98.0
定量法 (%) <sup>※3</sup>		100.24	99.18	99.33
乾燥減量 (%)		1.8	3.2	3.1

※1 [規格]外観(参考データ)、純度試験：類縁物質 D 1.0%以下、個々最大 0.5%以下、類縁物質の合計 2.0%  
以下、溶出性：15 分間 75%以上、定量法：95.0~105.0%、乾燥減量(参考データ)

※2 6 個の最小値~最大値

※3 3 回の測定値の平均値

〈アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」〉<sup>32)</sup>

①保存条件：成り行き温度・湿度、室内散乱光、シャーレ（上部をサランラップで軽く覆ったもの）

(温度：19.0~26.0℃、湿度：35.0~98.0%、照度：204~321 lx)

試験項目 <sup>※1</sup>		開始時	0.5 ヶ月	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
外観		微赤色のフィルム混在する白色の粉末	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。
純度試験 (%)	類縁物質 D	0.090	0.105	0.107	0.106	0.111
	個々最大	0.053	0.063	0.064	0.063	0.066
	合計	0.158	0.200	0.205	0.220	0.226
溶出性 (%) <sup>※2</sup>		95.8~97.4	96.0~98.0	95.0~96.0	95.0~96.6	95.5~97.3
定量法 (%) <sup>※3</sup>		100.31	98.40	98.14	98.45	97.35
乾燥減量 (%)		1.6	3.3	3.3	4.5	4.6

②保存条件：30℃±2℃、75%RH±5%RH、シャーレ（上部をサランラップで軽く覆ったもの）

試験項目 <sup>※1</sup>		開始時	0.5 ヶ月	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
外観		微赤色のフィルム混在する白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験 (%)	類縁物質 D	0.090	0.103	0.112	0.128	0.146
	個々最大	0.053	0.062	0.068	0.078	0.089
	合計	0.158	0.183	0.199	0.229	0.273
溶出性 (%) <sup>※2</sup>		95.8~97.4	94.0~96.4	95.3~96.9	95.1~96.8	94.7~95.8
定量法 (%) <sup>※3</sup>		100.31	98.26	96.59	97.57	96.93
乾燥減量 (%)		1.6	4.9	5.1	5.1	4.6

③保存条件：成り行き温度・湿度、約 1000lx 照射、シャーレ（上部をサランラップで軽く覆ったもの）

(温度：20.7~27.5℃、湿度：23.4~64.8%、照度：903~1098 lx)

試験項目 <sup>※1</sup>		開始時	約 13 日 (30 万 lx・hr)	約 25 日 (60 万 lx・hr)
外観		微赤色のフィルム混在する白色の粉末	光照射面についてのみ、黄変した。	光照射面についてのみ、黄変した。
純度試験 (%)	類縁物質 D	0.090	0.106	0.105
	個々最大	0.053	0.061	0.072
	合計	0.158	0.224	0.256
溶出性 (%) <sup>※2</sup>		95.8~97.4	97.0~98.1	97.0~98.5
定量法 (%) <sup>※3</sup>		100.31	98.74	99.33
乾燥減量 (%)		1.6	3.3	3.0

※1 [規格]外観(参考データ)、純度試験：類縁物質 D 1.0%以下、個々最大 0.5%以下、類縁物質の合計 2.0%  
以下、溶出性：15 分間 75%以上、定量法：95.0~105.0%、乾燥減量(参考データ)

※2 6 個の最小値~最大値

※3 3 回の測定値の平均値

〈アジルサルタン OD錠 40mg 「杏林」〉<sup>33)</sup>

①保存条件：成り行き温度・湿度、室内散乱光、シャーレ（上部をサランラップで軽く覆ったもの）  
 （温度：19.0～26.0℃、湿度：35.0～98.0%、照度：204～321 lx）

試験項目 <sup>※1</sup>		開始時	0.5 ヶ月	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
外観		黄色のフィルム混在する白色の粉末	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。	光照射面についてのみ、僅かに黄変した。
純度試験 (%)	類縁物質 D	0.075	0.085	0.085	0.086	0.088
	個々最大	0.040	0.047	0.048	0.048	0.049
	合計	0.128	0.158	0.159	0.172	0.178
溶出性 (%) <sup>※2</sup>		91.7～101.3	92.3～93.8	93.0～93.9	92.3～93.8	93.5～94.8
定量法 (%) <sup>※3</sup>		100.03	98.13	97.99	98.19	97.21
乾燥減量 (%)		1.4	3.1	3.3	4.1	4.1

②保存条件：30℃±2℃、75%RH±5%RH、シャーレ（上部をサランラップで軽く覆ったもの）

試験項目 <sup>※1</sup>		開始時	0.5 ヶ月	1 ヶ月	2 ヶ月	3 ヶ月
外観		黄色のフィルム混在する白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験 (%)	類縁物質 D	0.075	0.081	0.087	0.099	0.113
	個々最大	0.040	0.047	0.050	0.058	0.065
	合計	0.128	0.142	0.152	0.173	0.197
溶出性 (%) <sup>※2</sup>		91.7～101.3	93.9～95.1	95.1～95.5	94.8～95.6	92.2～94.8
定量法 (%) <sup>※3</sup>		100.03	98.16	96.23	97.76	97.15
乾燥減量 (%)		1.4	4.6	4.5	4.5	4.5

③保存条件：成り行き温度・湿度、約 1000lx 照射、シャーレ（上部をサランラップで軽く覆ったもの）  
 （温度：20.7～27.5℃、湿度：23.4～64.8%、照度：903～1098 lx）

試験項目 <sup>※1</sup>		開始時	約 13 日 (30 万 lx・hr)	約 25 日 (60 万 lx・hr)
外観		黄色のフィルム混在する白色の粉末	光照射面についてのみ、黄変した。	光照射面についてのみ、黄変した。
純度試験 (%)	類縁物質 D	0.075	0.087	0.089
	個々最大	0.040	0.061	0.061
	合計	0.128	0.211	0.212
溶出性 (%) <sup>※2</sup>		91.7～101.3	96.1～97.0	96.1～97.7
定量法 (%) <sup>※3</sup>		100.03	98.86	99.21
乾燥減量 (%)		1.4	2.9	2.8

※1 [規格]外観(参考データ)、純度試験：類縁物質 D 1.0%以下、個々最大 0.5%以下、類縁物質の合計 2.0%以下、溶出性：15 分間 75%以上、定量法：95.0～105.0%、乾燥減量(参考データ)

※2 6 個の最小値～最大値

※3 3 回の測定値の平均値



## (2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

〈アジルサルタン OD 錠 10mg/20mg/40mg 「杏林」<sup>34)~36)</sup>

[試験方法]

### 崩壊懸濁試験

注入器の押し子部を抜き取り、注入器内に錠剤をそのまま1個入れて押し子を戻し注入器に55℃のお湯20mLを吸い取り、筒先の蓋をして5分間自然放置する。5分後に、崩壊・懸濁の状況を観察する。5分後に崩壊しない場合、さらに5分間放置後、注入器を手で180度15往復横転して攪拌し崩壊・懸濁の状況を再確認する。

### 通過性試験

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液の入った注入器をチューブに接続し約2~3mL/秒(10秒で20mL)の速度で注入する。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端3分の2を水平にし、他端(注入端)を30cmの高さにセットする。サイズ8Fr.長さ120cmのチューブに注入し、通過性を観察する。懸濁液を注入した後に適量の水(20mL程度)を同じ注入器で吸い取り、チューブ内を洗う。

### 懸濁液のpH測定

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液のpHを測定する。

### 懸濁液の安定性

1錠に55℃の温湯20mLを加え、10分間放置した懸濁液の含量を測定する。対照として、常温の精製水で実施した場合の含量も測定する。

[結果]

〈アジルサルタン OD 錠 10mg 「杏林」〉

崩壊懸濁試験	5分で崩壊・懸濁した。
通過性試験	サイズ8Fr.長さ120cmのチューブを通過した。 その後、20mLの水を注入してチューブ内を洗浄したとき、薬剤は残存していなかった。
懸濁液のpH	6.44
懸濁液の含量 (n=3の平均値)	55℃の温湯 : 101.33% 常温の精製水 : 101.80%

〈アジルサルタン OD 錠 20mg 「杏林」〉

崩壊懸濁試験	5分で崩壊・懸濁した。
通過性試験	サイズ8Fr.長さ120cmのチューブを通過した。 その後、20mLの水を注入してチューブ内を洗浄したとき、薬剤は残存していなかった。
懸濁液のpH	6.46
懸濁液の含量 (n=3の平均値)	55℃の温湯 : 101.50% 常温の精製水 : 101.85%

〈アジルサルタン OD 錠 40mg 「杏林」〉

崩壊懸濁試験	5分で崩壊・懸濁した。
通過性試験	サイズ8Fr.長さ120cmのチューブを通過した。 その後、20mLの水を注入してチューブ内を洗浄したとき、薬剤は残存していなかった。
懸濁液のpH	6.31
懸濁液の含量 (n=3の平均値)	55℃の温湯 : 100.38% 常温の精製水 : 100.32%

## 2. その他の関連資料

該当資料なし