

貯法：室温保存  
有効期間：3年  
処方箋医薬品：注意－医師等の処方箋により使用すること

	錠5mg	錠10mg	錠20mg	錠40mg
承認番号	22900AMX00741000	22900AMX00742000	22900AMX00739000	22900AMX00740000
販売開始	2017年12月	2017年12月	2017年12月	2017年12月

高親和性AT<sub>1</sub>レセプターブロッカー

日本薬局方 オルメサルタン メドキシソミル錠

オルメサルタン錠5mg「TCK」

オルメサルタン錠10mg「TCK」

オルメサルタン錠20mg「TCK」

オルメサルタン錠40mg「TCK」

OLMESARTAN Tablets 「TCK」

## 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. 組成・性状

### 3.1 組成

販売名	有効成分（1錠中）	添加剤
オルメサルタン錠5mg「TCK」	オルメサルタン メドキシソミル（日局）5mg	乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、黄色三酸化鉄
オルメサルタン錠10mg「TCK」	オルメサルタン メドキシソミル（日局）10mg	
オルメサルタン錠20mg「TCK」	オルメサルタン メドキシソミル（日局）20mg	乳糖水和物、ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、ステアリン酸マグネシウム
オルメサルタン錠40mg「TCK」	オルメサルタン メドキシソミル（日局）40mg	

### 3.2 製剤の性状

販売名	外形			色調 剤形 <sup>注)</sup>
	直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)	
オルメサルタン錠5mg「TCK」	 7.0	 2.4	 120	淡黄白色 素錠
オルメサルタン錠10mg「TCK」	 7.0	 2.4	 120	白色 素錠 (割線入り)
オルメサルタン錠20mg「TCK」	 8.0	 2.5	 160	白色 素錠 (割線入り)
オルメサルタン錠40mg「TCK」	 9.5	 3.6	 320	白色 素錠 (割線入り)

注) においはないか、又はわずかに特異なにおいがある。

## 4. 効能又は効果

高血圧症

## 6. 用法及び用量

通常、成人にはオルメサルタン メドキシソミルとして10～20mgを1日1回経口投与する。なお、1日5～10mgから投与を開始し、年齢、症状により適宜増減するが、1日最大投与量は40mgまでとする。

## 8. 重要な基本的注意

- 8.1 本剤を含むアンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤投与中に重篤な肝機能障害があらわれたとの報告があるので、肝機能検査を実施するなど観察を十分に行うこと。[11.1.5 参照]
- 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。
- 8.3 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。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

- 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過剰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惹起し、病態を悪化させるおそれがある。
  - 9.1.4 厳重な減塩療法中の患者  
低用量から投与を開始し、増量する場合は徐々に行うこと。一過性の急激な血圧低下を起こすおそれがある。[11.1.4 参照]
- 9.2 腎機能障害患者
  - 9.2.1 重篤な腎機能障害（血清クレアチニン値3.0mg/dL以上）のある患者  
これらの患者を対象とした有効性及び安全性を検討する臨床試験は実施していない。腎機能を悪化させるおそれがある。[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し、増量する場合は徐々に行うこと。一過性の急激な血圧低下を起こすおそれがある。[11.1.4 参照]

### 9.3 肝機能障害患者

軽度又は中等度の肝機能障害患者（Child-Pugh 分類スコア：5～9）でオルメサルタンの血漿中濃度が上昇することが報告されている。[16.6.2 参照]

### 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>1),2)</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。

### 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、肺の形成不全等があらわれたとの報告がある。[2.2、9.4.1 参照]

### 9.6 授乳婦

授乳しないことが望ましい。動物実験（ラット）の5mg/kg/日で乳汁中への移行が認められている。動物実験（ラット周産期及び授乳期経口投与）の200mg/kg/日で出生児に腎盂拡張を伴う死亡及び体重減少が、8mg/kg/日で出生児に体重増加抑制及び生後分化の遅延が認められている。

### 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。

### 9.8 高齢者

開始用量を遵守し、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。

## 10. 相互作用

### 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。

### 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おそれがある。 危険因子：腎機能障害のある患者

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
利尿降圧剤 フロセミド、トリクロルメチアジド等 [11.1.4 参照]	一過性の急激な血圧低下を起こすおそれがある。低用量から投与を開始し、増量する場合は徐々に行うこと。	利尿降圧剤で治療を受けている患者にはレニン活性が亢進している患者が多く、本剤が奏効しやすい。
リチウム製剤 炭酸リチウム	リチウム中毒が起こるおそれがある。	明確な機序は不明であるが、ナトリウムイオン不足はリチウムイオンの貯留を促進するといわれているため、本剤がナトリウム排泄を促進することにより起こると考えられる。
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。	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。
非ステロイド性消炎鎮痛剤	降圧作用が減弱するおそれがある。	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阻害作用により、本剤の降圧作用を減弱させる可能性がある。
非ステロイド性消炎鎮痛剤	腎機能を悪化させるおそれがある。	プロスタグランジンの合成阻害作用により、腎血流量が低下するためと考えられる。

## 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。

### 11.1 重大な副作用

#### 11.1.1 血管浮腫（頻度不明）

顔面、口唇、咽頭、舌の腫脹等が症状としてあらわれることがある。

#### 11.1.2 腎不全（頻度不明）

#### 11.1.3 高カリウム血症（頻度不明）

#### 11.1.4 ショック（頻度不明）、失神（頻度不明）、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]

#### 11.1.5 肝機能障害（頻度不明）、黄疸（頻度不明）

AST、ALT、γ-GTP 上昇等の肝機能障害があらわれることがある。[8.1 参照]

#### 11.1.6 血小板減少（頻度不明）

#### 11.1.7 低血糖（頻度不明）

脱力感、空腹感、冷汗、手の震え、集中力低下、痙攣、意識障害等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。糖尿病治療中の患者であらわれやすい。

#### 11.1.8 横紋筋融解症（頻度不明）

筋肉痛、脱力感、CK 上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とする横紋筋融解症があらわれることがあるので、このような場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

### 11.1.9 アナフィラキシー（頻度不明）

そう痒感、全身発赤、血圧低下、呼吸困難等が症状としてあらわれることがあり、アナフィラキシーショックを起こしたとの報告もある。

### 11.1.10 重度の下痢（頻度不明）

長期投与により、体重減少を伴う重度の下痢があらわれることがある。生検により腸絨毛萎縮等が認められたとの報告がある。

### 11.1.11 間質性肺炎（頻度不明）

発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部 X 線異常等を伴う間質性肺炎があらわれることがあるので、このような場合には投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。

## 11.2 その他の副作用

	1～5%未満	1%未満	頻度不明
過敏症		発疹	そう痒
血液	赤血球数減少、ヘモグロビン減少、ヘマトクリット減少	白血球数増加、血小板数減少	貧血
精神神経系	めまい、立ちくらみ、ふらつき感	頭痛、頭重感、眠気	
消化器		軟便	下痢、嘔気・嘔吐、口渇、口内炎、胃部不快感、便秘、腹痛
循環器			心房細動、動悸、ほてり、胸痛
肝臓	ALT 上昇、AST 上昇、 $\gamma$ -GTP 上昇、LDH 上昇	ALP 上昇	
泌尿器	BUN 上昇	血清クレアチニン上昇、尿蛋白陽性、尿沈渣陽性	頻尿
その他	CK 上昇、CRP 上昇、トリグリセリド上昇、血清カリウム上昇、尿酸上昇	全身倦怠感、咳嗽	浮腫、異常感（浮遊感、気分不良等）、胸部不快感、筋肉痛、脱力感、疲労、しびれ、味覚異常、脱毛

## 14. 適用上の注意

### 14.1 薬剤調製時の注意

本剤をメトホルミン塩酸塩製剤又はカモスタットメシル酸塩製剤等と一包化し高温多湿条件下にて保存した場合、メトホルミン塩酸塩製剤又はカモスタットメシル酸塩製剤等が変色することがあるので、一包化は避けること。

### 14.2 薬剤交付時の注意

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

## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

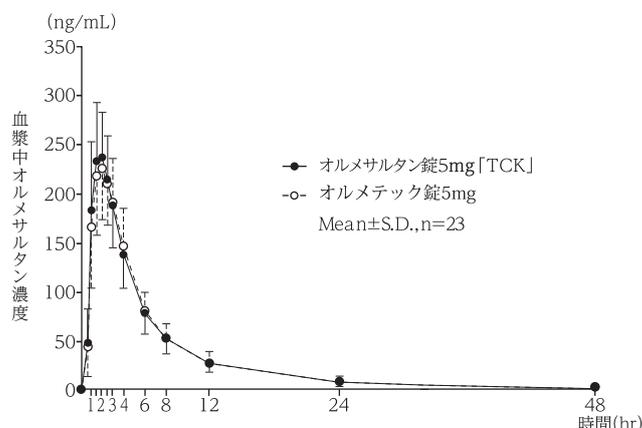
#### 16.1.1 生物学的同等性試験

##### 〈オルメサルタン錠 5mg [TCK]〉

オルメサルタン錠 5mg [TCK] とオルメテック錠 5mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（オルメサルタン メドキシソミル 5mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中活性代謝物濃度を測定し、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<sup>3)</sup>。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→48hr</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
オルメサルタン錠 5mg [TCK]	1505.29±358.74	252.65±46.16	1.78±0.47	8.95±0.98
オルメテック錠 5mg	1496.98±342.07	240.64±45.05	2.04±0.64	8.88±0.91

(Mean±S.D., n=23)

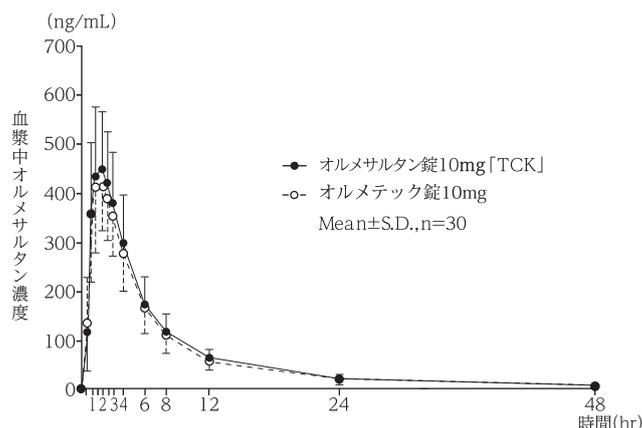


##### 〈オルメサルタン錠 10mg [TCK]〉

オルメサルタン錠 10mg [TCK] とオルメテック錠 10mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（オルメサルタン メドキシソミル 10mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中活性代謝物濃度を測定し、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<sup>4)</sup>。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→48hr</sub> (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
オルメサルタン錠 10mg [TCK]	3151.76±805.90	490.49±113.89	1.95±0.79	8.48±1.13
オルメテック錠 10mg	2983.05±717.21	454.64±94.67	1.85±0.67	8.67±1.18

(Mean±S.D., n=30)

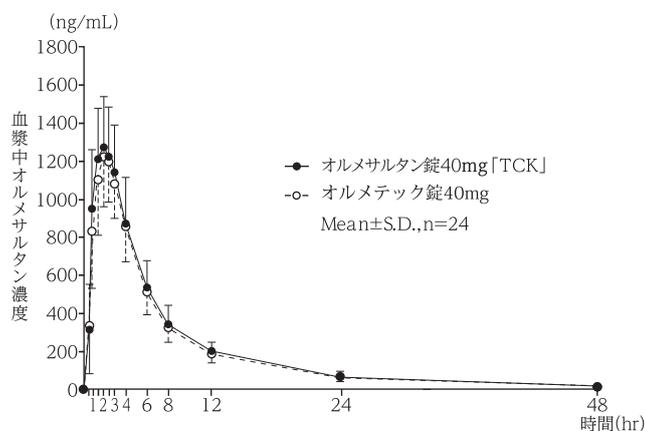


##### 〈オルメサルタン錠 40mg [TCK]〉

オルメサルタン錠 40mg [TCK] とオルメテック錠 40mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（オルメサルタン メドキシソミル 40mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中活性代謝物濃度を測定し、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<sup>5)</sup>。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC <sub>0→48hr</sub> (ng・hr/mL)	C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
オルメサルタン錠 40mg 〔TCK〕	9226.65±2003.69	1326.50±249.96	1.85±0.56	9.56±1.46
オルメテック錠 40mg	8790.61±1558.51	1278.22±239.49	2.17±0.60	9.66±1.17

(Mean±S.D., n=24)



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。

## 16.6 特定の背景を有する患者

### 16.6.1 腎機能障害患者

健康な成人男性 8 例と、腎機能障害患者 26 例を重症度別に 8～9 例ずつ 3 群に分けた計 34 例に対し、オルメサルタン メドキシソミル 10mg を 1 日 1 回 7 日間反復経口投与したときの 7 日目の定常状態における血漿中オルメサルタンの AUC の幾何平均値は、腎機能正常者と比較して、軽度、中等度及び重度腎機能障害患者でそれぞれ 1.6 倍、1.8 倍、2.8 倍であった<sup>6)</sup> (外国人データ)。[9.2.1 参照]

### 16.6.2 肝機能障害患者

軽度及び中等度肝機能障害患者 12 例にオルメサルタン メドキシソミル 10mg を空腹時単回経口投与したとき、肝機能正常者と比較して血漿中オルメサルタンの AUC はそれぞれ 1.1 倍、1.7 倍であった<sup>6)</sup> (外国人データ)。[9.3 参照]

## 16.8 その他

### 〈オルメサルタン錠 20mg 〔TCK〕〉

オルメサルタン錠 20mg 〔TCK〕は、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン (平成 24 年 2 月 29 日薬食審査発 0229 第 10 号)」に基づき、オルメサルタン錠 40mg 〔TCK〕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<sup>7)</sup>。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

オルメサルタン メドキシソミルはプロドラッグであり、生体内で活性代謝物であるオルメサルタンに変換され、アンジオテンシン II (A II) タイプ 1 (AT<sub>1</sub>) 受容体を選択的に作用して A II の結合を競合的に阻害し、昇圧系である A II の薬理作用を抑制する<sup>8)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的知見

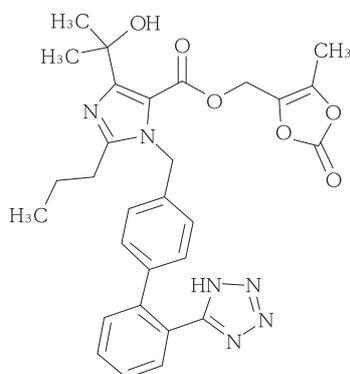
一般的名称：オルメサルタン メドキシソミル (Olmesartan Medoxomil)

化学名：(5-Methyl-2-oxo-1,3-dioxol-4-yl) methyl 4-(1-hydroxy-1-methylethyl)-2-propyl-1-[[2'-(1H-tetrazol-5-yl) biphenyl-4-yl] methyl]-1H-imidazole-5-carboxylate

分子式：C<sub>29</sub>H<sub>30</sub>N<sub>6</sub>O<sub>6</sub>

分子量：558.59

## 構造式：



性状：白色～微黄白色の結晶性の粉末である。  
アセトニトリル又はエタノール (99.5) に溶けにくく、水にほとんど溶けない。

## 20. 取扱い上の注意

アルミピロー開封後は湿気を避けて保存すること。

## 22. 包装

### 〈オルメサルタン錠 5mg 〔TCK〕〉

100 錠 (10 錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り)

### 〈オルメサルタン錠 10mg 〔TCK〕〉

100 錠 (10 錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り)

### 〈オルメサルタン錠 20mg 〔TCK〕〉

100 錠 (10 錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り)

500 錠 (10 錠 (PTP) × 50、乾燥剤入り)

### 〈オルメサルタン錠 40mg 〔TCK〕〉

100 錠 (10 錠 (PTP) × 10、乾燥剤入り)

## 23. 主要文献

- 1) 阿部真也ほか：周産期医学. 2017; 47: 1353-1355
- 2) 齊藤大祐ほか：鹿児島産科婦人科学会雑誌. 2021; 29: 49-54
- 3) 社内資料：生物学的同等性試験 (錠 5mg)
- 4) 社内資料：生物学的同等性試験 (錠 10mg)
- 5) 社内資料：生物学的同等性試験 (錠 40mg)
- 6) von Bergmann K, et al. : J Hypertens. 2001; 19 (S1) : S33-S40
- 7) 社内資料：生物学的同等性試験 (錠 20mg)
- 8) 薬理学的分類 (オルメテック錠：2004 年 1 月 29 日承認、申請資料概要 2.5.1.3)

## 24. 文献請求先及び問い合わせ先

辰巳化学株式会社 薬事・学術課  
〒921-8164 金沢市久安 3 丁目 406 番地  
TEL 076-247-2132  
FAX 076-247-5740

## 26. 製造販売業者等

### 26.1 製造販売元



辰巳化学株式会社

金沢市久安 3 丁目 406 番地