＊＊2020年１月改訂（第４版）
＊2018年11月改訂

日本標準商品分類番号
872149

貯　　法：気密容器、室温保存
使用期限：外箱等に表示

高親和性AT_1レセプターブロッカー

	承認番号	薬価収載	販売開始
5mg	22900AMX00763000	2017年12月	2017年12月
10mg	22900AMX00764000	2017年12月	2017年12月
20mg	22900AMX00765000	2017年12月	2017年12月
40mg	22900AMX00766000	2017年12月	2017年12月

処方箋医薬品注）

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

OLMESARTAN OD Tablets 5mg「KN」・10mg「KN」・20mg「KN」・40mg「KN」
オルメサルタン メドキソミル口腔内崩壊錠

注）注意－医師等の処方箋により使用すること

【禁忌（次の患者には投与しないこと）】
（1）本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
（2）妊婦又は妊娠している可能性のある婦人（「妊婦、産婦、授乳婦等への投与」の項参照）
（3）アリスキレンフマル酸塩を投与中の糖尿病患者（ただし、他の降圧治療を行ってもなお血圧のコントロールが著しく不良の患者を除く）［非致死性脳卒中、腎機能障害、高カリウム血症及び低血圧のリスク増加が報告されている。］（「重要な基本的注意」の項参照）

【組成・性状】

品　名	オルメサルタンOD錠５mg「KN」	オルメサルタンOD錠10mg「KN」
成分・含量	１錠中、日局オルメサルタン メドキソミル５mg含有	１錠中、日局オルメサルタン メドキソミル10mg含有
添加物	D-マンニトール、L-グルタミン酸、スクラロース、黄色三二酸化鉄、トウモロコシデンプン、ジメチルポリシロキサン（内服用）、軽質無水ケイ酸、香料、その他１成分	D-マンニトール、L-グルタミン酸、スクラロース、トウモロコシデンプン、ジメチルポリシロキサン（内服用）、軽質無水ケイ酸、香料、その他１成分
性　状※	淡黄白色の素錠（口腔内崩壊錠）	白色の素錠であり、割線を有する（口腔内崩壊錠）
大きさ	直径：約7.0mm 厚さ：約3.2mm 重量：約110mg	直径：約7.0mm 厚さ：約3.1mm 重量：約110mg
外　形		
識別コード	オルメサルタンOD 5 KN	オルメサルタンOD 10 KN

品　名	オルメサルタン OD錠20mg「KN」	オルメサルタンOD錠40mg「KN」
成分・含量	１錠中、日局オルメサルタン メドキソミル20mg含有	１錠中、日局オルメサルタン メドキソミル40mg含有
添加物	D-マンニトール、L-グルタミン酸、スクラロース、トウモロコシデンプン、ジメチルポリシロキサン（内服用）、軽質無水ケイ酸、香料、その他１成分	
性　状※	白色の素錠であり、割線を有する（口腔内崩壊錠）	白色の素錠であり、割線を有する（口腔内崩壊錠）
大きさ	直径：約8.0mm 厚さ：約3.6mm 重量：約165mg	直径：約9.5mm 厚さ：約4.2mm 重量：約275mg
外　形		
識別コード	オルメサルタンOD 20 KN	オルメサルタンOD 40 KN

※においはないか、又はわずかに特異なにおいがある。

【効能・効果】
高血圧症

【用法・用量】
通常、成人にはオルメサルタン　メドキソミルとして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。

＜用法・用量に関連する使用上の注意＞
本剤は口腔内で速やかに崩壊するが、口腔粘膜からの吸収により効果発現を期待する薬剤ではないため、崩壊後は唾液又は水で飲み込むこと。

【使用上の注意】
１．慎重投与（次の患者には慎重に投与すること）
（1）両側性腎動脈狭窄のある患者又は片腎で腎動脈狭窄のある患者（「重要な基本的注意」の項参照）
（2）高カリウム血症の患者（「重要な基本的注意」の項参照）
（3）重篤な腎機能障害のある患者［腎機能を悪化させるおそれがある。血清クレアチニン値が3.0mg/dL以上の患者での十分な使用経験はないので、このような患者に対しては状態を観察しながら慎重に投与すること。］
（4）肝機能障害のある患者［外国において、軽度又は中等度の肝機能障害患者でオルメサルタンの血漿中濃度（AUC）が、健康な成人と比較してそれぞれ1.1倍と1.7倍に上昇することが報告されている。］
（5）脳血管障害のある患者［過度の降圧が脳血流不全を惹起し、病態を悪化させるおそれがある。］
（6）高齢者（「高齢者への投与」の項参照）
２．重要な基本的注意
（1）両側性腎動脈狭窄のある患者又は片腎で腎動脈狭窄のある患者においては、腎血流量の減少や糸球体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ので、治療上やむを得ないと判断される場合を除き、使用は避けること。
（2）高カリウム血症の患者においては、高カリウム血症を増悪させるおそれがあるので、治療上やむを得ないと判断される場合を除き、使用は避けること。
また、腎機能障害、コントロール不良の糖尿病等により血清カリウム値が高くなりやすい患者では、高カリウム血症が発現するおそれがあるので、血清カリウム値に注意すること。

(3)本剤の投与によって、**一過性の急激な血圧低下を起こすおそれがあるので、そのような場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。また、特に次の患者では低用量から投与を開始し、増量する場合は患者の状態を十分に観察しながら徐々に行うこと。**
1)血液透析中の患者
2)利尿降圧剤投与中の患者
3)厳重な減塩療法中の患者

(4)アリスキレンフマル酸塩を併用する場合、腎機能障害、高カリウム血症及び低血圧を起こすおそれがあるため、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。なお、eGFRが60mL/min/1.73m²未満の腎機能障害のある患者へのアリスキレンフマル酸塩との併用については、治療上やむを得ないと判断される場合を除き避けること。

(5)本剤を含むアンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤投与中に重篤な肝機能障害があらわれたとの報告がある。肝機能検査を実施するなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(6)手術前24時間は投与しないことが望ましい。

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

3．相互作用

併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
カリウム保持性利尿剤 スピロノラクトン、トリアムテレン等 **カリウム補給剤** 塩化カリウム等	血清カリウム値が上昇することがある。	併用によりカリウム貯留作用が増強するおそれがある。 危険因子：腎機能障害のある患者
リチウム製剤 炭酸リチウム	血中リチウム濃度が上昇し、リチウム中毒を起こすおそれがあるので、血中リチウム濃度に注意すること。	明確な機序は不明であるが、ナトリウムイオン不足はリチウムイオンの貯留を促進するといわれているため、本剤がナトリウム排泄を促進することにより起こると考えられる。
アリスキレンフマル酸塩	腎機能障害、高カリウム血症及び低血圧を起こすおそれがあるため、腎機能、血清カリウム値及び血圧を十分に観察すること。なお、eGFRが60mL/min/1.73m²未満の腎機能障害のある患者へのアリスキレンフマル酸塩との併用については、治療上やむを得ないと判断される場合を除き避けること。	併用によりレニン-アンジオテンシン系阻害作用が増強される可能性がある。
アンジオテンシン変換酵素阻害剤	腎機能障害、高カリウム血症及び低血圧を起こすおそれがあるため、腎機能、血清カリウム値及び血圧を十分に観察すること。	
非ステロイド性消炎鎮痛剤	降圧作用が減弱するおそれがある。	プロスタグランジンの合成阻害作用により、本剤の降圧作用を減弱させる可能性がある。
	腎機能を悪化させるおそれがある。	プロスタグランジンの合成阻害作用により、腎血流量が低下するためと考えられる。

4．副作用

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。

(1)重大な副作用(頻度不明)

1)**血管浮腫**：顔面、口唇、咽頭、舌の腫脹等が症状としてあらわれることがあるので観察を十分に行うこと。

2)**腎不全**：腎不全があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

3)**高カリウム血症**：重篤な高カリウム血症があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、直ちに適切な処置を行うこと。

4)**ショック、失神、意識消失**：ショック、血圧低下に伴う失神、意識消失があらわれることがあるので、観察を十分に行い、冷感、嘔吐、意識消失等があらわれた場合には、直ちに適切な処置を行うこと。特に血液透析中、厳重な減塩療法中、利尿降圧剤投与中の患者では低用量から投与を開始し、増量する場合は患者の状態を十分に観察しながら徐々に行うこと。

5)**肝機能障害、黄疸**：AST(GOT)、ALT(GPT)、γ-GTPの上昇等の肝機能障害、黄疸があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

6)**血小板減少**：血小板減少があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

7)**低血糖**：低血糖があらわれることがある(糖尿病治療中の患者であらわれやすい)ので、観察を十分に行い、脱力感、空腹感、冷汗、手の震え、集中力低下、痙攣、意識障害等があらわれた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

8)**横紋筋融解症**：筋肉痛、脱力感、CK(CPK)上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇を特徴とする横紋筋融解症があらわれることがあるので、観察を十分に行い、このような場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。

9)**アナフィラキシー**：そう痒感、全身発赤、血圧低下、呼吸困難等が症状としてあらわれることがあり、またアナフィラキシーショックを起こしたとの報告もあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

10)**重度の下痢**：長期投与により、体重減少を伴う重度の下痢があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。なお、生検により腸絨毛萎縮等が認められたとの報告がある。

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

(2)その他の副作用

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

	頻　度　不　明
過敏症注)	そう痒、発疹
血　液	貧血、血小板数減少、白血球数増加
精神神経系	めまい、立ちくらみ、ふらつき感、頭痛、頭重感、眠気
消化器	下痢、嘔気・嘔吐、口渇、口内炎、胃部不快感、便秘、腹痛
循環器	心房細動、動悸、ほてり、胸痛
肝　臓	ALT(GPT)上昇、AST(GOT)上昇、γ-GTP上昇、LDH上昇、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(CPK)上昇、血清カリウム上昇、尿酸上昇、全身倦怠感、咳嗽、浮腫、CRP上昇、トリグリセリド上昇、異常感(浮遊感、気分不良等)、胸部不快感、筋肉痛、脱力感、疲労、しびれ、味覚異常、脱毛

注)投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

5．高齢者への投与

(1)高齢者では一般に過度の降圧は好ましくないとされているので、開始用量を遵守し、患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。[脳梗塞等が起こるおそれがある。]

(2)65歳未満の非高齢者と65歳以上の高齢者において本剤の降圧効果及び副作用に差はみられなかった。

6．妊婦、産婦、授乳婦等への投与

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

(2)授乳中の婦人への投与を避け、やむを得ず投与する場合には授乳を中止させること。[動物実験(ラット)の5mg/kg/日で乳汁中への移行が認められている。また、動物実験(ラット周産期及び授乳期経口投与)の200mg/kg/日で出生児に腎盂拡張を伴う死亡及び体重減少が、8mg/kg/日で出生児に体重増加抑制及び生後分化の遅延が認められている。]

7．小児等への投与

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

8．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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

(2)**服用時**

1)本剤は舌の上にの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。

2)本剤は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

【薬物動態】

<生物学的同等性試験>

1．オルメサルタン OD錠5mg「KN」

オルメサルタンOD錠5mg「KN」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日付　薬食審査発0229第10号)に基づき、オルメサルタンOD錠20mg「KN」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。[1)]

2．オルメサルタンOD錠10mg「KN」

オルメサルタンOD錠10mg「KN」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日付　薬食審査発0229第10号)に基づき、オルメサルタンOD錠20mg「KN」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。[2)]

3．オルメサルタンOD錠20mg「KN」

オルメサルタンOD錠20mg「KN」と標準製剤(普通錠)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 メドキソミル20mg)健康成人男性に水あり及び水なし※で絶食単回経口投与して血漿中活性代謝物オルメサルタン濃度を測定し、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)～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(図1、図2、表1、表2)。[3)]

※水なしの服用はオルメサルタンOD錠20mg「KN」のみで、標準製剤(普通錠)は水で服用

(1)水あり(オルメサルタンOD錠20mg「KN」、標準製剤ともに水で服用)

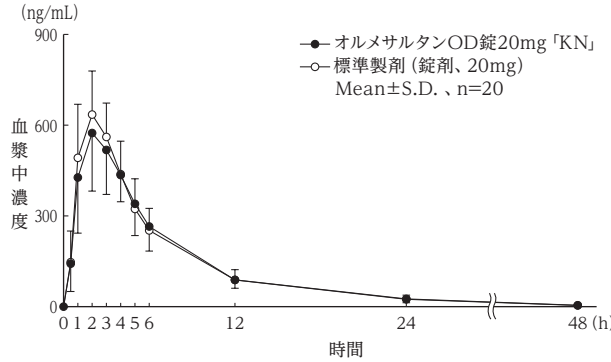


図1　活性代謝物オルメサルタンの血漿中濃度推移(水あり)

表1　薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\to48h}$ (ng·h/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (h)	$t_{1/2}$ (h)
オルメサルタン OD錠20mg「KN」	4460±1050	609±155	2.4±0.9	7.7±1.8
標準製剤(錠剤、20mg)	4590±1210	658±139	2.1±0.6	7.8±2.0

(Mean±S.D.、n=20)

(2)水なし(オルメサルタンOD錠20mg「KN」は水なしで服用、標準製剤は水で服用)

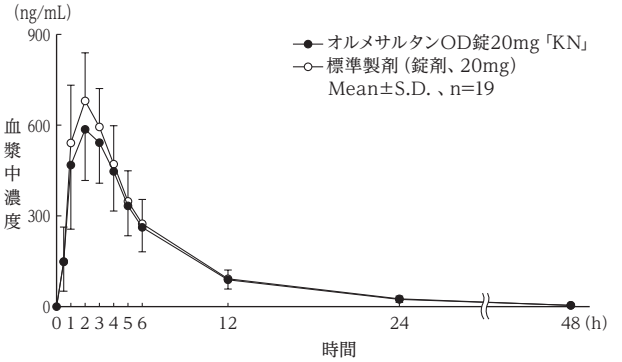


図2　活性代謝物オルメサルタンの血漿中濃度推移(水なし)

表2　薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\to48h}$ (ng・h/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (h)	$t_{1/2}$ (h)
オルメサルタンOD錠20mg「KN」	4530±1190	637±169	2.1±0.7	7.9±1.7
標準製剤(錠剤、20mg)	4870±1150	710±155	2.1±0.5	7.8±1.7

(Mean±S.D.、n=19)

4．オルメサルタンOD錠40mg「KN」

オルメサルタンOD錠40mg「KN」と標準製剤(普通錠)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 メドキソミル40mg)健康成人男性に水あり及び水なし※で絶食単回経口投与して血漿中活性代謝物オルメサルタン濃度を測定し、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)～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(図3、図4、表3、表4)。[4)]

※水なしの服用はオルメサルタンOD錠40mg「KN」のみで、標準製剤(普通錠)は水で服用

(1)水あり(オルメサルタンOD錠40mg「KN」、標準製剤ともに水で服用)

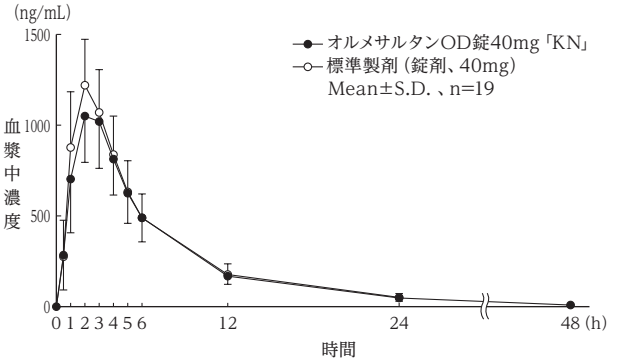


図3　活性代謝物オルメサルタンの血漿中濃度推移(水あり)

表3　薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\to48h}$ (ng・h/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (h)	$t_{1/2}$ (h)
オルメサルタンOD錠40mg「KN」	8360±1930	1140±226	2.4±0.8	8.7±1.4
標準製剤(錠剤、40mg)	8880±2150	1260±240	2.2±0.4	8.5±1.6

(Mean±S.D.、n=19)

(2)水なし(オルメサルタンOD錠40mg「KN」は水なしで服用、標準製剤は水で服用)

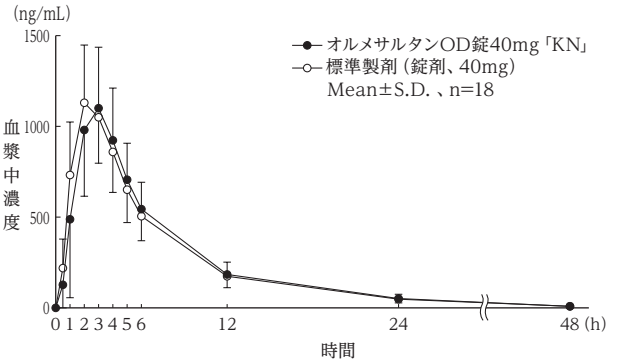


図4　活性代謝物オルメサルタンの血漿中濃度推移(水なし)

表4　薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\to48h}$ (ng・h/mL)	Cmax (ng/mL)	tmax (h)	$t_{1/2}$ (h)
オルメサルタンOD錠40mg「KN」	8720±2540	1180±347	2.6±0.8	7.8±1.5
標準製剤(錠剤、40mg)	8640±2080	1200±263	2.3±0.8	8.0±1.3

(Mean±S.D.、n=18)

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。

【薬効薬理】

アンジオテンシンⅡ受容体のサブタイプAT_1受容体の拮抗薬。内因性昇圧物質のアンジオテンシンⅡに対して受容体レベルで競合的に拮抗することにより降圧作用を現す。なお、本薬はプロドラッグであり、経口投与後、主に小腸上皮においてエステラーゼにより加水分解を受け、活性代謝物であるオルメサルタンに変換される。[5)]

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：オルメサルタン メドキソミル
(Olmesartan Medoxomil)

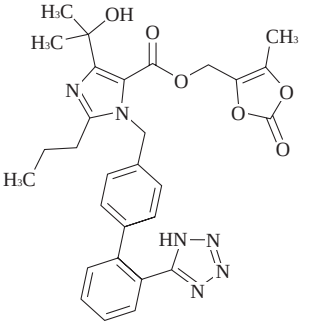
化学名：(5-Methyl-2-oxo-1,3-dioxol-4-yl)methyl 4-(1-hydroxy-1-methylethyl)-2-propyl-1-{[2'-(1*H*-tetrazol-5-yl)biphenyl-4-yl]methyl}-1*H*-imidazole-5-carboxylate

分子式：$C_{29}H_{30}N_6O_6$

分子量：558.59

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。

構造式：



【取扱い上の注意】

1. 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。
2. 本剤は崩壊性を考慮し設計された製剤（湿製錠）のため、製剤の製法上、錠剤のエッジや側面が滑らかでないことがある。
3. 自動分包機を使用する場合は欠けることがあるため、カセットの位置及び錠剤投入量などに配慮すること。

*<安定性試験>[6)]

オルメサルタンOD錠５mg「KN」

最終包装製品を用いた長期保存試験（25℃、60%RH、３年間）の結果、通常の市場流通下において３年間安定であることが確認された。

オルメサルタンOD錠10mg「KN」、オルメサルタンOD錠20mg「KN」、オルメサルタンOD錠40mg「KN」

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、75%RH、６ヵ月）の結果、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。

【包装】

オルメサルタンOD錠５mg「KN」
　　ＰＴＰ：100錠
オルメサルタンOD錠10mg「KN」
　　ＰＴＰ：100錠
オルメサルタンOD錠20mg「KN」
　　ＰＴＰ：100錠　140錠　500錠
　　バ　ラ：500錠
オルメサルタンOD錠40mg「KN」
　　ＰＴＰ：100錠

【主要文献】

1）小林化工株式会社・社内資料（生物学的同等性試験）
2）小林化工株式会社・社内資料（生物学的同等性試験）
3）小林化工株式会社・社内資料（生物学的同等性試験）
4）小林化工株式会社・社内資料（生物学的同等性試験）
5）第十七改正日本薬局方解説書
6）小林化工株式会社・社内資料（安定性試験）

【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

小林化工株式会社　安全管理部
〒919－0603　福井県あわら市矢地5－15
0120－37－0690　TEL 0776－73－0911
FAX 0776－73－0821

製造販売元
小林化工株式会社
福井県あわら市矢地5-15

（D.1.0）005
11169-5