** 2023年 5 月改訂（第3版）
* 2020年 1 月改訂

日本標準商品分類番号
872149

高親和性AT1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

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

処方箋医薬品：注意－医師等の処方箋により使用すること
貯法：室温保存、開封後は湿気を避けて保存すること
使用期限：外装に表示

【　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女性（「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　】

オルメサルタン錠5mg「TCK」は1錠中にオルメサルタン　メドキソミル（日局）を5mg含有する。
添加物として、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、黄色三二酸化鉄を含有する。
オルメサルタン錠10mg「TCK」は1錠中にオルメサルタン　メドキソミル（日局）を10mg含有する。
オルメサルタン錠20mg「TCK」は1錠中にオルメサルタン　メドキソミル（日局）を20mg含有する。
オルメサルタン錠40mg「TCK」は1錠中にオルメサルタン　メドキソミル（日局）を40mg含有する。
添加物としてそれぞれに、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を含有する。

販売名	外形 直径（mm）	外形 厚さ（mm）	外形 重量（mg）	色調 剤形注)
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。

【　効能又は効果　】

高血圧症

【　用法及び用量　】

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。

【　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/1.73m^{2}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**：瘙痒感、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)	瘙痒、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オルメサルタン　メドキソミル製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女性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）妊娠する可能性のある女性に投与する場合には、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。
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。

[妊娠していることが把握されずアンジオテンシン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。[1),2)]]

**(3) 授乳中の女性への投与を避け、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

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。)

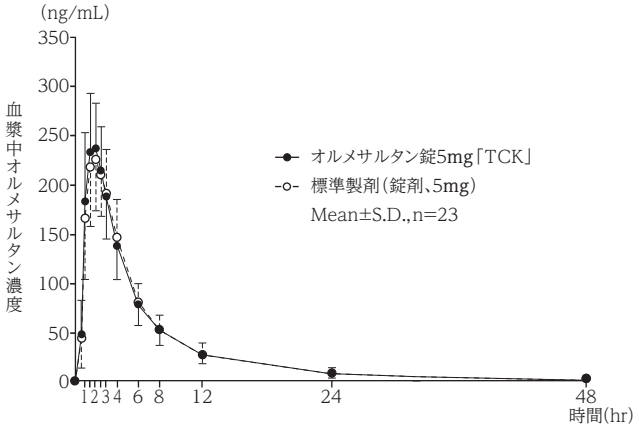
【　薬物動態　】

生物学的同等性試験

オルメサルタン錠5mg「TCK」と標準製剤を、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）～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)]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\to48hr}$ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$T_{1/2}$ (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
標準製剤（錠剤、5mg）	1496.98±342.07	240.64±45.05	2.04±0.64	8.88±0.91

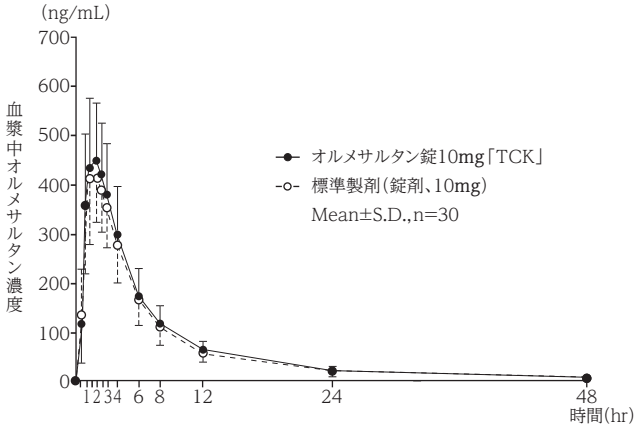
（Mean±S.D.,n=23）



オルメサルタン錠10mg「TCK」と標準製剤を、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）～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)]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\to48hr}$ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$T_{1/2}$ (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
標準製剤（錠剤、10mg）	2983.05±717.21	454.64±94.67	1.85±0.67	8.67±1.18

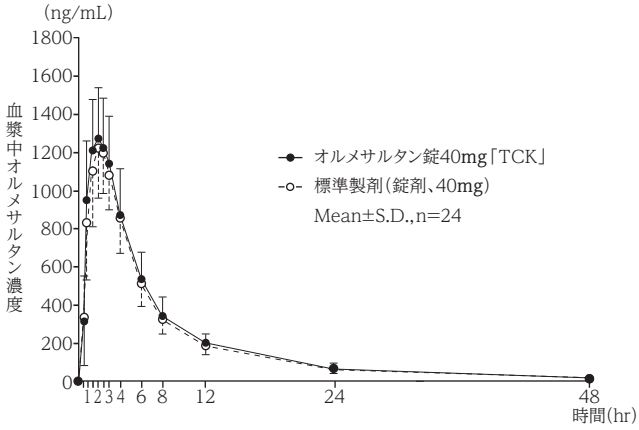
（Mean±S.D.,n=30）



オルメサルタン錠40mg「TCK」と標準製剤を、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）～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)]

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\to48hr}$ (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$T_{1/2}$ (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
標準製剤（錠剤、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、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。

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。[3)]

溶出挙動

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」及びオルメサルタン錠40mg「TCK」は、日本薬局方医薬品各条に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。[4)]

【　薬効薬理　】

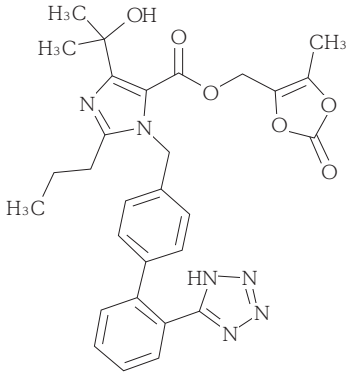
アンギオテンシンⅡ受容体のサブタイプAT_1受容体の拮抗薬。内因性昇圧物質のアンギオテンシンⅡに対して受容体レベルで競合的に拮抗することにより降圧作用を現す。なお、本薬はプロドラッグであり、経口投与後、主に小腸上皮においてエステラーゼにより加水分解を受け、活性代謝物であるオルメサルタンに変換される。[5)]

【　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
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。

【　取扱い上の注意　】

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。

安定性試験
加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヵ月）の結果、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」及びオルメサルタン錠 40mg「TCK」は通常の市場流通下において 3 年間安定であることが推測された。[6)]

*【　包装　】

オルメサルタン錠 5mg「TCK」：100 錠（PTP）
オルメサルタン錠 10mg「TCK」：100 錠（PTP）
オルメサルタン錠 20mg「TCK」：100 錠（PTP）　500 錠（PTP）
オルメサルタン錠 40mg「TCK」：100 錠（PTP）

**【　主要文献　】

1）阿部真也 他：周産期医学.2017；47：1353-1355
2）齊藤大祐 他：鹿児島産科婦人科学会雑誌.2021；29：49-54
3）辰巳化学株式会社：生物学的同等性試験
4）辰巳化学株式会社：溶出試験
5）第十七改正　日本薬局方解説書
6）辰巳化学株式会社：安定性試験

【　文献請求先　】

主要文献に記載の社内資料につきましては下記にご請求下さい。

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

製　造　販　売　元
辰巳化学株式会社
金沢市久安３丁目４０６番地

㊦ 2305 ⑤