

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AT₁レセプターブロッカー
アジルサルタン錠

アジルサルタン錠10mg「ニプロ」
アジルサルタン錠20mg「ニプロ」
アジルサルタン錠40mg「ニプロ」

Azilsartan Tablets

剤形	錠剤（フィルムコーティング錠）
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	アジルサルタン錠10mg「ニプロ」 1錠中 アジルサルタン 10mg アジルサルタン錠20mg「ニプロ」 1錠中 アジルサルタン 20mg アジルサルタン錠40mg「ニプロ」 1錠中 アジルサルタン 40mg
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	製造販売承認年月日：2023年2月15日
薬価基準収載・ 販売開始年月日	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：ニプロ株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	ニプロ株式会社 医薬品情報室 TEL：0120-226-898 FAX：050-3535-8939 医療関係者向けホームページ： https://www.nipro.co.jp/

本IFは2026年3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。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

(2020年4月改訂)

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（<https://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・表現には医薬品、医療機器等の品質、有効性及び安全性の確保等に関する法律の広告規則や販売情報提供活動ガイドライン、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IF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、IFを利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	5. 臨床成績	24
1. 開発の経緯	1	
2. 製品の治療学的特性	1	
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	2	
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	
6. RMPの概要	2	
II. 名称に関する項目	VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 販売名	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	29
2. 一般名	2. 薬理作用	29
3. 構造式又は示性式	VII. 薬物動態に関する項目	
4. 分子式及び分子量	1. 血中濃度の推移	30
5. 化学名（命名法）又は本質	2. 薬物速度論的パラメータ	34
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3. 母集団（ポピュレーション）解析	34
III. 有効成分に関する項目	4. 吸収	34
1. 物理化学的性質	5. 分布	35
2. 有効成分の各種条件下における安定性	6. 代謝	35
3. 有効成分の確認試験法，定量法	7. 排泄	36
IV. 製剤に関する項目	8. トランスポーターに関する情報	36
1. 剤形	9. 透析等による除去率	36
2. 製剤の組成	10. 特定の背景を有する患者	36
3. 添付溶解液の組成及び容量	11. その他	37
4. 力価	VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	
5. 混入する可能性のある夾雑物	1. 警告内容とその理由	38
6. 製剤の各種条件下における安定性	2. 禁忌内容とその理由	38
7. 調製法及び溶解後の安定性	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	38
8. 他剤との配合変化（物理化学的变化）	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	38
9. 溶出性	5. 重要な基本的注意とその理由	38
10. 容器・包装	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	38
11. 別途提供される資材類	7. 相互作用	41
12. その他	8. 副作用	42
V. 治療に関する項目	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	43
1. 効能又は効果	10. 過量投与	44
2. 効能又は効果に関連する注意	11. 適用上の注意	44
3. 用法及び用量	12. その他の注意	44
4. 用法及び用量に関連する注意	IX. 非臨床試験に関する項目	
	1. 薬理試験	45
	2. 毒性試験	45
	X. 管理的事項に関する項目	
	1. 規制区分	46
	2. 有効期間	46

3. 包装状態での貯法	46	14. 保険給付上の注意	48
4. 取扱い上の注意	46		
5. 患者向け資材	46	X I . 文献	
6. 同一成分・同効薬	46	1. 引用文献	49
7. 国際誕生年月日	46	2. その他の参考文献	51
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	46	X II . 参考資料	
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	47	1. 主な外国での発売状況	52
10. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及び その内容	47	2. 海外における臨床支援情報	52
11. 再審査期間	47	X III . 備考	
12. 投薬期間制限に関する情報	47	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	53
13. 各種コード	47	2. その他の関連資料	58

略語表

略語	略語内容
ALT	alanine aminotransferase : アラニンアミノトランスフェラーゼ (=GPT)
AST	aspartate aminotransferase : アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ (=GOT)
AUC	area under curve : 血中濃度-時間曲線下面積
BUN	blood urea nitrogen : 血液尿素窒素
CK (CPK)	creatine kinase : クレアチンキナーゼ (creatine phosphokinase : クレアチンホスホキナーゼ)
C_{max}	最高血漿中濃度
Cr	creatinine : クレアチニン
CYP	cytochrome P450 (シトクロム P450)
eGFR	estimated glomerular filtration rate : 概算糸球体濾過値
γ -GTP	gamma-glutamyl transpeptidase : γ グルタミルトランスペプチダーゼ
IC ₅₀	50%阻害濃度
INR	international normalized ratio : 国際標準化比
PT	prothrombin time : プロトロンビン時間
RMP	Risk Management Plan : 医薬品リスク管理計画
S. D.	standard deviation : 標準偏差
$t_{1/2}$	消失半減期
T_{max}	Time to reach maximum concentration in plasma : 最高血漿中濃度到達時間

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

アジルサルタン製剤は、持続性 AT₁ レセプターブロッカーであり、本邦では 2012 年に上市されている。

1錠中にアジルサルタンをそれぞれ 10mg、20mg 及び 40mg 含有するアジルサルタン錠 10mg「ニプロ」、同錠 20mg「ニプロ」及び同錠 40mg「ニプロ」は、ニプロ株式会社が後発医薬品として開発を企画し、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、2023 年 2 月に承認を取得、2023 年 6 月に販売を開始した。

また、2026 年 3 月に、「高血圧症」の小児に対する用法及び用量が追加承認された。

なお、アジルサルタン錠 10mg「ニプロ」、同錠 20mg「ニプロ」及び同錠 40mg「ニプロ」は後発医薬品として、ニプロ株式会社、沢井製薬株式会社の合計 2 社による共同開発を実施し、共同開発グループとして実施したデータを共有し、承認を得た。

2. 製品の治療学的特性

- アジルサルタンはアンジオテンシン II タイプ 1 (AT₁) 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¹⁾。
- 臨床的には、高血圧症に有用性が認められている。
- 重大な副作用としては、血管性浮腫、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、横紋筋融解症が報告されている。（「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

- 錠剤の両面に「一般名」・「含量」・「屋号」のインクジェット印字を施した。
- PTP シートには、表面の 1 錠ごとに「一般名」・「含量」を表示し、裏面の 1 錠ごとに「一般名」・「含量」・「屋号」・「GS1 コード」を表示した。更に表面には薬効「高血圧症のお薬」を表示した。

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材、 最適使用推進ガイドライン等	有無	タイトル、参照先
RMP	有	(「I.6. RMP の概要」の項参照)
追加のリスク最小化活動として 作成されている資材	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

21. 承認条件

医薬品リスク管理計画を策定の上、適切に実施すること。

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

医薬品リスク計画書 (RMP) の概要

安全性検討事項		
【重要な特定されたリスク】	【重要な潜在的リスク】	【重要な不足情報】
低血圧関連事象	なし	なし
腎機能障害		
高カリウム血症		
肝機能障害		
横紋筋融解症		
血管性浮腫		
妊娠中の薬物曝露による胎児の障害		
有効性に関する検討事項		
なし		

↓上記に基づく安全性監視のための活動

医薬品安全性監視計画の概要
通常の医薬品安全性監視活動
追加の医薬品安全性監視活動
なし
有効性に関する調査・試験の計画の概要
なし

↓上記に基づくリスク最小化のための活動

リスク最小化計画の概要
通常のリスク最小化活動
追加のリスク最小化活動
なし

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。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

- (1) 和 名 : アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」
アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」
アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」

(2) 洋 名 : Azilsartan Tablets

(3) 名称の由来 : 有効成分であるアジルサルタンに剤形及び含量を記載し、社名である「ニプロ」を付した。

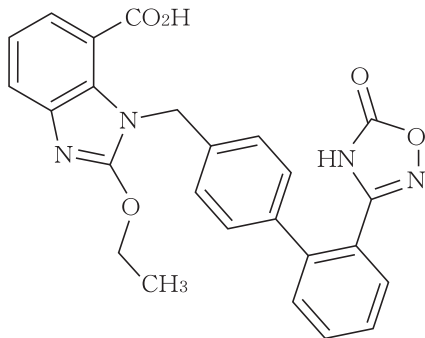
2. 一般名

(1) 和 名(命名法) : アジルサルタン (JAN)

(2) 洋 名(命名法) : Azilsartan (JAN)

(3) ステム (stem) : angiotensin II receptor antagonists, antihypertensive (non-peptidic) : -sartan

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{25}H_{20}N_4O_5$

分子量 : 456.45

5. 化学名(命名法)又は本質

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 (JAN)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

該当資料なし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状

白色の結晶又は結晶性の粉末である。

(2) 溶解性

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

錠剤（フィルムコーティング錠）

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	性状	外形・大きさ		
		直径 (mm)	厚さ (mm)	重量 (mg)
アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」	微黄赤色の楕円形の フィルムコーティング錠			
		(長径) 8.2 (短径) 4.7	3.1	94
アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」	微赤色の楕円形の割線 入りフィルムコーティ ング錠			
		(長径) 9.1 (短径) 5.1	3.3	125
アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」	黄色の楕円形の割線入 りフィルムコーティン グ錠			
		(長径) 9.1 (短径) 5.1	3.3	125

(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

該当しない

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量及び添加剤

販売名	有効成分	添加剤	
アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」	1錠中 アジルサルタン 10mg	D-マンニトール、結晶セル ロース、低置換度ヒドロキ シプロピルセルロース、ヒ ドロキシプロピルセルロー ス、ステアリン酸マグネシ ウム、ラウロマクロゴール、 ステアリン酸、ヒプロメロ ース、マクロゴール 400、 酸化チタン、タルク、カル ナウバロウ	黄色三二酸化鉄、 三二酸化鉄
アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」	1錠中 アジルサルタン 20mg		三二酸化鉄
アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」	1錠中 アジルサルタン 40mg		黄色三二酸化鉄

(2) 電解質等の濃度

該当資料なし

(3) 熱量

該当資料なし

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

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

加速試験

試験条件：40±2℃、75±5%RH

①アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」²⁾

PTP 包装：包装形態（ポリ塩化ビニル・アルミ箔）

項目及び規格	開始時	1 カ月	3 カ月	6 カ月
性状（微黄赤色の楕円形のフィルム コーティング錠である。）	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	—	—	適合

項目及び規格	開始時	1 カ月	3 カ月	6 カ月
純度試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合
含量 (95.0~105.0%)	99.9	99.8	99.5	99.5
	100.7	100.7	100.6	100.2
	99.6	99.7	99.9	99.6

1 ロット (n=3)、3 ロット

②アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」³⁾

PTP 包装：包装形態 (ポリ塩化ビニル・アルミ箔)

項目及び規格	開始時	1 カ月	3 カ月	6 カ月
性状 (微赤色の楕円形の両面割線入りフィルムコーティング錠である。)	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	—	—	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合
含量 (95.0~105.0%)	100.0	99.9	99.7	99.4
	100.1	99.8	100.5	98.9
	100.3	100.2	100.3	99.8

1 ロット (n=3)、3 ロット

バラ包装：包装形態 (ポリエチレン瓶、ポリプロピレンキャップ)

項目及び規格	開始時	1 カ月	3 カ月	6 カ月
性状 (微赤色の楕円形の両面割線入りフィルムコーティング錠である。)	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	—	—	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合
含量 (95.0~105.0%)	100.0	99.9	99.7	99.8
	100.1	100.0	99.8	100.0
	100.3	100.8	100.2	100.1

1 ロット (n=3)、3 ロット

③アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」⁴⁾

PTP 包装：包装形態（ポリ塩化ビニル・アルミ箔）

項目及び規格	開始時	1 カ月	3 カ月	6 カ月
性状（黄色の楕円形の両面割線入りフィルムコーティング錠である。）	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	—	—	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合
含量（95.0～105.0%）	98.8	99.0	98.5	98.7
	99.4	99.9	99.2	99.9
	100.7	100.9	100.3	100.6

1 ロット（n=3）、3 ロット

バラ包装：包装形態（ポリエチレン瓶、ポリプロピレンキャップ）

項目及び規格	開始時	1 カ月	3 カ月	6 カ月
性状（黄色の楕円形の両面割線入りフィルムコーティング錠である。）	適合	適合	適合	適合
確認試験	適合	—	—	適合
純度試験	適合	適合	適合	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合
含量（95.0～105.0%）	98.8	99.2	98.8	98.6
	99.4	99.8	99.5	99.7
	100.7	100.8	100.3	100.6

1 ロット（n=3）、3 ロット

長期保存試験

試験条件：25±2℃、60±5%RH

①アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」⁵⁾

PTP 包装：最終包装形態（内包装：ポリ塩化ビニル・アルミ箔、外包装：紙箱）

項目及び規格	開始時	3 カ月	6 カ月	9 カ月	12 カ月	18 カ月	24 カ月	30 カ月	36 カ月
性状（微黄赤色の楕円形の両面割線入りフィルムコーティング錠である。）	適合	適合	適合	—	適合	—	適合	—	適合
確認試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	—	適合
純度試験	適合	適合	適合	—	適合	—	適合	—	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	—	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
含量 (95.0~105.0%)	99.9 100.6 99.6	100.4 100.7 100.0	100.3 100.2 99.9	99.8 100.5 100.0	100.2 100.9 100.0	100.5 100.7 100.3	99.7 100.2 99.9	100.2 100.2 99.2	99.6 100.1 99.4

1ロット (n=1)、3ロット

②アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」⁶⁾

PTP 包装：最終包装形態（内包装：ポリ塩化ビニル・アルミ箔、外包装：紙箱）

項目及び規格	開始時	3 カ月	6 カ月	9 カ月	12 カ月	18 カ月	24 カ月	30 カ月	36 カ月
性状（微赤色の楕円形の両面割線入りフィルムコーティング錠である。）	適合	適合	適合	—	適合	—	適合	—	適合
確認試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	—	適合
純度試験	適合	適合	適合	—	適合	—	適合	—	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	—	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
含量 (95.0~105.0%)	100.1 100.5 100.5	100.0 100.3 100.6	100.0 100.3 100.3	99.9 99.8 100.3	100.2 100.0 100.4	100.3 99.5 100.9	99.8 99.8 100.3	100.0 99.8 100.1	99.7 99.7 100.3

1ロット (n=1)、3ロット

バラ包装：最終包装形態（内包装：ポリエチレン瓶、ポリプロピレンキャップ、外包装：紙箱）

項目及び規格	開始時	3 カ月	6 カ月	9 カ月	12 カ月	18 カ月	24 カ月	30 カ月	36 カ月
性状（微赤色の楕円形の両面割線入りフィルムコーティング錠である。）	適合	適合	適合	—	適合	—	適合	—	適合
確認試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	—	適合
純度試験	適合	適合	適合	—	適合	—	適合	—	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	—	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
含量 (95.0～105.0%)	100.1	100.4	100.0	99.5	100.0	99.9	99.9	99.9	99.9
	100.5	100.5	99.9	99.5	99.8	99.4	100.0	99.9	99.6
	100.5	100.5	100.0	99.8	100.2	99.9	100.1	100.4	100.2

1ロット (n=1)、3ロット

③アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」⁷⁾

PTP 包装：最終包装形態（内包装：ポリ塩化ビニル・アルミ箔、外包装：紙箱）

項目及び規格	開始時	3 カ月	6 カ月	9 カ月	12 カ月	18 カ月	24 カ月	30 カ月	36 カ月
性状（黄色の楕円形の両面割線入りフィルムコーティング錠である。）	適合	適合	適合	—	適合	—	適合	—	適合
確認試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	—	適合
純度試験	適合	適合	適合	—	適合	—	適合	—	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	—	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
含量 (95.0～105.0%)	98.5	99.0	98.8	98.7	98.9	99.0	97.8	98.4	98.5
	99.6	99.9	99.8	99.6	99.7	99.3	99.3	100.0	99.9
	100.7	100.6	100.7	100.1	100.6	100.6	99.5	100.4	100.4

1ロット (n=1)、3ロット

バラ包装：最終包装形態（内包装：ポリエチレン瓶、ポリプロピレンキャップ、外包装：紙箱）

項目及び規格	開始時	3 カ月	6 カ月	9 カ月	12 カ月	18 カ月	24 カ月	30 カ月	36 カ月
性状（黄色の楕円形の両面割線入りフィルムコーティング錠である。）	適合	適合	適合	—	適合	—	適合	—	適合
確認試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	—	適合
純度試験	適合	適合	適合	—	適合	—	適合	—	適合
製剤均一性試験	適合	—	—	—	適合	—	適合	—	適合
溶出試験	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合	適合
含量 (95.0~105.0%)	98.5	99.6	98.9	98.2	98.9	99.0	97.8	98.9	98.5
	99.6	99.8	100.3	99.7	99.6	99.2	99.0	100.0	99.6
	100.7	100.9	100.7	100.1	100.4	100.3	99.5	99.7	100.2

1ロット (n=1)、3ロット

長期保存試験（25℃、相対湿度 60%、36 カ月）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確認された。

その他の安定性

『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）』における試験法を参考にし、同評価基準に従い評価した結果は以下の通りである。

(1) 無包装状態での安定性

試験条件：温度 40±2℃、26 週（保存形態：遮光・気密容器）

湿度 75±5%RH/25±2℃、26 週（保存形態：遮光・開放）

室温 25±2℃/60±5%RH、26 週（保存形態：遮光・開放）

光 120 万 lx・hr（60±5%RH/25±2℃）（保存形態：透明・開放）

試験結果：

①アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」⁸⁾

保存条件	外観	含量	硬度 (19.6N 以上)		溶出性	参考
			長径	短径		純度試験 (類縁物質)
〈開始時〉	微黄赤色の楕円形のフィルムコーティング錠	99.9% (適合)	73.20N (適合)	59.20N (適合)	適合	適合
温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内

保存条件	外観	含量	硬度 (19.6N 以上)		溶出性	参考
			長径	短径		純度試験 (類縁物質)
湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
室温	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内

試験回数 (外観・含量・溶出性・純度試験 (類縁物質) : 1 回、硬度 : 5 回)

②アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」⁹⁾

保存条件	外観	含量	硬度 (19.6N 以上)		溶出性	参考
			長径	短径		純度試験 (類縁物質)
〈開始時〉	微赤色の楕円形の 両面割線入り フィルム コーティング錠	100.1% (適合)	91.80N (適合)	79.60N (適合)	適合	適合
温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
室温	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内

試験回数 (外観・含量・溶出性・純度試験 (類縁物質) : 1 回、硬度 : 5 回)

③アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」¹⁰⁾

保存条件	外観	含量	硬度 (19.6N 以上)		溶出性	参考
			長径	短径		純度試験 (類縁物質)
〈開始時〉	黄色の楕円形の 両面割線入り フィルム コーティング錠	98.5% (適合)	103.80N (適合)	84.60N (適合)	適合	適合
温度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
湿度	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
室温	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
光	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	規格内

試験回数 (外観・含量・溶出性・純度試験 (類縁物質) : 1 回、硬度 : 5 回)

(2) 分割後の安定性

試験条件：室温 25±2°C/60±5%RH、13 週（保存形態：遮光・開放）
光 120 万 lx・hr（25°C/60%RH）（保存形態：透明・開放）

試験結果：

① アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」¹¹⁾

保存条件	外観	含量	溶出性	参考
				純度試験 (類縁物質)
〈開始時〉	微赤色の楕円形の両面割線入りフィルムコーティング錠の半錠であり、分割面は白色である。	100.5% (適合)	適合	適合
室温	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
光	変化なし	変化なし	変化なし	規格内

試験回数（外観・含量・溶出性・純度試験（類縁物質））：1 回

② アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」¹²⁾

保存条件	外観	含量	溶出性	参考
				純度試験 (類縁物質)
〈開始時〉	黄色の楕円形の両面割線入りフィルムコーティング錠の半錠であり、分割面は白色である。	100.7% (適合)	適合	適合
室温	変化なし	変化なし	変化なし	規格内
光	変化なし	変化なし	変化なし	規格内

試験回数（外観・含量・溶出性・純度試験（類縁物質））：1 回

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

溶出挙動における同等性

アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」¹³⁾

(「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日 医薬審第487号、平成13年5月31日一部改正 医薬審第786号、平成18年11月24日一部改正 薬食審査発第1124004号、平成24年2月29日一部改正 薬食審査発0229第10号及び令和2年3月19日一部改正 薬食審査発0319第1号」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12年2月14日 医薬審第64号、平成13年5月31日一部改正 医薬審第786号、平成18年11月24日一部改正 薬食審査発第1124004号、平成24年2月29日一部改正 薬食審査発0229第10号及び令和2年3月19日一部改正 薬生薬審発0319第1号」)

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

装置	回転数	試験液	試験液量	温度	製剤の投与数
パドル法	50rpm	pH1.2 = 日本薬局方 溶出試験第1液	900mL	37±0.5℃	試験製剤：2錠/1ベッセル 標準製剤：1錠/1ベッセル
		pH5.0 = 薄めた McIlvaineの緩衝液			
		pH6.8 = 日本薬局方 溶出試験第2液			試験製剤：1錠/1ベッセル 標準製剤：1錠/1ベッセル
		水			
	100rpm	pH6.8 = 日本薬局方 溶出試験第2液			試験製剤：1錠/1ベッセル 標準製剤：1錠/1ベッセル

判定基準：溶出試験条件それぞれについて、以下に示す(1)及び(2)の基準を満たすとき、溶出挙動が同等と判定する。

(1) 平均溶出率

①標準製剤が15分以内に平均85%以上溶出する場合：

試験製剤が15分以内に平均85%以上溶出する。

②標準製剤が30分以内に平均85%以上溶出しない場合：

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が50%に達しないとき、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。

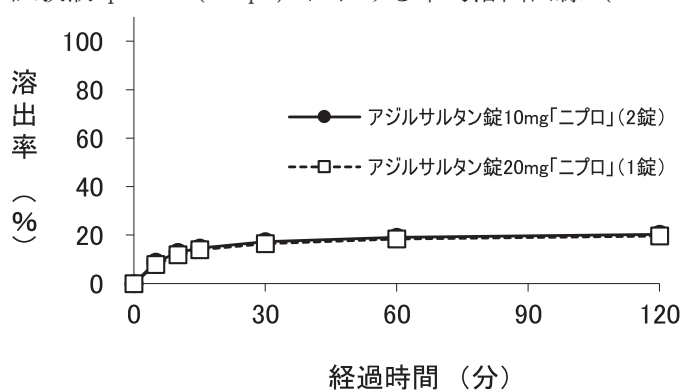
(2) 個々の溶出率

最終比較時点における試験製剤の個々の溶出率について、以下のいずれかの基準に適合する。

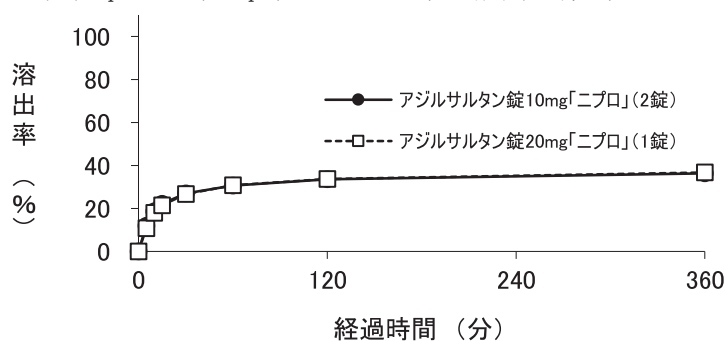
- a. 標準製剤の平均溶出率が 85%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 25\%$ の範囲を超えるものがない。
- b. 標準製剤の平均溶出率が 50%に達しないとき、試験製剤の平均溶出率 $\pm 9\%$ の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、 $\pm 15\%$ の範囲を超えるものがない。

試験結果：同等性試験ガイドラインに従ってアジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」と標準製剤（アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」）の溶出挙動を比較した。その結果、全ての条件において溶出挙動の同等性の判定基準を満たしていたため、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。

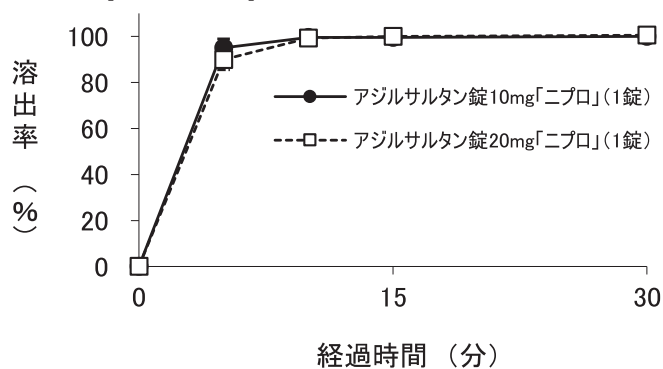
試験液 pH1.2 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean \pm S. D.、n=12)



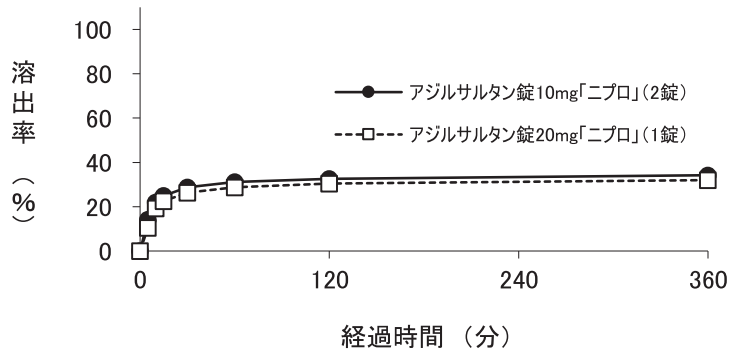
試験液 pH5.0 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean \pm S. D.、n=12)



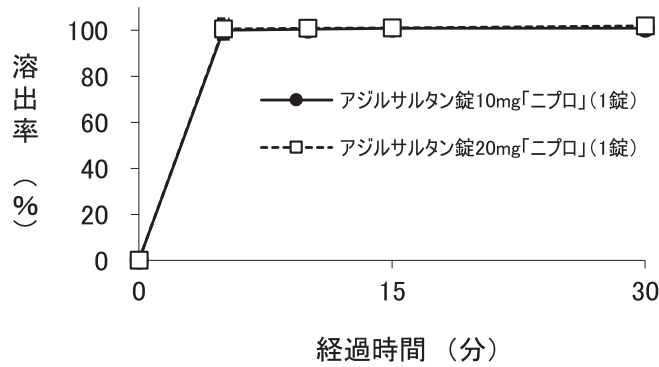
試験液 pH6.8 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean \pm S. D.、n=12)



試験液 水 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



試験液 pH6.8 (100rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



溶出挙動における類似性

- ①アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」¹⁴⁾
- ②アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」¹⁵⁾

(「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日 医薬審第487号、平成13年5月31日一部改正 医薬審発第786号、平成18年11月24日一部改正 薬食審査発第1124004号、平成24年2月29日一部改正 薬食審査発0229第10号及び令和2年3月19日一部改正 薬生薬審発0319第1号」)

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

装置	回転数	試験液	試験液量	温度	製剤の投与数
パドル法	50rpm	pH1.2 = 日本薬局方溶出試験第1液	900mL	37±0.5℃	1錠/1ベッセル
		pH5.0 = 薄めた McIlvaine の緩衝液			
		pH6.8 = 日本薬局方溶出試験第2液			
		水			
	100rpm	pH6.8 = 日本薬局方溶出試験第2液			

判定基準：試験製剤の平均溶出率を、標準製剤の平均溶出率と比較する。

全ての溶出試験条件において、以下のいずれかの基準に適合するとき、溶出挙動が類似しているとする。

①標準製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する場合：

試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出する。

②標準製剤が 15～30 分に平均 85%以上溶出する場合：

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 \pm 15%の範囲にあるか、又は f_2 関数の値が 42 以上である。

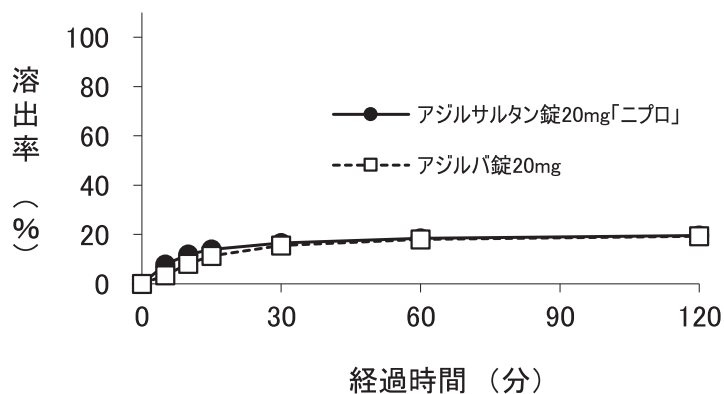
③標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合：

規定された試験時間において、標準製剤の平均溶出率が 50%に達しないとき、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 \pm 9%の範囲にある。

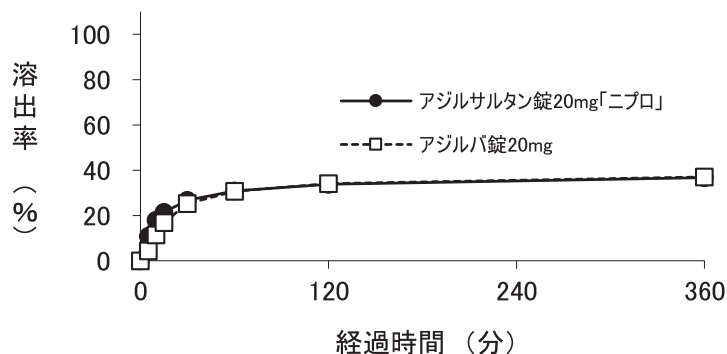
①アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」

試験結果：同等性試験ガイドラインに従ってアジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」と標準製剤（アジルバ錠 20mg）の溶出挙動を比較した。その結果、全ての条件において溶出挙動の類似性の判定基準を満たしていたため、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。

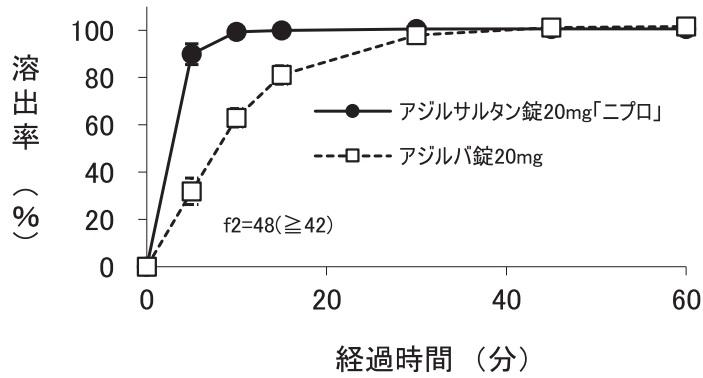
試験液 pH1.2 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean \pm S. D.、n=12)



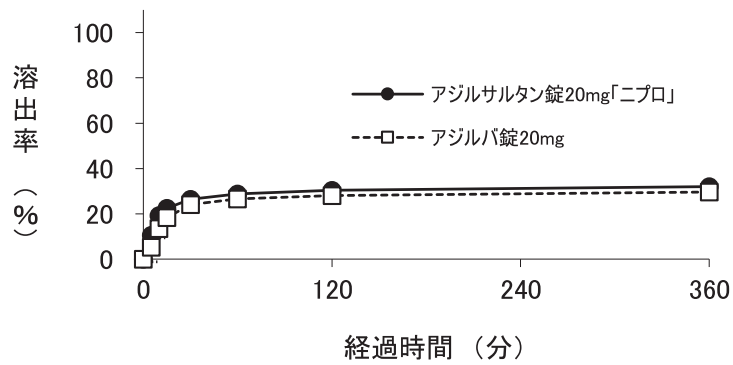
試験液 pH5.0 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean \pm S. D.、n=12)



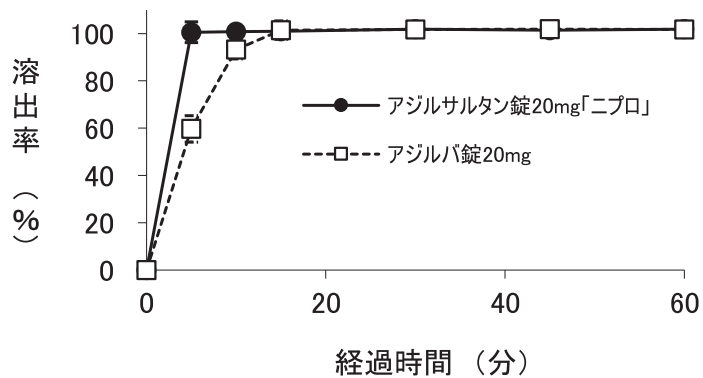
試験液 pH6.8 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



試験液 水 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



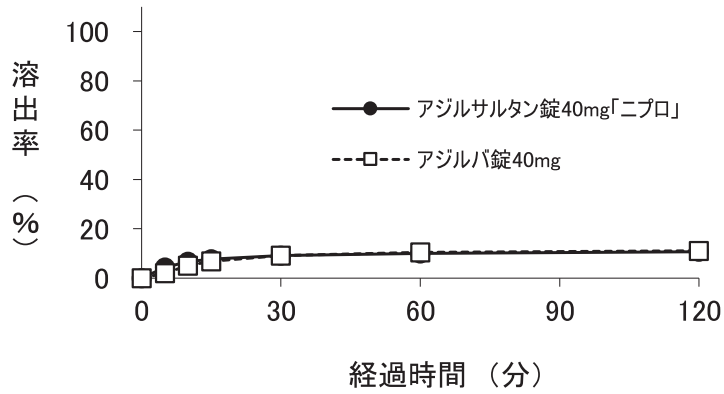
試験液 pH6.8 (100rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



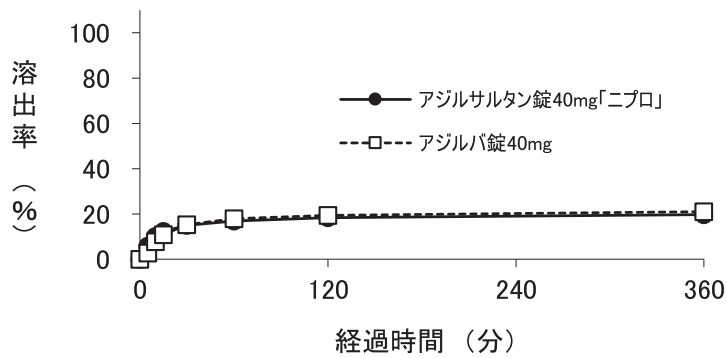
②アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」

試験結果：同等性試験ガイドラインに従ってアジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」と標準製剤 (アジルバ錠 40mg) の溶出挙動を比較した。その結果、pH1.2、pH5.0、水 (50rpm) 及び pH6.8 (100rpm) では溶出挙動における類似性の判定基準を満たしていたが、pH6.8 試験液 (50rpm) では類似性が認められなかった。なお、健康成人男子を対象とした生物学的同等性試験では、両製剤は生物学的に同等であることが確認されている。

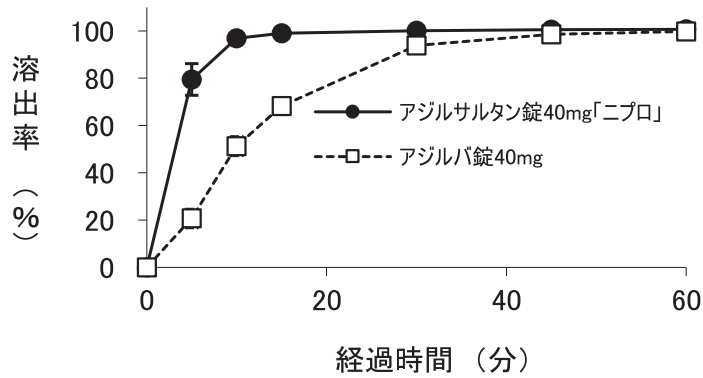
試験液 pH1.2 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



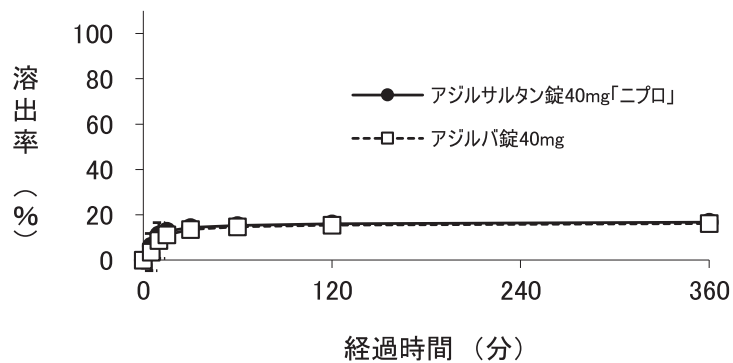
試験液 pH5.0 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



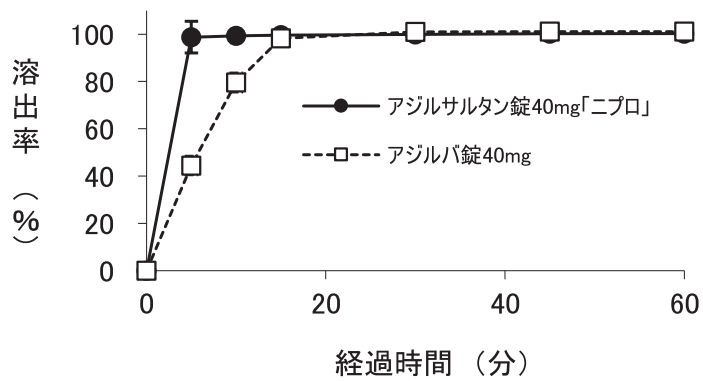
試験液 pH6.8 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



試験液 水 (50rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



試験液 pH6.8 (100rpm) における平均溶出曲線 (mean±S. D.、n=12)



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

<p>22. 包装</p> <p>〈アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」〉</p> <p>100錠 [10錠 (PTP) ×10]</p> <p>500錠 [10錠 (PTP) ×50]</p> <p>〈アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」〉</p> <p>100錠 [10錠 (PTP) ×10]</p> <p>500錠 [10錠 (PTP) ×50]</p> <p>500錠 [瓶、バラ]</p> <p>〈アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」〉</p> <p>100錠 [10錠 (PTP) ×10]</p> <p>500錠 [10錠 (PTP) ×50]</p> <p>500錠 [瓶、バラ]</p>
--

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

PTP包装

PTP: ポリ塩化ビニル、アルミニウム

バラ包装

容器: ポリエチレン

キャップ: ポリプロピレン

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

自動分包機への適合性確認試験¹⁶⁾

全ての試験条件において分包した錠剤に割れや欠けは確認されなかった。

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能・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・用量

〈製剤共通〉

〈成人〉

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。

〈小児〉

通常、6歳以上の小児には、アジルサルタンとして体重50kg未満の場合は2.5mg、体重50kg以上の場合は5mgの1日1回経口投与から開始する。なお、年齢、体重、症状により適宜増減するが、1日最大投与量は体重50kg未満の場合は20mg、体重50kg以上の場合は40mgとする。

〈アジルサルタン錠10mg、20mg「ニプロ」〉

〈小児〉

通常、2歳以上6歳未満の小児には、アジルサルタンとして0.1mg/kg（最大2.5mg）の1日1回経口投与から開始する。なお、年齢、体重、症状により適宜増減するが、1日最大投与量は0.8mg/kg（最大20mg）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・用量に関連する注意

成人では、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

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¹⁷⁾。

トラフ時座位血圧変化量^{注1)} 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)。

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 ^{注3)}	160.0±7.66	-8.2±14.63 ^{注3)}
アジルサルタン 10mg	83	100.2±4.07	-10.8±7.76 ^{注3)}	158.5±6.96	-17.6±14.20 ^{注3)}
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 ^{注2)}	82	101.0±4.40	-10.9±10.13 ^{注4)}	159.6±7.68	-18.3±15.88 ^{注4)}

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

(平均値±標準偏差)

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¹⁷⁾。[7.参照]

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

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¹⁸⁾。

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。

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

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¹⁸⁾。

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¹⁹⁾。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¹⁹⁾。

17.1.6 国内第Ⅲ相試験（長期投与試験）

6歳以上16歳未満の高血圧症患者（27例）を対象とした長期投与試験において、アジルサルタンを体重20kg以上50kg未満の患者では2.5～20mg（2.5mgより開始し、降圧目標^{注1)}に到達せず、忍容性に問題がない場合は5mg、10mg、20mgの順で段階的^{注2)}に増量）、体重50kg以上の患者では5～40mg（5mgより開始し、降圧目標^{注1)}に到達せず、忍容性に問題がない場合は10mg、20mg、40mgの順で段階的^{注2)}に増量）を1日1回52週間経口投与した。結果は以下のとおりであった。治療期第1期（0～12週）ではレニン-アンジオテンシン系阻害薬以外の降圧薬1剤の同一用法・用量での併用を、治療期第2期（12～52週）ではレニン-アンジオテンシン系阻害薬以外の降圧薬の追加又は用量変更を可能とした²⁰⁾。

注1)本態性高血圧では「小児の性別・年齢別血圧基準値（小児期心疾患における薬物療法ガイドライン2012）」の95パーセンタイル未満、二次性高血圧では90パーセンタイル未満。

注2)来院時（2、4、8、12、16、20、24、32、40週後）ごとに判断された。

	トラフ時座位血圧 (mmHg) ^{注1)}	
	拡張期	収縮期
投与前値	72.0±13.43	125.7±12.89
変化量 ^{注2)}		
投与12週時点（治療期第1期終了時）	-13.9±13.24	-12.4±10.33
投与52週時点（治療期第2期終了時）	-10.9±13.23	-10.0±11.47

注1)平均値±標準偏差

注2)LOCF法

副作用発現頻度は、44.4%（12/27例）であった。主な副作用は、浮動性めまい7.4%（2/27例）、頭痛7.4%（2/27例）及び腎機能障害7.4%（2/27例）であった²⁰⁾。

17.1.7 国内第Ⅲ相試験（長期投与試験）

2歳以上6歳未満の高血圧症患者（9例）を対象とした長期投与試験において、アジルサルタンを0.1～0.8mg/kg [0.1mg/kg（最大2.5mg）より開始し、降圧目標^{注1}）に到達せず、忍容性に問題がない場合は0.2mg/kg（最大5mg）、0.4mg/kg（最大10mg）、0.8mg/kg（最大20mg）の順で段階的に増量]を1日1回52週間経口投与した。結果は以下のとおりであった。治療期0～12週ではレニン-アンジオテンシン系阻害薬以外の降圧薬1剤の同一用法・用量での併用を、治療期12～52週ではレニン-アンジオテンシン系阻害薬以外の降圧薬の追加又は用量変更を可能とした²¹⁾。

注)本態性高血圧では「小児の性別・年齢別血圧基準値 [先天性心疾患並びに小児期心疾患の診断検査と薬物療法ガイドライン（2018年改訂版）]」の95パーセンタイル未満、二次性高血圧では90パーセンタイル未満。

	トラフ時座位血圧 (mmHg) ^{注1)}	
	拡張期	収縮期
投与前値	67.7±5.48	111.0±7.63
変化量 ^{注2)}		
投与12週時点	-10.9±11.04	-8.0±6.73
投与52週時点	-14.8±8.39	-10.9±8.30

注1)平均値±標準偏差

注2)LOCF法

主な副作用は、急性腎障害11.1%（1/9例）であった²¹⁾。

(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²²⁾。

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²³⁾。

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²⁴⁾。

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²³⁾。

(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（ARB）

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（AT₁）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¹⁾。

（2）薬効を裏付ける試験成績

18.2 AT₁受容体に対する阻害作用

ヒトAT₁受容体の活性を濃度依存的に阻害し（IC₅₀値：0.62～2.6nmol/L）、AT₁受容体からの解離は極めて緩やかであった（*in vitro*）²⁵⁾。

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²⁶⁾。

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²⁷⁾。

（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

〈成人〉

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²⁸⁾。

投与量	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (h)	AUC _{0-inf} (ng·h/mL)	T _{1/2} (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_{max} は中央値 (最小値-最大値))

〈小児〉

6 歳以上 16 歳未満の高血圧症患者に、アジルサルタンを体重 50kg 未満の患者では 5mg (3 例)、体重 50kg 以上の患者では 10mg (3 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²⁹⁾。

投与量	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (h)	AUC _{0-inf} (ng·h/mL)	T _{1/2} (h)
5mg	888.3±291.1	3.00 (2.1-3.0)	6,635.7±3,279.6	4.7±1.0
10mg	831.3±180.8	4.00 (2.1-4.0)	7,433.3±1,227.5	6.1±0.7

(平均値±標準偏差、T_{max} は中央値 (最小値-最大値))

16.1.2 反復投与

〈成人〉

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²⁶⁾。

〈小児〉

健康成人（52例）及び2歳以上16歳未満の高血圧症患者（42例）から得られた血漿中アジルサルタン濃度データ（992点）を用いて母集団薬物動態解析を行った。2歳以上6歳未満の高血圧症患者にアジルサルタン0.1～0.8mg/kg、6歳以上16歳未満の高血圧症患者に、アジルサルタンを体重50kg未満の患者では2.5～20mg、体重50kg以上の患者では5～40mgを1日1回反復経口投与した時の母集団薬物動態解析の結果に基づき推定した薬物動態学的パラメータは、以下のとおりであった³⁰⁾。

2歳以上6歳未満

投与量	n	C _{max, ss} (ng/mL)	AUC _{τ, ss} (ng・h/mL)
0.1mg/kg	9	461±139	3,011±1,044
0.2mg/kg	6	986±169	6,158±2,071
0.4mg/kg	5	1,909±338	11,112±3,245
0.8mg/kg	2	4,494.2, 3,929.9 ^{注1)}	20,250, 20,280 ^{注1)}

注1) 個別値
(平均値±標準偏差)

6歳以上16歳未満

体重50kg未満				体重50kg以上			
投与量	n	C _{max, ss} (ng/mL)	AUC _{τ, ss} (ng・h/mL)	投与量	n	C _{max, ss} (ng/mL)	AUC _{τ, ss} (ng・h/mL)
2.5mg	22	348±120	2,749±983	5mg	5	434±151	2,976±560
5mg	14	723±295	5,668±2,252	10mg	4	831±337	5,555±787
10mg	5	1,384±553	12,156±3,708	20mg	3	1,723±812	11,857±590
20mg	2	1,274.8, 2,562.0 ^{注1)}	20,420, 21,110 ^{注1)}	40mg	1	4,480 ^{注1)}	25,050 ^{注1)}

注1) 個別値
(平均値±標準偏差)

生物学的同等性試験

(「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン：平成9年12月22日 医薬審第487号、平成13年5月31日一部改正 医薬審発第786号、平成18年11月24日一部改正 薬食審査発第1124004号、平成24年2月29日一部改正 薬食審査発0229第10号及び令和2年3月19日一部改正 薬生薬審発0319第1号」)

①アジルサルタン錠10mg「ニプロ」¹³⁾

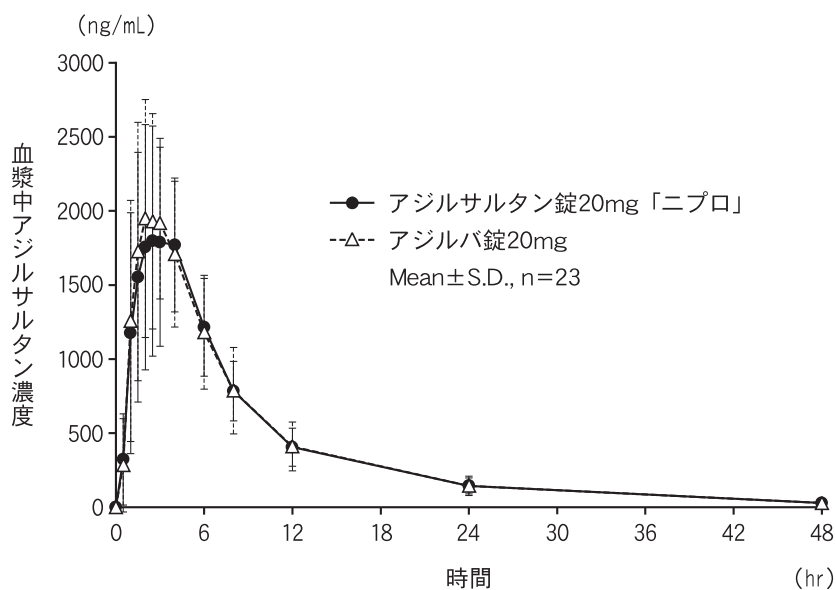
(「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン：令和2年3月19日一部改正 薬生薬審発0319第1号」)

アジルサルタン錠10mg「ニプロ」は、アジルサルタン錠20mg「ニプロ」を標準製剤としたとき、溶出挙動が同等と判断され、生物学的に同等とみなされた。

「IV.9. 溶出性」の項参照。

②アジルサルタン錠20mg「ニプロ」¹⁴⁾

アジルサルタン錠20mg「ニプロ」とアジルバ錠20mgのそれぞれ1錠（アジルサルタンとして20mg）を、2剤2期のクロスオーバー法により健康成人男子に絶食単回経口投与してLC/MS法にて血漿中アジルサルタン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（ AUC_{0-48hr} 、 C_{max} ）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。



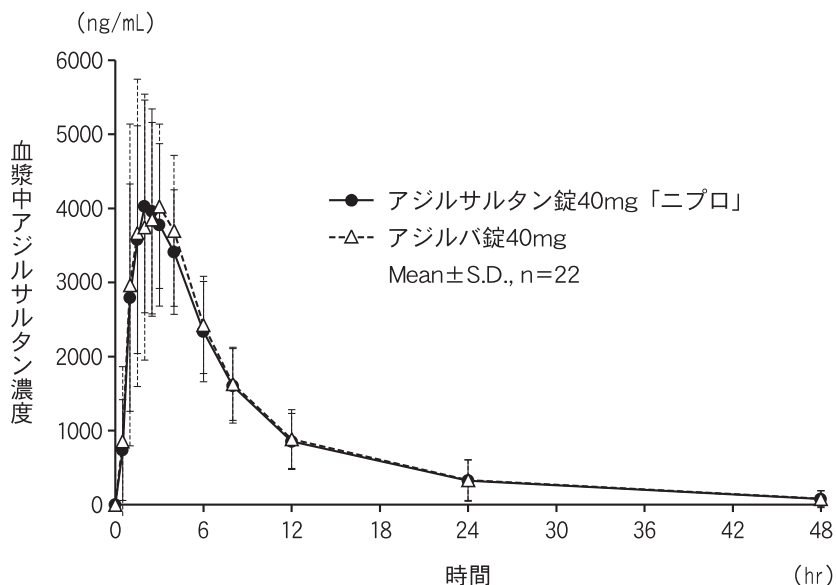
	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_{0-48hr} (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
アジルサルタン錠 20mg「ニプロ」	18246±3870	2325±359	2.8±1.4	9.1±1.9
アジルバ錠 20mg	18513±4817	2377±480	2.7±1.3	9.1±1.9

(Mean±S.D., n=23)

血漿中濃度ならびに AUC、 C_{max} 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アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」¹⁵⁾

アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」とアジルバ錠 40mg のそれぞれ 1 錠（アジルサルタンとして 40mg）を、2 剤 2 期のクロスオーバー法により健康成人男子に絶食単回経口投与して LC/MS 法にて血漿中アジルサルタン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（ AUC_{0-48hr} 、 C_{max} ）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。



	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC_{0-48hr} (ng · hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」	38521 ± 14329	4599 ± 1038	2.5 ± 1.2	9.6 ± 2.4
アジルバ錠 40mg	39850 ± 13752	5055 ± 1143	2.5 ± 1.3	9.7 ± 2.1

(Mean ± S. D., n=22)

血漿中濃度ならびに AUC、 C_{max} 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

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³¹⁾。

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_{max} 、AUCは、単独投与時と比較してそれぞれ14.1%、42.1%増加した³²⁾（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

健康成人単回経口投与

投与量	20mg (20mg×1錠、n=23)	40mg (40mg×1錠、n=22)
kel (/hr)	0.080±0.022	0.076±0.018

(Mean±S. D.)

(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

該当資料なし

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

該当資料なし

(3) 乳汁への移行性

該当資料なし

(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

[¹⁴C] アジルサルタンを 0.3、3、30 μ 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*)³³⁾。

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 AT₁ 受容体の阻害作用は未変化体の約 1/1,000 であった (*in vitro*)^{25)、34)}。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

16.4 代謝

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*)³⁴⁾。

(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²⁶⁾。

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

「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^{注1)} 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_{max}、AUC はそれぞれ 17.3%、16.7%増加し、重度腎機能障害者の C_{max}、AUC はそれぞれ 8.9%、39.3%増加した³⁵⁾。

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^{注1)} 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³⁶⁾。[9.2.1 参照]

注 1) 男性の eGFR (mL/min/1.73m²) = 194 × Cr^{-1.094} × Age^{-0.287}

女性の eGFR (mL/min/1.73m²) = 194 × Cr^{-1.094} × Age^{-0.287} × 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^{注2)} 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^{注3)} 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_{max} は 7.7%減少、AUC は 27.9%増加、中等度肝機能障害者の C_{max}、AUC はそれぞれ 17.9%、64.4%増加した³⁷⁾ (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³⁸⁾（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 嚴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/1.73m² 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。[9.7.3、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^{39)、40)}。

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

9.7.1 低出生体重児、新生児、乳児、2歳未満の幼児又は体重8.8kg未満の小児を対象とした臨床試験は実施していない。

9.7.2 eGFRが30mL/min/1.73m²未満もしくは透析を受けている小児等を対象とした臨床試験は実施していない。[9.7.3 参照]

9.7.3 腎機能及び血清カリウム値を注意深く観察すること。小児等の高血圧では腎機能異常を伴うことが多い。特に、腎機能に影響を及ぼす状態（発熱、脱水）の患者に本剤を投与する場合や血清カリウム値を上昇させる可能性がある他の薬剤と併用する場合は注意すること。[9.2.1、9.7.2、10.2 参照]

(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 スピロノラクトン、 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 [9.7.3 参照]	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。

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	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 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。	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 血管性浮腫（頻度不明）

顔面、口唇、舌、咽・喉頭等の腫脹を症状とする血管性浮腫があらわれることがある。また、腹痛、嘔気、嘔吐、下痢等を伴う腸管血管性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、 γ -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

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。

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

15. その他の注意

15.2 非臨床試験に基づく情報

臓器が未成熟な時期の幼若ラットにアジルサルタンメドキシミル^{注1)}及び/又はアジルサルタンの代謝物 M-II を投与した毒性試験において、生後 7 日から生後 97 日まで 1 日 1 回経口投与した結果、水腎症（腎盂の拡張、好塩基性尿細管、間質の線維化、リンパ球浸潤）、小葉間動脈の中膜肥厚、傍糸球体細胞の肥大及び心臓の壁内冠状動脈の中膜肥厚が認められ、また、生後 14 日から生後 27 日まで 1 日 1 回経口投与した結果、腎臓の乳頭浮腫が認められた⁴⁾。

注 1) アジルサルタンのプロドラッグ体（国内未承認）

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

〈参考〉

「Ⅷ. 6. (6)授乳婦」の項参照。

(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

〈参考〉

「Ⅷ. 12. (2)非臨床試験に基づく情報」の項参照。

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

製 剤：アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」 処方箋医薬品^{注)}
アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」 処方箋医薬品^{注)}
アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」 処方箋医薬品^{注)}
有効成分：アジルサルタン 該当しない
注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

2. 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

該当しない

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：レニン - アンジオテンシン系阻害作用のあるお薬を服用される女性の患者さんへ

「XⅢ. 2. その他の関連資料」の項参照

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：アジルバ錠 10mg、同錠 20mg、同錠 40mg、同顆粒 1%（武田薬品工業） 他

同 効 薬：アンジオテンシンⅡ受容体拮抗薬（ARB）

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

製造販売承認年月日：2023年2月15日

承認番号 : アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」：30500AMX00032000

アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」：30500AMX00033000

アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」：30500AMX00034000

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

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

○「用法及び用量」の追加

一部変更承認年月日：2026年3月25日

〈用法及び用量〉「〈製剤共通〉

〈小児〉

通常、6歳以上の小児には、アジルサルタンとして体重50kg未満の場合は2.5mg、体重50kg以上の場合は5mgの1日1回経口投与から開始する。なお、年齢、体重、症状により適宜増減するが、1日最大投与量は体重50kg未満の場合は20mg、体重50kg以上の場合は40mgとする。

〈アジルサルタン錠10mg、20mg「ニプロ」〉

〈小児〉

通常、2歳以上6歳未満の小児には、アジルサルタンとして0.1mg/kg（最大2.5mg）の1日1回経口投与から開始する。なお、年齢、体重、症状により適宜増減するが、1日最大投与量は0.8mg/kg（最大20mg）とする。」を追記する。

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（あるいは投与）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 錠10mg「ニプロ」	2149048F3084	2149048F3084	129432301	622943201
アジルサルタン 錠20mg「ニプロ」	2149048F1081	2149048F1081	129433001	622943301
アジルサルタン 錠40mg「ニプロ」	2149048F2088	2149048F2088	129434701	622943401

14. 保険給付上の注意

本剤は、診療報酬上の後発医薬品に該当する。

X I . 文 献

1. 引用文献

- 1) 作用機序（アジルバ錠：2012年1月18日承認、CTD2.6.1）（L20220904）
- 2) ニプロ(株)社内資料：加速安定性試験（10mg）
- 3) ニプロ(株)社内資料：加速安定性試験（20mg）
- 4) ニプロ(株)社内資料：加速安定性試験（40mg）
- 5) ニプロ(株)社内資料：長期保存試験（10mg）
- 6) ニプロ(株)社内資料：長期保存試験（20mg）
- 7) ニプロ(株)社内資料：長期保存試験（40mg）
- 8) ニプロ(株)社内資料：無包装状態での安定性試験（10mg）
- 9) ニプロ(株)社内資料：無包装状態での安定性試験（20mg）
- 10) ニプロ(株)社内資料：無包装状態での安定性試験（40mg）
- 11) ニプロ(株)社内資料：分割後の安定性試験（20mg）
- 12) ニプロ(株)社内資料：分割後の安定性試験（40mg）
- 13) ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性試験（溶出）（10mg）
- 14) ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性試験（溶出、血漿中濃度測定）（20mg）
- 15) ニプロ(株)社内資料：生物学的同等性試験（溶出、血漿中濃度測定）（40mg）
- 16) ニプロ(株)社内資料：自動分包機への適合性確認試験（10mg、20mg、40mg）
- 17) 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、CTD2.7.6.26）
（L20210555）
- 18) 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、CTD2.7.6.27）
（L20210556）
- 19) 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、CTD2.7.6.28）
（L20210557）
- 20) アジルサルタンの臨床試験成績⑧（アジルバ錠/顆粒：2021年9月27日承認、
CTD2.7.6.10）（L20250076）
- 21) アジルサルタンの臨床試験成績⑨（アジルバ錠/顆粒：2024年8月28日承認、審査報告
書）（L20250075）
- 22) 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、CTD2.7.6.29）
（L20210558）
- 23) 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、CTD2.7.4.5）
（L20210559）
- 24) 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、CTD2.7.6.30）
（L20210560）
- 25) 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、
CTD2.6.2.1）（L20210165）

- 26) 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、CTD2. 7. 6. 5) (L20210173)
- 27) 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、CTD2. 6. 2. 2) (L20210562)
- 28) 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、CTD2. 7. 6. 3) (L20210550)
- 29) アジルサルタンの薬物動態試験成績② (アジルバ錠/顆粒 : 2021 年 9 月 27 日承認、CTD2. 7. 6. 4) (L20250074)
- 30) アジルサルタンの母集団薬物動態解析 (アジルバ錠/顆粒 : 2024 年 8 月 28 日承認、審査報告書) (L20250075)
- 31) 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、CTD2. 7. 6. 1) (L20210552)
- 32) 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、CTD2. 7. 6. 18) (L20210170)
- 33) 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、CTD2. 6. 4. 4) (L20210554)
- 34) 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、CTD2. 6. 4. 1) (L20210164)
- 35) 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、CTD2. 7. 2. 2、2. 7. 6. 16) (L20210166、L20220903)
- 36) 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、CTD2. 7. 2. 2、2. 7. 6. 30) (L20210166、L20210560)
- 37) 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、CTD2. 7. 6. 17) (L20210167)
- 38) アジルサルタンの薬物動態試験成績⑤ (アジルバ錠 : 2012 年 1 月 18 日承認、CTD2. 7. 6. 15) (L20210168)
- 39) 阿部真也ほか : 周産期医学. 2017 ; 47 : 1353-1355 (L20230078)
- 40) 齊藤大祐ほか : 鹿児島産科婦人科学会雑誌. 2021 ; 29 : 49-54 (L20230079)
- 41) アジルサルタンの非臨床毒性試験成績 (アジルバ錠/顆粒 : 2021 年 9 月 27 日承認、CTD2. 6. 6. 6) (L20250073)
- 42) ニプロ(株)社内資料 : 粉碎後の安定性試験 (10mg)
- 43) ニプロ(株)社内資料 : 粉碎後の安定性試験 (20mg)
- 44) ニプロ(株)社内資料 : 粉碎後の安定性試験 (40mg)
- 45) ニプロ(株)社内資料 : 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性 (10mg)
- 46) ニプロ(株)社内資料 : 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性 (20mg)
- 47) ニプロ(株)社内資料 : 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性 (40mg)

2. その他の参考文献

該当資料なし

X II. 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

XIII. 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

粉砕後の安定性

試験項目：外観、含量 残存率 (%)、乾燥減量 (%)、純度試験 類縁物質

①アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」⁴²⁾

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	1 カ月	2 カ月	3 カ月
温度	40℃ 遮光・ 気密容器	外観	微黄赤色のフィルム片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		含量 残存率 (%)	100.0	100.9	99.8	101.0
		乾燥減量 (%)	1.4	2.3	2.9	3.0
		純度試験 類縁物質	適合	適合	適合	適合

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	1 カ月	2 カ月	100 日
湿度	75%RH /25℃ 遮光・開放	外観	微黄赤色のフィルム片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		含量 残存率 (%)	100.0	100.0	99.6	101.1

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	1 カ月	2 カ月	100 日
湿度	75%RH /25℃ 遮光・開放	乾燥減量 (%)	1.4	2.9	3.4	3.1
		純度試験 類縁物質	適合	適合	適合	適合

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	4 日	7 日	14 日
光	75%RH /25℃ /1000lx 透明・開放	外観	微黄赤色のフィルム片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		含量 残存率 (%)	100.0	101.0	101.5	99.4
		乾燥減量 (%)	1.4			3.0
		純度試験 類縁物質	適合	適合	不適合 (規格外)	不適合 (規格外)

②アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」⁴³⁾

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	1 カ月	2 カ月	3 カ月
温度	40℃ 遮光・ 気密容器	外観	微赤色のフィルム片を含む白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		含量 残存率 (%)	100.0	101.5	100.7	100.4
		乾燥減量 (%)	0.5	1.3	3.0	3.3
		純度試験 類縁物質	適合	適合	適合	適合

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	1 カ月	2 カ月	100 日
湿度	75%RH /25℃ 遮光・開放	外観	微赤色のフィルム片を含む 白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		含量 残存率 (%)	100.0	100.7	100.7	100.1
		乾燥減量 (%)	0.5	3.0	3.5	3.1
		純度試験 類縁物質	適合	適合	適合	適合

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	4 日	7 日	14 日
光	75%RH /25℃ /1000lx 透明・開放	外観	微赤色のフィルム片を含む 白色の粉末	変化なし	変化なし	変化あり(光 照射面がわずかに黄変)
		含量 残存率 (%)	100.0	101.3	100.6	100.2
		乾燥減量 (%)	0.5			3.0
		純度試験 類縁物質	適合	適合	適合	不適合 (規格外)

③アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」⁴⁴⁾

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	1 カ月	2 カ月	3 カ月
温度	40℃ 遮光・ 気密容器	外観	黄色のフィルム片を含む 白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		含量 残存率 (%)	100.0	99.9	97.9	98.1
		乾燥減量 (%)	0.5	1.8	2.8	2.9

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	1 カ月	2 カ月	3 カ月
温度	40℃ 遮光・ 気密容器	純度試験 類縁物質	適合	適合	適合	適合

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	1 カ月	2 カ月	100 日
湿度	75%RH /25℃ 遮光・開放	外観	黄色のフィルム片を含む 白色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
		含量 残存率 (%)	100.0	99.2	99.0	97.3
		乾燥減量 (%)	0.5	2.9	3.5	3.0
		純度試験 類縁物質	適合	適合	適合	適合

保存条件 保存形態		試験項目	開始時	4 日	7 日	14 日
光	75%RH /25℃ /1000lx 透明・開放	外観	黄色のフィルム片を含む 白色の粉末	変化なし	変化あり(光照射面がわずかに黄変)	変化あり(光照射面がわずかに黄変)
		含量 残存率 (%)	100.0	99.4	99.1	97.8
		乾燥減量 (%)	0.5			3.0
		純度試験 類縁物質	適合	適合	適合	不適合 (規格外)

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

①崩壊・懸濁性及び通過性

試験方法

(1) 崩壊懸濁試験

注入器（シリンジ）のプランジャーを抜き取り、シリンジ内に錠剤1個を入れてプランジャーを戻し、約55℃のお湯20mLを吸い取った後、（シリンジ先端にキャップをして）5分間自然放置した。

5分後にシリンジを手で180度15往復横転して攪拌し崩壊・懸濁の状況を確認した。試験回数は1回とした。

(2) 通過性試験

得られた懸濁液の入ったシリンジを8Fr. 経管チューブ（経管栄養用カテーテル）に接続し、懸濁液を約2~3mL/secの速度で注入して、通過性を観察した。チューブはベッドの上の患者を想定し、体内挿入端から3分の2を水平にし、他端（注入端）を30cmの高さにセットした。注入後に適量の水を同じシリンジで吸い取り、注入してチューブ内を洗うとき、シリンジ内、チューブ内に残留物がみられなければ、通過性に問題なしとした。また、得られた懸濁液についてpHを測定した。試験回数は1回とした。

試験結果

試験製剤	試験条件	試験回数	放置時間	崩壊懸濁試験	通過性試験		pH
				観察結果	チューブサイズ	通過性及び残存	
アジルサルタン錠 10mg「ニプロ」 ⁴⁵⁾	水 (約55℃)	1	5分	崩壊・懸濁した	8Fr.	残存なし	6.53
アジルサルタン錠 20mg「ニプロ」 ⁴⁶⁾	水 (約55℃)	1	5分	崩壊・懸濁した	8Fr.	残存なし	6.26
アジルサルタン錠 40mg「ニプロ」 ⁴⁷⁾	水 (約55℃)	1	5分	崩壊・懸濁した	8Fr.	残存なし	6.16

②粉砕法試験

試験方法

(1) 懸濁試験

錠剤を乳棒・乳鉢で、完全に粉末状になるまで粉砕してビーカーに移した後、約55℃のお湯20mLを注ぎ、分散するように攪拌して懸濁状態を観察した。試験回数は1回とした。

(2) 通過性試験

得られた懸濁液を速やかにシリンジで吸い取り、8Fr. 経管チューブ（経管栄養用カテーテル）に接続し、懸濁液を約2~3mL/secの速度で注入して、通過性を観察した。チューブはベッドの上の患者を想定し、体内挿入端から3分の2を水平に

し、他端（注入端）を 30cm の高さにセットした。注入後に適量の水を同じシリンジで吸い取り、注入してチューブ内を洗うとき、シリンジ内、チューブ内に残留物がみられなければ、通過性に問題なしとした。また、得られた懸濁液について pH を測定した。試験回数は 1 回とした。

試験結果

試験製剤	試験条件	試験回数	懸濁試験	通過性試験		pH
			観察結果	チューブサイズ	通過性及び残存	
アジルサルタン錠 10mg 「ニプロ」 ⁴⁵⁾	水 (約 55°C)	1	均一に懸濁した	8Fr.	残存なし	6.34
アジルサルタン錠 20mg 「ニプロ」 ⁴⁶⁾	水 (約 55°C)	1	均一に懸濁した	8Fr.	残存なし	6.13
アジルサルタン錠 40mg 「ニプロ」 ⁴⁷⁾	水 (約 55°C)	1	均一に懸濁した	8Fr.	残存なし	6.12

本試験は「内服薬経管投与ハンドブック第 4 版（株）じほう」、「簡易懸濁法マニュアル（株）じほう」に準じて実施。

2. その他の関連資料

患者向け資料

○レニン - アンジオテンシン系阻害作用のあるお薬を服用される女性の患者さんへ


レニン - アンジオテンシン系阻害作用のあるお薬を服用される 女性の患者さんへ

妊婦又は妊娠している可能性のある女性は、医師に相談してください。


- 妊娠中に使用した場合、胎児・新生児に影響を及ぼす可能性があります。
- 妊娠が判明した場合又は疑われる場合（月経遅延、つわり症状、基礎体温を測定している場合は高温期の持続など）は、医師に相談してください。
- 妊娠を計画する場合は、医師に相談してください。

医師は、このお薬を患者さんに必要と判断して処方しています。医師に相談なくお薬の使用を中止することのないようにお願いします。

妊娠中や妊娠希望の方のお薬に関する相談窓口として「妊娠と薬情報センター」があります。



(対象のお薬は、裏面の記載をご覧ください。)



医療関係者向け情報 医薬品情報 <https://med.nipro.co.jp/pharmaceuticals>

【MEMO】

【MEMO】

【MEMO】

ニフ.オ株式会社

大阪府摂津市千里丘新町3番26号