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_1 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「トーワ」
アジルサルタン錠 20mg「トーワ」
アジルサルタン錠 40mg「トーワ」

AZILSARTAN TABLETS 10mg “TOWA”/TABLETS 20mg “TOWA”/TABLETS 40mg “TOWA”

剤形	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)] 注）注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	錠 10mg：1 錠中 アジルサルタン 10mg 含有 錠 20mg：1 錠中 アジルサルタン 20mg 含有 錠 40mg：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： 東和薬品株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	東和薬品株式会社　学術部 DI センター TEL　0120-108-932　　FAX　06-7177-7379 https://med.towayakuhin.co.jp/medical/

本 IF は 2026 年 3 月改訂の電子添文の記載に基づき作成した。
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－

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、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。

（2020 年 4 月改訂）

目　次

Ⅰ. 概要に関する項目 ……1
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 ……1
5．承認条件及び流通・使用上の制限事項 ……1
6．RMP の概要 ……2

Ⅱ. 名称に関する項目 ……3
1．販売名 ……3
2．一般名 ……3
3．構造式又は示性式 ……3
4．分子式及び分子量 ……3
5．化学名（命名法）又は本質 ……3
6．慣用名、別名、略号、記号番号 ……3

Ⅲ. 有効成分に関する項目 ……4
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
3．有効成分の確認試験法、定量法 ……4

Ⅳ. 製剤に関する項目 ……5
1．剤形 ……5
2．製剤の組成 ……6
3．添付溶解液の組成及び容量 ……6
4．力価 ……6
5．混入する可能性のある夾雑物 ……6
6．製剤の各種条件下における安定性 ……6
7．調製法及び溶解後の安定性 ……13
8．他剤との配合変化（物理化学的変化） ……14
9．溶出性 ……14
10. 容器・包装 ……20
11. 別途提供される資材類 ……21
12. その他 ……21

Ⅴ. 治療に関する項目 ……22
1．効能又は効果 ……22
2．効能又は効果に関連する注意 ……22
3．用法及び用量 ……22
4．用法及び用量に関連する注意 ……22
5．臨床成績 ……22

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目 ……26
1．薬理学的に関連ある化合物又は化合物群 ……26
2．薬理作用 ……26

Ⅶ. 薬物動態に関する項目 ……27
1．血中濃度の推移 ……27
2．薬物速度論的パラメータ ……30
3．母集団（ポピュレーション）解析 ……31
4．吸収 ……31
5．分布 ……31
6．代謝 ……32
7．排泄 ……32
8．トランスポーターに関する情報 ……32
9．透析等による除去率 ……32
10. 特定の背景を有する患者 ……32
11. その他 ……33

Ⅷ. 安全性（使用上の注意等）に関する項目 ……34
1．警告内容とその理由 ……34
2．禁忌内容とその理由 ……34
3．効能又は効果に関連する注意とその理由 ……34
4．用法及び用量に関連する注意とその理由 ……34
5．重要な基本的注意とその理由 ……34
6．特定の背景を有する患者に関する注意 ……34
7．相互作用 ……36
8．副作用 ……37
9．臨床検査結果に及ぼす影響 ……37
10. 過量投与 ……38
11. 適用上の注意 ……38
12. その他の注意 ……38

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目 ……39
1．薬理試験 ……39
2．毒性試験 ……39

Ⅹ. 管理的事項に関する項目 ……40
1．規制区分 ……40
2．有効期間 ……40
3．包装状態での貯法 ……40
4．取扱い上の注意 ……40
5．患者向け資材 ……40
6．同一成分・同効薬 ……40
7．国際誕生年月日 ……40
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 ……40
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 ……40
10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 ……40
11. 再審査期間 ……40
12. 投薬期間制限に関する情報 ……40
13. 各種コード ……41
14. 保険給付上の注意 ……41

ⅩⅠ. 文献 ……42
1．引用文献 ……42
2．その他の参考文献 ……43

ⅩⅡ. 参考資料 ……43
1．主な外国での発売状況 ……43
2．海外における臨床支援情報 ……43

ⅩⅢ. 備考 ……44
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 ……44
2．その他の関連資料 ……45

Ⅰ．概要に関する項目

１．開発の経緯

アジルサルタンは持続性 AT_1 レセプターブロッカーであり、本邦では 2012 年（錠 20mg/40mg）から製造販売されている。

東和薬品株式会社が後発医薬品として、アジルサルタン錠 10mg/20mg/40mg「トーワ」の開発を企画し、薬食発第 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実施し、2023 年 2 月にそれぞれ承認を取得、2023 年 6 月に発売した。

２．製品の治療学的特性

(1)本剤はアジルサルタンを有効成分とする持続性 AT_1 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する。（「Ⅴ．１．効能又は効果」の項参照）

(2)重大な副作用として血管性浮腫、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

- 錠剤両面に製品名と含量を印刷
- 錠 20mg と錠 40mg に分割性を考慮した両面割線を付与。分割後の錠剤にそれぞれ「20 アジル」、「40 アジル」の表示が残る

（Ⅳ．1.（2）製剤の外観及び性状の項参照）

- PTP シートに「高血圧の薬」と表示（両面）
- PTP シートに 1 錠単位で GS 1 コードを表示(裏面)。専用アプリ「添文ナビ」で読み取ることで、最新の電子添文等を参照可能

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
RMP	有
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

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

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、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	なし	なし
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 自発報告、文献・学会情報及び外国措置情報等の収集・評価・分析を実施し、それらの結果に基づく安全対策を検討し、実行する。
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 電子添文及び患者向医薬品ガイドにより情報提供及び注意喚起を行う。
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「トーワ」
アジルサルタン錠 20mg「トーワ」
アジルサルタン錠 40mg「トーワ」

(2) 洋　　名

AZILSARTAN TABLETS 10mg　“TOWA”
AZILSARTAN TABLETS 20mg　“TOWA”
AZILSARTAN TABLETS 40mg　“TOWA”

(3) 名称の由来

一般名＋剤形＋規格（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）

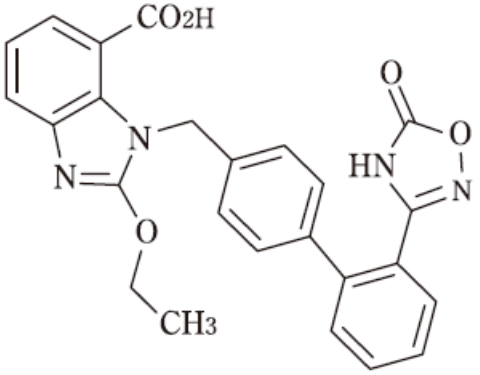
(2) 洋　　名（命名法）

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



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}-1*H*-benzo[*d*]imidazole-7-carboxylic acid（IUPAC）

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

白色～帯黄白色の粉末である。

(2) 溶解性

メタノール又は酢酸（100）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

(2) 製剤の外観及び性状

販売名		アジルサルタン錠 10mg「トーワ」	アジルサルタン錠 20mg「トーワ」	アジルサルタン錠 40mg「トーワ」
性状・剤形		微黄赤色の楕円形の フィルムコーティング錠	微赤色の割線入りの 楕円形の フィルムコーティング錠	黄色の割線入りの 楕円形の フィルムコーティング錠
本体 表示	表	アジルサルタン 10　トーワ	20　アジル	40　アジル
	裏		20　アジル サルタン　トーワ	40　アジル サルタン　トーワ
外形	表			
	裏			
	側面			
直径(mm)		8.2／4.7 (長径／短径)	9.1／5.1 (長径／短径)	9.1／5.1 (長径／短径)
厚さ(mm)		3.1	3.3	3.3
質量(mg)		106	130	130

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

「Ⅳ.6　製剤の各種条件下における安定性」の項参照

(5) その他

該当しない

２．製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

販売名	アジルサルタン錠 10mg「トーワ」	アジルサルタン錠 20mg「トーワ」	アジルサルタン錠 40mg「トーワ」
1錠中の有効成分	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	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、マクロゴール6000、低置換度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、ヒプロメロース、酸化チタン、黄色三二酸化鉄、三二酸化鉄	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、マクロゴール6000、低置換度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、ヒプロメロース、酸化チタン、三二酸化鉄	乳糖水和物、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、マクロゴール6000、低置換度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、ヒプロメロース、酸化チタン、黄色三二酸化鉄

(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

該当資料なし

６．製剤の各種条件下における安定性

アジルサルタン錠10mg「トーワ」

(1) 加速試験[1)]

包装形態：PTP包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3ロット(n=3)

試験項目	開始時	6箇月
性状	微黄赤色の楕円形のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	91.6～100.5	92.6～98.3
含量(%)	100.0～100.6	99.8～100.5

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品
試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	微黄赤色の楕円形の フィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	91.6～100.5	93.0～99.3
含量(%)	100.0～100.6	100.0～100.5

(2) 長期保存試験 [2)]
包装形態：PTP 包装した製品
試験条件：25℃、60%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	3 年
性状	微黄赤色の楕円形の フィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	91.6～100.5	94.1～99.2
含量(%)	100.0～100.6	99.6～100.2

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品
試験条件：25℃、60%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	3 年
性状	微黄赤色の楕円形の フィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	91.6～100.5	95.1～99.9
含量(%)	100.0～100.6	99.6～100.2

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、アジルサルタン錠 10mg「トーワ」は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。

(3) 無包装状態における安定性 [3)]

《試験条件》

温度：40℃、遮光、気密容器

湿度：25℃、75%RH、遮光、シャーレ（開放）

光　：25℃、60%RH、3000lx、シャーレ（ラップで覆う）

試験項目	開始時	温度	湿度	光
		3 箇月	3 箇月	120 万 lx・hr
外観	微黄赤色の楕円形のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
含量	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
規格：95.0～105.0%	99.7%	99.8%	99.8%	100.5%
硬度	規格内	変化なし	変化あり＊（規格内）	変化なし
規格（参考値）：20N 以上	78N	84N	51N	67N
溶出性	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	規格内	変化なし	変化なし	変化なし

＊：78N(開始時)→53N(1 箇月)→51N(3 箇月)

注)「(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」を参考に評価した。

【評価基準】

分類	外観	含量	硬度	崩壊性 溶出性 純度試験
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	含量低下が 3%未満の場合	硬度変化が 30%未満の場合	規格値内の場合
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（20N）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	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kgf（20N）未満の場合	規格値外の場合

アジルサルタン錠 20mg「トーワ」

(1) 加速試験 [4)]

包装形態：PTP 包装した製品

試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	微赤色の割線入りの楕円形のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	93.6～98.6	87.3～93.8
含量(%)	101.3～101.9	101.0～101.5

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品
試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	微赤色の割線入りの楕円形のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	93.6～98.6	88.5～94.5
含量(%)	101.3～101.9	101.0～101.9

(2) 長期保存試験 [5)]
包装形態：PTP 包装した製品
試験条件：25℃、60%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	3 年
性状	微赤色の割線入りの楕円形のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	93.6～98.6	84.0～95.0
含量(%)	101.3～101.9	100.7～101.3

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品
試験条件：25℃、60%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	3 年
性状	微赤色の割線入りの楕円形のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	93.6～98.6	85.2～95.6
含量(%)	101.3～101.9	100.7～101.4

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、アジルサルタン錠 20mg「トーワ」は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。

(3) 無包装状態における安定性 [6)]

《試験条件》

温度：40℃、遮光、気密容器

湿度：25℃、75%RH、遮光、シャーレ（開放）

光　：25℃、60%RH、3000lx、シャーレ（ラップで覆う）

試験項目	開始時	温度	湿度	光
		3 箇月	3 箇月	120 万 lx・hr
外観	微赤色の割線入りの楕円形のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
含量	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
規格：95.0～105.0%	98.9%	99.2%	99.2%	99.2%
硬度	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
規格（参考値）：20N 以上	102N	104N	83N	87N
溶出性	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	規格内	変化なし	変化なし	変化なし

注)「(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」を参考に評価した。

【評価基準】

分類	外観	含量	硬度	崩壊性 溶出性 純度試験
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	含量低下が 3%未満の場合	硬度変化が 30%未満の場合	規格値内の場合
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（20N）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	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kgf（20N）未満の場合	規格値外の場合

(4) 分割後の安定性 [7)]

保存形態：遠沈管（開放）

試験条件：25℃、60%RH、遮光保存、1 ロット(n=3)

試験項目	分割直後	90 日目
性状	微赤色の分割されたフィルムコーティング錠	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	－
含量(%)	101.5～101.6	101.8～102.0

保存形態：シャーレ（ラップで覆う）
試験条件：25℃、60%RH、4000lx 散光下、1 ロット(n=3)

試験項目	分割直後	120 万 lx・hr
性状	微赤色の分割された フィルムコーティング錠	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	－
含量(%)	101.5～101.6	102.0～102.4

アジルサルタン錠 40mg「トーワ」

(1) 加速試験 [8)]

包装形態：PTP 包装した製品
試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	黄色の割線入りの楕円形の フィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	95.4～99.5	92.8～97.0
含量(%)	99.9～100.8	100.3～101.1

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品
試験条件：40℃、75%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	6 箇月
性状	黄色の割線入りの楕円形の フィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	95.4～99.5	94.1～98.9
含量(%)	99.9～100.8	100.1～101.2

(2) 長期保存試験 [9)]

包装形態：PTP 包装した製品
試験条件：25℃、60%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	3 年
性状	黄色の割線入りの楕円形のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	95.4～99.5	92.5～96.9
含量(%)	99.9～100.8	99.3～100.1

包装形態：ポリエチレン瓶に入れた製品
試験条件：25℃、60%RH、3 ロット(n=3)

試験項目	開始時	3 年
性状	黄色の割線入りの楕円形のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格内	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	同左
溶出率(%)	95.4～99.5	93.3～98.2
含量(%)	99.9～100.8	99.6～100.3

最終包装製品を用いた長期保存試験の結果、アジルサルタン錠 40mg「トーワ」は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。

(3) 無包装状態における安定性 [10)]

《試験条件》
温度：40℃、遮光、気密容器
湿度：25℃、75%RH、遮光、シャーレ（開放）
光　：25℃、60%RH、3000lx、シャーレ（ラップで覆う）

試験項目	開始時	温度	湿度	光
		3 箇月	3 箇月	120 万 lx・hr
外観	黄色の割線入りの楕円形のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
含量	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
規格：95.0～105.0%	100.2%	100.5%	100.7%	101.0%
硬度	規格内	変化なし	変化あり*（規格内）	変化なし
規格（参考値）：20N 以上	122N	125N	79N	109N
溶出性	規格内	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	規格内	変化なし	変化なし	変化なし

＊：122N(開始時)→84N(1 箇月)→79N(3 箇月)
注)「(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」を参考に評価した。

【評価基準】

分類	外観	含量	硬度	崩壊性 溶出性 純度試験
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない場合	含量低下が 3%未満の場合	硬度変化が 30%未満の場合	規格値内の場合
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（20N）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	硬度変化が 30%以上で、硬度が 2.0kgf（20N）未満の場合	規格値外の場合

（4）分割後の安定性 [11)]

保存形態：遠沈管（開放）
試験条件：25℃、60%RH、遮光保存、1 ロット(n=3)

試験項目	分割直後	90 日目
性状	黄色の分割された フィルムコーティング錠	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	－
含量(%)	100.1～100.2	100.2～100.3

保存形態：シャーレ（ラップで覆う）
試験条件：25℃、60%RH、4000lx 散光下、1 ロット(n=3)

試験項目	分割直後	120 万 lx・hr
性状	黄色の分割された フィルムコーティング錠	同左
純度試験	規格内	同左
製剤均一性	規格内	－
含量(%)	100.1～100.2	101.0～101.2

分割後の安定性試験の結果、アジルサルタン錠 40mg「トーワ」は上記試験条件において、それぞれの試験項目でほとんど変化を認めなかった。

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（物理化学的変化）

服薬補助ゼリーとの配合変化 [12)]

アジルサルタン錠 20mg「トーワ」

■方法

(1)配合方法

アジルサルタン錠 20mg「トーワ」（1 錠）と服薬補助ゼリー（大さじ 1（およそ 15mL））を配合した。

(2)保存条件

条件：成り行き温湿度、室内散光

保存形態：無色ガラス瓶（密栓）

■結果

服薬補助ゼリー（メーカー名）	測定項目	配合前	配合直後	3 時間後
らくらく服薬ゼリー（龍角散）	外観	試験製剤：微赤色の割線入りの楕円形のフィルムコーティング錠	微黄白色のゼリーに錠剤が包まれていた	微黄白色のゼリーに膨潤した錠剤が包まれていた
	におい	-	レモン様のにおい	同左
	含量 (%)	試験製剤：99.7	98.3	98.9

９．溶出性

(1) 規格及び試験方法

アジルサルタン錠 10mg/20mg/40mg「トーワ」は、設定された溶出規格に適合していることが確認されている。

方　法：日局溶出試験法（回転バスケット法）
試験液：pH6.0 の薄めた McIlvaine 緩衝液　900mL（錠 10mg/20mg）
　　pH6.3 の薄めた McIlvaine 緩衝液　900mL（錠 40mg）
回転数：100rpm
測定法：液体クロマトグラフィー
規　格：20 分間の溶出率が 85%以上のときは適合とする。（錠 10mg）
　　20 分間の溶出率が 80%以上のときは適合とする。（錠 20mg/40mg）

(2) 溶出挙動における同等性

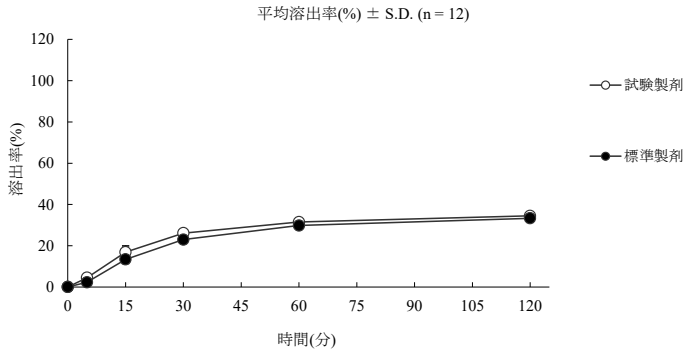
アジルサルタン錠 10mg「トーワ」[13)]

アジルサルタン錠 10mg「トーワ」について、「後発医薬品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）（以下、ガイドライン）に従い溶出試験を行った。

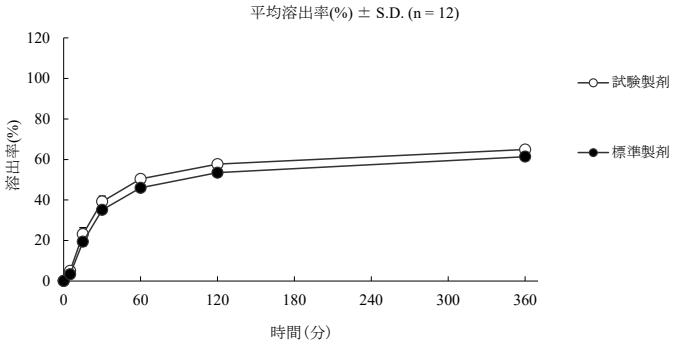
＜測定条件＞

試験液： pH1.2、pH5.0、pH6.8、水
回転数： 50rpm、100rpm
試験製剤：アジルサルタン錠 10mg「トーワ」
検体数： n=12
試験法：パドル法、回転バスケット法
標準製剤：アジルバ錠 10mg

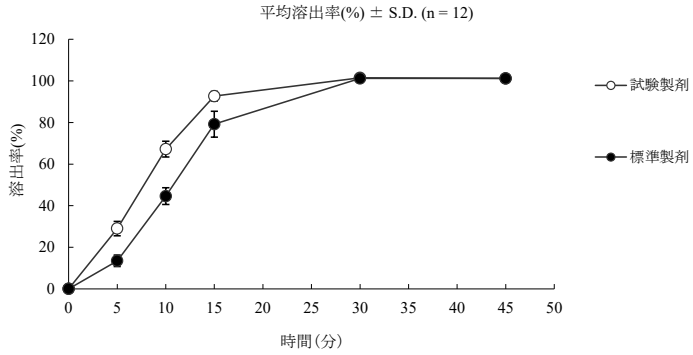
pH1.2，50rpm，パドル法



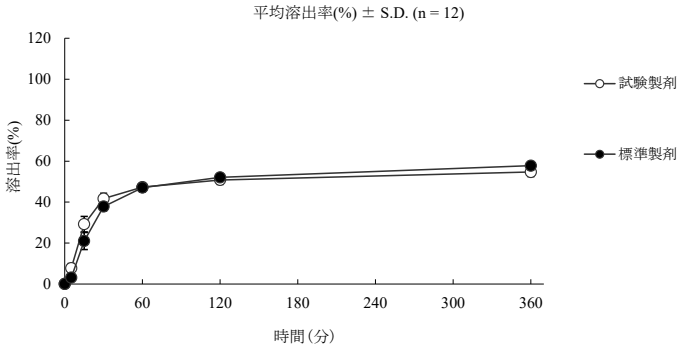
pH5.0，50rpm，パドル法



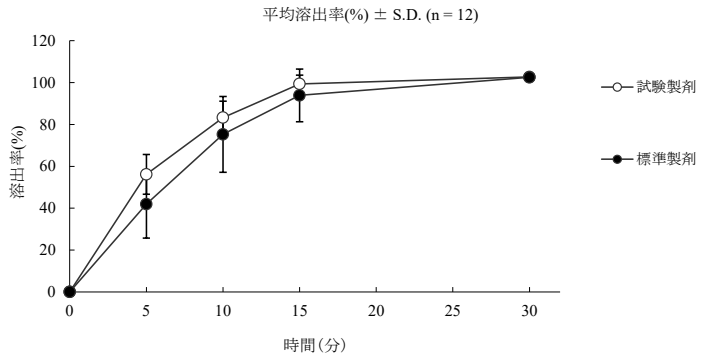
pH6.8，100rpm，回転バスケット法



水，50rpm，パドル法



pH6.8，100rpm，パドル法



試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較

試験条件				平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	f_2 値	類似性の判定基準	判定
試験法	回転数(rpm)	試験液	採取時間(分)	試験製剤	標準製剤				
パドル法	50	pH1.2	15	16.9	13.4	3.5		標準製剤の平均溶出率の±9%	適
			120	34.5	33.3	1.2			
		pH5.0	30	39.2	35.1	4.1		標準製剤の平均溶出率の±12%	適
			360	64.9	61.4	3.5			
回転バスケット法	100	pH6.8	15	92.7	79.2		55.2	f_2 関数の値が 42 以上	適
			30	101.5	101.2				
			45	101.2	101.2				
パドル法	50	水	15	29.2	21.0	8.2		標準製剤の平均溶出率の±12%	適
			360	54.7	57.8	−3.1			
	100	pH6.8	15	99.4	93.9			15 分以内に平均85%以上溶出	適

(n=12)

上記の結果より、すべての試験条件でガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合し、アジルサルタン錠 10mg「トーワ」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。従って、ヒトにおける生物学的同等性試験を行い、アジルサルタン錠 10mg「トーワ」は標準製剤との生物学的同等性が確認された。

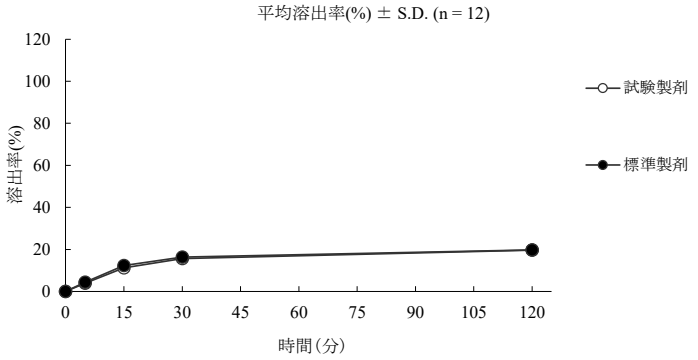
アジルサルタン錠 20mg「トーワ」[14)]

アジルサルタン錠 20mg「トーワ」について、「後発医薬品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）（以下、ガイドライン）に従い溶出試験を行った。

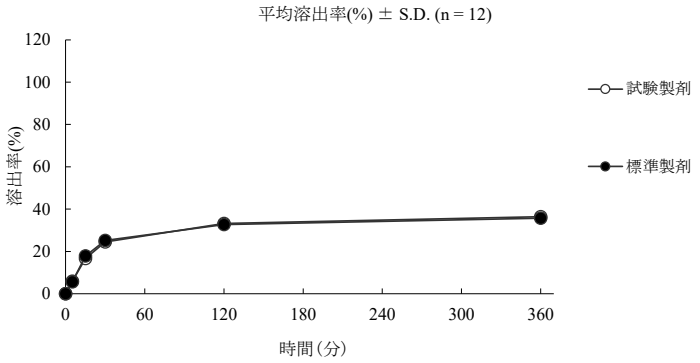
＜測定条件＞

試験液： pH1.2、pH5.0、pH6.8、水
回転数： 50rpm、100rpm
試験製剤：アジルサルタン錠 20mg「トーワ」
検体数： n=12
試験法：パドル法、回転バスケット法
標準製剤：アジルバ錠 20mg

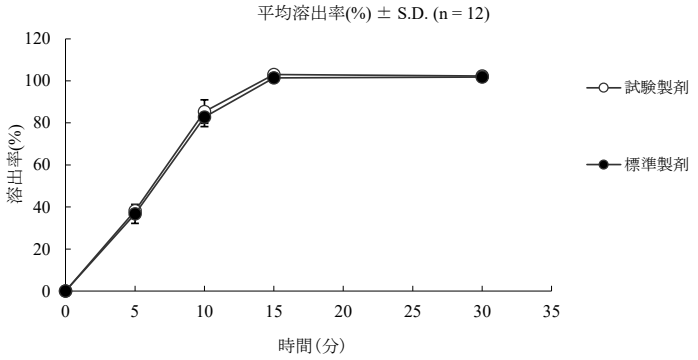
pH1.2，50rpm，パドル法



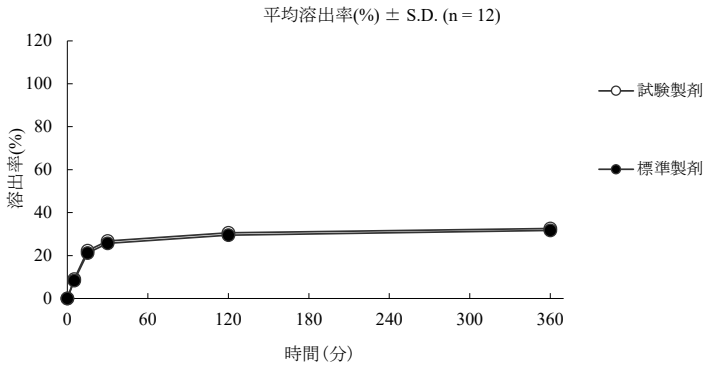
pH5.0，50rpm，パドル法



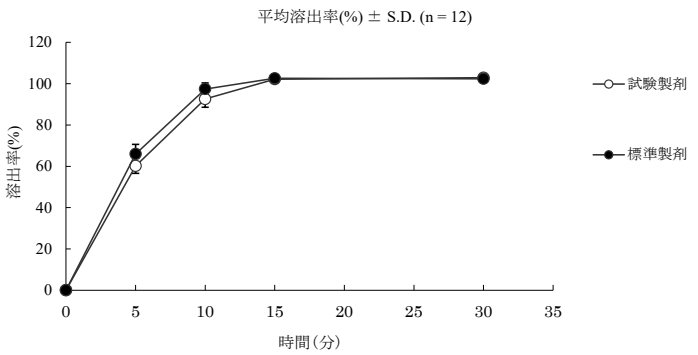
pH6.8，100rpm，回転バスケット法



水，50rpm，パドル法



pH6.8，100rpm，パドル法



試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較

試験条件				平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	類似性の判定基準	判定
試験法	回転数(rpm)	試験液	採取時間(分)	試験製剤	標準製剤			
パドル法	50	pH1.2	15	11.2	12.3	−1.1	標準製剤の平均溶出率の±9%	適
			120	19.7	19.8	−0.1		
		pH5.0	15	16.7	17.9	−1.2		適
			360	36.4	35.7	0.7		
回転バスケット法	100	pH6.8	15	103.0	101.4		15 分以内に平均85%以上溶出	適
パドル法	50	水	15	22.3	21.2	1.1	標準製剤の平均溶出率の±9%	適
			360	32.6	31.7	0.9		
	100	pH6.8	15	102.2	102.6		15 分以内に平均85%以上溶出	適

(n=12)

上記の結果より、すべての試験条件でガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合し、アジルサルタン錠 20mg「トーワ」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。従って、ヒトにおける生物学的同等性試験を行い、アジルサルタン錠 20mg「トーワ」は標準製剤との生物学的同等性が確認された。

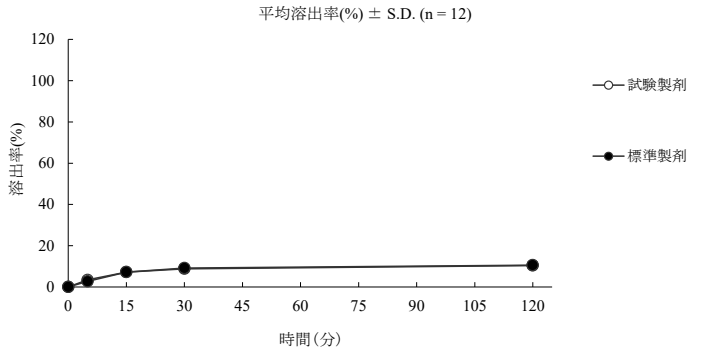
アジルサルタン錠 40mg「トーワ」[15)]

アジルサルタン錠 40mg「トーワ」について、「後発医薬品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）（以下、ガイドライン）に従い溶出試験を行った。

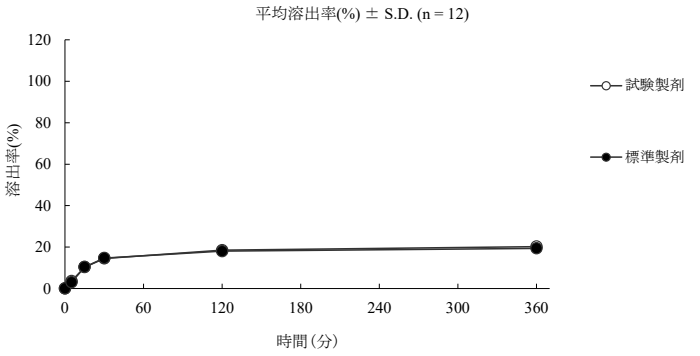
＜測定条件＞

試験液： pH1.2、pH5.0、pH6.8、水
回転数： 50rpm、100rpm
試験製剤：アジルサルタン錠 40mg「トーワ」
検体数： n=12
試験法：パドル法、回転バスケット法
標準製剤：アジルバ錠 40mg

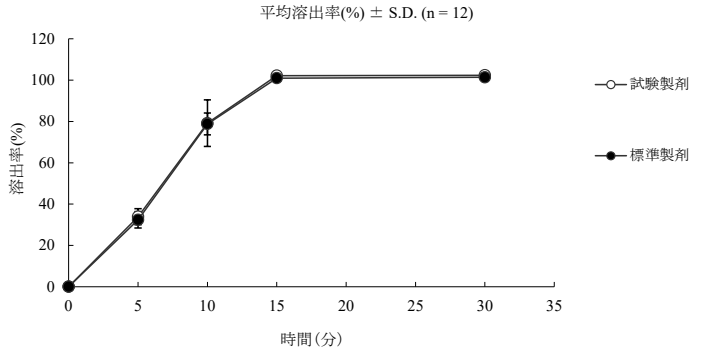
pH1.2，50rpm，パドル法



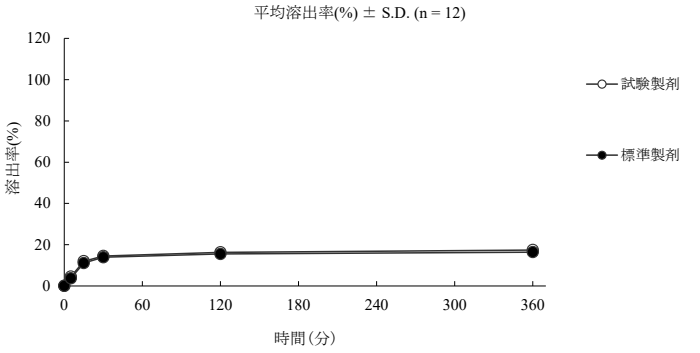
pH5.0，50rpm，パドル法



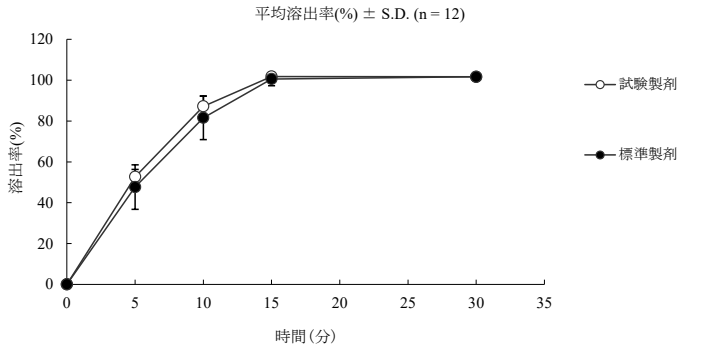
pH6.8，100rpm，回転バスケット法



水，50rpm，パドル法



pH6.8，100rpm，パドル法



試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較

試験条件				平均溶出率(%)		平均溶出率の差(%)	類似性の判定基準	判定
試験法	回転数(rpm)	試験液	採取時間(分)	試験製剤	標準製剤			
パドル法	50	pH1.2	15	7.2	7.2	0.0	標準製剤の平均溶出率の±9%	適
			120	10.4	10.6	−0.2		
		pH5.0	15	10.3	10.4	−0.1		適
			360	20.2	19.4	0.8		
回転バスケット法	100	pH6.8	15	102.2	101.0		15 分以内に平均85%以上溶出	適
パドル法	50	水	15	12.0	11.1	0.9	標準製剤の平均溶出率の±9%	適
			360	17.4	16.4	1.0		
	100	pH6.8	15	101.8	100.6		15 分以内に平均85%以上溶出	適

(n=12)

上記の結果より、すべての試験条件でガイドラインの溶出挙動の類似性の判定基準に適合し、アジルサルタン錠 40mg「トーワ」と標準製剤の溶出挙動は類似していると判断した。従って、ヒトにおける生物学的同等性試験を行い、アジルサルタン錠 40mg「トーワ」は標準製剤との生物学的同等性が確認された。

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

〈アジルサルタン錠 10mg「トーワ」〉

100 錠［10 錠×10：PTP］
100 錠［バラ］

〈アジルサルタン錠 20mg「トーワ」〉

100 錠［10 錠×10：PTP］
500 錠［10 錠×50：PTP］
300 錠［バラ］

〈アジルサルタン錠 40mg「トーワ」〉

100 錠［10 錠×10：PTP］
500 錠［10 錠×50：PTP］
300 錠［バラ］

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

包装形態	材質
PTP 包装	PTP：ポリ塩化ビニル、アルミニウム
バラ包装	瓶、蓋：ポリエチレン

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

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
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
〈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「トーワ」、アジルサルタン錠 20mg「トーワ」〉

〈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. 用法及び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

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。[16)]

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。[16)]

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

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。[17)]

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］ 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。[17)]

2）安全性試験

①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。[18)]

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。[18)]

②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。[19)]

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 [19)]

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。[19)]

③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。[20)]

注 1）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。[20)]

(5) 患者・病態別試験

1) 国内第Ⅲ相試験：Ⅲ度高血圧症

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。[21)]
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。[22)]

2) 国内第Ⅲ相試験：腎障害を伴う高血圧症

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。[23)]
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。[22)]

(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

該当しない

(7) その他

該当資料なし

Ⅵ. 薬効薬理に関する項目

１．薬理学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

アジルサルタンはアンジオテンシンⅡタイプ 1（AT_1）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。[24)]

(2) 薬効を裏付ける試験成績

1) AT_1 受容体に対する阻害作用

ヒト AT_1 受容体の活性を濃度依存的に阻害し（IC_{50} 値：0.62～2.6nmol/L）、AT_1 受容体からの解離は極めて緩やかであった（*in vitro*）。[25)]

2) 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)]

3) 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

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)	$AUC_{0\text{-}inf}$ (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)	$AUC_{0\text{-}inf}$ (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））

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)	$AUC_{\tau,ss}$ (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

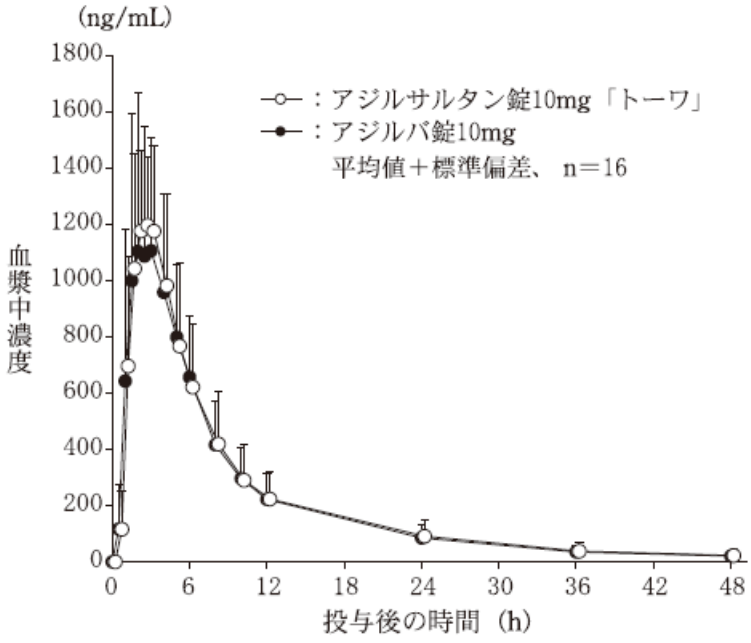
体重 50kg 未満				体重 50kg 以上			
投与量	n	$C_{max,ss}$ (ng/mL)	$AUC_{\tau,ss}$ (ng・h/mL)	投与量	n	$C_{max,ss}$ (ng/mL)	$AUC_{\tau,ss}$ (ng・h/mL)
2.5mg	22	348±120	2,749±983	5mg	5	434±151	2,976±560
5mg	14	723±295	5,668±2,252	10mg	4	831±337	5,555±787
10mg	5	1,384±553	12,156±3,708	20mg	3	1,723±812	11,857±590
20mg	2	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）

3) 生物学的同等性試験

〈アジルサルタン錠 10mg「トーワ」〉

アジルサルタン錠 10mg「トーワ」とアジルバ錠 10mg 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 10mg）健康成人男子に絶食単回経口投与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_{max}）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、いずれも 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。[31)]



薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}48}$ (ng・h/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (h)	$T_{1/2}$ (h)
アジルサルタン錠 10mg「トーワ」	10320±3925	1308±290	2.31±0.54	10.17±1.70
アジルバ錠 10mg	10067±3386	1339±422	2.59±1.23	10.01±2.05

（平均値±標準偏差，n＝16）

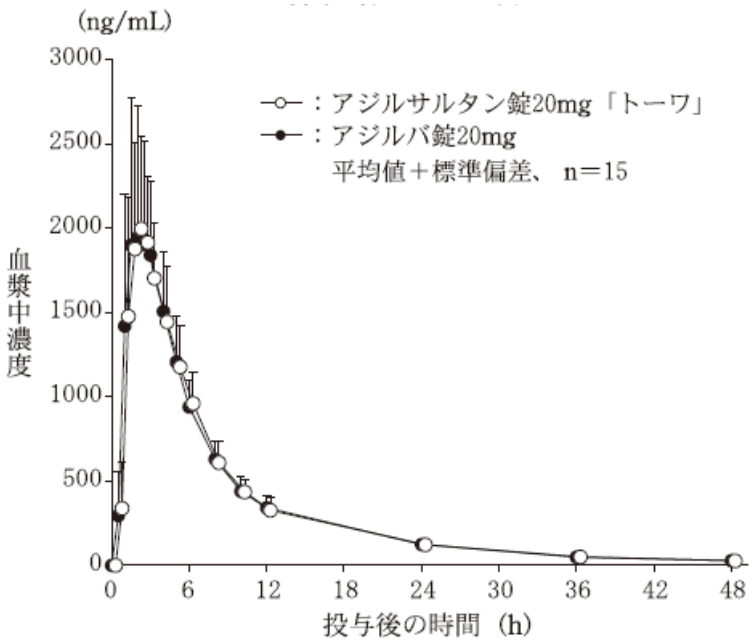
血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある

両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び 90%信頼区間

パラメータ	$AUC_{0\text{-}48}$	C_{max}
平均値の差	log(1.0175)	log(0.9974)
平均値の差の 90%信頼区間	log(0.9469)～log(1.0934)	log(0.9142)～log(1.0880)

〈アジルサルタン錠 20mg「トーワ」〉

アジルサルタン錠 20mg「トーワ」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単回経口投与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_{max}）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、いずれも 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。[32)]



薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}48}$ (ng・h/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (h)	$T_{1/2}$ (h)
アジルサルタン錠 20mg「トーワ」	15705±2869	2163±489	2.27±0.92	10.21±1.21
アジルバ錠 20mg	15959±2622	2306±473	2.13±0.88	9.93±0.98

（平均値±標準偏差，n＝15）

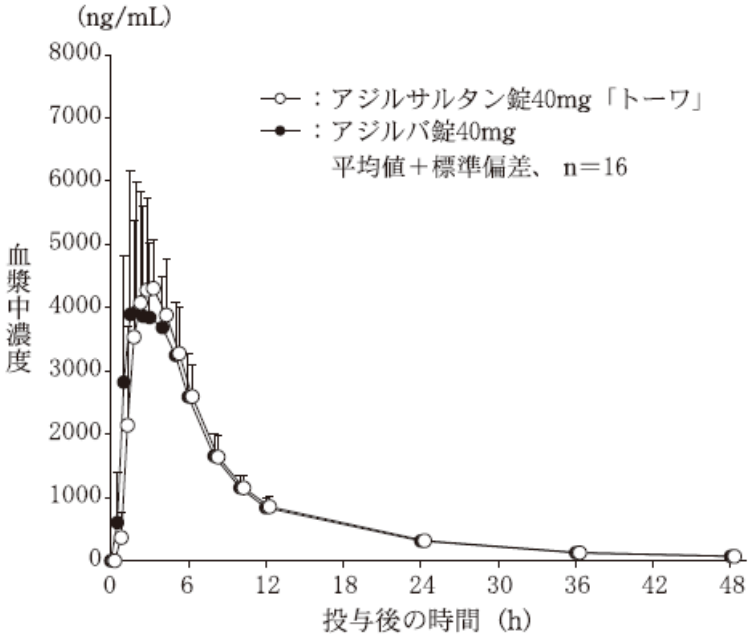
血漿中濃度並びに AUC、C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある

両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び 90%信頼区間

パラメータ	$AUC_{0\text{-}48}$	C_{max}
平均値の差	log(0.9829)	log(0.9352)
平均値の差の 90%信頼区間	log(0.9313)～log(1.0374)	log(0.8458)～log(1.0341)

〈アジルサルタン錠 40mg「トーワ」〉

アジルサルタン錠 40mg「トーワ」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単回経口投与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_{max}）について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、いずれも 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。[33)]



薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}48}$ (ng・h/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (h)	$T_{1/2}$ (h)
アジルサルタン錠 40mg「トーワ」	38689±5768	4997±917	2.66±0.98	9.75±1.34
アジルバ錠 40mg	38375±5246	5190±797	2.59±1.20	10.08±1.16

（平均値±標準偏差，n＝16）

血漿中濃度並びに 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

両製剤の判定パラメータの対数変換値の平均値の差及び 90%信頼区間

パラメータ	$AUC_{0\text{-}48}$	C_{max}
平均値の差	log(1.0065)	log(0.9583)
平均値の差の 90%信頼区間	log(0.9607)～log(1.0546)	log(0.8914)～log(1.0301)

(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

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。[34)]

2) 併用薬の影響

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（外国人データ）。[35)]

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
アジルサルタン錠 10mg「トーワ」[31]
kel：0.0700±0.0117h^{-1}（健康成人男子、絶食単回経口投与）
アジルサルタン錠 20mg「トーワ」[32]
kel：0.06870±0.00763h^{-1}（健康成人男子、絶食単回経口投与）
アジルサルタン錠 40mg「トーワ」[33]
kel：0.07224±0.00910h^{-1}（健康成人男子、絶食単回経口投与）

(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
＜参考＞ラット
「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
［^{14}C］アジルサルタンを 0.3、3、30 μg/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*）。[36]

６．代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

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（*in vitro*）。[37)]

(2) 代謝に関与する酵素（CYP 等）の分子種、寄与率

CYP2C9 により代謝物 M-II に代謝される。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*）。[37)]

(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

M-I 及び M-Ⅱの AT_1 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)]

７．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

(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。[38)]

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。[39)]

注 1）男性の eGFR（mL/min/1.73m²）$=194\times Cr^{-1.094}\times Age^{-0.287}$
女性の eGFR（mL/min/1.73m²）$=194\times Cr^{-1.094}\times Age^{-0.287}\times 0.739$

(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ソミル[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（外国人データ）。[40)]

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）

(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（外国人データ）。[41]

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/1.73m²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[42),43)]。

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/日以上の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

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。
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/1.73m² 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。	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

15.2 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ソミル[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[44)]。

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

「Ⅷ. 12. (2) 非臨床試験に基づく情報」の項参照

(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

「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

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分
製剤：処方箋医薬品[注)]
注）注意－医師等の処方箋により使用すること
有効成分：該当しない

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
設定されていない

5. 患者向け資材
患者向医薬品ガイド：有
くすりのしおり：有
その他の患者向け資材：無

6. 同一成分・同効薬
同一成分薬：アジルバ錠 10mg/20mg/40mg・顆粒 1%

7. 国際誕生年月日
2012年1月18日（日本）

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
アジルサルタン錠 10mg「トーワ」	2023年2月15日	30500AMX00038000	2023年6月16日	2023年6月16日
アジルサルタン錠 20mg「トーワ」	2023年2月15日	30500AMX00039000	2023年6月16日	2023年6月16日
アジルサルタン錠 40mg「トーワ」	2023年2月15日	30500AMX00040000	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

項目	内容	変更追加年月日
用法及び用量	小児用量の追加	2026年3月25日

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「トーワ」	2149048F3076	2149048F3076	129374601	622937401
アジルサルタン錠 20mg「トーワ」	2149048F1073	2149048F1073	129375301	622937501
アジルサルタン錠 40mg「トーワ」	2149048F2070	2149048F2070	129376001	622937601

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) 社内資料：加速試験（錠 10mg）
2) 社内資料：長期保存試験（錠 10mg）
3) 社内資料：無包装状態における安定性試験（錠 10mg）
4) 社内資料：加速試験（錠 20mg）
5) 社内資料：長期保存試験（錠 20mg）
6) 社内資料：無包装状態における安定性試験（錠 20mg）
7) 社内資料：分割後の安定性試験（錠 20mg）
8) 社内資料：加速試験（錠 40mg）
9) 社内資料：長期保存試験（錠 40mg）
10) 社内資料：無包装状態における安定性試験（錠 40mg）
11) 社内資料：分割後の安定性試験（錠 40mg）
12) 社内資料：服薬補助ゼリーとの配合変化（錠 20mg）
13) 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験（錠 10mg）
14) 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験（錠 20mg）
15) 社内資料：生物学的同等性試験；溶出試験（錠 40mg）
16) 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)
17) 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)
18) 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)
19) 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、申請資料概要 2.7.3.2、2.7.6.10）
20) 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）
21) 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)
22) 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)
23) 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)
24) 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）
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、申請資料概要 2.6.2.1）
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、申請資料概要 2.7.6.5）
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、申請資料概要 2.6.2.2）
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、申請資料概要 2.7.6.3）
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、申請資料概要 2.7.6.4）
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）
31) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 10mg）
32) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 20mg）
33) 社内資料：生物学的同等性試験（錠 40mg）
34) 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 2.7.6.1）
35) 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）
36) 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）
37) 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）

38) 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）
39) 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）
40) 肝機能障害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）
41) 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、申請資料概要 2.7.6.15）
42) 阿部真也ほか：周産期医学. 2017；47：1353-1355
43) 齊藤大祐ほか：鹿児島産科婦人科学会雑誌. 2021；29：49-54.
44) 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、申請資料概要 2.6.6.6）
45) 社内資料：粉砕後の安定性試験
46) 社内資料：崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性試験

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

該当資料なし

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 [45)]

■ 保存条件

粉砕した検体を以下の条件で保存した。

・散光・湿度

条件：25℃、75%RH、1000 lx

（累積照度は 7 日の時点で 10 万 lx・hr 以上、1 箇月時点で 40 万 lx・hr 以上、3 箇月時点で 120 万 lx・hr 以上）

保存形態：シャーレ（ラップで覆う）

（累積照度に到達後は、遮光状態で保存した。）

・遮光・湿度

条件：25℃、75%RH、遮光

保存形態：シャーレ（ラップで覆う）

■ 結果

アジルサルタン錠 10mg「トーワ」

保存条件	試験項目	粉砕直後	7 日後	1 箇月後	3 箇月後
散光・湿度	外観	白色の粉末*1	表層：帯黄白色の粉末*1 内層：白色の粉末*1	同左	同左
	含量(%)	99.8	101.0	100.7	100.1
遮光・湿度	外観	白色の粉末*1	—	白色の粉末*1	同左
	含量(%)	99.8	—	100.9	100.3

*1：微黄赤色のフィルムコーティング片が混在

アジルサルタン錠 20mg「トーワ」

保存条件	試験項目	粉砕直後	7 日後	1 箇月後	3 箇月後
散光・湿度	外観	白色の粉末*2	表層：帯黄白色の粉末*2 内層：白色の粉末*2	同左	同左
	含量(%)	99.5	100.5	101.8	99.7
遮光・湿度	外観	白色の粉末*2	—	白色の粉末*2	同左
	含量(%)	99.5	—	102.0	100.3

*2：微赤色のフィルムコーティング片が混在

アジルサルタン錠 40mg「トーワ」

保存条件	試験項目	粉砕直後	7 日後	1 箇月後	3 箇月後
散光・湿度	外観	白色の粉末*3	表層：帯黄白色の粉末*3 内層：白色の粉末*3	表層：淡黄白色の粉末*3 内層：白色の粉末*3	同左
	含量(%)	99.9	103.2	104.0	102.5
遮光・湿度	外観	白色の粉末*3	—	白色の粉末*3	同左
	含量(%)	99.9	—	103.2	102.6

＊3：黄色のフィルムコーティング片が混在

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性 [46)]

■ 方法

①シリンジのプランジャーを抜き取り、シリンジ内に製剤 1 個を入れてプランジャーを戻し、お湯（55℃又は 60℃）を 20mL 吸い取る。
②5 分間放置後、シリンジを手で 180 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状況を観察する。崩壊不良の場合は再度 5 分間放置し、同様の操作を行う。
③崩壊しない場合は、錠剤に亀裂を入れたものについて①～②の作業を行う。
④チューブに取りつけ、流速約 2～3mL／秒で懸濁液を全て押し込んだ後、さらに水 20mL をシリンジで注入し洗いこみ後の残留物の有無を確認する。

■ 試験器具・機器

チューブ：トップ栄養カテーテル （長さ：120cm）
シリンジ：ネオフィードシリンジ 30mL サイズ

■ 結果

販売名	試験項目	水(55℃)	水(60℃)
アジルサルタン錠 10mg「トーワ」	崩壊性	10 分で崩壊した	5 分で崩壊した
	通過性	8Fr チューブ：抵抗なくチューブを通過した（全量を押し出せた）	
	残存	ほとんどなかった	
	懸濁液 pH	pH 6.57	pH 6.44
アジルサルタン錠 20mg「トーワ」	崩壊性	5 分で崩壊した	10 分で崩壊した
	通過性	8Fr チューブ：抵抗なくチューブを通過した（全量を押し出せた）	
	残存	シリンジにのみわずかに認められた（目視で残留物が確認できるが微量であった）*1	シリンジにのみわずかに認められた（目視で残留物が確認できるが微量であった）*2
	懸濁液 pH	pH 6.31	pH 6.29
アジルサルタン錠 40mg「トーワ」	崩壊性	5 分で崩壊した	10 分で崩壊した
	通過性	8Fr チューブ：抵抗なくチューブを通過した（全量を押し出せた）	
	残存	シリンジにのみわずかに認められた（目視で残留物が確認できるが微量であった）*3	シリンジにのみわずかに認められた（目視で残留物が確認できるが微量であった）*2
	懸濁液 pH	pH 6.46	pH 6.30

＊1：追加洗いこみ(20mL)1 回目終了後、残存はほとんどなかった
＊2：追加洗いこみ(20mL)2 回目終了後、残存はほとんどなかった
＊3：追加洗いこみ(20mL)2 回目終了後も、残存がわずかに認められた

2．その他の関連資料

東和薬品株式会社　医療関係者向けサイト
https://med.towayakuhin.co.jp/medical/

製造販売元
東和薬品株式会社
大阪府門真市新橋町2番11号