

前立腺肥大症の排尿障害改善剤

タムスロシン 塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」

タムスロシン 塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」

TAMSULOSIN HCl

〈タムスロシン塩酸塩口腔内崩壊錠〉

	OD錠0.1mg	OD錠0.2mg
承認番号	22300AMX01037	22300AMX01038
薬価収載	2011年11月	2011年11月
販売開始	2011年11月	2011年11月

規制区分：
 処方せん医薬品^(注1)

貯法：
 「取扱い上の注意」の項参照

使用期限：
 包装箱、ラベルに表示。
 使用期限を過ぎた製品は使用しないこと。

【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

【効能・効果】



前立腺肥大症に伴う排尿障害

【組成・性状】

1. 組成

販売名	タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」	タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」
有効成分	1錠中、日局タムスロシン塩酸塩0.1mgを含有する。	1錠中、日局タムスロシン塩酸塩0.2mgを含有する。
添加物	結晶セルロース(粒)、ヒプロメロース、エチルセルロース、セタノール、ラウリル硫酸ナトリウム、アクリル酸エチル・メタクリル酸メチルコポリマー、ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル、メタクリル酸コポリマーLD、ポリソルベート80、乳糖水和物、D-マンニトール、クロスポリドン、結晶セルロース、合成ケイ酸アルミニウム、ヒドロキシプロピルスターチ、スクラロース、ステアリン酸カルシウム	結晶セルロース(粒)、ヒプロメロース、エチルセルロース、セタノール、ラウリル硫酸ナトリウム、アクリル酸エチル・メタクリル酸メチルコポリマー、ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル、メタクリル酸コポリマーLD、ポリソルベート80、乳糖水和物、D-マンニトール、クロスポリドン、結晶セルロース、合成ケイ酸アルミニウム、ヒドロキシプロピルスターチ、スクラロース、ステアリン酸カルシウム

2. 製剤の性状

販売名	剤形	色	外形・大きさ等	識別コード
タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」	素錠	白色		KW TM 0.1
			直径：約7.0mm 厚さ：約3.4mm 質量：約120mg	
タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」	素錠	白色		KW TM 0.2
			直径：約7.5mm 厚さ：約3.6mm 質量：約160mg	

【用法・用量】

通常、成人にはタムスロシン塩酸塩として0.2mgを1日1回食後に経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

【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)

- 起立性低血圧のある患者〔症状が悪化するおそれがある。〕
- 重篤な肝機能障害のある患者〔血漿中濃度が上昇するおそれがある。〕
- 重篤な腎機能障害のある患者〔血漿中濃度が上昇するおそれがある。〕
- 高齢者(「高齢者への投与」の項参照)
- ホスホジエステラーゼ5阻害作用を有する薬剤を服用している患者(「相互作用」の項参照)

2. 重要な基本的注意

- 本剤は口腔内で崩壊するが、口腔の粘膜から吸収されることはないため、唾液又は水で飲み込ませること。
- 本剤の過剰投与により**血圧低下**が予想されるので、投与量には注意すること。
- 立位血圧が低下**することがあるので、体位変換による血圧変化に注意すること。
- 本剤による治療は原因療法ではなく、対症療法であることに留意し、本剤投与により期待する効果が得られない場合は、手術療法等、他の適切な処置を考慮すること。
- めまい等**があらわれることがあるので、高所作業、自動車の運転等**危険を伴う作業に従事する場合には注意**させること。
- 本剤投与開始時に**降圧剤投与の有無**について問診を行い、降圧剤が投与されている場合には血圧変化に注意し、血圧低下がみられたときには、減量又は中止するなど適切な処置を行うこと。

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
降圧剤	起立性低血圧が起るおそれがあるので、減量するなど注意すること。	降圧剤服用中の患者は起立時の血圧調節力が低下している場合がある。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ホスホジエステラーゼ5阻害作用を有する薬剤 シルденаフィル クエン酸塩 バルденаフィル 塩酸塩水和物等	併用により症候性低血圧があらわれるとの報告がある。	本剤は α 遮断作用を有するため、併用によりこれらの血管拡張作用による降圧作用を増強するおそれがある。

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) **失神・意識喪失**：血圧低下に伴う一過性の意識喪失等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、本剤の投与を中止し適切な処置を行うこと。
- 2) **肝機能障害、黄疸**：AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、黄疸等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、本剤の投与を中止するなど、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

以下のような副作用が認められた場合には、投与を中止するなど症状に応じて適切な処置を行うこと。

	頻度不明
精神神経系	めまい、ふらふら感、立ちくらみ、頭痛、眠気、いらいら感、しびれ感
循環器	血圧低下、起立性低血圧、頻脈、動悸、不整脈
* 過敏症 ^(注2)	そう痒感、発疹、蕁麻疹、多形紅斑
消化器	胃不快感、嘔気、嘔吐、口渇、便秘、胃重感、胃痛、食欲不振、下痢、嚥下障害
* その他	鼻閉、浮腫、尿失禁、咽頭灼焼感、全身倦怠感、味覚異常、女性化乳房、持続勃起症、射精障害、術中虹彩緊張低下症候群、霧視、視力障害、ほてり、熱感、灼熱感

注2) 投与を中止すること。

5. 高齢者への投与

高齢者では腎機能が低下していることがあるので、腎機能が低下している場合は0.1mgから投与を開始し、経過を十分に観察した後に0.2mgに増量すること。0.2mgで期待する効果が得られない場合にはそれ以上の増量は行わず、他の適切な処置を行うこと。

6. 適用上の注意

(1) 服用時：

- 1) 本剤は噛み砕かずに服用させること。〔本剤はタムスロシン塩酸塩の徐放性粒を含有しており、噛み砕いた際に徐放性粒が壊れ、薬物動態が変わる可能性がある。〕
- 2) 本剤は舌の上のせ唾液を浸潤させ舌で軽くつぶし、崩壊後唾液のみで服用可能である。
- 3) 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

(2) 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、更には穿孔を起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)

7. その他の注意

- 1) α 遮断薬を服用中又は過去に服用経験のある患者において、 α 遮断作用によると考えられる術中虹彩緊張低下症候群(Intraoperative Floppy Iris Syndrome)があらわれるとの報告がある。
- 2) 前立腺肥大症の診断・診療については、国内外のガイドライン等の最新の情報を参考にすること。

【薬物動態】

(生物学的同等性試験)¹⁾

タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」及びタムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」と各標準製剤について、下記のとおりクロスオーバー法により健康成人男子に水なし又は水ありで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、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

また、タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」及びタムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」と各標準製剤について、下記のとおりクロスオーバー法により健康成人男子に水なしで食後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、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

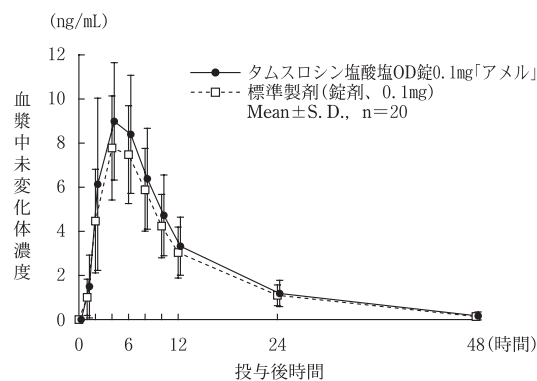
(注) 本剤の承認された用法は、食後投与である。

	標準製剤	試験投与量
タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」	錠剤、0.1mg	それぞれ2錠(タムスロシン塩酸塩として0.2mg)
タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」	錠剤、0.2mg	それぞれ1錠(タムスロシン塩酸塩として0.2mg)

—絶食、水なし—

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₍₀₋₄₈₎ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr.)	T _{1/2} (hr.)
タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」	114.22±41.28	9.79±2.95	4.2±1.3	8.1±2.0
標準製剤 (錠剤、0.1mg)	101.16±32.34	8.30±2.35	4.8±1.2	8.2±1.8

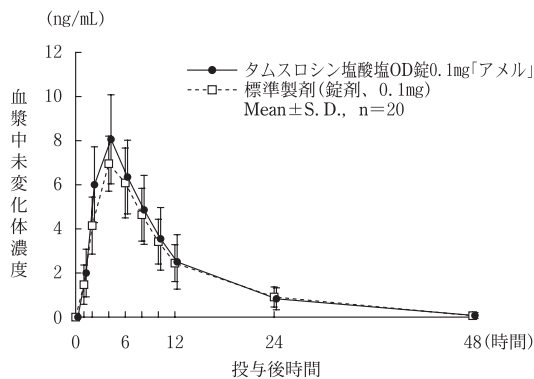
(Mean ± S. D., n = 20)



—絶食、水あり—

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₍₀₋₄₈₎ (ng·hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr.)	T _{1/2} (hr.)
タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」	90.00±31.16	8.18±1.96	3.8±0.9	7.1±1.7
標準製剤 (錠剤、0.1mg)	84.23±24.97	7.16±1.47	4.4±0.8	7.7±2.1

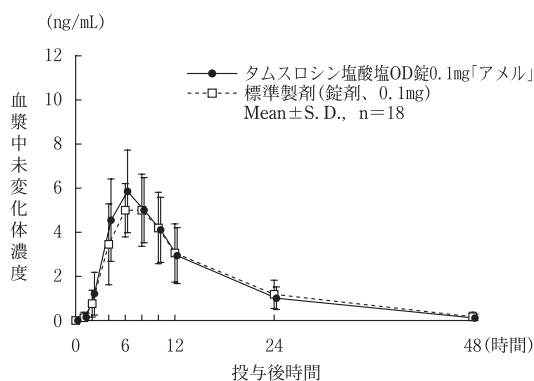
(Mean ± S. D., n = 20)



一食後、水なし

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₍₀₋₄₈₎ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr.)	T _{1/2} (hr.)
タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」	81.09 ± 26.37	6.25 ± 1.78	6.2 ± 1.7	7.9 ± 2.1
標準製剤(錠剤, 0.1mg)	81.34 ± 29.93	5.69 ± 1.52	6.7 ± 1.7	8.7 ± 2.3

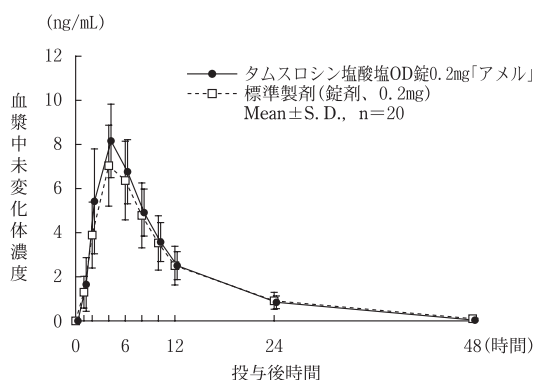
(Mean ± S. D., n = 18)



一絶食、水なし

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₍₀₋₄₈₎ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr.)	T _{1/2} (hr.)
タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」	89.77 ± 19.39	8.46 ± 1.63	4.0 ± 1.1	7.4 ± 1.6
標準製剤(錠剤, 0.2mg)	85.73 ± 25.61	7.51 ± 1.65	4.4 ± 1.0	8.4 ± 2.1

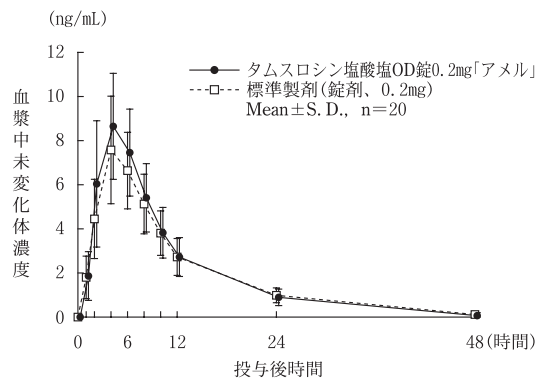
(Mean ± S. D., n = 20)



一絶食、水あり

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₍₀₋₄₈₎ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr.)	T _{1/2} (hr.)
タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」	97.58 ± 28.02	8.89 ± 2.35	4.2 ± 1.1	7.5 ± 1.7
標準製剤(錠剤, 0.2mg)	93.06 ± 24.99	7.85 ± 2.13	4.6 ± 0.9	8.3 ± 1.9

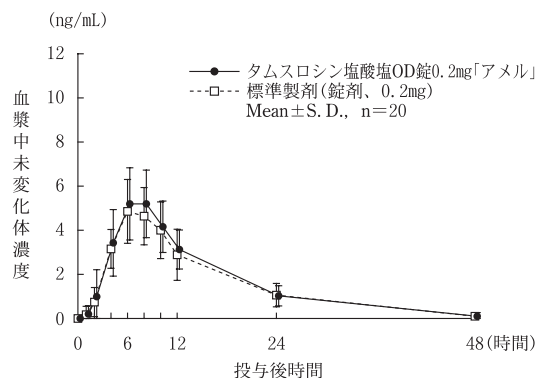
(Mean ± S. D., n = 20)



一食後、水なし

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC ₍₀₋₄₈₎ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr.)	T _{1/2} (hr.)
タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」	79.22 ± 18.35	6.01 ± 1.33	7.2 ± 2.0	8.0 ± 2.5
標準製剤(錠剤, 0.2mg)	75.03 ± 23.14	5.31 ± 1.40	6.8 ± 1.6	8.0 ± 2.3

(Mean ± S. D., n = 20)



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。

*【薬効薬理】²⁾

アドレナリンα₁-受容体の選択的遮断薬。α₁-受容体刺激作用に拮抗するが、尿道平滑筋のα₁-受容体遮断作用による尿道緊張緩和に基づく排尿困難改善作用が臨床的に利用される。

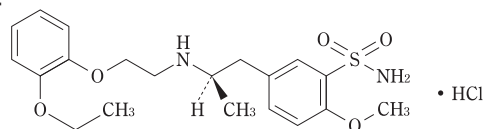
【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：タムスロシン塩酸塩 (Tamsulosin Hydrochloride)

分子式：C₂₀H₂₈N₂O₅S · HCl

分子量：444.97

構造式：



化学名：5-[(2*R*)-2-[2-(2-Ethoxyphenoxy)ethylamino]propyl]-2-methoxybenzenesulfonamide monohydrochloride

性状：白色の結晶である。

ギ酸に溶けやすく、水にやや溶けにくく、酢酸(100)に溶けにくく、エタノール(99.5)に極めて溶けにくい。
融点：約230℃(分解)。

【取扱い上の注意】

1. 貯法

気密容器、室温保存

2. 保管方法

アルミビロー開封後は湿気を避けて保存すること。
使用期限内であっても、開封後はなるべく速やかに使用すること。

3. 安定性試験³⁾

最終包装製品を用いた加速試験(40±1℃、相対湿度75±5%、6ヵ月)の結果、タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」・OD錠0.2mg「アメル」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。

【包装】

タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」：

PTP140錠(14錠×10)

タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」：

PTP140錠(14錠×10)、700錠(14錠×50)

バラ300錠

【主要文献及び文献請求先】

〈主要文献〉

- 1) 共和薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 2) 第十六改正日本薬局方解説書、廣川書店、C-2640(2011)
- 3) 共和薬品工業株式会社 社内資料：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も下記にご請求下さい。

共和薬品工業株式会社 学術情報課
〒530-0005 大阪市北区中之島3-2-4

☎ 0120-041-189

FAX 06-6121-2858

** 製造販売元
共和薬品工業株式会社
大阪市北区中之島3-2-4