

処方せん医薬品 (注意 - 医師等の
処方せんにより使用すること)

タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「日新」
タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「日新」

貯 法 : 気密容器、室温保存
使用期限 : 3年 (外箱に記載)
注 意 : 【取扱い上の注意】の項参照

Tamsulosin Hydrochloride OD Tablets 0.1mg・0.2mg “NISSIN”

(タムスロシン塩酸塩口腔内崩壊製剤)

	0.1mg	0.2mg
承認番号	22200AMX00570	22200AMX00571
薬価収載	2010年11月	
販売開始	2010年11月	

【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

【組成・性状】

タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「日新」は、1錠中に日本薬局方タムスロシン塩酸塩0.1mg、添加物として、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、クロスポビドン、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、スクラロース及びステアリン酸カルシウムを含有する、白色の素錠である。

タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「日新」は、1錠中に日本薬局方タムスロシン塩酸塩0.2mg、添加物として、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、クロスポビドン、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、スクラロース及びステアリン酸カルシウムを含有する、白色の素錠である。

	識別コード	大 き さ	外 形
タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「日新」	NS 536	錠径 7.0mm 錠厚 3.4mm 重量 120mg	
タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「日新」	NS 537	錠径 7.5mm 錠厚 3.6mm 重量 160mg	

【効能・効果】

前立腺肥大症に伴う排尿障害

【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)

- (1) 起立性低血圧のある患者 [症状が悪化するおそれがある。]
- (2) 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。]
- (3) 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。]
- (4) 高齢者 (「高齢者への投与」の項参照)
- (5) 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

- (1) 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。
- (2) 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。
- (3) 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。
- (4) 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。

- (5) 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。
- (6) 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	起立性低血圧が起こ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。
ホスホジエステラーゼ5阻害作用を有する薬剤 シルデナフィル タムスロシン塩酸塩 バルデナフィル 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

	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)	そう痒感、発疹、蕁麻疹、多形紅斑
消化器	胃不快感、嘔気、嘔吐、口渴、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、咽頭灼熱感、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) 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) 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)。

(2) 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) 本剤は舌の上のに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。

7. その他の注意

- (1) α_1 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_1 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事。

【薬物動態】

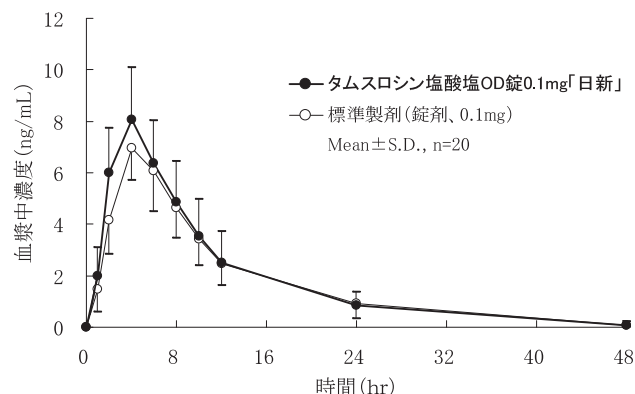
生物学的同等性試験¹⁾

(1) タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「日新」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠 (タムスロシン塩酸塩として0.2mg) 健康成人男子に単回経口投与 (絶食時-水で服用、絶食時-水なしで服用及び食後-水なしで服用) 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、両製剤の生物学的同等性が確認された。

1) 絶食時-水で服用

	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「日新」	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

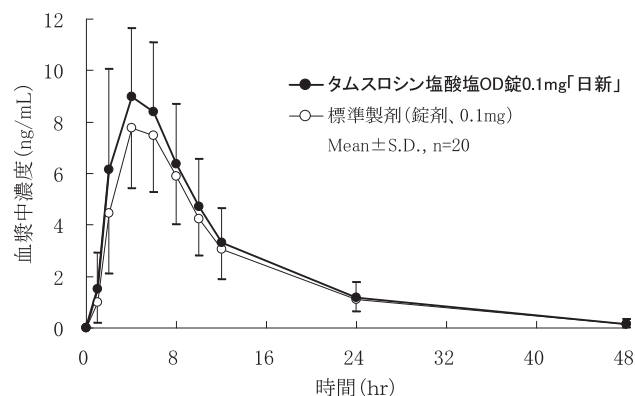
(Mean ± S.D., n=20)



2) 絶食時-水なしで服用

	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「日新」	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

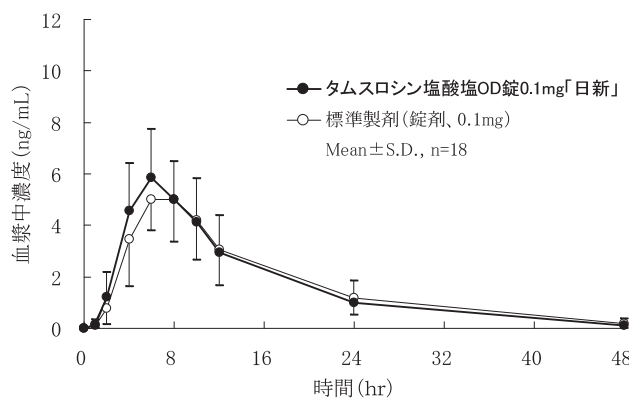
(Mean ± S.D., n=20)



3) 食後-水なしで服用

	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「日新」	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)



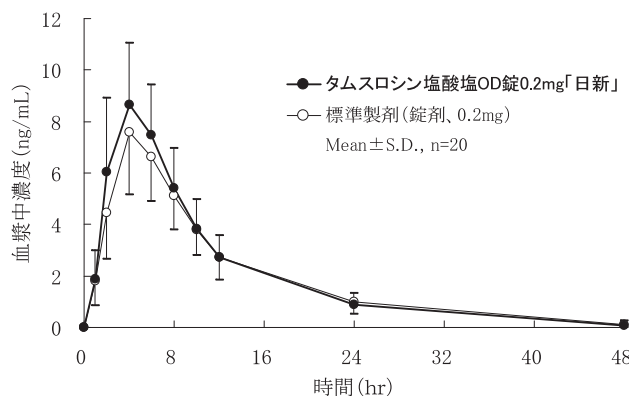
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

(2) タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「日新」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1錠 (タムスロシン塩酸塩として0.2mg) 健康成人男子に単回経口投与 (絶食時-水で服用、絶食時-水なしで服用及び食後-水なしで服用) 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、両製剤の生物学的同等性が確認された。

1) 絶食時-水で服用

	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0.2mg「日新」	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

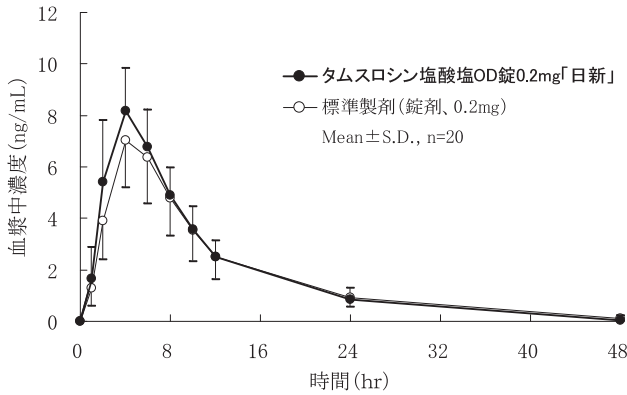
(Mean ± S.D., n=20)



2) 絶食時一水なしで服用

	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0.2mg「日新」	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

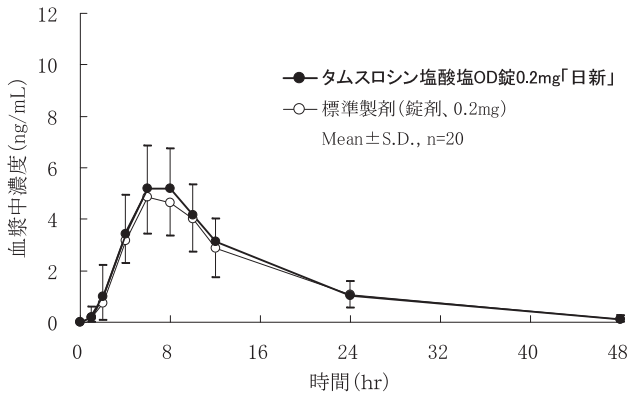
(Mean ± S.D., n=20)



3) 食後一水なしで服用

	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0.2mg「日新」	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、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

【薬効薬理】²⁾

タムスロシン塩酸塩は尿道及び前立腺部のアドレナリンα₁-受容体遮断により下部尿路平滑筋弛緩作用が強く、尿道内圧を低下させ、前立腺肥大症に伴う排尿障害を改善する。強い選択的α₁-受容体遮断作用を示し、また、α₁-受容体サブタイプに対する親和性が異なり、前立腺に多いα_{1A}に選択性を示すことが前立腺組織への高い選択性の理由と考えられる。

【有効成分に関する理化学的知見】

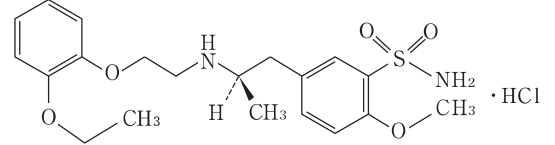
一般名：タムスロシン塩酸塩 (Tamsulosin Hydrochloride)

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

分子式：C₂₀H₂₈N₂O₅S · HCl

分子量：444.97

構造式：



性状：本品は白色の結晶である。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. 保管方法

アルミピ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。

* 2. 安定性試験³⁾

タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「日新」及びタムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「日新」は、最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、室温保存において3年間安定であることが推測された。また、最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、相対湿度60%、3年)の結果、外観及び含量等は規格の範囲内であり、室温保存における3年間の安定性が確認された。

【包装】

タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「日新」

(PTP包装) 140錠(14錠×10)

タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「日新」

(PTP包装) 140錠(14錠×10) 560錠(14錠×40)

【主要文献】

- 1) 日新製薬株式会社 社内資料：生物学的同等性に関する資料
- 2) 第十五改正日本薬局方解説書
- 3) 日新製薬株式会社 社内資料：安定性に関する資料

【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。

日新製薬株式会社 安全管理部

〒994-0069 山形県天童市清池東二丁目3番1号

TEL 023-655-2131 FAX 023-655-3419

E-mail: d-info@yg-nissin.co.jp

製造販売元

 **日新製薬株式会社**

山形県天童市清池東二丁目3番1号