

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2013に準拠して作成

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 OD Tab.0.1mg・OD Tab.0.2mg 「AMEL」

剤形	素錠（口腔内崩壊錠）
製剤の規制区分	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）
規格・含量	タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」： 1錠中、日局タムスロシン塩酸塩0.1mgを含有する。 タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」： 1錠中、日局タムスロシン塩酸塩0.2mgを含有する。
一般名	和名：タムスロシン塩酸塩 洋名：Tamsulosin Hydrochloride
製造販売承認年月日・ 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2011年7月15日 薬価基準収載年月日：2011年11月28日 発売年月日：2011年11月28日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：共和薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	共和薬品工業株式会社 営業本部 営業推進部 学術情報課 TEL.0120-041189(フリーダイヤル) FAX.06-6121-2858 医療関係者向けホームページ http://www.kyowayakuhin.co.jp/amel-di/

本IFは2013年1月改訂の添付文書の記載に基づき改訂した。
 最新の添付文書情報は、独立行政法人医薬品医療機器総合機構ホームページ
<http://www.pmda.go.jp/>にてご確認ください。

IF 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、添付文書と略す）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る。

医療現場では、当該医薬品について製薬企業の医薬情報担当者等に情報の追加請求や質疑をして情報を補完して対処してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための情報リストとしてインタビューフォームが誕生した。

昭和 63 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬と略す）学術第 2 小委員会が「医薬品インタビューフォーム」（以下、IF と略す）の位置付け並びに IF 記載様式を策定した。その後、医療従事者向け並びに患者向け医薬品情報ニーズの変化を受けて、平成 10 年 9 月に日病薬学術第 3 小委員会において IF 記載要領の改訂が行われた。

更に 10 年が経過し、医薬品情報の創り手である製薬企業、使い手である医療現場の薬剤師、双方にとって薬事・医療環境は大きく変化したことを受けて、平成 20 年 9 月に日病薬医薬情報委員会において IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更に合わせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、(独)医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ (<http://www.info.pmda.go.jp/>) から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、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・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

2. IF とは

IF は「添付文書等の情報を補完し、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薬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。

ただし、薬事法・製薬企業機密等に関わるもの、製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師自らが評価・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、薬剤師自らが評価・判断・臨床適応するとともに、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 の様式]

- ①規格は A4 版、横書きとし、原則として 9 ポイント以上の字体（図表は除く）で記載し、一色刷りとする。ただし、添付文書で赤枠・赤字を用いた場合には、電子媒体ではこれに従うものとする。
- ②IF 記載要領に基づき作成し、各項目名はゴシック体で記載する。
- ③表紙の記載は統一し、表紙に続けて日病薬作成の「IF 利用の手引きの概要」の全文を記載するものとし、2 頁にまとめる。

[IF の作成]

- ①IF は原則として製剤の投与経路別（内用剤，注射剤，外用剤）に作成される。
- ②IF に記載する項目及び配列は日病薬が策定した IF 記載要領に準拠する。
- ③添付文書の内容を補完するとの IF の主旨に沿って必要な情報が記載される。
- ④製薬企業の機密等に関するもの，製薬企業の製剤努力を無効にするもの及び薬剤師をはじめ医療従事者自らが評価・判断・提供すべき事項については記載されない。
- ⑤「医薬品インタビューフォーム記載要領 2013」（以下，「IF 記載要領 2013」と略す）により作成された IF は，電子媒体での提供を基本とし，必要に応じて薬剤師が電子媒体（PDF）から印刷して使用する。企業での製本は必須ではない。

[IF の発行]

- ①「IF 記載要領 2013」は，平成 25 年 10 月以降に承認された新医薬品から適用となる。
- ②上記以外の医薬品については，「IF 記載要領 2013」による作成・提供は強制されるものではない。
- ③使用上の注意の改訂，再審査結果又は再評価結果（臨床再評価）が公表された時点並びに適応症の拡大等がなされ，記載すべき内容が大きく変わった場合には IF が改訂される。

3. IF の利用にあたって

「IF 記載要領 2013」においては，PDF ファイルによる電子媒体での提供を基本としている。情報を利用する薬剤師は，電子媒体から印刷して利用することが原則である。

電子媒体の IF については，医薬品医療機器総合機構の医薬品医療機器情報提供ホーム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薬剤師等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，当該医薬品の製薬企業が提供する添付文書やお知らせ文書等，あるいは医薬品医療機器情報配信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，最新の添付文書を医薬品医療機器情報提供ホームページで確認する。

なお，適正使用や安全性の確保の点から記載されている「臨床成績」や「主な外国での発売状況」に関する項目等は承認事項に関わることもあり，その取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 を薬剤師等の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頂きたい。しかし，薬事法や医療用医薬品プロモーションコード等による規制により，製薬企業が医薬品情報として提供できる範囲には自ずと限界がある。IF は日病薬の記載要領を受けて，当該医薬品の製薬企業が作成・提供するものであることから，記載・表現には制約を受けざるを得ないことを認識しておかなければならない。

また製薬企業は，IF があくまでも添付文書を補完する情報資材であり，インターネットでの公開等も踏まえ，薬事法上の広告規制に抵触しないよう留意し作成されていることを理解して情報を活用する必要がある。

(2013 年 4 月改訂)

目次

I. 概要に関する項目		V. 治療に関する項目	
1. 開発の経緯	1	1. 効能又は効果	20
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	2. 用法及び用量	20
		3. 臨床成績	20
II. 名称に関する項目		VI. 薬効薬理に関する項目	
1. 販売名	2	1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群	22
2. 一般名	2	2. 薬理作用	22
3. 構造式又は示性式	2	VII. 薬物動態に関する項目	
4. 分子式及び分子量	2	1. 血中濃度の推移・測定法	23
5. 化学名（命名法）	3	2. 薬物速度論的パラメータ	30
6. 慣用名，別名，略号，記号番号	3	3. 吸収	30
7. CAS登録番号	3	4. 分布	31
		5. 代謝	31
III. 有効成分に関する項目		6. 排泄	31
1. 物理化学的性質	4	7. トランスポーターに関する情報	32
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	8. 透析等による除去率	32
3. 有効成分の確認試験法	4		
4. 有効成分の定量法	5	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	33
IV. 製剤に関する項目		2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	33
1. 剤形	6	3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	33
2. 製剤の組成	6	4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	33
3. 懸濁剤，乳剤の分散性に対する注意	7	5. 慎重投与内容とその理由	33
4. 製剤の各種条件下における安定性	7	6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法	33
5. 調製法及び溶解後の安定性	11	7. 相互作用	34
6. 他剤との配合変化（物理化学的変化）	11	8. 副作用	34
7. 溶出性	11	9. 高齢者への投与	35
8. 生物学的試験法	18	10. 妊婦，産婦，授乳婦等への投与	35
9. 製剤中の有効成分の確認試験法	18	11. 小児等への投与	35
10. 製剤中の有効成分の定量法	18	12. 臨床検査結果に及ぼす影響	35
11. 力価	18	13. 過量投与	35
12. 混入する可能性のある夾雑物	19	14. 適用上の注意	35
13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報	19		
14. その他	19		

15. その他の注意	36
16. その他	36

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験	37
2. 毒性試験	37

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分	38
2. 有効期間又は使用期限	38
3. 貯法・保存条件	38
4. 薬剤取扱い上の注意点	38
5. 承認条件等	38
6. 包装	39
7. 容器の材質	39
8. 同一成分・同効薬	39
9. 国際誕生年月日	39
10. 製造販売承認年月日及び承認番号	39
11. 薬価基準収載年月日	39
12. 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	39
13. 再審査結果, 再評価結果公表年月日及びその内容	40
14. 再審査期間	40
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報	40
16. 各種コード	40
17. 保険給付上の注意	40

X I. 文献

1. 引用文献	41
2. その他の参考文献	41

X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況	42
2. 海外における臨床支援情報	42

X III. 備考

その他の関連資料	43
----------	----

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

タムスロシン塩酸塩は山之内製薬(現 アステラス製薬)での循環器系用薬剤の研究途次に見出され、前立腺、尿道平滑筋の α_1 受容体に選択的に作用する sulfamoylphenyl-ethylamine 系の α_1 -ブロッカーである。¹⁾

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「アメル」、OD 錠 0.2mg 「アメル」は、共和薬品工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、「医薬品の承認申請について(平成 17 年 3 月 31 日 薬食発第 0331015 号)」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、平成 23 年 7 月に承認を取得して同年 11 月に上市した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 尿道及び前立腺部のアドレナリン α_1 -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。¹⁾
- (2) プラゾシンより強力な α_1 受容体遮断作用をもち、作用時間が長い。²⁾
- (3) OD 錠は水なしでも服用できる口腔内崩壊錠である。
- (4) 主な副作用は、めまい、胃不快感、ふらつき等である。
- (5) 重大な副作用として、失神・意識喪失、肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名：

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」

(2) 洋名：

TAMSULOSIN HCl OD Tab. 0.1mg 「AMEL」

TAMSULOSIN HCl OD Tab. 0.2mg 「AMEL」

(3) 名称の由来：

本剤の一般名「タムスロシン塩酸塩」、共和薬品工業(株)の屋号「アメル」(AMEL)に由来する。

2. 一般名

(1) 和名(命名法)：

タムスロシン塩酸塩(JAN)

(2) 洋名(命名法)：

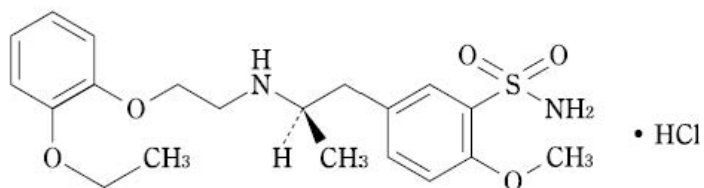
Tamsulosin Hydrochloride(JAN)

Tamusulosin(INN)

(3) ステム：

プラゾシン系降圧薬：-azosin

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₀H₂₈N₂O₅S • HCl

分子量：444.97

5. 化学名(命名法)

5- $\{(2R)-2-[2-(2-Ethoxyphenoxy)ethylamino]propyl\}$ -2-methoxybenzenesulfonamide
monohydrochloride(IUPAC)

6. 慣用名, 別名, 略号, 記号番号

該当資料なし

7. CAS 登録番号

106463-17-6(Tamsulosin Hydrochloride)

106133-20-4(Tamusulosin)

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質

(1) 外観・性状：

白色の結晶である。

(2) 溶解性：

溶 媒	日局表現
ギ酸	溶けやすい
水	やや溶けにくい
酢酸(100)	溶けにくい
エタノール(99.5)	極めて溶けにくい

(3) 吸湿性：

該当資料なし

(4) 融点(分解点), 沸点, 凝固点：

融点：約 230℃(分解)。

(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：

旋光度 $[\alpha]_{\text{D}}^{20}$ ：-17.5 ～ -20.5° (乾燥後、0.15g、水、加温、冷後、20mL、100mm)

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

日本薬局方「タムスロシン塩酸塩」による

- (1) 紫外可視吸光度測定法
- (2) 赤外吸収スペクトル測定法(塩化カリウム錠剤法)
- (3) 塩化物の定性反応

4. 有効成分の定量法

日本薬局方「タムスロシン塩酸塩」による
電位差滴定法(0.1mol/L 過塩素酸)

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別, 外観及び性状 :

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	 直径：約7.0mm 厚さ：約3.4mm 質量：約120mg	KW TM 0.1
タムスロシン 塩酸塩OD錠0.2mg 「アメル」	素錠	白色	 直径：約7.5mm 厚さ：約3.6mm 質量：約160mg	KW TM 0.2

(2) 製剤の物性 :

硬度：10N(1.0kg)以上

(3) 識別コード :

IV-1-(1) 参照

錠剤本体、PTP 包装資材に表示。

(4) pH, 浸透圧比, 粘度, 比重, 無菌の旨及び安定な pH 域等 :

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分(活性成分)の含量 :

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」

1錠中、日局タムスロシン塩酸塩 0.1mg を含有する。

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」

1錠中、日局タムスロシン塩酸塩 0.2mg を含有する。

(2) 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、ステアリン酸カルシウム

(3) その他 :

該当資料なし

3. 懸濁剤, 乳剤の分散性に対する注意

該当しない

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速試験での安定性³⁾ :

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg「アメル」、OD錠 0.2mg「アメル」で実施した加速試験での安定性試験方法及び結果は次のとおりである。

試験区分	加速試験
試験期間	6ヵ月
試験条件	温度：40±1℃、湿度：75±5%RH
包装形態	PTP包装、バラ包装品 (OD錠 0.1mg は PTP 包装のみ)

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg「アメル」

PTP包装品*(n=9)

試験項目	規格	開始時	1ヵ月	3ヵ月	6ヵ月
性状	白色の素錠	白色の素錠	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験(1) 溶出試験第1液	120分間 25%以下	11.1%	—	—	16.0%
溶出試験(2) 溶出試験第2液	30分間 10～40% 60分間 35～65% 240分間75%以上	30分：28.8% 60分：56.3% 240分：89.8%	30分：30.6% 60分：57.8% 240分：91.7%	30分：28.6% 60分：55.3% 240分：90.3%	30分：32.3% 60分：55.3% 240分：89.9%
定量試験	95.0～105.0%	99.0%	99.3%	100.2%	98.6%

* PTP包装品：未包装バルク製剤をポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔で PTP 包装し、アルミニウムピローしたもの(乾燥剤入り)。

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「アメル」

1)PTP包装品*(n=9)

試験項目	規格	開始時	1ヵ月	3ヵ月	6ヵ月
性状	白色の素錠	白色の素錠	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験(1) 溶出試験第1液	120分間 25%以下	9.8%	—	—	14.1%
溶出試験(2) 溶出試験第2液	30分間 10～40% 60分間 35～65% 300分間77%以上	30分：27.4% 60分：52.4% 300分：89.7%	—	—	30分：26.8% 60分：51.5% 300分：88.8%
定量試験	95.0～105.0%	99.8%	100.3%	100.7%	99.1%

* PTP包装品：未包装バルク製剤をポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔で PTP 包装し、アルミニウムピローしたもの(乾燥剤入り)。

2)バラ包装品*(n=9)

試験項目	規 格	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性 状	白色の素錠	白色の素錠	変化なし	変化なし	変化なし
溶出試験(1) 溶出試験第 1 液	120 分間 25%以下	9.8%	—	—	12.8%
溶出試験(2) 溶出試験第 2 液	30 分間 10 ~ 40% 60 分間 35 ~ 65% 300 分間 77%以上	30 分 : 27.4% 60 分 : 52.4% 300 分 : 89.7%	—	—	30 分 : 25.3% 60 分 : 51.0% 300 分 : 89.3%
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.8%	100.5%	100.7%	99.0%

*バラ包装品：未包装バルク製剤をポリエチレン製容器に入れ、密封したもの(乾燥剤入り)。

(2) 無包装下の安定性³⁾：

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg、OD 錠 0.2mg 「アメル」で実施した苛酷試験での安定性試験方法及び結果は次のとおりである。

試験区分	苛酷試験(温度、湿度、光)
試験期間	温度：90 日間 湿度：①15 日間 ②90 日間 光 ：50 日間
試験条件	温度：60℃ 湿度：①30℃、75%RH ②25℃、60%RH 光 ：(曝光量) 120 万 lux・hr
包装形態	温度：遮光・開放 湿度：遮光・開放 光 ：開放

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「アメル」

1)温度(遮光・開放)

試験項目	規 格	開始時	90 日目
性 状	白色の素錠	白色の素錠	変化なし
溶出試験(1) 溶出試験第 1 液	120 分間 25%以下	—	18 ~ 20%
溶出試験(2) 溶出試験第 2 液	30 分間 10 ~ 40% 60 分間 35 ~ 65% 240 分間 75%以上	30 分 : 28 ~ 34% 60 分 : 53 ~ 60% 240 分 : 86 ~ 96%	30 分 : 27 ~ 30% 60 分 : 51 ~ 55% 240 分 : 87 ~ 90%
硬 度	—	4.2kg	3.6kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	100.2%	99.1%

2)湿度 (30℃、75%RH)

試験項目	規 格	開始時	15 日目
性 状	白色の素錠	白色の素錠	変化なし
溶出試験(1) 溶出試験第 1 液	120 分間 25%以下	—	11 ~ 14%
溶出試験(2) 溶出試験第 2 液	30 分間 10 ~ 40% 60 分間 35 ~ 65% 240 分間 75%以上	30 分 : 28 ~ 34% 60 分 : 53 ~ 60% 240 分 : 86 ~ 96%	30 分 : 29 ~ 34% 60 分 : 54 ~ 60% 240 分 : 86 ~ 92%
硬 度	—	4.2kg	1.0kg 以下
定量試験	95.0 ~ 105.0%	100.2%	101.9%

3)湿度 (25℃、60%RH)

試験項目	規 格	開始時	90 日間
性 状	白色の素錠	白色の素錠	変化なし
溶出試験(1) 溶出試験第 1 液	120 分間 25%以下	—	14 ~ 16%
溶出試験(2) 溶出試験第 2 液	30 分間 10 ~ 40% 60 分間 35 ~ 65% 240 分間 75%以上	30 分 : 28 ~ 34% 60 分 : 53 ~ 60% 240 分 : 86 ~ 96%	30 分 : 31 ~ 35% 60 分 : 55 ~ 63% 240 分 : 85 ~ 95%
硬 度	—	4.2kg	2.1kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	100.2%	100.0%

4)光 (開放)

試験項目	規 格	開始時	120 万 lux・hr
性 状	白色の素錠	白色の素錠	変化なし
溶出試験(1) 溶出試験第 1 液	120 分間 25%以下	—	14 ~ 15%
溶出試験(2) 溶出試験第 2 液	30 分間 10 ~ 40% 60 分間 35 ~ 65% 240 分間 75%以上	30 分 : 28 ~ 34% 60 分 : 53 ~ 60% 240 分 : 86 ~ 96%	30 分 : 30 ~ 34% 60 分 : 52 ~ 58% 240 分 : 89 ~ 96%
硬 度	—	4.2kg	3.7kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	100.2%	100.1%

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」

1)温度(遮光・開放)

試験項目	規 格	開始時	90 日目
性 状	白色の素錠	白色の素錠	変化なし
溶出試験(1) 溶出試験第 1 液	120 分間 25%以下	—	10 ~ 16%
溶出試験(2) 溶出試験第 2 液	30 分間 10 ~ 40% 60 分間 35 ~ 65% 240 分間 75%以上*	30 分 : 25 ~ 31% 60 分 : 51 ~ 58% 240 分 : 85 ~ 93%	30 分 : 22 ~ 26% 60 分 : 46 ~ 63% 240 分 : 78 ~ 94%
硬度	—	4.8kg	4.0kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.6%	97.0%

* : 承認審査(同一性調査)後 300 分間 77%以上に変更された。

2)湿度(30℃、75%RH)

試験項目	規 格	開始時	15 日目
性 状	白色の素錠	白色の素錠	変化なし
溶出試験(1) 溶出試験第 1 液	120 分間 25%以下	—	9 ~ 11%
溶出試験(2) 溶出試験第 2 液	30 分間 10 ~ 40% 60 分間 35 ~ 65% 240 分間 75%以上*	30 分 : 25 ~ 31% 60 分 : 51 ~ 58% 240 分 : 85 ~ 93%	30 分 : 28 ~ 30% 60 分 : 52 ~ 56% 240 分 : 80 ~ 86%
硬度	—	4.8kg	1.0kg 以下
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.6%	101.1%

* : 承認審査(同一性調査)後 300 分間 77%以上に変更された。

3)湿度(25℃、60%RH)

試験項目	規 格	開始時	90 日間
性 状	白色の素錠	白色の素錠	変化なし
溶出試験(1) 溶出試験第 1 液	120 分間 25%以下	—	10 ~ 13%
溶出試験(2) 溶出試験第 2 液	30 分間 10 ~ 40% 60 分間 35 ~ 65% 240 分間 75%以上*	30 分 : 25 ~ 31% 60 分 : 51 ~ 58% 240 分 : 85 ~ 93%	30 分 : 29 ~ 31% 60 分 : 53 ~ 57% 240 分 : 83 ~ 87%
硬度	—	4.8kg	2.3kg
定量試験	95.0 ~ 105.0%	99.6%	99.8%

* : 承認審査(同一性調査)後 300 分間 77%以上に変更された。

4)光(開放)

試験項目	規 格	開始時	120 万 lux・hr
性 状	白色の素錠	白色の素錠	変化なし
溶出試験(1) 溶出試験第 1 液	120 分間 25%以下	—	10～13%
溶出試験(2) 溶出試験第 2 液	30 分間 10～40% 60 分間 35～65% 240 分間 75%以上*	30 分：25～31% 60 分：51～58% 240 分：85～93%	30 分：24～27% 60 分：46～52% 240 分：81～85%
硬 度	—	4.8kg	4.7kg
定量試験	95.0～105.0%	99.6%	101.4%

*：承認審査(同一性調査)後 300 分間 77%以上に変更された。

5. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

6. 他剤との配合変化(物理化学的变化)

該当資料なし

7. 溶出性⁴⁾

(1) 溶出挙動における同等性

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「アメル」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について(平成 18 年 11 月 24 日付 薬食審査発第 1124004 号)」に基づき、タムスロシン塩酸塩製剤であるタムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「アメル」(試験製剤)及び標準製剤の溶出挙動の類似性を評価した。

試験方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法、回転バスケット法	
試験条件	試験液量：900mL、温度：37±0.5℃	
回 転 数	50 回転、100 回転、200 回転	
試 験 液	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第 1 液
	pH3.0	薄めた McIlvaine 緩衝液
	pH7.5	薄めた McIlvaine 緩衝液
	水	日本薬局方 精製水
	pH7.5(1.0%)	薄めた McIlvaine 緩衝液(ポリソリベート 80 濃度 1.0%)

判定基準：

試験方法	回転数	試験液	判 定
パドル法	50	pH1.2	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±9%の範囲にある。

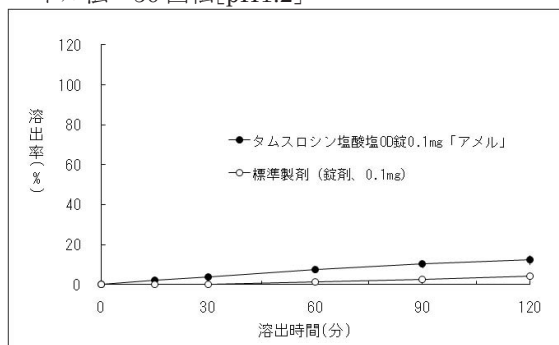
パドル法	50	pH3.0	規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が50%以上80%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にある。
		pH7.5	標準製剤の平均溶出率が30%、50%、80%付近の適当な3時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にある。
		水	f2 関数の値が53以上である。
		pH7.5(1.0%)	f2 関数の値が42以上である。
回転バスケット法	100	pH7.5	標準製剤の平均溶出率が30%、50%、80%付近の適当な3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±15%の範囲にある。
	200	pH7.5	
回転バスケット法	100	pH7.5	
	200	pH7.5	

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について(平成18年11月24日付薬食審査発第1124004号)」の実施基準に基づき、タムスロシン塩酸塩製剤であるタムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「アメル」(試験製剤)及び標準製剤の溶出挙動の類似性を評価した結果、両剤の溶出挙動は類似していると判定された。

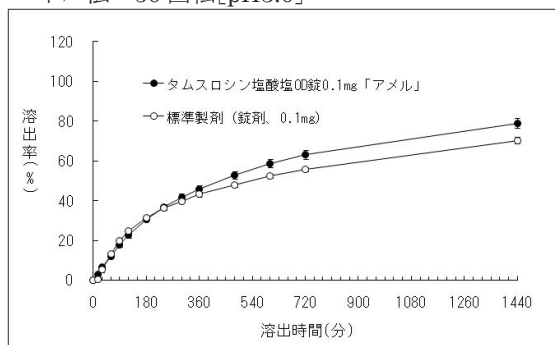
各試験液における溶出挙動は下図の通りである。

図. 溶出曲線 (n=12 ; mean ± S.D.)

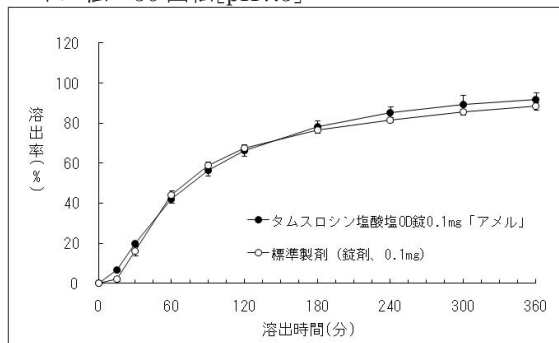
パドル法・50回転[pH1.2]



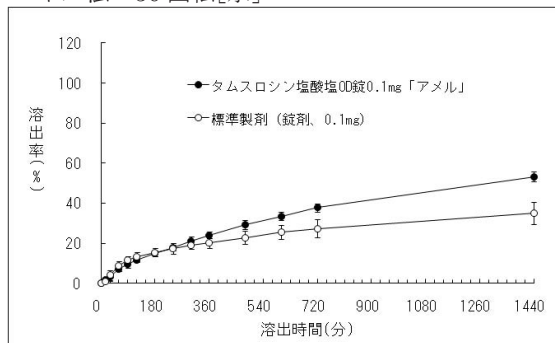
パドル法・50回転[pH3.0]



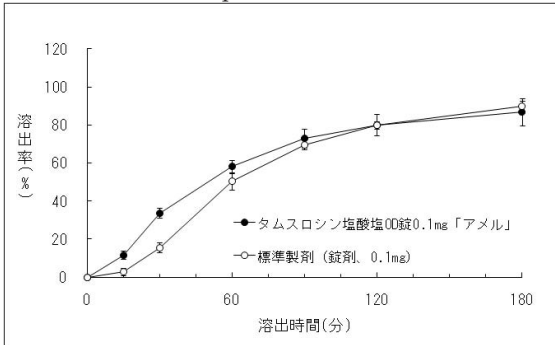
パドル法・50回転[pH7.5]



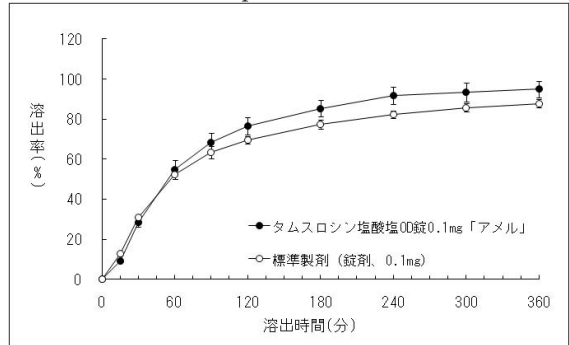
パドル法・50回転[水]



パドル法・50回転[pH7.5(1.0%)]

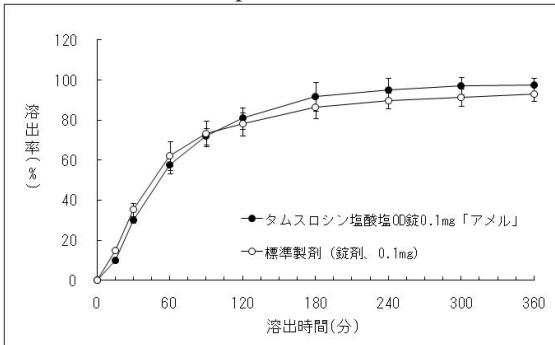


パドル法・100回転[pH7.5]

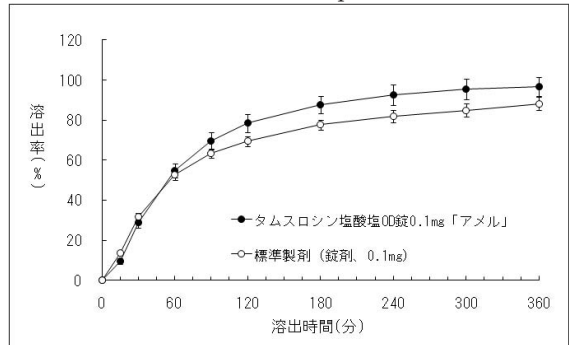


()内はポリソルベート80の濃度

パドル法・200回転[pH7.5]



回転バスケット法・100回転[pH7.5]



回転バスケット法・200回転[pH7.5]

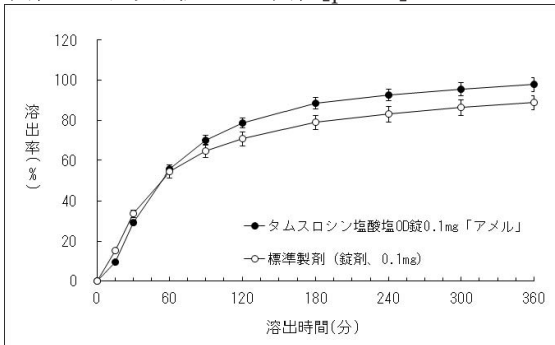


表. 溶出挙動における類似性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件			判定基準		平均溶出率(%)		判定結果
試験方法	回転数 (rpm)	試験液	溶出率	判定時間 (分)	標準製剤	試験製剤	
パドル法	50	pH1.2	1/2の平均溶出率	90	2.5	10.2	適合
			規定された平均溶出率	120	4.4	12.6	適合
		pH3.0	1/2の平均溶出率	240	36.2	36.8	適合
			規定された平均溶出率	1440	70.3	79.0	適合
		pH7.5	30%付近	30	16.3	19.8	適合
			50%付近	60	44.2	42.0	適合

パドル法	50	pH7.5	80%付近	240	81.6	85.1	適合
	100	pH7.5	30%付近	30	31.0	28.6	適合
			50%付近	60	52.4	54.8	適合
			80%付近	240	82.4	91.7	適合
	200	pH7.5	30%付近	30	35.3	30.3	適合
			50%付近	60	62.1	57.6	適合
80%付近			120	78.2	81.0	適合	
回転バスケット法	100	pH7.5	30%付近	30	31.9	28.9	適合
			50%付近	60	52.6	54.7	適合
			80%付近	240	82.0	92.7	適合
	200	pH7.5	30%付近	30	33.8	29.3	適合
			50%付近	60	54.6	55.5	適合
			80%付近	180	78.9	88.4	適合

試験条件			判定基準		平均溶出率(%)		f2 値	判定結果
試験方法	回転数 (rpm)	試験液	f2 値	判定時間(分)	標準製剤	試験製剤		
パドル法	50	水	53 以上	180	15.5	14.9	58.6	適合
				360	20.1	24.1		
				540	24.3	31.5		
				720	27.4	37.8		
	pH7.5(1.0%)*	42 以上	30	15.6	33.7	49.9	適合	
			60	50.4	58.2			
			90	69.6	73.0			
			120	79.9	80.1			

* : ()内はポリソルベート 80 の濃度

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について(平成 18 年 11 月 24 日付 薬食審査発第 1124004 号)」に基づき、タムスロシン塩酸塩製剤であるタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」(試験製剤)及び標準製剤の溶出挙動の類似性を評価した。

試験方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法 パドル法、回転バスケット法	
試験条件	試験液量：900mL、温度：37±0.5℃	
回転数	50 回転、100 回転、200 回転	
試験液	pH1.2	日本薬局方 溶出試験第 1 液
	pH3.0	薄めた McIlvaine 緩衝液
	pH7.5	薄めた McIlvaine 緩衝液
	水	日本薬局方 精製水
	pH7.5(1.0%)	薄めた McIlvaine 緩衝液(ポリソルベート 80 濃度 1.0%)

判定基準：

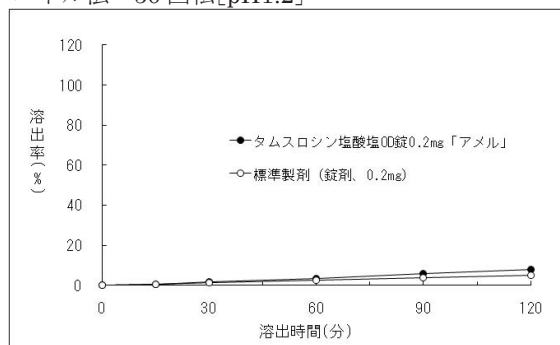
試験方法	回転数	試験液	判定
パドル法	50	pH1.2	規定された試験時間において標準製剤の平均溶出時間が50%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にある。
		pH3.0	規定された試験時間において標準時間の平均溶出率が50%以上80%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にある。
		pH7.5	標準製剤の平均溶出率が30%、50%、80%付近の適当な3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±15%の範囲にある。
		水	f2 関数の値が53以上である。
		pH7.5(1.0%)	標準製剤の平均溶出率が30%、50%、80%付近の適当な3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±15%の範囲にある。
100	pH7.5		
200	pH7.5		
回転バスケット法	100	pH7.5	標準製剤の平均溶出率が30%、50%、80%付近の適当な3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±15%の範囲にある。
	200	pH7.5	

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について(平成18年11月24日付 薬食審査発第1124004号)」の実施基準に基づき、タムスロシン塩酸塩製剤であるタムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「アメル」(試験製剤)及び標準製剤の溶出挙動の類似性を評価した結果、両剤の溶出挙動は類似していると判定された。

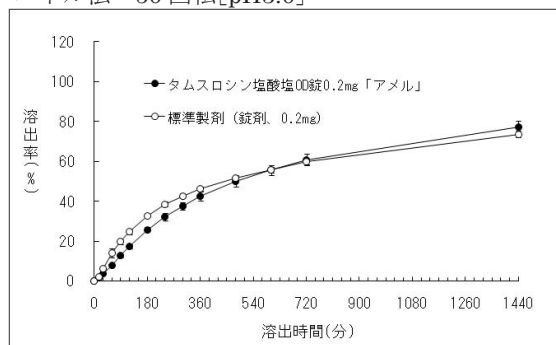
各試験液における溶出挙動は下図の通りである。

図. 溶出曲線 (n=12 ; mean ± S.D.)

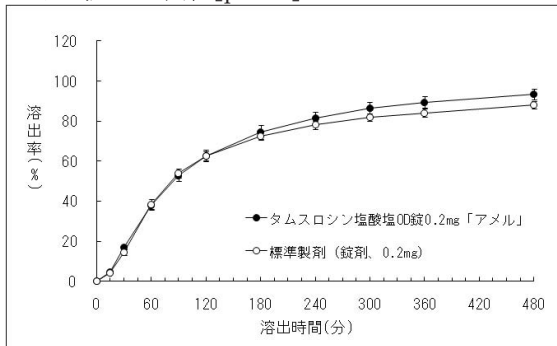
パドル法・50回転[pH1.2]



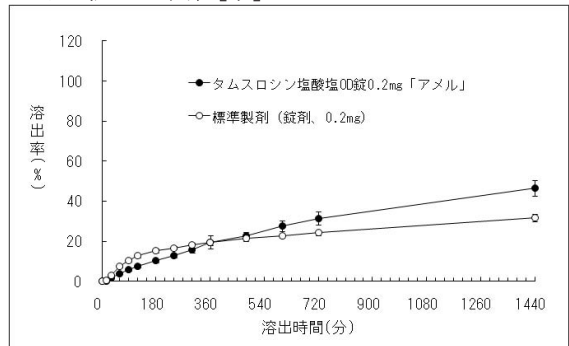
パドル法・50回転[pH3.0]



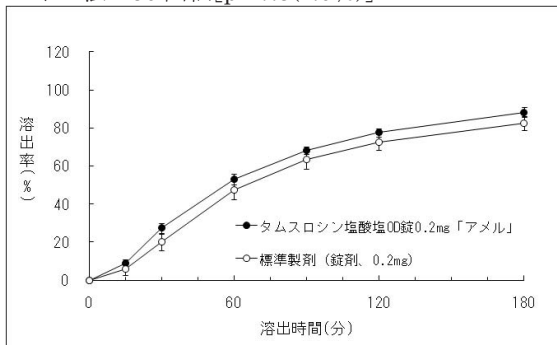
パドル法・50回転[pH7.5]



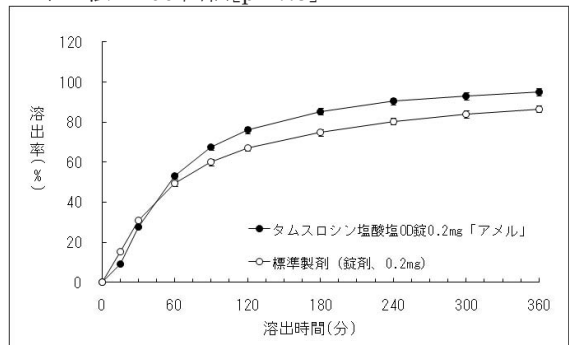
パドル法・50回転[水]



パドル法・50回転[pH7.5(1.0%)]

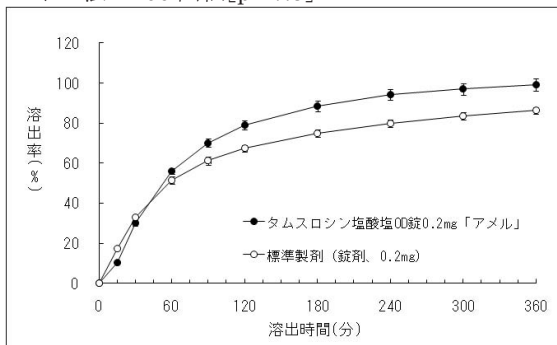


パドル法・100回転[pH7.5]

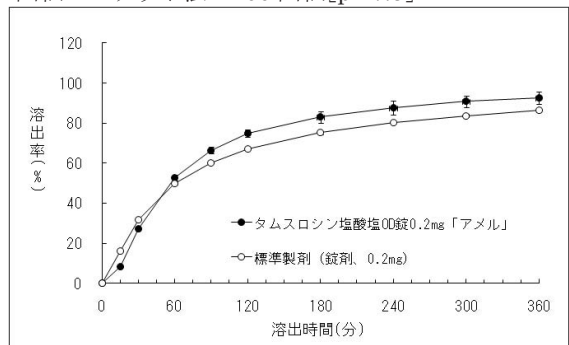


()内はポリソルベート 80 の濃度

パドル法・200回転[pH7.5]



回転バスケット法・100回転[pH7.5]



回転バスケット法・200回転[pH7.5]

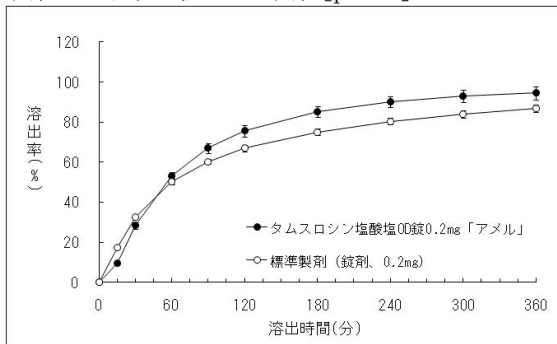


表. 溶出挙動における類似性(試験製剤及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件			判定基準		平均溶出率(%)		判定結果
試験方法	回転数 (rpm)	試験液	溶出率	判定時間 (分)	標準製剤	試験製剤	
パドル法	50	pH1.2	1/2 の平均溶出率	60	2.4	3.6	適合
			規定された平均溶出率	120	5.1	8.1	適合
		pH3.0	1/2 の平均溶出率	240	38.6	32.4	適合
			規定された平均溶出率	1440	73.7	77.3	適合
		pH7.5	30%付近	60	38.5	38.0	適合
			50%付近	90	54.0	52.6	適合
			80%付近	240	78.1	81.5	適合
		pH7.5(1.0%)*	30%付近	30	20.1	27.4	適合
	50%付近		60	47.5	53.0	適合	
	80%付近		180	82.5	88.3	適合	
	100	pH7.5	30%付近	30	30.8	27.8	適合
			50%付近	60	49.6	53.0	適合
			80%付近	240	80.5	90.5	適合
	200	pH7.5	30%付近	30	32.9	30.0	適合
			50%付近	60	51.4	56.1	適合
80%付近			240	80.0	94.2	適合	
回転バスケット法	100	pH7.5	30%付近	30	31.8	27.3	適合
			50%付近	60	49.8	52.7	適合
			80%付近	240	80.4	87.7	適合
	200	pH7.5	30%付近	30	32.7	28.3	適合
			50%付近	60	50.3	53.0	適合
			80%付近	240	80.5	90.1	適合

試験条件			判定基準		平均溶出率(%)		f2 値	判定結果
試験方法	回転数 (rpm)	試験液	f2 値	判定時間(分)	標準製剤	試験製剤		
パドル法	50	水	53 以上	180	15.2	10.3	66.2	適合
				360	19.3	19.5		
				540	22.0	25.2		
				720	24.2	31.4		

* : ()内はポリソルベート 80 の濃度

(2) 溶出規格

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg「アメル」、OD錠 0.2mg「アメル」

日本薬局方一般試験溶出法パドル法に基づき試験を実施し、以下の溶出規格に適合していることが確認されている。

表示量	回転数	試験液	規定時間	溶出率
0.1mg	50rpm	pH1.2 の溶出試験第 1 液	120 分	25%以下
		pH6.8 の溶出試験第 2 液	30 分	10 ~ 40%
			60 分	35 ~ 65%
			240 分	75%以上
0.2mg	50rpm	pH1.2 の溶出試験第 1 液	120 分	25%以下
		pH6.8 の溶出試験第 2 液	30 分	10 ~ 40%
			60 分	35 ~ 65%
			300 分	77%以上

8. 生物学的試験法

該当しない

9. 製剤中の有効成分の確認試験法

紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

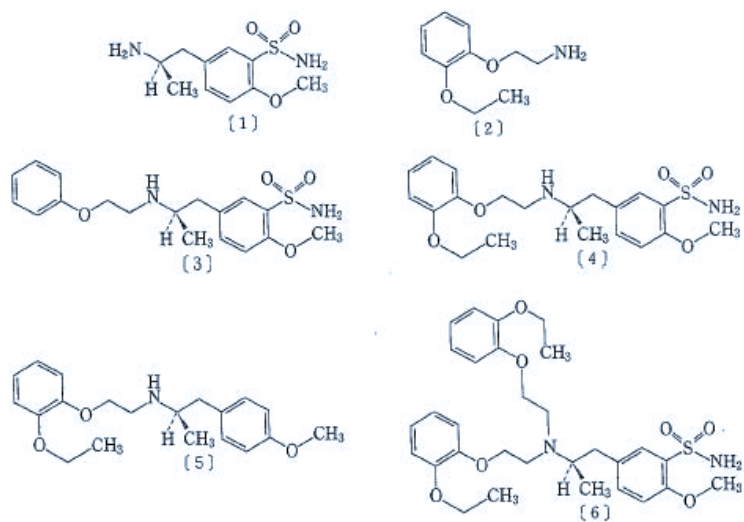
液体クロマトグラフィー

11. 力 価

該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物¹⁾

混在が予想される主たる類縁物質には次に示す〔1〕～〔6〕などがある。



13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に関する情報

該当資料なし

14. 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

前立腺肥大症に伴う排尿障害

2. 用法及び用量

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。

3. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ：

該当しない

(2) 臨床効果：

該当資料なし

(3) 臨床薬理試験：

該当資料なし

(4) 探索的試験：

該当資料なし

(5) 検証的試験：

1) 無作為化並行用量反応試験：

該当資料なし

2) 比較試験：

該当資料なし

3) 安全性試験：

該当資料なし

4) 患者・病態別試験：

該当資料なし

(6) 治療的使用：

1) 使用成績調査・特定使用成績調査(特別調査)・製造販売後臨床試験(市販後臨床試験)：

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試験の概要：
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

α_1 受容体遮断剤：ナフトピジル、シロドシン、プラゾシン塩酸塩 等

ホルモン剤：クロルマジノン酢酸エステル、アリルエステトレノール、ゲストノロンカ
プロン酸エステル、オキセンドロン 等

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序⁵⁾：

アドレナリン α_1 -受容体の選択的遮断薬。 α_1 -受容体刺激作用に拮抗するが、尿道平滑筋の α_1 -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。

(2) 薬効を裏付ける試験成績：

該当資料なし

(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・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度：

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間⁶⁾：

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」

絶食投与試験(水なし)：4.2±1.3 時間(健常成人男子にタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」を 2 錠投与した場合)

絶食投与試験(水あり)：3.8±0.9 時間(健常成人男子にタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」を 2 錠投与した場合)

食後投与試験(水なし)：6.2±1.7 時間(健常成人男子にタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」を 2 錠投与した場合)

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」

絶食投与試験(水なし)：4.0±1.1 時間(健常成人男子にタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」を 1 錠投与した場合)

絶食投与試験(水あり)：4.2±1.1 時間(健常成人男子にタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」を 1 錠投与した場合)

食後投与試験(水なし)：7.2±2.0 時間(健常成人男子にタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」を 1 錠投与した場合)

(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁶⁾：

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製剤であるタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」の医薬品製造販売承認申請を行うにあたり、タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」又は標準製剤を健康成人男子 20 例(1 群 10 例)に絶食単回経口投与、又は健康成人男子 18 例(1 群 9 例)に食後単回経口投与し、血漿中の未変化体濃度を測定して、薬物動態から両製剤の生物学的同等性を検証した。

治験デザイン	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について(平成 13 年 5 月 31 日 医薬審第 786 号)」に準じ、絶食単回投与、食後単回投与ともに非盲検下における 2 剤 2 期のクロスオーバー法を用いた。初めの 3 泊 4 日の入院期間を第 I 期とし、2 回目の入院期間を第 II 期とした。 なお、第 I 期と第 II 期の間の休薬期間は 5 日間以上とした。
投与条件	1) 絶食投与(水なし) 被験者に対して 10 時間以上の絶食下において、1 錠中にタムスロシン塩酸塩として 0.1mg 含有するタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」 2 錠又は標準製剤 2 錠を水なしで唾液とともに単回経口投与した。 投与後 4 時間までは絶食で実施した。 2) 絶食投与(水あり) 被験者に対して 10 時間以上の絶食下において、1 錠中にタムスロシン塩酸塩として 0.1mg 含有するタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」 2 錠又は標準製剤 2 錠を 150mL の水とともに単回経口投与した。 投与後 4 時間までは絶食で実施した。 3) 食後投与(水なし) 被験者に対して 10 時間以上の絶食下において、高脂肪食を 20 分以内に摂り、1 錠中にタムスロシン塩酸塩として 0.1mg 含有するタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」 2 錠又は標準製剤 2 錠を食後 10 分以内に水なしで単回経口投与した。 投与後 4 時間までは絶食で実施した。
採血時点	第 I 期及び第 II 期ともに採血は、治験薬の投与前、投与後 1、2、4、6、8、10、12、24 及び 48 時間後の 10 時点とした。 採血量は 1 回につき 5mL とした。
分析法	LC/MS/MS 法

1) 絶食投与(水なし)

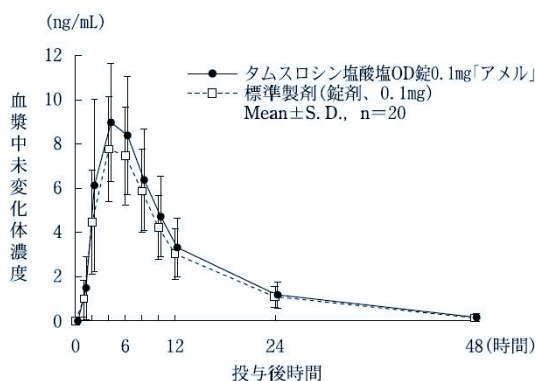
<薬物動態パラメータ>

	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)

得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	AUC _(0→48)	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log(1.1193)	log(1.1699)
90%信頼区間	log(1.0440)～log(1.2002)	log(1.0985)～log(1.2460)



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) 絶食投与(水あり)

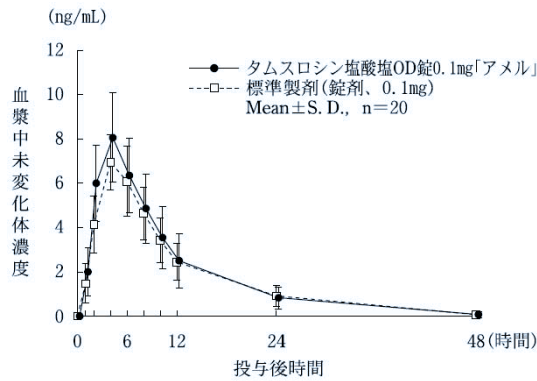
<薬物動態パラメータ>

	AUC _(0→48) (ng · hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr.)	T _{1/2} (hr.)
タムソロシン塩酸塩 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)

得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	AUC _(0→48)	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log(1.0574)	log(1.1318)
90%信頼区間	log(0.9906)～log(1.1287)	log(1.0390)～log(1.2328)



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。

3) 食後投与(水なし)

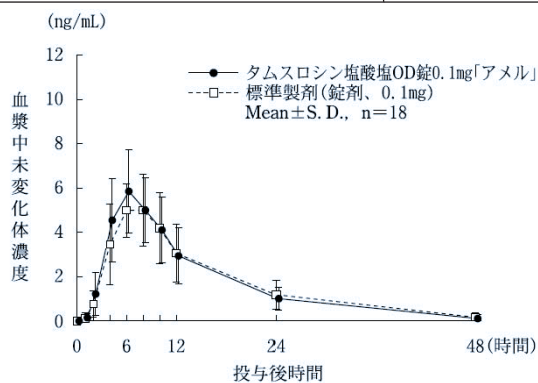
<薬物動態パラメータ>

	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」	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)

得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	AUC _(0→48)	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log(1.0082)	log(1.0846)
90%信頼区間	log(0.9394)～log(1.0821)	log(0.9429)～log(1.2475)



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。

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」

タムスロシン塩酸塩製剤であるタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」の医薬品製造販売承認申請を行うにあたり、タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」又は標準製剤を健康成人男子 20 例(1 群 10 例)に絶食単回経口投与、又は食後単回経口投与し、血漿中の未変化体濃度を測定して、薬物動態から両製剤の生物学的同等性を検証した。

治験デザイン	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン等の一部改正について(平成 13 年 5 月 31 日 医薬審第 786 号)」に準じ、絶食単回投与、食後単回投与ともに非盲検下における 2 剤 2 期のクロスオーバー法を用いた。初めの 3 泊 4 日の入院期間を第 I 期とし、2 回目の入院期間を第 II 期とした。 なお、第 I 期と第 II 期の間の休薬期間は 5 日間以上とした。
投与条件	1) 絶食投与(水なし) 被験者に対して 10 時間以上の絶食下において、1 錠中にタムスロシン塩酸塩として 0.2mg 含有するタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」1 錠又は標準製剤 1 錠を水なしで唾液とともに単回経口投与した。 投与後 4 時間までは絶食で実施した。 2) 絶食投与(水あり) 被験者に対して 10 時間以上の絶食下において、1 錠中にタムスロシン塩酸塩として 0.2mg 含有するタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」1 錠又は標準製剤 1 錠を 150mL の水とともに単回経口投与した。 投与後 4 時間までは絶食で実施した。 3) 食後投与(水なし) 被験者に対して 10 時間以上の絶食下において、高脂肪食を 20 分以内に摂り、1 錠中にタムスロシン塩酸塩として 0.2mg 含有するタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」1 錠又は標準製剤 1 錠を食後 10 分以内に水なしで単回経口投与した。 投与後 4 時間までは絶食で実施した。
採血時点	第 I 期及び第 II 期ともに採血は、治験薬の投与前、投与後 1、2、4、6、8、10、12、24 及び 48 時間後の 10 時点とした。 採血量は 1 回につき 5mL とした。
分析法	LC/MS/MS 法

1) 絶食投与(水なし)

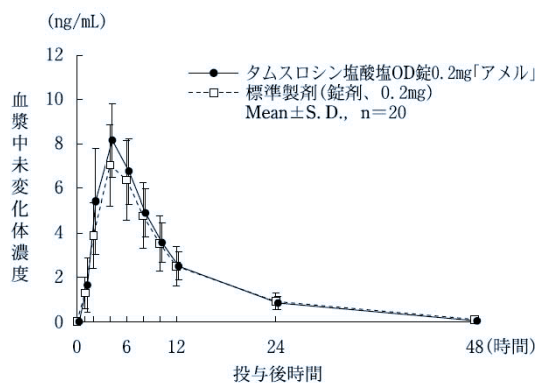
<薬物動態パラメータ>

	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)

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、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。

	AUC _(0→48)	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log(1.0682)	log(1.1330)
90%信頼区間	log(1.0040)～log(1.1365)	log(1.0363)～log(1.2387)



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) 絶食投与(水あり)

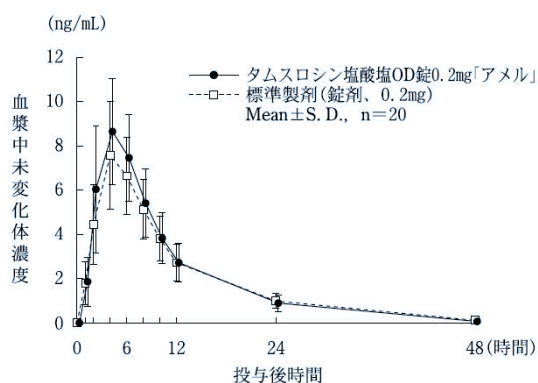
<薬物動態パラメータ>

	AUC _(0→48) (ng · hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr.)	T _{1/2} (hr.)
タムロシン塩酸塩 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)

得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	AUC _(0→48)	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log(1.0468)	log(1.1281)
90%信頼区間	log(0.9918)～log(1.1048)	log(1.0497)～log(1.2124)



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。

3) 食後投与(水なし)

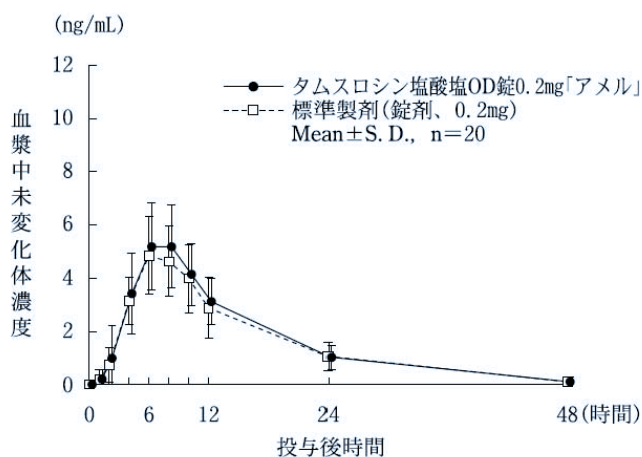
<薬物動態パラメータ>

	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「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)

得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)～log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

	AUC _(0→48)	Cmax
2 製剤間の対数変換値の差	log(1.0739)	log(1.1407)
90%信頼区間	log(1.0100)～log(1.1417)	log(1.0467)～log(1.2431)



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。

(4) 中毒域：

該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響：

食物と同時摂取でバイオアベイラビリティ低下、最高血中濃度到達時間延長。⁷⁾

「VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目 7.相互作用」参照

(6) 母集団(ポピュレーション)解析により判明した薬物体内動態変動要因：

該当資料なし

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) バイオアベイラビリティ⁷⁾：

100% 食物と同時摂取で低下

(4) 消失速度定数：

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「アメル」：絶食投与(水なし) $0.0910 \pm 0.0232(\text{hr}^{-1})$

絶食投与(水あり) $0.1024 \pm 0.0219(\text{hr}^{-1})$

食後投与(水なし) $0.0932 \pm 0.0225(\text{hr}^{-1})$

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「アメル」：絶食投与(水なし) $0.0975 \pm 0.0191(\text{hr}^{-1})$

絶食投与(水あり) $0.0973 \pm 0.0202(\text{hr}^{-1})$

食後投与(水なし) $0.0942 \pm 0.0284(\text{hr}^{-1})$

(5) クリアランス⁷⁾：

0.62mL/min/kg 腎障害、加齢により低下

(6) 分布容積⁷⁾：

0.20L/kg

(7) 血漿蛋白結合率⁷⁾：

94 ~ 99% 腎障害で上昇

3. 吸収⁷⁾

90%以上が吸収される

4. 分 布

- (1) 血液－脳関門通過性⁷⁾ :
中枢移行は軽度
- (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

5. 代 謝

- (1) 代謝部位及び代謝経路⁸⁾ :
代謝部位：肝臓
- (2) 代謝に関与する酵素(CYP450 等)の分子種⁷⁾ :
CYP3A4、CYP2D6
- (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比率⁸⁾ :
なし又は 1/50
- (5) 活性代謝物の速度論的パラメータ :
該当資料なし

6. 排 泄

- (1) 排泄部位及び経路⁷⁾ :
排泄部位：尿中、糞中
経路：グルクロン酸抱合、硫酸抱合体として腎排泄される。
- (2) 排泄率⁷⁾ :
尿中未変化体排泄率 10%未満
尿中回収率 76% 糞便中回収率 21% (168hr まで)

(3) 排泄速度：

該当資料なし

7. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 透析等による除去率⁷⁾

蛋白結合率が高いため、透析で除去されにくい

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

該当しない

2. 禁忌内容とその理由(原則禁忌を含む)

【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

3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

該当しない

5. 慎重投与内容とその理由

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)

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

- (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。

7. 相互作用

(1) 併用禁忌とその理由：

該当しない

(2) 併用注意とその理由：

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 シルデナフィルクエン酸塩 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。

8. 副作用

(1) 副作用の概要：

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。

(2) 重大な副作用と初期症状：

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。

(3) その他の副作用：

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)	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) 投与を中止すること。

(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧：

該当資料なし

(5) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度：

該当資料なし

(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法：

- 1) 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者には投与しないこと。
- 2) 過敏症(そう痒感、発疹、蕁麻疹等)が認められた場合には、投与を中止すること。

9. 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を行わず、他の適切な処置を行うこと。

10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

該当しない

11. 小児等への投与

該当しない

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

「Ⅷ.安全性(使用上の注意等)に関する項目 6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法」参照

14. 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)

15.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こと。

16.その他

該当資料なし

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」参照) :

(2) 副次的薬理試験 :

該当資料なし

(3) 安全性薬理試験 :

該当資料なし

(4) 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) 生殖発生毒性試験 :

該当資料なし

(4) 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：処方せん医薬品(注意－医師等の処方せんにより使用すること)

有効成分：タムスロシン塩酸塩 劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年(安定性試験結果に基づく)

3. 貯法・保存条件

気密容器、室温保存

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取り扱い上の留意点について：

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

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」は通常の商品流通下において3年間安定であることが推測された。

(2) 薬剤交付時の取り扱いについて(患者等に留意すべき必須事項等)：

くすりのしおり：有り

「VIII. 安全性(使用上の注意等)」に関する項目 14.適用上の注意」参照

(3) 調剤時の留意点について：

該当資料なし

5. 承認条件等

該当しない

6. 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

7. 容器の材質

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム＋アルミニウム箔、アルミニウム袋、乾燥剤

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」

PTP包装：ポリ塩化ビニルフィルム＋アルミニウム箔、アルミニウム袋、乾燥剤

バラ包装：ポリエチレン製容器(ポリエチレン製栓)

PTP サイズ：14錠ヒート 37×128(mm)

8. 同一成分・同効薬

同一成分：ハルナール D錠 0.1mg、ハルナール D錠 0.2mg (アステラス製薬株)

同効薬：ナフトピジル、シロドシン、プラゾシン塩酸塩、クロルマジノン酢酸エステル、
アリルエステトレノール、ゲストノロンカプロン酸エステル、オキセンドロン

9. 国際誕生年月日

1993年7月2日

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造販売承認年月日

2011年7月15日

承認番号

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「アメル」：22300AMX01037

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「アメル」：22300AMX01038

11. 薬価基準収載年月日

2011年11月28日

12. 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

該当しない

13.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

14.再審査期間

該当しない

15.投薬期間制限医薬品に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

16.各種コード

販売名	HOT (9桁)番号	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	レセプト電算コード
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg「アメル」	120917401	2590008F1115	622091701
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「アメル」	120918101	2590008F2014	622091801

17.保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

X I . 文献

1. 引用文献

- 1) 第十五改正日本薬局方 解説書、タムスロシン塩酸塩、廣川書店、2006.
- 2) 田中千賀子、加藤隆一 編集：NEW 薬理学 改訂第4版、南江堂、P.240、2002.
- 3) 共和薬品工業株式会社 社内資料：安定性試験
- 4) 共和薬品工業株式会社 社内資料：溶出試験
- 5) 第十六改正日本薬局方 解説書、タムスロシン塩酸塩、廣川書店、2011.
- 6) 共和薬品工業株式会社 社内資料：生物学的同等性試験
- 7) 平田純生 他編著：透析患者への投薬ガイドブック 改訂2版、じほう、P.628、2009
- 8) 石井公道 監修：肝機能低下時の薬剤使用ガイドブック、じほう、P.284、2004.

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

その他の関連資料

該当資料なし