

# 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 2008 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「ケミファ」 タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「ケミファ」 Tamsulosin OD

タムスロシン塩酸塩口腔内崩壊錠

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 「ケミファ」 ：1 錠中(日局)タムスロシン塩酸塩 0.10mg 含有 タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「ケミファ」 ：1 錠中(日局)タムスロシン塩酸塩 0.20mg 含有
一般名	和名：タムスロシン塩酸塩(JAN) 洋名：Tamsulosin Hydrochloride (JAN、INN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造承認年月日 2010年 7月 15日 薬価基準収載年月日 2010年 11月 19日 発売年月日 2010年 11月 19日
開発・製造販売(輸入)・ 提携・販売会社名	製造販売元：日本薬品工業株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	日本薬品工業株式会社 安全管理課 TEL. 03-5833-5011/FAX. 03-5833-5100 受付時間：9:00 ～ 17:00（土日祝祭日を除く） 医療関係者向けホームページ <a href="http://www.npi-inc.co.jp/medical.html">http://www.npi-inc.co.jp/medical.html</a>

本 IF は 2013 年 1 月改訂の添付文書の記載に基づき作成した。

最新の添付文書情報は、医薬品医療機器情報提供ホームページ

<http://www.info.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 年が経過した現在、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新たな IF 記載要領が策定された。

### 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 判、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 2008」（以下、「IF 記載要領 2008」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 2008」は、平成 21 年 4 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 2008」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 2008」においては、従来の主にMRによる紙媒体での提供に替え、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、医療機関でのIT環境によっては必要に応じてMRに印刷物での提供を依頼してもよいこととした。

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、今後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。

(2008年9月)

# 目 次

## I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯 ..... 1
2. 製品の治療学的・製剤学的特性 ..... 1

## II. 名称に関する項目

1. 販売名 ..... 2
2. 一般名 ..... 2
3. 構造式又は示性式 ..... 2
4. 分子式及び分子量 ..... 2
5. 化学名（命名法） ..... 2
6. 慣用名、別名、略号、記号番号 ..... 2
7. CAS 登録番号 ..... 2

## III. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質 ..... 3
2. 有効成分の各種条件下における安定性 ..... 3
3. 有効成分の確認試験法 ..... 3
4. 有効成分の定量法 ..... 4

## IV. 製剤に関する項目

1. 剤形 ..... 5
2. 製剤の組成 ..... 5
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意 ..... 5
4. 製剤の各種条件下における安定性 ..... 6
5. 調整法及び溶解後の安定性 ..... 6
6. 他剤との配合変化（物理化学的变化） ..... 6
7. 溶出性 ..... 7
8. 生物学的試験法 ..... 8
9. 製剤中の有効成分の確認試験法 ..... 8
10. 製剤中の有効成分の定量法 ..... 8
11. 力価 ..... 8
12. 混入する可能性のある夾雑物 ..... 8
13. 治療上注意が必要な容器に関する情報 ..... 9
14. その他 ..... 9

## V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果 ..... 10
2. 用法及び用量 ..... 10
3. 臨床成績 ..... 10

## 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 ..... 11
2. 薬理作用 ..... 11

## VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法 ..... 12
2. 薬物速度論的パラメータ ..... 16
3. 吸収 ..... 16
4. 分布 ..... 16
5. 代謝 ..... 16
6. 排泄 ..... 17
7. 透析等による除去率 ..... 17

## 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 ..... 18
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む） ..... 18
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由 ..... 18
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由 ..... 18
5. 慎重投与内容とその理由 ..... 18
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法 ..... 18
7. 相互作用 ..... 18
8. 副作用 ..... 19
9. 高齢者への投与 ..... 20
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与 ..... 20
11. 小児等への投与 ..... 20
12. 臨床検査結果に及ぼす影響 ..... 20
13. 過量投与 ..... 20
14. 適用上の注意 ..... 20
15. その他の注意 ..... 20
16. その他 ..... 20

## IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験 ..... 21
2. 毒性試験 ..... 21

## X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分 ..... 22
2. 有効期間又は使用期限 ..... 22
3. 貯法・保存条件 ..... 22
4. 薬剤取扱い上の注意点 ..... 22
5. 承認条件等 ..... 22
6. 包装 ..... 22
7. 容器の材質 ..... 22
8. 同一成分、同効薬 ..... 22
9. 国際誕生年月日 ..... 23
10. 製造販売承認年月日及び承認番号 ..... 23
11. 薬価基準収載年月日 ..... 23
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 ..... 23
13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容 ..... 23
14. 再審査期間 ..... 23
15. 投薬期間制限医薬品に関する情報 ..... 23
16. 各種コード ..... 23
17. 保険給付上の注意 ..... 23

## X I. 文献

1. 引用文献 ..... 24
2. その他の参考文献 ..... 24

## X II. 参考資料

1. 主な外国での発売状況 ..... 24
2. 海外における臨床支援情報 ..... 24

## X III. 備考

- その他の関連資料 ..... 24

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

タムスロシン塩酸塩製剤は前立腺肥大症の排尿障害改善剤であり、本邦では1993年に上市されている。

タムスロシン塩酸塩製剤の後発医薬品として、ハルタムカプセル0.1mg及びハルタムカプセル0.2mgを、2005年3月に承認を得て2005年7月より上市している。今回、口腔内崩壊錠としてタムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「ケミファ」及びタムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「ケミファ」の開発を企画し、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、2010年7月に承認を得て、2010年11月に上市した。

※ハルタムカプセル0.1mg/0.2mgは2012年に医療事故防止の観点から、タムスロシン塩酸塩カプセル0.1mg/0.2mg「ケミファ」へ名称を変更した。

### 2. 製品の治療学的・製剤学的特性

タムスロシン塩酸塩製剤は、前立腺・尿道平滑筋の $\alpha_1$ 受容体に選択的に作用する $\alpha_1$ ブロッカーである。徐放性製剤であり、1日1回投与により前立腺肥大症に伴う排尿困難、夜間頻尿、残尿感などに優れた改善効果が認められている。

重大な副作用として、失神・意識喪失、肝機能障害、黄疸が報告されている（頻度不明）。

## 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 「ケミファ」

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「ケミファ」

#### (2)洋名

Tamsulosin OD

#### (3)名称の由来

「有効成分」+「剤形」+「含量」+「屋号」より命名した。

### 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）

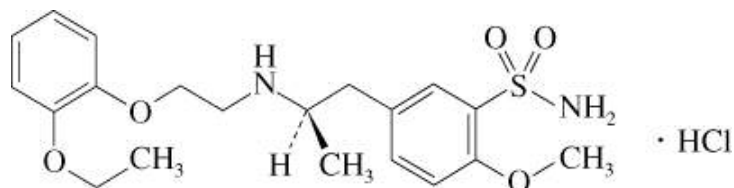
Tamsulosin Hydrochloride (JAN、INN)

#### (3)STEM

該当しない

### 3. 構造式又は示性式

構造式：



### 4. 分子式及び分子量

分子式：C<sub>20</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S · HCl

分子量：444.97

### 5. 化学名（命名法）

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

### 6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

### 7. CAS 登録番号

106463-17-6

### 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

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

溶解度 (37°C) <sup>1)</sup>

pH1.2	0.5mg/mL 以上
pH4.0	0.5mg/mL 以上
pH6.8	0.5mg/mL 以上
水	0.5mg/mL 以上
pH7.2	0.5mg/mL 以上

##### (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°C(分解)

##### (5) 酸塩基解離定数 <sup>1)</sup>

(25°C)  $pK_{a1}$  : 8.37(第二アミノ基、滴定法)

$pK_{a2}$  : 10.23(スルホンアミド基、吸光度法)

##### (6) 分配係数

該当資料なし

##### (7) その他の主な示性値

旋光度  $[\alpha]_D^{20}$  : -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 <sup>1)</sup>

水	なし
液性(pH)	なし
光	白色蛍光灯(約 1000lx)下、pH1.2、37°C、2 時間で約 5% 分解する。
その他	なし

#### 3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方医薬品各条「タムスロシン塩酸塩」の確認試験による

(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

日本薬局方医薬品各条「タムスロシン塩酸塩」の定量法による  
電位差滴定法



## IV. 製剤に関する項目

### 1. 剤形

#### (1) 剤形の区別、規格及び性状

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「ケミファ」：白色の素錠

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「ケミファ」：白色の素錠

販売名	表面	裏面	側面
タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「ケミファ」			
直径：7.0mm、厚さ：3.4mm、重量：120mg			
タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「ケミファ」			
直径：7.5mm、厚さ：3.6mm、重量：160mg			

#### (2) 製剤の物性

該当資料なし

#### (3) 識別コード

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「ケミファ」：錠剤表面に表示 NPI 125 裏面に 0.1

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「ケミファ」：錠剤表面に表示 NPI 126 裏面に 0.2

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

該当しない

### 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 「ケミファ」：1 錠中(日局)タムスロシン塩酸塩 0.10mg 含有

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「ケミファ」：1 錠中(日局)タムスロシン塩酸塩 0.20mg 含有

#### (2) 添加物

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg・タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg(共通)：

結晶セルロース(粒)、結晶セルロース、ヒプロメロース、エチルセルロース、メタクリル酸コポリマーLD、ラウリル硫酸ナトリウム、セタノール、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、D-マンニトール、乳糖水和物、スクラロース、ステアリン酸カルシウム、合成ケイ酸アルミニウム・ヒドロキシプロピルスターチ・結晶セルロース、クロスポビドン

#### (3) その他

該当しない

### 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<sup>2)</sup>

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg「ケミファ」、タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg「ケミファ」各種条件下における安定性

##### 1) 加速試験

規格	保存条件	保存期間	保存形態	結果
0.1mg	40℃・75%RH	6 ヶ月	PTP・ピロー包装品	変化は認められなかった。
0.2mg				変化は認められなかった。

加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、通常の市場流通において 3 年間安定であることが推測された。

##### 2) 光安定性試験

規格	保存条件	保存期間	保存形態	結果
0.1mg	蛍光灯下 (約 1000Lux/h)	50 日 (総照度 120 万 Lux・hr)	シャーレ(開放)	変化は認められなかった。
0.2mg				変化は認められなかった。

##### 3) 無包装安定性試験

規格	保存条件	保存期間	保存形態	結果
0.1mg	30℃・75%RH	0.5 ヶ月	シャーレ(開放)	硬度が 40.5N→10N 以下に低下するが、その他の項目に品質の低下は認められなかった。
	25℃・60%RH	3 ヶ月		硬度が 40.5N→20.6N に低下するが、その他の項目に品質の低下は認められなかった。
0.2mg	30℃・75%RH	0.5 ヶ月		硬度が 47.4N→10N 以下に低下するが、その他の項目に品質の低下は認められなかった。
	25℃・60%RH	3 ヶ月		硬度が 47.4N→22.9N に低下するが、その他の項目に品質の低下は認められなかった。
	通常環境下			硬度が 47.4N→25.9N に低下するが、その他の項目に品質の低下は認められなかった。

#### 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<sup>3)</sup>

### (1) タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「ケミファ」

本製剤は後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成13年5月31日付 医薬審第786号）に準拠。

(試験条件および評価方法)

試験方法	回転数	試験液	判定時間 (min)	類似性の判定基準
日局溶出試験法パドル法	50 回転	①pH1.2	90	各平均溶出率差は±9%
			120	
		②pH3.0	240	各平均溶出率差は±12%
			1440	
		③pH7.5	30	各平均溶出率差は±15%
			60	
	240			
	④水	—	f2 関数 53 以上	
	⑤pH7.5 ポリソルベート 80, 1.0%(W/V)添加	—	f2 関数 42 以上	
	100 回転	⑥pH7.5	30	各平均溶出率差は±15%
60				
240				
200 回転	⑦pH7.5	30		
		60		
		120		
日局溶出試験法 回転バスケット法	100 回転	⑧pH7.5	30	
			60	
			240	
200 回転	⑨pH7.5	30		
		60		
		180		

(結果) すべての試験液において判定基準を満たし、標準製剤と同等性を有することが確認された。

(2) タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「ケミファ」

本製剤は後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 13 年 5 月 31 日付 医薬審第 786 号）に準拠。

(試験条件および評価方法)

試験方法	回転数	試験液	判定時間 (min)	類似性の判定基準
日局溶出試験法パドル法	50 回転	①pH1.2	60	各平均溶出率差は±9%
			120	
		②pH3.0	240	各平均溶出率差は±12%
			1440	
		③pH7.5	60	各平均溶出率差は±15%
			90	
	240			
	④水	—	f2 関数 53 以上	
	100 回転	⑤pH7.5 ポリソルベート 80, 1.0%(W/V)添加	30	各平均溶出率差は±15%
			60	
			180	
		⑥pH7.5	30	
			60	
240				
200 回転	⑦pH7.5	30		
		60		
		240		
日局溶出試験法 回転バスケット法	100 回転	⑧pH7.5	30	
			60	
			240	
	200 回転	⑨pH7.5	30	
			60	
			240	

(結果) すべての試験液において判定基準を満たし、標準製剤と同等性を有することが確認された。

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

液体クロマトグラフィー

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

該当資料なし

13. 治療上注意が必要な容器に関する情報  
該当しない

14. その他

## 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（2009 年 4 月以降承認品目）

該当しない

#### (2)臨床効果

該当資料なし

#### (3)臨床薬理試験：忍容性試験

該当資料なし

#### (4)探索的試験：用量反応探索試験

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・特別使用成績調査（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

イミダゾリン系 $\alpha$ 受容体遮断剤：メシル酸フェントラミン

キナゾリン系 $\alpha$ 受容体遮断剤：テラゾシン塩酸塩水和物、プラゾシン塩酸塩、ブナゾシン塩酸塩 等

フェニルピペラジン系 $\alpha$ 受容体遮断剤：ウラピジル、ナフトピジル 等

### 2. 薬理作用

#### (1) 作用部位・作用機序<sup>4)</sup>

タムスロシン塩酸塩は、アドレナリン $\alpha_1$ 受容体の選択的遮断薬である。 $\alpha_1$ 受容体刺激作用に拮抗するが、尿道平滑筋の $\alpha_1$ 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<sup>5)</sup>

$\alpha$ 受容体サブタイプへの選択性 (in vitro)

各 $\alpha$ 受容体サブタイプに対するタムスロシン塩酸塩、プラゾシン塩酸塩、メシル酸フェントラミンの選択性について、ラット組織( $\alpha_{1A}$ :ラット前立腺  $\alpha_{1D}$ :ラット大動脈  $\alpha_2$ :ラット大脳皮質)を用いて検討した。

タムスロシン塩酸塩は、血管平滑筋の収縮に関与している $\alpha_{1D}$ より前立腺平滑筋の収縮に関与している $\alpha_{1A}$ に対して約600倍高い遮断効力を示した。

薬剤	IC <sub>50</sub> (nmol/L)		
	$\alpha_{1A}$	$\alpha_{1D}$	$\alpha_2$
タムスロシン塩酸塩	0.229	136	961
プラゾシン塩酸塩	0.574	5.27	2190
メシル酸フェントラミン	43.0	453.0	6.85

#### (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

「VII-(3) 臨床試験で確認された血中濃度」の項参照

#### (3) 臨床試験で確認された血中濃度

生物学的同等性試験<sup>6)</sup>

##### 1) タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「ケミファ」

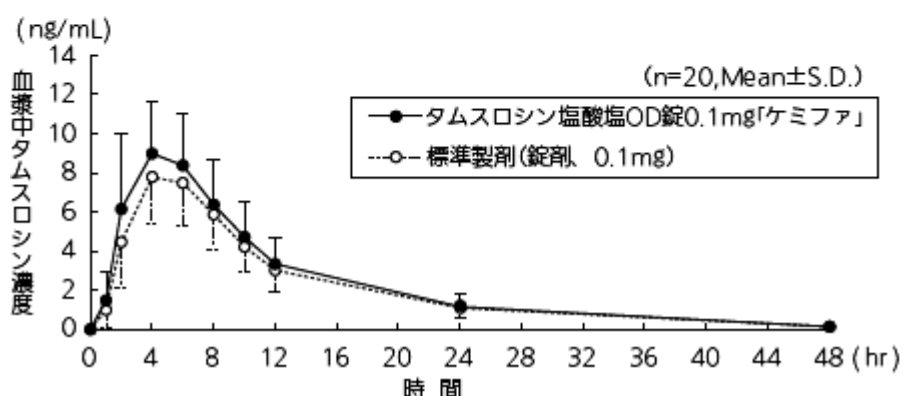
タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「ケミファ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ2錠（タムスロシン塩酸塩として0.2mg）健康成人男子に水なし・絶食、水なし・食後及び水あり・絶食の条件下で単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ

（AUCt、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。

##### ① 水なし・絶食投与

製品名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
タムスロシン塩酸塩OD錠 0.1mg「ケミファ」	114.222 ±41.282	9.786 ±2.954	4.2 ±1.3	8.09 ±1.97
標準製剤 (錠剤、0.1mg)	101.161 ±32.336	8.299 ±2.351	4.8 ±1.2	8.20 ±1.77

(n=20, Mean±S.D.)

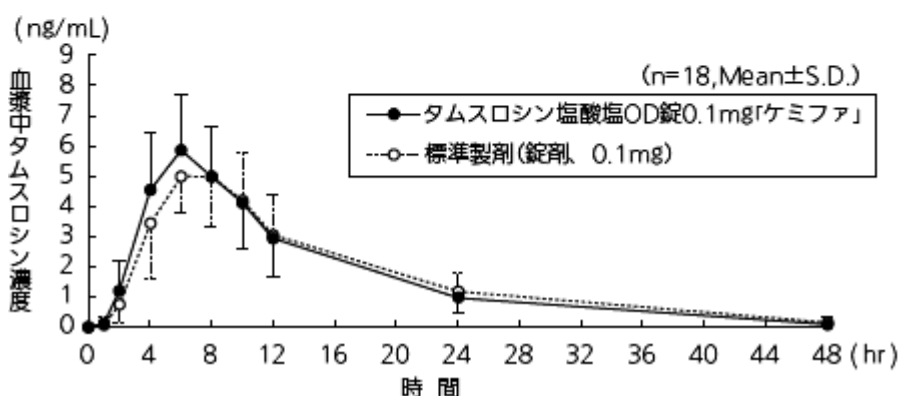




②水なし・食後投与

製品名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
タムスロシン塩酸塩OD錠 0.1mg「ケミファ」	81.093 ±26.371	6.252 ±1.778	6.2 ±1.7	7.91 ±2.14
標準製剤 (錠剤、0.1mg)	81.336 ±29.930	5.692 ±1.521	6.7 ±1.7	8.73 ±2.26

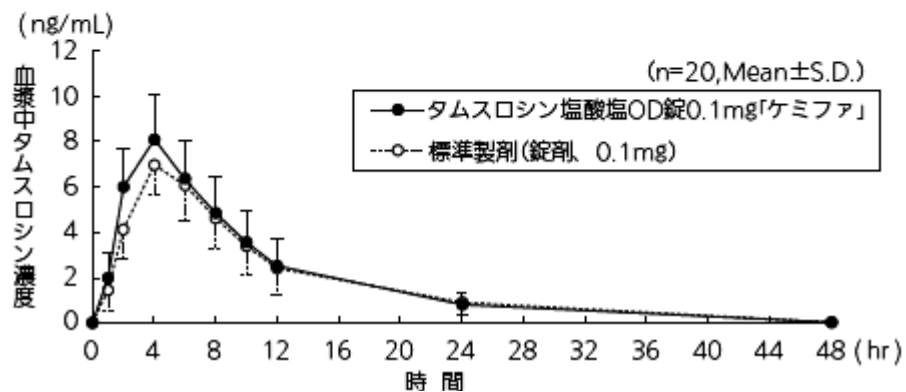
(n=18, Mean±S.D.)



③水あり・絶食投与

製品名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
タムスロシン塩酸塩OD錠 0.1mg「ケミファ」	90.002 ±31.158	8.177 ±1.960	3.8 ±0.9	7.11 ±1.73
標準製剤 (錠剤、0.1mg)	84.234 ±24.965	7.157 ±1.473	4.4 ±0.8	7.71 ±2.12

(n=20, Mean±S.D.)



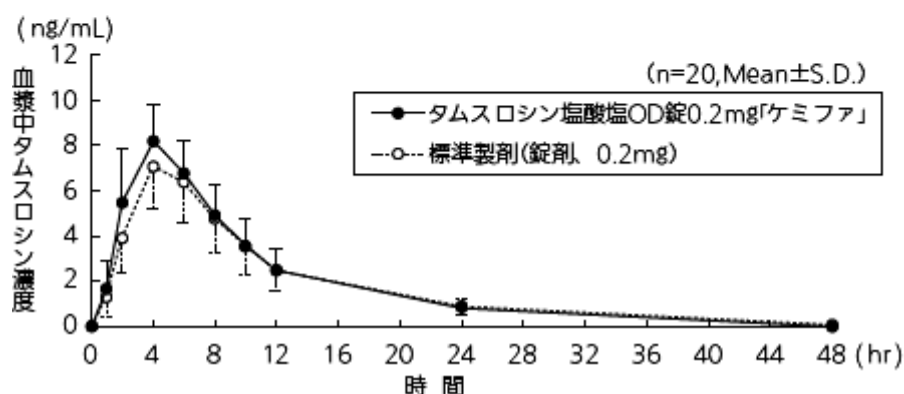
2) タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「ケミファ」

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「ケミファ」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）健康成人男子に水なし・絶食、水なし・食後及び水あり・絶食の条件下で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（AUCt、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。

① 水なし・絶食投与

製品名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
タムスロシン塩酸塩OD錠 0.2mg「ケミファ」	89.769 ±19.388	8.460 ±1.632	4.0 ±1.1	7.40 ±1.58
標準製剤 (錠剤、0.2mg)	85.725 ±25.607	7.511 ±1.648	4.4 ±1.0	8.40 ±2.10

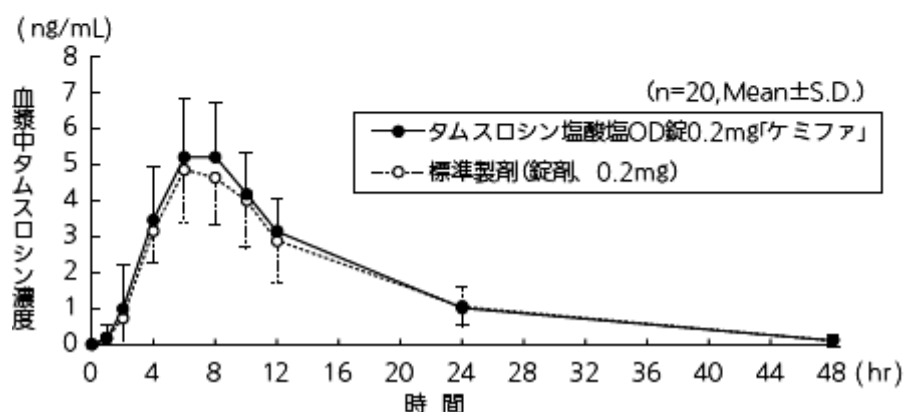
(n=20, Mean±S.D.)



②水なし・食後投与

製品名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
タムスロシン塩酸塩OD錠 0.2mg「ケミファ」	79.217 ±18.350	6.009 ±1.331	7.2 ±2.0	8.04 ±2.45
標準製剤 (錠剤、0.2mg)	75.033 ±23.141	5.312 ±1.395	6.8 ±1.6	8.03 ±2.27

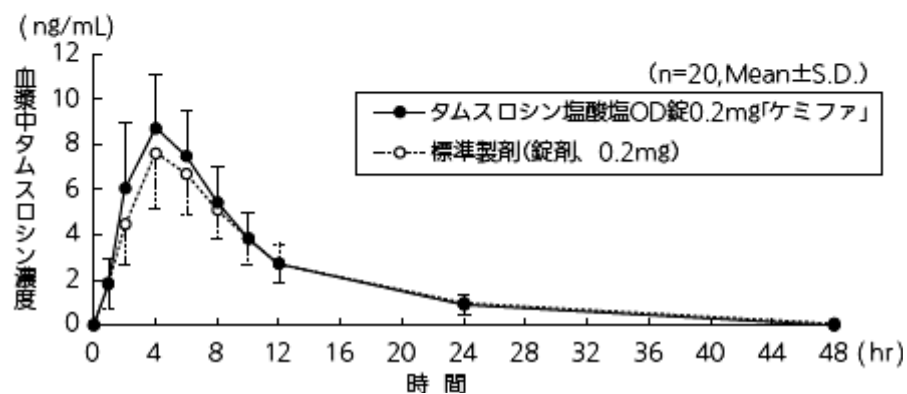
(n=20, Mean±S.D.)



③水あり・絶食投与

製品名	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	t <sub>1/2</sub> (hr)
タムスロシン塩酸塩OD錠 0.2mg「ケミファ」	97.582 ±28.024	8.886 ±2.353	4.2 ±1.1	7.46 ±1.75
標準製剤 (錠剤、0.2mg)	93.064 ±24.987	7.851 ±2.130	4.6 ±0.9	8.25 ±1.89

(n=20, Mean±S.D.)



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

該当資料なし

(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)コンパートメントモデル

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

該当資料なし

(4)消失速度定数

該当資料なし

(5)クリアランス

該当資料なし

(6)分布容積

該当資料なし

(7)血漿蛋白結合率

該当資料なし

3. 吸収

該当資料なし

4. 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)乳汁中への移行性

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

該当資料なし

(2)代謝に関与する酵素（CYP450 等）の分子種

該当資料なし

(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

該当資料なし

(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

該当資料なし

(2)排泄率

該当資料なし

(3)排泄速度

該当資料なし

7. 透析等による除去率

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

該当しない

### 2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

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

(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（「VIII-9.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（「VIII-7. 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

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。

## 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

- 1)失神・意識喪失(頻度不明)：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(頻度不明)：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

	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 <sup>注)</sup>	痒痒感、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

「VIII-2.禁忌とその理由」、「VIII-8.(3)その他の副作用」の項参照

## 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

該当なし

## 11. 小児等への投与

該当なし

## 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-6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法(1)」の項参照

## 14. 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)本剤は舌の上への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。

## 15. その他の注意

(1) $\alpha_1$ 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、 $\alpha_1$ 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と。

## 16. その他



## 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：タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg「ケミファ」 処方せん医薬品<sup>注)</sup>  
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「ケミファ」 処方せん医薬品<sup>注)</sup>  
注) 注意一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：製造後3年（外装に表示）

### 3. 貯法・保存条件

気密容器、室温保存  
開封後は湿気を避けて保存すること。

### 4. 薬剤取扱い上の注意点

#### (1) 薬局での取り扱いについて

「Ⅷ-6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法」、「Ⅷ-14.適用上の注意」の項参照

#### (2) 薬剤交付時の注意（患者等に留意すべき必須事項等）

「Ⅷ-6.重要な基本的注意とその理由及び処置方法」、「Ⅷ-14.適用上の注意」、「Ⅷ-15.その他の注意」の項参照

### 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「ケミファ」： 140錠(14錠×10)  
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「ケミファ」： 140錠(14錠×10)、560錠(14錠×40)

### 7. 容器の材質

PTP包装	PTP：ポリ塩化ビニルフィルム、アルミニウム箔 内袋：ポリエチレンラミネートアルミニウムフィルム
バラ包装	瓶・詰め物：ポリエチレン キャップ：ポリプロピレン

### 8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：タムスロシン塩酸塩カプセル 0.1mg「ケミファ」、  
タムスロシン塩酸塩カプセル 0.2mg「ケミファ」、  
ハルナール D錠 0.1mg、ハルナール D錠 0.2mg

同効薬：メシル酸フェントラミン、ドキサゾシンメシル酸塩、テラゾシン塩酸塩水和物、  
プラゾシン塩酸塩、ブナゾシン塩酸塩、ウラピジル、ナフトピジル

9. 国際誕生年月日

1993年7月（タムスロシン塩酸塩製剤として）

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製造承認年月日：2010年7月15日

製造承認番号：

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「ケミファ」：22200AMX00736000

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「ケミファ」：22200AMX00737000

11. 薬価基準収載年月日

2010年11月19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 「ケミファ」	120250201	2590008F1050	622025001
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「ケミファ」	120251901	2590008F2057	622025101

17. 保険給付上の注意

本剤は、保険診療上の後発品医薬品である。

## XI. 文献

### 1. 引用文献

- 1) (財)日本公定書協会編 医療用医薬品品質情報集 No.29 (Orange Book)
- 2) 日本薬品工業株式会社：安定性に関する資料 (社内資料)
- 3) 日本薬品工業株式会社：溶出に関する資料 (社内資料)
- 4) 第十六改正日本薬局方解説書 C-2644, 廣川書店, 東京, 2011
- 5) 日本薬品工業株式会社：薬効薬理に関する資料 (社内資料)
- 6) 日本薬品工業株式会社：生物学的同等性に関する資料 (社内資料)

### 2. その他の参考文献

第16改正 日本薬局方

The use of stems in the selection of International Nonproprietary Names (INN) for pharmaceutical substances, 2011

## XII. 参考資料

### 1. 主な外国での発売状況

該当しない

### 2. 海外における臨床支援情報

該当しない

## XIII. 備考

その他関連資料