

前立腺肥大症に伴う排尿障害改善剤

処方箋医薬品*

日本標準商品分類番号

87259

タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「サワイ」

タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「サワイ」

TAMSULOSIN HYDROCHLORIDE OD

タムスロシン塩酸塩口腔内崩壊錠

貯法: 室温保存
開封後は湿気を避けて保存すること
使用期限: 外箱に表示

| | OD錠0.1mg | OD錠0.2mg |
|------|------------------|------------------|
| 承認番号 | 22300AMX00452000 | 22300AMX00453000 |
| 薬価収載 | 2011年11月 | 2011年11月 |
| 販売開始 | 2009年5月 | 2009年5月 |

※注意—医師等の処方箋により使用すること

【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

【組成・性状】

**・組成

| 品名 | タムスロシン塩酸塩OD錠 0.1mg「サワイ」 | タムスロシン塩酸塩OD錠 0.2mg「サワイ」 |
|---------------|---|----------------------------|
| 有効成分 [1錠中] | 日局タムスロシン塩酸塩 0.1mg 0.2mg | |
| 添加剤 | アクリル酸エチル・メタクリル酸メチルコポリマー、エチルセルロース、結晶セルロース、ステアリン酸Ca、セタノール、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、没食子酸プロピル、ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル、ポリソルベート80、D-マンニトール、メタクリル酸コポリマーLD、メタケイ酸アルミン酸Mg、ラウリル硫酸Na | |

**・製剤の性状

| 品名 | タムスロシン塩酸塩OD錠 0.1mg「サワイ」 | タムスロシン塩酸塩OD錠 0.2mg「サワイ」 |
|--------|---|---|
| 外形 |  |  |
| 剤形 | 素錠(徐放性粒を含む口腔内崩壊錠) | |
| 性状 | 白色 | |
| 直径(mm) | 7.5 | 8.5 |
| 厚さ(mm) | 3.2 | 4.2 |
| 重量(mg) | 約140 | 約240 |
| 本体表示 | タムスロシン OD 0.1 サワイ | タムスロシン OD 0.2 サワイ |

【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)

- 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。 |

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)

- 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。
- 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) | 痒痒感、発疹、蕁麻疹、多形紅斑、血管浮腫 |
| 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、更には穿孔をお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こと。

【薬物動態】

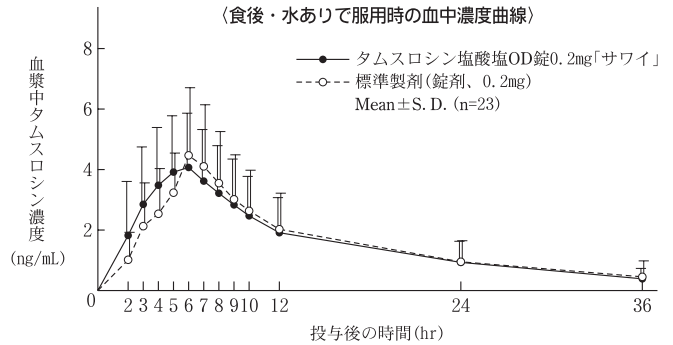
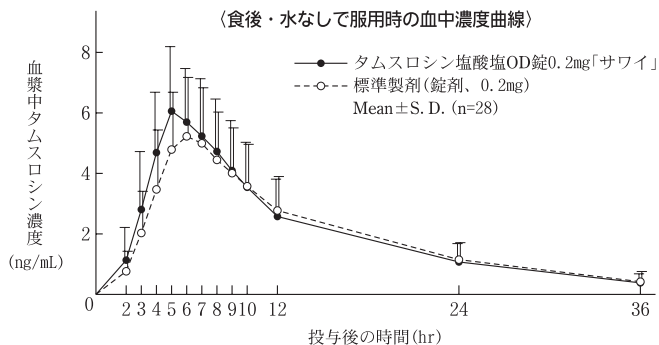
生物学的同等性試験

タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「サワイ」と標準製剤を健康成人男子にそれぞれ1錠(タムスロシン塩酸塩として0.2mg)空腹時及び食後単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中タムスロシン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。³⁾
(なお、タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「サワイ」はタムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「サワイ」と成分組成比が類似しており、「含量が異なる経口固形製剤の生物学的同等性試験ガイドライン(平成18年11月24日付 薬食審査発第1124004号)」に基づく溶出挙動の比較により、0.1mg錠は0.2mg錠と生物学的に同等とみなされた。²⁾)

タムスロシン塩酸塩として0.2mg投与時の薬物動態パラメータ

| | | Cmax (ng/mL) | Tmax (hr) | T _{1/2} (hr) | AUC _{0-36hr} (ng·hr/mL) |
|------------------------|------------------------|-----------------|--------------|--------------------------|-------------------------------------|
| 水なし | 空腹時 (n=24) | | | | |
| | タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「サワイ」 | 7.08±2.17 | 4.1±1.0 | 8.3±1.6 | 71.24±26.58 |
| | 標準製剤(錠剤、0.2mg) | 6.73±1.51 | 4.0±0.8 | 8.6±1.5 | 67.09±21.19 |
| | 食後 (n=28) | | | | |
| タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「サワイ」 | 6.53±2.01 | 5.2±1.1 | 8.5±1.6 | 73.50±30.22 | |
| 標準製剤(錠剤、0.2mg) | 5.71±1.87 | 6.3±1.6 | 8.6±2.1 | 71.22±25.85 | |
| 水あり | 空腹時 (n=24) | | | | |
| | タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「サワイ」 | 6.73±2.23 | 4.4±0.9 | 8.8±1.6 | 67.61±25.53 |
| | 標準製剤(錠剤、0.2mg) | 6.79±1.70 | 4.6±1.2 | 8.1±1.2 | 71.52±26.07 |
| | 食後 (n=23) | | | | |
| タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「サワイ」 | 4.61±1.83 | 4.7±1.5 | 10.4±2.7 | 57.31±30.93 | |
| 標準製剤(錠剤、0.2mg) | 4.66±2.21 | 5.8±1.0 | 10.6±3.5 | 56.85±29.84 | |

(Mean±S. D.)



血漿中濃度ならびに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】

1. 尿道及び前立腺部の α_1 受容体を遮断することにより、前立腺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。
2. 血管平滑筋に比べて前立腺・尿道平滑筋の α_1 受容体に親和性が高く、血圧を低下させない用量でこれらの平滑筋を弛緩させる。

【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)

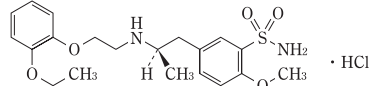
化学名：5-[(2R)-2-[2-(2-Ethoxyphenoxy)ethylamino]propyl]-2-methoxybenzenesulfonamide monohydrochloride

分子式：C₂₀H₂₈N₂O₅S · HCl

分子量：444.97

融点：約230℃(分解)

構造式：



性状：タムスロシン塩酸塩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。

【取扱い上の注意】

・安定性試験

PTP包装(PTPシートをアルミビロー包装(乾燥剤入り))又はバラ包装(ポリエチレン瓶(乾燥剤入り))したものを用いた加速試験(40℃75%RH、6ヶ月)の結果、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。^{3)、4)}

【包装】

タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「サワイ」：

PTP：140錠(14錠×10)

タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「サワイ」：

PTP：140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) 陶易王他, 医学と薬学, **61**(3), 367(2009).
- 2) 沢井製薬(株)社内資料[生物学的同等性試験]
- 3)、4) 沢井製薬(株)社内資料[安定性試験]

・文献請求先〔主要文献(社内資料を含む)は下記にご請求下さい〕

沢井製薬株式会社 医薬品情報センター
〒532-0003 大阪市淀川区宮原5丁目2-30
TEL：0120-381-999 FAX：06-6394-7355

製造販売元

沢井製薬株式会社

大阪市淀川区宮原5丁目2-30

D07 A211007