

貯法：気密容器、室温保存
使用期限：外箱に表示

前立腺肥大症の排尿障害改善剤
処方せん医薬品[※]

*日本薬局方 タムスロシン塩酸塩徐放錠

塩酸タムスロシン錠0.1「EK」 塩酸タムスロシン錠0.2「EK」

Tamsulosin Hydrochloride tab. 0.1「EK」・0.2「EK」


	0.1「EK」	0.2「EK」
承認番号	21700AMZ00506000	21700AMZ00507000
薬価収載	2005年7月	2005年7月
販売開始	2005年7月	2005年7月

注)注意-医師等の処方せん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】

品名	塩酸タムスロシン錠0.1「EK」	塩酸タムスロシン錠0.2「EK」
成分・含量	1錠中、日局タムスロシン塩酸塩0.1mg含有	1錠中、日局タムスロシン塩酸塩0.2mg含有
添加物	結晶セルロース、タルク、ステアリン酸カルシウム、トリアセチン、メタクリル酸コポリマーLD、ラウリル硫酸ナトリウム、ポリソルベート80、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロース、ポビドン、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、プロピレングリコール、ヒドロキシプロピルセルロース	
性状	白色のフィルムコート錠	白色のフィルムコート錠
大きさ	直径：約7.6mm 厚さ：約4.3mm 重量：約186mg	直径：約8.6mm 厚さ：約4.6mm 重量：約290mg
外形		
識別コード	EK01	EK02

【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。
- (2)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。
- (3)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。

- (4)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。
- (5)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денаフィルクエン酸塩、バルデナフィルクエン酸塩水合物等	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 [※]	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)服用時：本剤は徐放製剤なのでかまずに服用するよう患者に指導すること。

(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。]

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>

1. 塩酸タムスロシン錠0.1「EK」

塩酸タムスロシン錠0.1「EK」と標準製剤を、クロスオーバー法により1錠及び1カプセル(タムスロシン塩酸塩0.1mg)健康成人男子に絶食及び摂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、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された(図1、図2、表1)。¹⁾

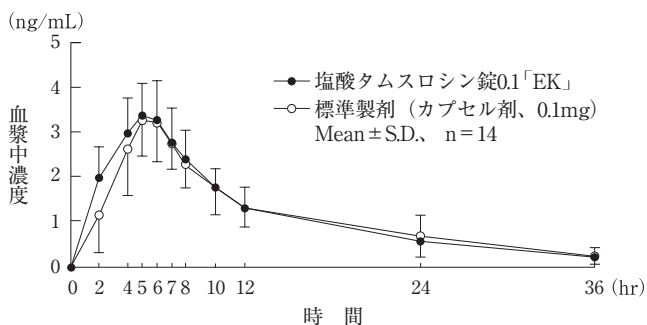


図1 0.1mg投与時のタムスロシン血漿中濃度推移(絶食時)

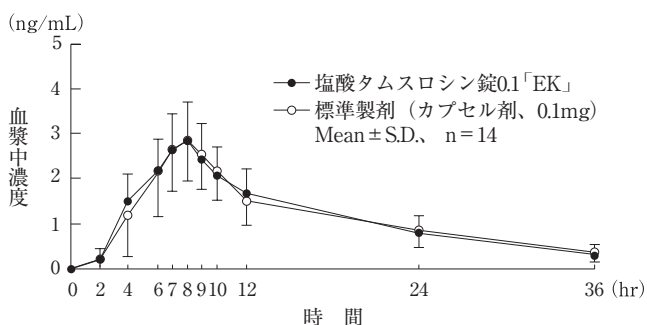


図2 0.1mg投与時のタムスロシン血漿中濃度推移(摂食時)

表1 薬物動態パラメータ

		判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC _{0-36hr} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
絶食時	塩酸タムスロシン錠0.1「EK」	42.01 ± 11.81	3.66 ± 0.78	5.4 ± 0.8	7.7 ± 2.0
	標準製剤 (カプセル剤, 0.1mg)	40.99 ± 12.39	3.59 ± 0.96	5.4 ± 0.8	8.3 ± 2.3
摂食時	塩酸タムスロシン錠0.1「EK」	40.54 ± 10.96	3.08 ± 0.88	7.7 ± 0.8	9.0 ± 2.0
	標準製剤 (カプセル剤, 0.1mg)	39.84 ± 11.71	3.01 ± 0.91	7.5 ± 0.9	9.9 ± 3.5

(Mean ± S.D., n=14)

2. 塩酸タムスロシン錠0.2「EK」

塩酸タムスロシン錠0.2「EK」と標準製剤を、クロスオーバー法により1錠及び1カプセル(タムスロシン塩酸塩0.2mg)健康成人男子に絶食及び摂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、 $\log(0.8) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された(図3、図4、表2)。¹⁾

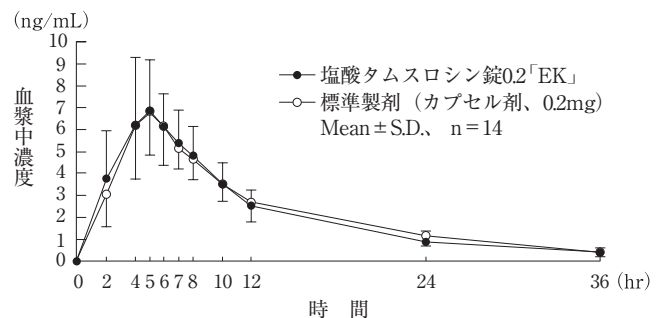


図3 0.2mg投与時のタムスロシン血漿中濃度推移(絶食時)

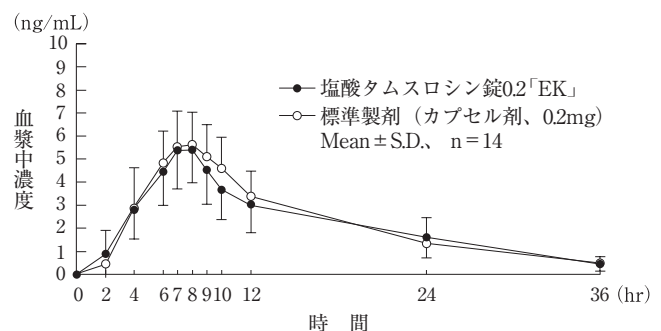


図4 0.2mg投与時のタムスロシン血漿中濃度推移(摂食時)

表2 薬物動態パラメータ

		判定パラメータ		参考パラメータ	
		AUC _{0-36hr} (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)
絶食時	塩酸タムスロシン錠0.2「EK」	79.72 ± 22.71	7.23 ± 2.66	5.1 ± 1.0	7.7 ± 1.8
	標準製剤 (カプセル剤, 0.2mg)	82.21 ± 19.88	7.43 ± 2.16	5.1 ± 1.0	7.5 ± 1.3
摂食時	塩酸タムスロシン錠0.2「EK」	76.90 ± 27.27	5.91 ± 1.73	7.7 ± 0.5	8.1 ± 2.1
	標準製剤 (カプセル剤, 0.2mg)	79.19 ± 24.56	5.91 ± 1.46	7.7 ± 0.6	7.6 ± 1.6

(Mean ± S.D., n=14)

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】

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⁾

【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： $C_{20}H_{28}N_2O_5S \cdot HCl$

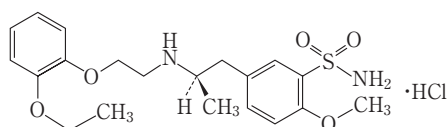
分子量：444.97

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)

構造式：



【取扱い上の注意】

<安定性試験>

最終包装製品を用いた長期保存試験(25℃、3年間)の結果、塩酸タムスロシン錠0.1「EK」及び塩酸タムスロシン錠0.2「EK」は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。³⁾

【包装】

塩酸タムスロシン錠0.1「EK」 P T P：140錠

塩酸タムスロシン錠0.2「EK」 P T P：140錠 560錠

バラ：300錠

【主要文献】

- 1) 小林化工株式会社・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
- 3) 小林化工株式会社・社内資料(安定性試験)


【文献請求先】

主要文献欄に記載の文献・社内資料は下記にご請求下さい。

小林化工株式会社 安全管理部

〒919-0603 福井県あわら市矢地5-15

TEL 0776-73-0911 FAX 0776-73-0821

製造販売元
 **小林化工株式会社**
福井県あわら市矢地5-15

(W.1.5)