

前立腺肥大症の排尿障害改善剤

日本標準商品分類番号

87259

タムスロシン塩酸塩製剤

処方箋医薬品

(注意—医師等の処方箋
により使用すること)

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」

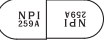
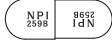
Tamsulosin

貯 法：気密容器、室温保存
 使用期限：外装に表示(3年、アルミピロー開封後はなるべく早く使用すること)

	0.1mg	0.2mg
承認番号	22400AMX00723000	22400AMX00724000
薬価収載	2012年12月	2012年12月
販売開始	2005年7月	2005年7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】

販売名	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」
1カプセル中の有効成分	(日局)タムスロシン塩酸塩0.1mg	(日局)タムスロシン塩酸塩0.2mg
添加物	アミノアルキルメタクリレートコポリマーRS、クエン酸トリエチル、結晶セルロース、水酸化ナトリウム、ステアリン酸カルシウム、ソルビン酸、タルク、トウモロコシデンプン、ポリソルベート80、マクロゴール、メタクリル酸コポリマーLD、メタクリル酸コポリマーS、ラウリル硫酸ナトリウムを含有する。 カプセル本体に黄色三二酸化鉄、酸化チタン、ゼラチン、ラウリル硫酸ナトリウムを含有する。	アミノアルキルメタクリレートコポリマーRS、クエン酸トリエチル、結晶セルロース、水酸化ナトリウム、ステアリン酸カルシウム、ソルビン酸、タルク、トウモロコシデンプン、ポリソルベート80、マクロゴール、メタクリル酸コポリマーLD、メタクリル酸コポリマーS、ラウリル硫酸ナトリウムを含有する。 カプセル本体に三二酸化鉄、酸化チタン、ゼラチン、ラウリル硫酸ナトリウムを含有する。
製剤の性状	キャップがごく小さい黄色不透明、ボディが白色不透明の硬カプセル剤。内容物は白色～微黄白色の粒。	キャップがごく小さい赤色不透明、ボディが白色不透明の硬カプセル剤。内容物は白色～微黄白色の粒。
サイズ	大きさ 4号カプセル 重量(mg) 124	大きさ 4号カプセル 重量(mg) 208
外形		
識別コード	NPI 259A	NPI 259B

【効能又は効果】

前立腺肥大症に伴う排尿障害

【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。

【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（「5.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（「3.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）

- 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。

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：カプセル中の粒をかみ砕いたり、カプセルを開けて服用しないよう患者に指導すること。

[本剤は、タムスロシン塩酸塩の徐放性粒を充填した硬カプセルであるため、薬物動態が変わる可能性がある。]

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】

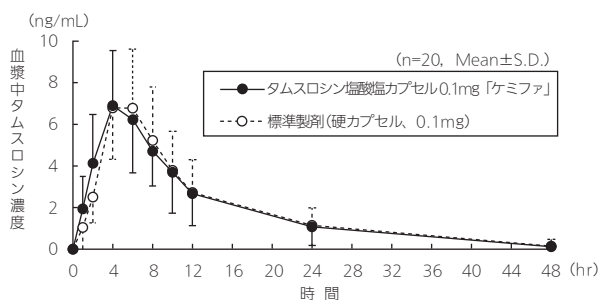
1. 生物学的同等性試験¹⁾

1) 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0.1mg「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食後に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、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

(1) 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 _{1/2} (hr)
タムスロシン塩酸塩カプセル0.1mg「ケミファ」	90.48 ±49.97	7.36 ±2.47	4.4 ±1.2	8.4 ±2.9
標準製剤 (硬カプセル, 0.1mg)	91.26 ±46.85	7.81 ±2.84	5.1 ±1.0	8.7 ±3.3

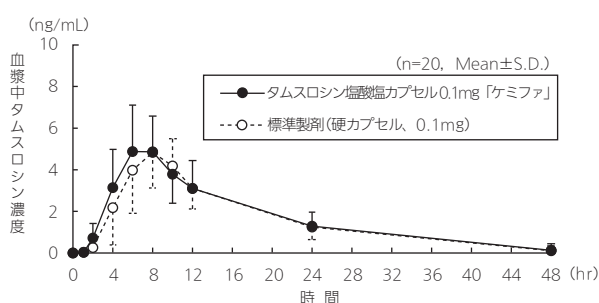
(n=20, Mean±S.D.)



(2) 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 _{1/2} (hr)
タムスロシン塩酸塩カプセル0.1mg「ケミファ」	80.54 ±36.20	5.32 ±2.02	7.1 ±1.0	9.4 ±2.7
標準製剤 (硬カプセル, 0.1mg)	75.96 ±28.23	5.07 ±1.82	7.9 ±1.8	9.1 ±2.9

(n=20, Mean±S.D.)

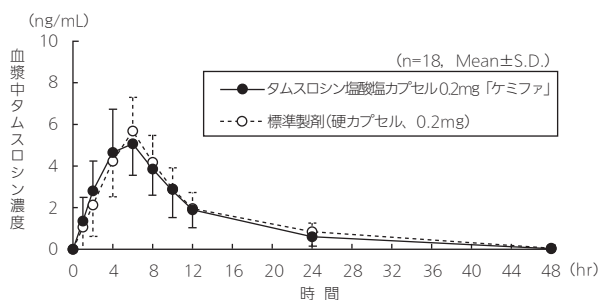


2) タムスロシン塩酸塩カプセル0.2mg「ケミファ」
 タムスロシン塩酸塩カプセル0.2mg「ケミファ」と標準製剤を、クロスオーバー法によりそれぞれ1カプセル（タムスロシン塩酸塩0.2mg）健康成人男子に絶食及び食後に単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

(1) 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 _{1/2} (hr)
タムスロシン塩酸塩カプセル0.2mg「ケミファ」	62.79 ±24.92	5.50 ±1.84	5.1 ±1.0	7.5 ±3.7
標準製剤 (硬カプセル, 0.2mg)	67.08 ±22.29	5.98 ±1.57	5.4 ±0.9	8.5 ±3.1

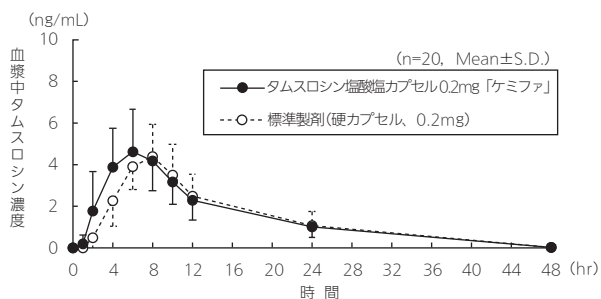
(n=18, Mean±S.D.)



(2) 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 _{1/2} (hr)
タムスロシン塩酸塩 カプセル0.2mg「ケミファ」	69.10 ±28.76	5.02 ±1.94	6.6 ±1.3	9.1 ±2.7
標準製剤 (硬カプセル, 0.2mg)	66.11 ±27.22	4.73 ±1.29	7.0 ±1.8	8.8 ±3.2

(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。

2. 溶出挙動²⁾

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」は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められたタムスロシン塩酸塩カプセルの溶出規格に適合していることが確認されている。

【薬効薬理】

1. α受容体サブタイプの選択性³⁾

ラット組織を用いてタムスロシン塩酸塩のα受容体サブタイプの選択性を検討したところ、血管平滑筋の収縮に参与しているα_{1D}より前立腺平滑筋の収縮に参与しているα_{1A}に対して約600倍高い遮断効力を示した。

【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

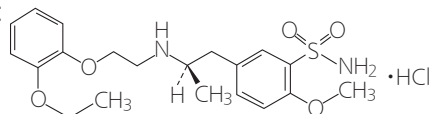
(Tamsulosin Hydrochloride)

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：タムスロシン塩酸塩は白色の結晶である。

本品はギ酸に溶けやすく、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】

安定性試験⁴⁾

最終包装製品を用いた長期保存試験（なりゆき室温・湿度、3年間）の結果、タムスロシン塩酸塩カプセル0.1mg「ケミファ」及びタムスロシン塩酸塩カプセル0.2mg「ケミファ」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。

【包装】

タムスロシン塩酸塩カプセル0.1mg「ケミファ」：
140カプセル（14カプセル×10）

※タムスロシン塩酸塩カプセル0.2mg「ケミファ」：
140カプセル（14カプセル×10）、
560カプセル（14カプセル×40）

【主要文献】

- 1) 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) 日本薬品工業株式会社：溶出に関する資料（社内資料）
- 3) 日本薬品工業株式会社：薬効薬理に関する資料（社内資料）
- 4) 日本薬品工業株式会社：安定性に関する資料（社内資料）

【資料請求先】

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ください。

日本薬品工業株式会社 安全管理課

〒101-0032 東京都千代田区岩本町2丁目2番3号

TEL 03-5833-5011

FAX 03-5833-5100



製造販売元

日本薬品工業株式会社

東京都千代田区岩本町2丁目2-3