**2017年４月改訂(第３版)
*2011年12月改訂

日本標準商品分類番号	872149

	1mg	2mg
承認番号	22100AMX01521	22100AMX01522
薬価収載	2009年９月	2009年９月
販売開始	2009年９月 ※2004年７月	2009年９月 ※2004年７月

※旧販売名による

貯　　法：室温保存 **使用期限**：外箱に表示の使用期限内に使用すること。

処方箋医薬品(注意－医師等の処方箋により使用すること)

持続性α$_1$ブロッカー・血圧降下剤

ドキサゾシン錠1mg「YD」
ドキサゾシン錠2mg「YD」

Doxazosin Tablets 1mg [YD] · 2mg [YD]

***日本薬局方　ドキサゾシンメシル酸塩錠**

【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		ドキサゾシン錠１mg「YD」			ドキサゾシン錠２mg「YD」		
有効成分		日局　ドキサゾシンメシル酸塩					
含量 (1錠中)		1.2129mg (ドキサゾシンとして１mg)			2.4257mg (ドキサゾシンとして２mg)		
添加物		乳糖水和物、結晶セルロース、デンプングリコール酸ナトリウム、ポリソルベート80、ステアリン酸マグネシウム			乳糖水和物、結晶セルロース、デンプングリコール酸ナトリウム、ポリソルベート80、ステアリン酸マグネシウム、黄色五号アルミニウムレーキ		
色・剤形 (又は性状)		白色の片面割線入り素錠			淡いだいだい色の 片面割線入り素錠		
外形		表	裏	側面	表	裏	側面
大きさ	直径	約7mm			約7mm		
	厚さ	約2.5mm			約2.5mm		
重量		120mg			120mg		
識別コード (PTP)		YD522			YD523		

【効能又は効果】
高血圧症
褐色細胞腫による高血圧症

【用法及び用量】
通常、成人にはドキサゾシンとして１日１回0.5mgより投与を始め、効果が不十分な場合は１～２週間の間隔をおいて１～４mgに漸増し、１日１回経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減するが、１日最高投与量は８mgまでとする。ただし、褐色細胞腫による高血圧症に対しては１日最高投与量を16mgまでとする。

【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)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)肝機能障害のある患者[主として肝臓で代謝されるため、血中濃度－時間曲線下面積(AUC)が増大することがある。]

２．重要な基本的注意
(１)起立性低血圧があらわれることがあるので、臥位のみならず立位又は坐位で血圧測定を行い、体位変換による血圧変化を考慮し、坐位にて血圧をコントロールすること。
(２)本剤の投与初期又は用量の急増時等に、立ちくらみ、めまい、脱力感、発汗、動悸・心悸亢進等があらわれることがある。その際は仰臥位をとらせるなどの適切な処置を行うこと。また、必要に応じて対症療法を行うこと。
(３)本剤の投与初期又は用量の急増時等に起立性低血圧に基づく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。

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
利尿剤又は他の降圧剤	相互に作用を増強するおそれがあるので、減量するなど注意すること。	相互に作用を増強するおそれがある。
ホスホジエステラーゼ５阻害作用を有する薬剤 バルデナフィル塩酸塩水和物 タダラフィル シルデナフィルクエン酸塩	併用によりめまい等の自覚症状を伴う症候性低血圧をきたしたとの報告がある。	血管拡張作用による降圧作用を有するため、本剤の降圧作用を増強することがある。

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**：失神・意識喪失があらわれることがある。これは起立性低血圧によることが多いので、このような症状があらわれた場合には投与を中止し、仰臥位をとらせるなど適切な処置を行うこと。
２)**不整脈**：不整脈があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
３)**脳血管障害**：脳血管障害があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
４)**狭心症**：狭心症があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
５)**心筋梗塞**：心筋梗塞があらわれることがあるので、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

6）**無顆粒球症、白血球減少、血小板減少**：無顆粒球症、白血球減少、血小板減少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投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

7）**肝炎、肝機能障害、黄疸**：肝炎、AST(GOT)、ALT(GPT)、γ-GTPの著しい上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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投与を中止し、適切な処置を行うこと。

（2）その他の副作用

次のような副作用が認められた場合には、必要に応じ、減量、投与中止等の適切な処置を行うこと。

種　類	頻度不明
肝　臓	AST(GOT)、ALT(GPT)、Al-P、LDHの上昇、胆汁うっ滞
循　環　器	起立性めまい、起立性低血圧、低血圧、動悸・心悸亢進、頻脈、ほてり(顔面潮紅等)、胸痛・胸部圧迫感、徐脈
精神・神経系	めまい、頭痛・頭重、眩暈、眠気、不眠、しびれ感、耳鳴、興奮、振戦、知覚鈍麻、不安、うつ病、神経過敏
消　化　器	悪心・嘔吐、腹痛、口渇、食欲不振、下痢、便秘、消化不良、鼓腸放屁
筋・骨格系	関節痛、筋力低下、筋痙直、筋肉痛、背部痛
呼　吸　器	息苦しさ、鼻出血、鼻炎、咳、気管支痙攣悪化、呼吸困難
泌尿・生殖器	頻尿・夜間頻尿、尿失禁、持続勃起、勃起障害、射精障害(逆行性射精等)、血尿、排尿障害、多尿
過　敏　症[注]	発疹、そう痒感、蕁麻疹、血管浮腫、光線過敏症
血　液	白血球減少、血小板減少、紫斑
眼	かすみ目、術中虹彩緊張低下症候群(IFIS)
そ　の　他	倦怠感、浮腫、脱力感、異常感覚、発熱、発汗、疼痛、体重増加、女性化乳房、脱毛

注)発現した場合には投与を中止すること。

5．高齢者への投与

高齢者では一般に過度の降圧は好ましくないとされている(脳梗塞等が起こるおそれがある)ので、低用量から投与を開始するなど患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。

6．妊婦、産婦、授乳婦等への投与

（1）妊娠中の投与に関する安全性は確立していないので、妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

** （2）ヒト母乳中への移行が報告されている[1]ので、授乳中の婦人に投与する場合には授乳を中止させることが望ましい。

（3）胎仔器官形成期投与試験にて、ラットへの120mg/kg投与及びウサギへの100mg/kg投与により胎仔死亡率の増加が報告されている。

7．小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児又は小児に対する安全性は確立していない。

8．過量投与

（1）症状

過量投与により低血圧を起こす可能性がある。

（2）処置

過量投与の結果低血圧になった場合には、直ちに患者を足高仰臥位に保つ。その他必要に応じて適切な処置を行う。本剤は蛋白結合率が高いため、透析は有用ではない。

9．適用上の注意

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、さら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。]

10. その他の注意

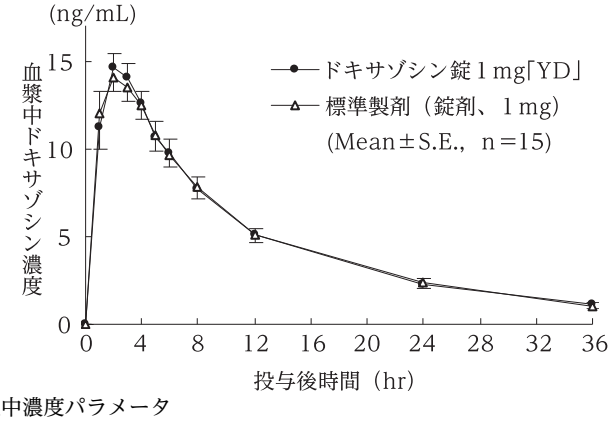
α_1遮断薬を服用中又は過去に服用経験のある患者において、α_1遮断作用によると考えられる術中虹彩緊張低下症候群(Intraoperative Floppy Iris Syndrome)があらわれるとの報告がある。

【薬物動態】

1．生物学的同等性試験[2),3)]

ドキサゾシン錠1mg「YD」又はドキサゾシン錠2mg「YD」と標準製剤をクロスオーバー法によりそれぞれ2錠又は1錠(ドキサゾシンとして2mg)、健康成人男子15名に絶食単回経口投与して血漿中ドキサゾ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90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.8)～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。

ドキサゾシン錠1mg「YD」投与後の血漿中濃度推移

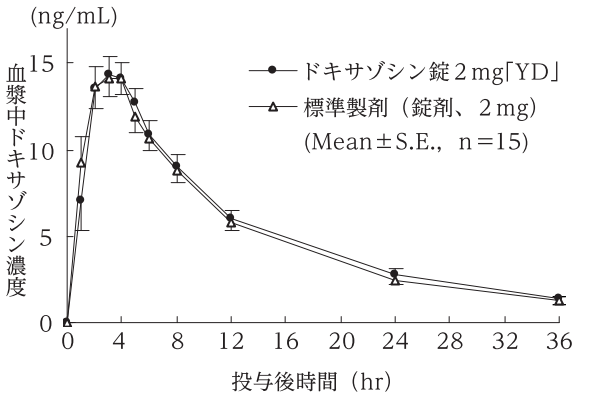


血中濃度パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}36}$ (ng･hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ドキサゾシン錠1mg「YD」	175.2±50.2	15.5±3.4	2.1±0.9	8.9±1.9
標準製剤(錠剤、1mg)	175.5±48.9	15.3±3.4	2.3±1.0	9.0±1.5

(平均値±標準偏差、n＝15)

ドキサゾシン錠2mg「YD」投与後の血漿中濃度推移



血中濃度パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	$AUC_{0\text{-}36}$ (ng･hr/mL)	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
ドキサゾシン錠2mg「YD」	194.8±58.3	16.0±3.6	2.8±0.9	9.3±1.8
標準製剤 (錠剤、2mg)	188.9±57.2	15.5±3.9	2.7±1.0	9.1±1.7

(平均値±標準偏差、n＝15)

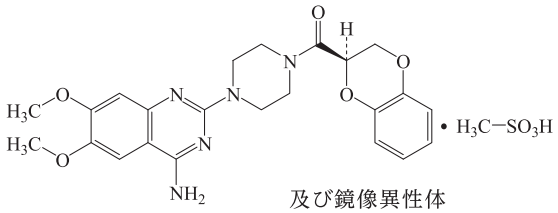
血漿中濃度並びにAUC、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

＊2．溶出挙動

ドキサゾシン錠1mg「YD」又はドキサゾシン錠2mg「YD」は、日本薬局方医薬品各条に定められたドキサゾシンメシル酸塩錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

＊【有効成分に関する理化学的知見】

構造式：



及び鏡像異性体

一般名：ドキサゾシンメシル酸塩(Doxazosin Mesilate)

化学名：1-(4-Amino-6,7-dimethoxyquinazolin-2-yl)-4-{[(2*RS*)-2,3-dihydro-1,4-benzodioxin-2-yl]carbonyl}piperazine monomethansulfonate

分子式：$C_{23}H_{25}N_5O_5 \cdot CH_4O_3S$

分子量：547.58

性　状：白色～帯黄白色の結晶性の粉末である。
ジメチルスルホキシドに溶けやすく、水又はメタノールに溶けにくく、エタノール(99.5)に極めて溶けにくい。
ジメチルスルホキシド溶液(1→20)は旋光性を示さない。
融点：約272℃(分解)

【取扱い上の注意】

安定性試験[4),5)]

最終包装製品を用いた加速試験(40℃、相対湿度75%、6ヵ月)の結果、ドキサゾシン錠1mg「YD」及びドキサゾシン錠2mg「YD」は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。

＊【包　　装】

ドキサゾシン錠1mg「YD」：100錠 (PTP)
ドキサゾシン錠2mg「YD」：100錠 (PTP)

＊＊【主要文献】

1) Berit, P. J. et al.：J Hum Lact 29(2)：150, 2013
2) ドキサゾシン錠1mg「YD」の生物学的同等性試験に関する資料(株式会社陽進堂社内資料)
3) ドキサゾシン錠2mg「YD」の生物学的同等性試験に関する資料(株式会社陽進堂社内資料)
4) ドキサゾシン錠1mg「YD」の安定性試験に関する資料(株式会社陽進堂社内資料)
5) ドキサゾシン錠2mg「YD」の安定性試験に関する資料(株式会社陽進堂社内資料)

＊＊【文献請求先】

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下さい。

サンド株式会社　カスタマーケアグループ
〒105-6333　東京都港区虎ノ門1-23-1
フリーコール 0120-982-001
FAX　03-6257-3633

＊販売
サンド株式会社
山形県上山市新金谷827-7
URL:http://www.sandoz.jp/

製造販売元
株式会社 陽進堂
富山県富山市婦中町萩島3697番地8号

007AN 003
S U91370