

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 2013 に準拠して作成

前立腺肥大症の排尿障害改善剤

処方箋医薬品

タムスロシン塩酸塩口腔内崩壊錠

タムスロシン塩酸塩OD錠0.1mg「KN」

タムスロシン塩酸塩OD錠0.2mg「KN」

TAMSULOSIN HYDROCHLORIDE OD TABLETS 「KN」

剤形	錠剤（口腔内崩壊錠）
製剤の規制区分	処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）
規格・含量	OD錠0.1mg「KN」：1錠中タムスロシン塩酸塩（日局）0.1mgを含有 OD錠0.2mg「KN」：1錠中タムスロシン塩酸塩（日局）0.2mgを含有
一般名	和名：タムスロシン塩酸塩（JAN） 洋名：Tamsulosin Hydrochloride（JAN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・発売年月日	製造販売承認年月日：2015年 8月 17日 薬価基準収載年月日：2015年 12月 11日 発売年月日：2015年 12月 11日
開発・製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：小林化工株式会社 販売元：第一三共エスファ株式会社 販売提携：第一三共株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	第一三共エスファ株式会社 お客様相談室 TEL：0120-100-601 医療関係者向けホームページ： https://med.daiichisankyo-ep.co.jp/index.php

本 IF は 2019 年 10 月改訂（第 3 版）の添付文書の記載に基づき改訂した。

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

<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html> 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、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 IF 記載要領 2008 が策定された。

IF 記載要領 2008 では、IF を紙媒体の冊子として提供する方式から、PDF 等の電磁的データとして提供すること（e-IF）が原則となった。この変更にあわせて、添付文書において「効能・効果の追加」、「警告・禁忌・重要な基本的注意の改訂」などの改訂があった場合に、改訂の根拠データを追加した最新版の e-IF が提供されることとなった。

最新版の e-IF は、（独）医薬品医療機器総合機構の医薬品情報提供ホームページ

（<https://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html>）から一括して入手可能となっている。日本病院薬剤師会では、e-IF を掲載する医薬品情報提供ホームページが公的サイトであることに配慮して、薬価基準収載にあわせて e-IF の情報を検討する組織を設置して、個々の IF が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討することとした。

2008 年より年 4 回のインタビューフォーム検討会を開催した中で指摘してきた事項を再評価し、製薬企業にとっても、医師・薬剤師等にとっても、効率の良い情報源とすることを考えた。そこで今般、IF 記載要領の一部改訂を行い IF 記載要領 2013 として公表する運びとなった。

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 版、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。

- ② IF 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]

- ① IF 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。
- ② IF 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 2013」（以下、「IF 記載要領 2013」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 2013」は、平成 25 年 10 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 2013」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 2013」においては、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ある。

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料であり、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。

(2013 年 4 月改訂)

目 次

I. 概要に関する項目	1	9. 製剤中の有効成分の確認試験法	13
1. 開発の経緯	1	10. 製剤中の有効成分の定量法	13
2. 製品の治療学的・製剤学的特性	1	11. 力 価	13
II. 名称に関する項目	2	12. 混入する可能性のある夾雑物	13
1. 販売名	2	13. 注意が必要な容器・外観が特殊な容器に 関する情報	14
(1) 和 名	2	14. その他	14
(2) 洋 名	2	V. 治療に関する項目	15
(3) 名称の由来	2	1. 効能又は効果	15
2. 一般名	2	2. 用法及び用量	15
(1) 和 名 (命名法)	2	3. 臨床成績	15
(2) 洋 名 (命名法)	2	(1) 臨床データパッケージ	15
(3) ステム	2	(2) 臨床効果	15
3. 構造式又は示性式	2	(3) 臨床薬理試験	15
4. 分子式及び分子量	2	(4) 探索的試験	15
5. 化学名 (命名法)	2	(5) 検証的試験	15
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	1) 無作為化並行用量反応試験	15
7. CAS 登録番号	3	2) 比較試験	15
III. 有効成分に関する項目	4	3) 安全性試験	15
1. 物理化学的性質	4	4) 患者・病態別試験	15
(1) 外観・性状	4	(6) 治療的使用	15
(2) 溶解性	4	1) 使用成績調査・特定使用成績調査 (特別調査)・ 製造販売後臨床試験 (市販後臨床試験)	15
(3) 吸湿性	4	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	15
(4) 融点 (分解点)、沸点、凝固点	4	VI. 薬効薬理に関する項目	16
(5) 酸塩基解離定数	4	1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	16
(6) 分配係数	4	2. 薬理作用	16
(7) その他の主な示性値	4	(1) 作用部位・作用機序	16
2. 有効成分の各種条件下における安定性	4	(2) 薬効を裏付ける試験成績	16
3. 有効成分の確認試験法	4	(3) 作用発現時間・持続時間	16
4. 有効成分の定量法	4	VII. 薬物動態に関する項目	17
IV. 製剤に関する項目	5	1. 血中濃度の推移・測定法	17
1. 剤 形	5	(1) 治療上有効な血中濃度	17
(1) 剤形の区別、外観及び性状	5	(2) 最高血中濃度到達時間	17
(2) 製剤の物性	5	(3) 臨床試験で確認された血中濃度	17
(3) 識別コード	5	(4) 中毒域	20
(4) pH、浸透圧比、粘度、比重、無菌の旨及び 安定な pH 域等	5	(5) 食事・併用薬の影響	20
2. 製剤の組成	5	(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	20
(1) 有効成分 (活性成分) の含量	5	2. 薬物速度論的パラメータ	20
(2) 添加物	5	(1) 解析方法	20
(3) その他	5	(2) 吸収速度定数	20
3. 懸濁剤、乳剤の分散性に対する注意	5	(3) バイオアベイラビリティ	21
4. 製剤の各種条件下における安定性	6	(4) 消失速度定数	21
5. 調製法及び溶解後の安定性	6	(5) クリアランス	21
6. 他剤との配合変化 (物理化学的変化)	6		
7. 溶出性	6		
8. 生物学的試験法	13		

(6) 分布容積.....	21	16. その他.....	26
(7) 血漿蛋白結合率.....	21		
3. 吸 収.....	21	IX. 非臨床試験に関する項目	27
4. 分 布.....	21	1. 薬理試験.....	27
(1) 血液－脳関門通過性.....	21	(1) 薬効薬理試験.....	27
(2) 血液－胎盤関門通過性.....	21	(2) 副次的薬理試験.....	27
(3) 乳汁への移行性.....	21	(3) 安全性薬理試験.....	27
(4) 髄液への移行性.....	21	(4) その他の薬理試験.....	27
(5) その他の組織への移行性.....	21	2. 毒性試験.....	27
5. 代 謝.....	21	(1) 単回投与毒性試験.....	27
(1) 代謝部位及び代謝経路.....	21	(2) 反復投与毒性試験.....	27
(2) 代謝に関与する酵素（CYP450等）の分子種.....	21	(3) 生殖発生毒性試験.....	27
(3) 初回通過効果の有無及びその割合.....	21	(4) その他の特殊毒性.....	27
(4) 代謝物の活性の有無及び比率.....	21	X. 管理的事項に関する項目	28
(5) 活性代謝物の速度論的パラメータ.....	22	1. 規制区分.....	28
6. 排 泄.....	22	2. 有効期間又は使用期限.....	28
(1) 排泄部位及び経路.....	22	3. 貯法・保存条件.....	28
(2) 排泄率.....	22	4. 薬剤取扱い上の注意点.....	28
(3) 排泄速度.....	22	(1) 薬局での取扱い上の留意点について.....	28
7. トランスポーターに関する情報.....	22	(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）.....	28
8. 透析等による除去率.....	22	(3) 調剤時の留意点について.....	28
VIII. 安全性（使用上の注意等）に関する項目	23	5. 承認条件等.....	28
1. 警告内容とその理由.....	23	6. 包 装.....	28
2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）.....	23	7. 容器の材質.....	28
3. 効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由.....	23	8. 同一成分・同効薬.....	29
4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由.....	23	9. 国際誕生年月日.....	29
5. 慎重投与内容とその理由.....	23	10. 製造販売承認年月日及び承認番号.....	29
6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法.....	23	11. 薬価基準収載年月日.....	29
7. 相互作用.....	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.....	29
(1) 併用禁忌とその理由.....	23	13. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容.....	29
(2) 併用注意とその理由.....	24	14. 再審査期間.....	29
8. 副作用.....	24	15. 投薬期間制限医薬品に関する情報.....	29
(1) 副作用の概要.....	24	16. 各種コード.....	29
(2) 重大な副作用と初期症状.....	24	17. 保険給付上の注意.....	29
(3) その他の副作用.....	24	XI. 文 献	30
(4) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常一覧.....	24	1. 引用文献.....	30
(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.....	24	2. その他の参考文献.....	30
(6) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法.....	25	XII. 参考資料	31
9. 高齢者への投与.....	25	1. 主な外国での発売状況.....	31
10. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与.....	25	2. 海外における臨床支援情報.....	31
11. 小児等への投与.....	25	XIII. 備 考	32
12. 臨床検査結果に及ぼす影響.....	25	その他の関連資料.....	32
13. 過量投与.....	25		
14. 適用上の注意.....	25		
15. その他の注意.....	26		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

タムスロシン塩酸塩は、前立腺・尿道平滑筋に選択的に作用するスルファモイルフェネチルアミン誘導体の α_1 受容体遮断薬であり、前立腺肥大症に伴う排尿障害の治療薬として本邦では2005年6月に上市されている。

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg「KN」及びタムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」は、小林化工株式会社が後発医薬品として開発を企画し、平成17年3月31日 薬食発第0331015号に基づき、規格及び試験方法を設定して加速試験、生物学的同等性試験を実施し、2015年8月に承認を取得し、2015年12月に販売を開始した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

- (1) 尿道平滑筋の α_1 受容体遮断作用により尿道の緊張を緩和し、排尿困難を改善する。
- (2) 1日1回投与で、効果を発揮する。
- (3) 唾液のみで服用が可能である。
- (4) 錠剤に製品名と有効成分の含量を両面印刷し、判別しやすくしている。
- (5) PTPシートはピッチコントロールを行い、製品名と有効成分の含量の表示を識別しやすくしている。また、PTPシート上部に「飲みはじめた日」記載表示欄を表示しました。
- (6) 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。

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 「KN」

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「KN」

(2)洋 名

TAMSULOSIN HYDROCHLORIDE OD TABLETS 0.1mg 「KN」

TAMSULOSIN HYDROCHLORIDE OD TABLETS 0.2mg 「KN」

(3)名称の由来

通知「平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号」に基づき設定した

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)

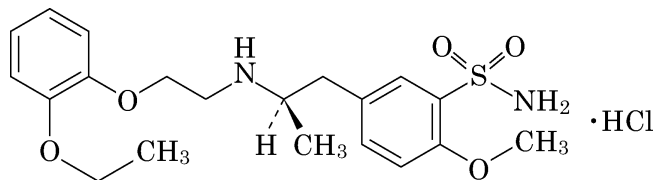
Tamsulosin Hydrochloride (JAN)

Tamsulosin (INN)

(3)ステム

血圧降下剤、プラゾシン誘導体：-azosin 関連

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₀H₂₈N₂O₅S·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

開発番号：KTAM (OD) 0.1 (タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「KN」)

KTAM (OD) 0.2 (タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「KN」)

7. CAS 登録番号

106133-20-4 (Tamsulosin)

106463-17-6 (Tamsulosin(*R*)-Form Hydrochloride)

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

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。本品 1g はギ酸約 2mL、水約 85mL、酢酸（100）約 800mL に溶ける。

溶解度¹⁾

試験液 (37℃)	溶解度
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²⁾

本薬を 25℃で相対湿度 84%及び 93%の条件下に保存し、その重量を測定した結果、7 日後の重量変化率はそれぞれ 0.05%及び 0.04%であり、吸湿性を示さなかった。

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

約 230℃（分解）

(5) 酸塩基解離定数

pKa₁ : 8.37（第二アミノ基、滴定法）

pKa₂ : 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

該当資料なし

3. 有効成分の確認試験法

日本薬局方タムスロシン塩酸塩の確認試験法による。

(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、外観及び性状

販売名	有効成分	剤形	色	外形			識別コード
				直径 (mm)	厚さ (mm)	重さ (mg)	
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg「KN」	1錠中 タムスロシン塩酸塩 (日局) 0.1mg	素錠 (口腔内崩壊錠)	白色				タムスロシン OD 0.1 KN
				約 7.6	約 3.2	約 130	
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」	1錠中 タムスロシン塩酸塩 (日局) 0.2mg	素錠 (口腔内崩壊錠)	白色				タムスロシン OD 0.2 KN
				約 8.6	約 4.3	約 220	

(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「KN」: タムスロシン OD 0.1 KN

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」: タムスロシン OD 0.2 KN

(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「KN」: 1錠中日本薬局方タムスロシン塩酸塩 0.1mg を含有

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」: 1錠中日本薬局方タムスロシン塩酸塩 0.2mg を含有

(2) 添加物

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、ポリソルベート 80、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、セタノール、D-マンニトール、トウモロコシデンプン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウム

(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

IV. 製剤に関する項目

4. 製剤の各種条件下における安定性

(1) 加速条件下での安定性試験

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 ヶ月）の結果、タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「KN」及びタムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「KN」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。

PTP 包装

試験項目〔規格値〕	40±2℃、75±5%RH				
	開始時	1 ヶ月後	3 ヶ月後	6 ヶ月後	
性状〔白色の素錠〕	適	適	適	適	
確認試験（紫外可視吸光度測定法）〔※1〕	適	適	適	適	
純度試験（液体クロマトグラフィー）	適	適	適	適	
製剤均一性試験〔判定値 15.0%以内〕	適			適	
崩壊試験〔30 秒以内〕	適	適	適	適	
溶出試験（1）〔pH1.2、50rpm、30 分、75%以上〕	適	適	適	適	
溶出試験（2）〔※2〕	適	適	適	適	
定量〔94.0～106.0%〕※3 （平均含有率（%）±C.V.）	OD 錠 0.1mg	101.1±2.4	100.6±2.3	100.1±1.9	99.8±2.4
	OD 錠 0.2mg	102.7±1.2	101.2±1.2	101.3±0.9	102.0±1.6

※1：波長 222～226nm 及び 278～282nm に吸収の極大

※2：OD 錠 0.1mg：pH6.8、50rpm、30 分、10～40%、60 分、35～65%、240 分、75%以上

OD 錠 0.2mg：pH6.8、50rpm、30 分、10～40%、60 分、35～65%、300 分、75%以上

※3：3Lot の平均値

(2) 無包装状態の安定性

タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「KN」及びタムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「KN」の無包装の製剤について、各種条件下で保存し、安定性試験〔性状、崩壊試験、溶出試験、定量〕を行った。

	試験条件	結果	
		OD 錠 0.1mg 「KN」	OD 錠 0.2mg 「KN」
温度	40℃、3 ヶ月、褐色ガラス瓶（開栓）	変化なし	
湿度	25℃、75%RH、3 ヶ月、無色ガラス瓶（開栓）	変化なし	
光	総照射量 120 万 Lux・hr、ガラスシャーレ（開放）	変化なし	

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）

該当しない

7. 溶出性⁴⁾

後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドラインに基づく溶出試験

1) タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「KN」

「含量が異なる経口固形剤の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発 0229 第 10 号）」に基づき、試験を実施した。

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」及び「崩壊試験装置法」による。

標準製剤：タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「KN」

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第1液
 pH5.0 薄めた McIlvaine の緩衝液
 水 日本薬局方精製水
 pH7.5 薄めた McIlvaine の緩衝液
 pH7.5 薄めた McIlvaine の緩衝液（ポリソルベート 80 0.1% (w/v) 添加）

パドル法

回転数：50rpm（pH1.2、pH5.0、pH7.5、pH7.5 ポリソルベート 80 0.1% (w/v) 添加、水）
 100rpm、200rpm（pH7.5）

崩壊試験装置法

ストローク数：30spm（pH7.5 ディスク有、pH7.5 ディスク無）

判定基準：ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って同等性を判定した。

【pH1.2、50rpm】、【水、50rpm】：

平均溶出率：標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 50%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±6%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 61 以上である。ただし、規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 10%以下の場合、規定された試験時間でのみ評価し、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±6%の範囲にある。

個々の溶出率：

標準製剤の平均溶出率が 50%に達しないとき、試験製剤の平均溶出率±9%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±15%の範囲を超えるものはない。

【pH5.0、50rpm】：

平均溶出率：標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 50%以上 80%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の 1/2 の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±8%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 55 以上である。

個々の溶出率：

標準製剤の平均溶出率が 50%以上 80%に達しないとき、試験製剤の平均溶出率±12%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±20%の範囲を超えるものはない。

【pH7.5、50rpm】、【pH7.5、50rpm ポリソルベート 80 0.1% (w/v) 添加】、【pH7.5、100rpm】、【pH7.5、200rpm】、【pH7.5、30spm（ディスク有）】、【pH7.5、30spm（ディスク無）】：

平均溶出率：標準製剤が 30 分以内に平均 85%以上溶出しない場合

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が 80%以上に達するとき、標準製剤の平均溶出率が 30%、50%、80%附近の適当な 3 時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあるか、又は f2 関数の値が 50 以上である。

個々の溶出率：

標準製剤の平均溶出率が 80%以上に達するとき、試験製剤の平均溶出率±15%の範囲を超えるものが 12 個中 1 個以下で、±25%の範囲を超えるものはない。

IV. 製剤に関する項目

試験結果:すべての溶出試験条件において「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」の判定基準に適合した。

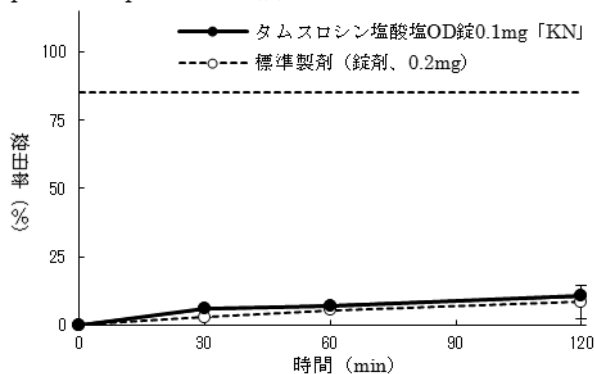
溶出挙動における同等性 (タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「KN」 及び標準製剤の平均溶出率の比較)

試験条件				溶出時間 (分)	平均溶出率(%)				判定	判定基準(タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「KN」 の溶出条件)			
方法	試験液	界面活性剤*	回転数		タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg 「KN」	標準製剤 (錠剤、0.2mg)	差 (絶対値)	f2 関数					
パドル法	pH1.2	無添加	50rpm	120	10.6	8.5	2.1	84.2	適	±6%			
				180	39.1	37.5	1.6		適				
	pH5.0			1440	84.7	75.6	9.1	84.2	適	±8%又は f2 関数 ≥ 55			
				540	15.9	13.9	2.0		適				
	pH7.5			pH7.5	添加	50rpm	1440	28.2	29.0	0.8	84.2	適	±6%又は f2 関数 ≥ 61
							60	34.5	31.0	3.5		適	
	pH7.5			pH7.5	添加	50rpm	120	54.9	53.9	1.0	84.2	適	±10%又は f2 関数 ≥ 50
							360	80.6	81.1	0.5		適	
	pH7.5			pH7.5	添加	50rpm	45	33.9	29.5	4.4	84.2	適	±10%又は f2 関数 ≥ 50
							90	55.1	49.5	5.6		適	
	pH7.5			pH7.5	添加	50rpm	360	88.6	83.6	5.0	84.2	適	±10%又は f2 関数 ≥ 50
							30	29.7	27.8	1.9		適	
	pH7.5			pH7.5	無添加	100rpm	60	48.7	47.2	1.5	84.2	適	±10%又は f2 関数 ≥ 50
							240	81.7	81.6	0.1		適	
pH7.5	pH7.5	無添加	200rpm	30	31.2	27.3	3.9	84.2	適	±10%又は f2 関数 ≥ 50			
				60	50.5	46.3	4.2		適				
pH7.5	pH7.5	無添加	200rpm	240	84.1	80.4	3.7	84.2	適	±10%又は f2 関数 ≥ 50			
				30	29.4	25.7	3.7		適				
崩壊試験装置法	pH7.5	無添加	30spm ディスク有	60	54.2	44.3	9.9	52.2	適	±10%又は f2 関数 ≥ 50			
				240	86.9	81.9	5.0		適				
				30	28.6	26.1	2.5		適				
				60	52.9	45.7	7.2		適				
				180	88.4	78.0	10.4		適				
				30spm ディスク無	60	52.9	45.7		7.2		適		

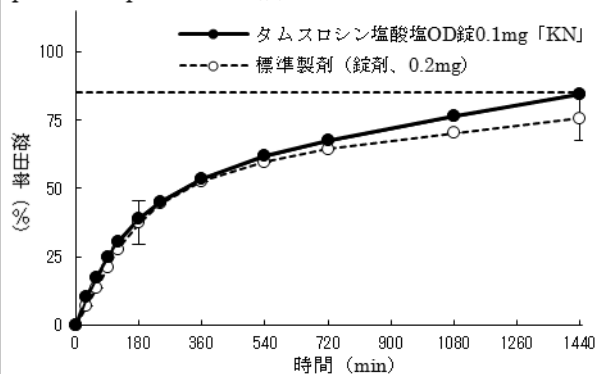
※: ポリソルベート 80 0.1% (w/v)

(溶出曲線)

pH1.2/50rpm パドル法

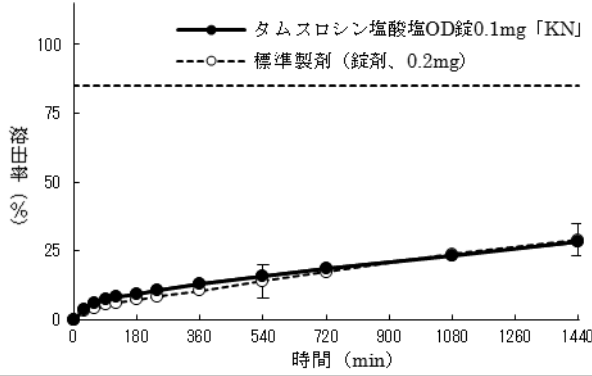


pH5.0/50rpm パドル法

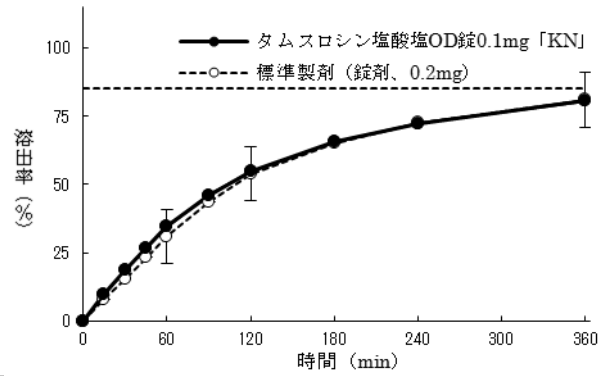


f2 関数 ≥ 55

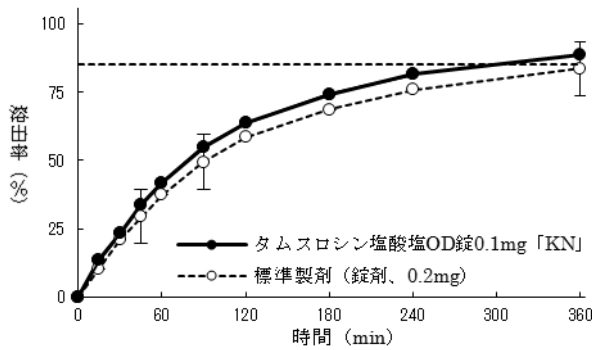
水/50rpm パドル法



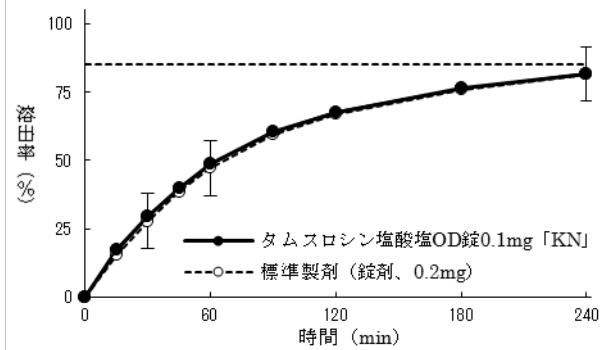
pH7.5/50rpm パドル法



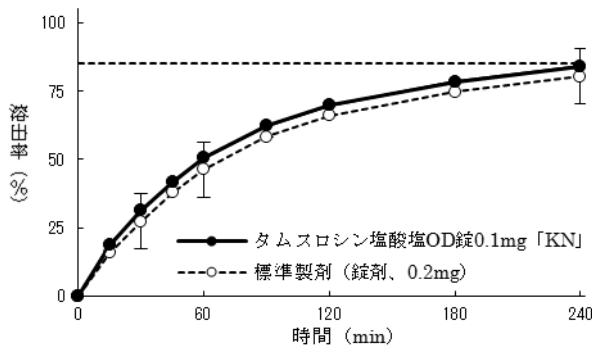
pH7.5/50rpm パドル法
(ポリソルベート80添加)



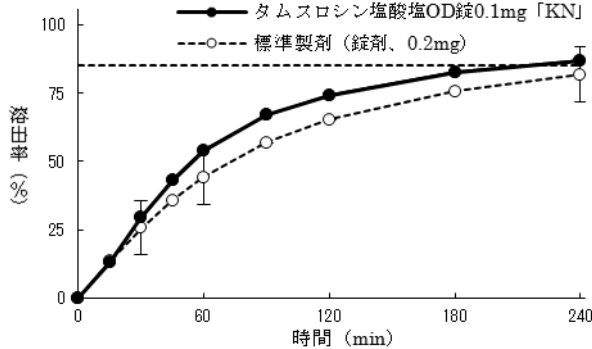
pH7.5/100rpm パドル法



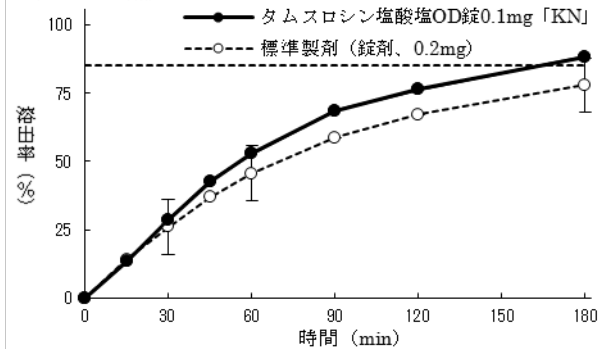
pH7.5/200rpm パドル法



pH7.5/30spm 崩壊試験装置法
(ディスク有)



pH7.5/30spm 崩壊試験装置法
(ディスク無)



f2 関数 ≥ 55

IV. 製剤に関する項目

最終比較時点でのタムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「KN」 の個々の溶出率 (%)

パドル法	pH1.2/ 50rpm	最終比較時点：120分			平均溶出率：10.6%			上限：19.6%			下限：1.6%			判定
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	適
		11.4	11.3	11.3	10.8	9.8	9.6	9.8	10.6	11.2	10.6	10.3	10.0	
	pH5.0/ 50rpm	最終比較時点：1440分			平均溶出率：84.7%			上限：96.7%			下限：72.7%			判定
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	適
		84.4	75.4	83.7	88.5	88.1	83.5	91.9	86.9	84.2	86.8	80.6	82.7	
	水 / 50rpm	最終比較時点：1440分			平均溶出率：28.2%			上限：37.2%			下限：19.2%			判定
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	適
		32.8	31.2	24.7	27.9	28.6	30.5	29.0	26.1	27.3	26.7	26.5	27.5	
	pH7.5/ 50rpm	最終比較時点：360分			平均溶出率：80.6%			上限：95.6%			下限：65.6%			判定
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	適
		85.8	77.7	80.5	79.3	79.2	79.2	79.4	80.0	81.4	81.2	82.7	81.2	
pH7.5*/ 50rpm	最終比較時点：360分			平均溶出率：88.6%			上限：103.6%			下限：73.6%			判定	
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	適	
	89.3	88.8	87.7	88.6	88.9	93.1	88.1	93.5	88.0	88.7	85.7	83.1		
pH7.5/ 100rpm	最終比較時点：240分			平均溶出率：81.7%			上限：96.7%			下限：66.7%			判定	
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	適	
	85.2	78.8	82.6	85.1	80.4	83.6	78.9	82.3	79.8	82.9	78.7	82.6		
pH7.5/ 200rpm	最終比較時点：240分			平均溶出率：84.1%			上限：99.1%			下限：69.1%			判定	
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	適	
	85.4	86.2	85.1	79.2	83.2	87.5	81.4	80.5	83.6	82.0	83.5	92.1		
崩壊試験装置法	pH7.5/ 30spm ディスク有	最終比較時点：240分			平均溶出率：86.9%			上限：101.9%			下限：71.9%			判定
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	適
	pH7.5/ 30spm ディスク無	92.2	82.1	85.5	84.0	92.9	83.5	99.1	85.7	84.2	83.2	85.3	85.1	
		最終比較時点：180分			平均溶出率：88.4%			上限：103.4%			下限：73.4%			判定
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	適
97.7	81.2	94.2	81.0	81.1	95.5	89.4	81.3	93.7	83.5	88.8	93.1			

2) タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「KN」

「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン（平成 24 年 2 月 29 日 薬食審査発第 0229 第 10 号）」に基づき、試験を実施した。

試験方法：日局一般試験法「溶出試験法パドル法」及び「崩壊試験装置法」による。

試験条件：

試験液量：900mL 温度：37±0.5℃

試験液：pH1.2 日本薬局方溶出試験第 1 液

pH3.0 薄めた McIlvaine の緩衝液

水 日本薬局方精製水

pH7.5 薄めた McIlvaine の緩衝液

pH7.5 薄めた McIlvaine の緩衝液（ポリソルベート 80 0.1% (w/v) 添加）

パドル法

回転数：50rpm (pH1.2、pH3.0、pH7.5、pH7.5 ポリソルベート 80 0.1% (w/v) 添加、水)
100rpm、200rpm (pH7.5)

崩壊試験装置法

ストローク数：30spm (pH7.5 ディスク有、pH7.5 ディスク無)

判定基準：ガイドラインの判定基準のうち、次の該当する項目に従って類似性を判定した。

【pH1.2、50rpm】、【水、50rpm】：

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が50%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあるか、又はf2関数の値が53以上である。ただし、規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が10%以下の場合、規定された試験時間でのみ評価し、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にある。

【pH3.0、50rpm】：

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が50%以上80%に達しないとき、標準製剤が規定された試験時間における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す適当な時点、及び規定された試験時間において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあるか、又はf2関数の値が46以上である。

【pH7.5、50rpm】、【pH7.5、50rpm ポリソルベート80 0.1% (w/v) 添加】、【pH7.5、100rpm】、【pH7.5、200rpm】、【pH7.5、30spm (ディスク有)】、【pH7.5、30spm (ディスク無)】：

規定された試験時間において標準製剤の平均溶出率が80%以上に達するとき、標準製剤の平均溶出率が30%、50%、80%附近の適当な3時点において、試験製剤の平均溶出率が標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあるか、又はf2関数の値が42以上である。

試験結果：すべての溶出試験条件において「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」の判定基準に適合した。

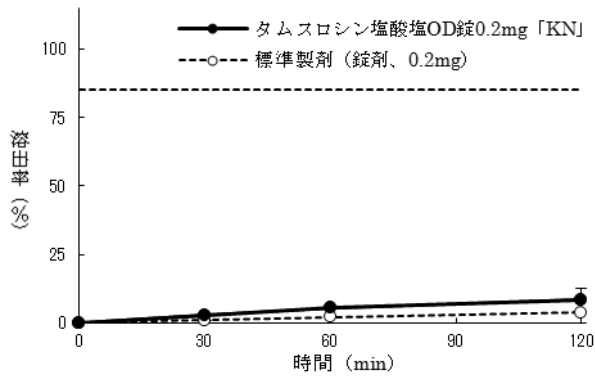
溶出挙動における類似性（タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」及び標準製剤の平均溶出率の比較）

方法	試験条件			溶出時間(分)	平均溶出率(%)				判定	判定基準(タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」の溶出条件)		
	試験液	界面活性剤*	回転数		タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」	標準製剤 (錠剤、0.2mg)	差 (絶対値)	f2 関数				
パドル法	pH1.2	無添加	50rpm	120	8.5	3.8	4.7	46.0	適	±9%		
	pH3.0			240	25.6	35.1	9.5		適		±12%又はf2関数≥46	
	水			1440	56.9	71.9	15.0	46.0	適	±9%又はf2関数≥53		
				240	8.3	16.6	8.3					
	pH7.5			50rpm	1440	29.0	33.4	4.4	46.0	適	±15%又はf2関数≥42	
					45	24.3	31.7	7.4				
					60	31.9	44.6	12.7				
	pH7.5			添加	50rpm	180	63.2	78.2	15.0	46.0	適	±15%又はf2関数≥42
						45	29.5	31.8	2.3			
						60	37.5	47.5	10.0			
	pH7.5			無添加	100rpm	180	68.7	82.8	14.1	46.0	適	±15%又はf2関数≥42
						30	27.8	32.7	4.9			
45		38.5	46.4			7.9						
200rpm		180	75.9		81.3	5.4	46.0	適				
		30	27.3		34.1	6.8						
		45	37.9		47.8	9.9						
崩壊試験装置法	pH7.5	無添加	30spm ディスク有	180	74.7	83.2	8.5	46.0	適	±15%又はf2関数≥42		
				30	25.7	32.0	6.3					
				45	35.8	46.8	11.0					
			30spm ディスク無	120	67.3	77.3	10.0	46.0	適			
				30	26.1	35.2	9.1					
				45	37.0	49.4	12.4					

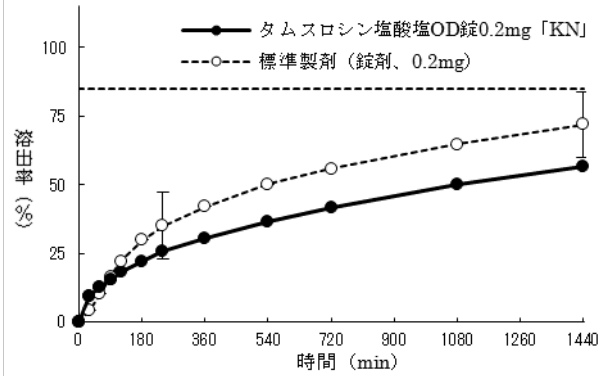
※：ポリソルベート80 0.1% (W/V)

(溶出曲線)

pH1.2/50rpm パドル法

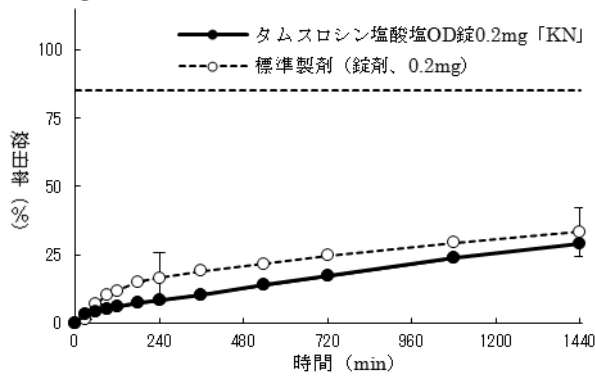


pH3.0/50rpm パドル法

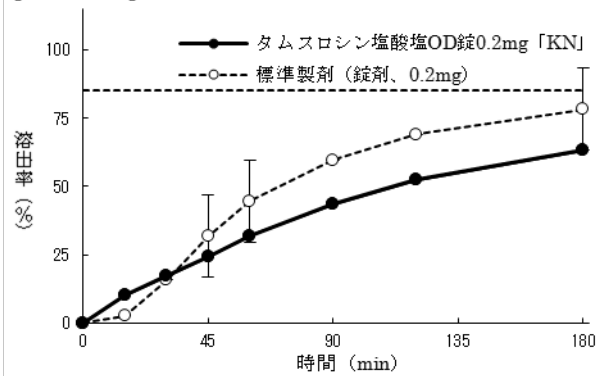


f2 関数 ≥ 55

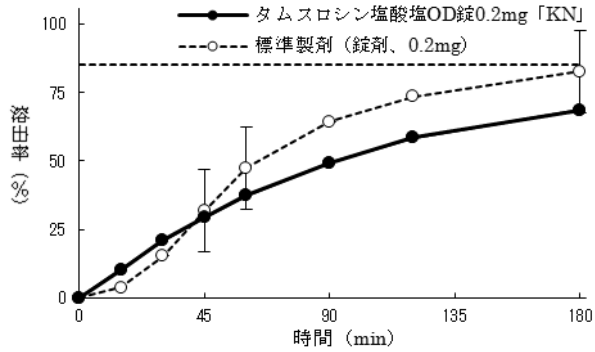
水/50rpm パドル法



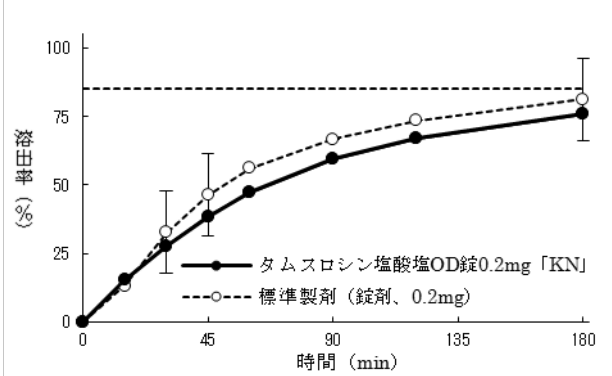
pH7.5/50rpm パドル法



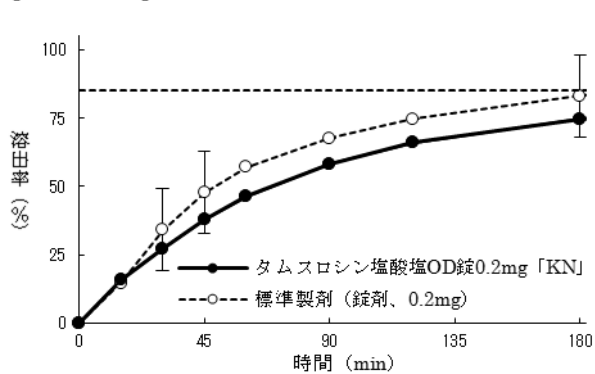
pH7.5/50rpm パドル法
(ポリソルベート80添加)

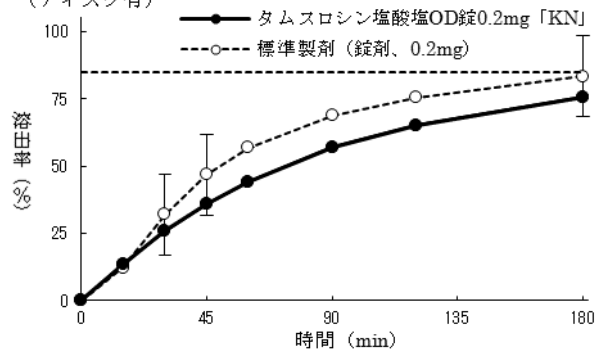
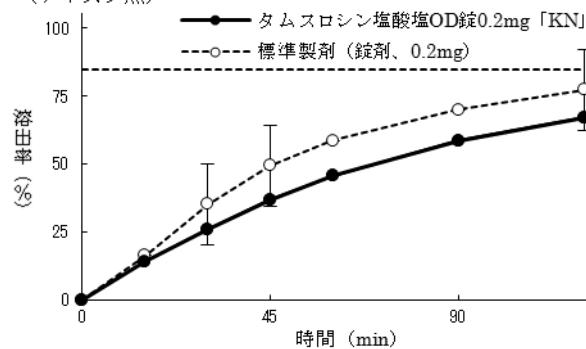


pH7.5/100rpm パドル法



pH7.5/200rpm パドル法



pH7.5/30spm 崩壊試験装置法
(ディスク有)pH7.5/30spm 崩壊試験装置法
(ディスク無)

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

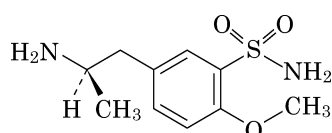
紫外可視吸光度測定法

10. 製剤中の有効成分の定量法

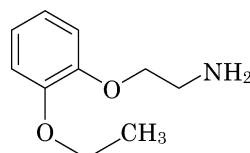
液体クロマトグラフィー

11. 力 価

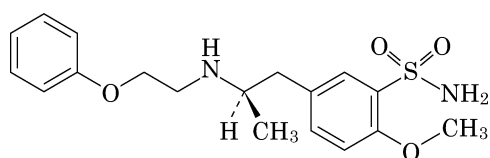
該当しない

12. 混入する可能性のある夾雑物⁶⁾

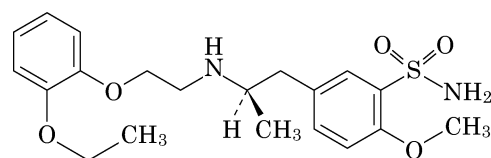
[1]



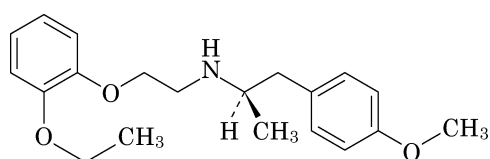
[2]



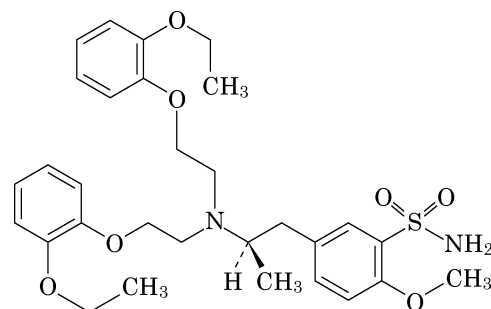
[3]



[4]



[5]



[6]

IV. 製剤に関する項目

13. 注意が必要な容器・外観が特殊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

該当資料なし

(2)臨床効果

該当資料なし

(3)臨床薬理試験

該当資料なし

(4)探索的試験

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

配当資料なし

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・特定使用成績調査（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

シロドシン、ナフトピジル、ウラピジル、テラゾシン塩酸塩水和物、プラゾシン塩酸塩

2. 薬理作用

(1)作用部位・作用機序

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)薬効を裏付ける試験成績²⁾

ヒトでの作用：

ヒト前立腺標本での受容体結合実験において、プラゾシン塩酸塩より 2.2 倍、フェントラミンメシル酸塩より 40 倍強い α_1 受容体遮断作用を示した。

<参考：動物>

動物での作用：

交感神経 α 受容体遮断作用：ラット脳膜標本での受容体結合実験および摘出ウサギ大動脈標本での摘出実験において、 α_1 受容体を選択的かつ競合的に遮断し、その作用はプラゾシン塩酸塩より 1/2.2~22 倍、フェントラミンメシル酸塩より 45~140 倍強力であった。なお、摘出ウサギ大動脈、摘出ラット輸精管及び摘出モルモット腸管での摘出実験において、本薬は α_2 受容体よりも α_1 受容体に対して 5400~24000 倍の選択性を示した。

下部尿路（尿道・膀胱）及び前立腺に対する作用：摘出ウサギ尿道、前立腺及び膀胱基部平滑筋標本での摘出実験において、プラゾシン塩酸塩より 23~98 倍、フェントラミンメシル酸塩より 87~320 倍強い α_1 受容体遮断作用を示した。また、麻酔イヌにおいて、 α_1 受容体刺激薬による尿道内圧上昇を拡張期血圧上昇よりも 13 倍強く抑制した。

排尿障害改善作用：麻酔雄性イヌにおいて、尿道内圧曲線の前立腺部圧を低下させた。一方、麻酔ラットにおいて、律動的膀胱収縮および膀胱内圧曲線に影響を及ぼさなかった。

(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⁵⁾

健康成人男子 1錠投与時

	水で服用した場合 (絶食時)	水なしで服用した場合 (絶食時)	水なしで服用した場合 (食後)
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg「KN」	該当資料なし	該当資料なし	該当資料なし
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」	3.9±0.9 時間	4.3±0.9 時間	5.6±1.7 時間

(Mean±S.D., n=16)

(3)臨床試験で確認された血中濃度

生物学的同等性試験

1) タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg「KN」⁴⁾

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.1mg「KN」は、「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24年2月29日 薬食審査発0229第10号)」に基づき、タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」を標準製剤としたとき、溶出挙動が等しく、生物学的に同等とみなされた。

「IV.7. 溶出性 1)」の項を参照

2) タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「KN」⁵⁾

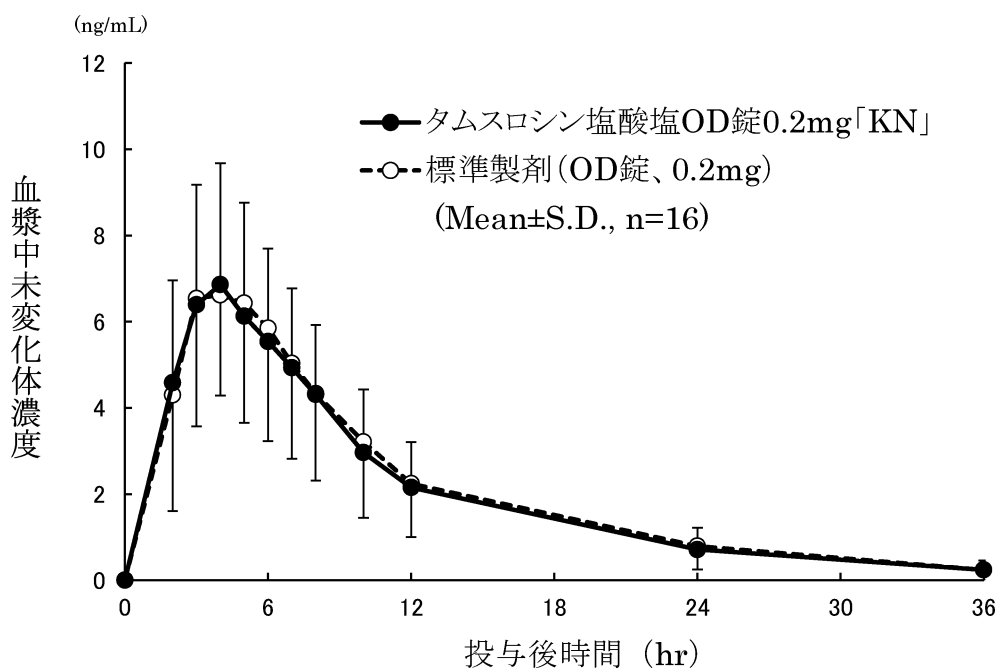
i) 絶食時投与（水で服用した場合）

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「KN」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それぞれ0.2mg）を健康成人男子に絶食時単回経口投与（水 150mLで服用）して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）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)～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。

薬物動態パラメータ

	AUC ₀₋₃₆ (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg 「KN」	74.10±33.75	7.23±2.85	3.9±0.9	6.6±1.4
標準製剤（OD錠、0.2mg）	76.40±27.76	7.31±2.55	3.9±1.2	7.2±1.6

(Mean±S.D., n=16)



血漿中未変化体濃度推移

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

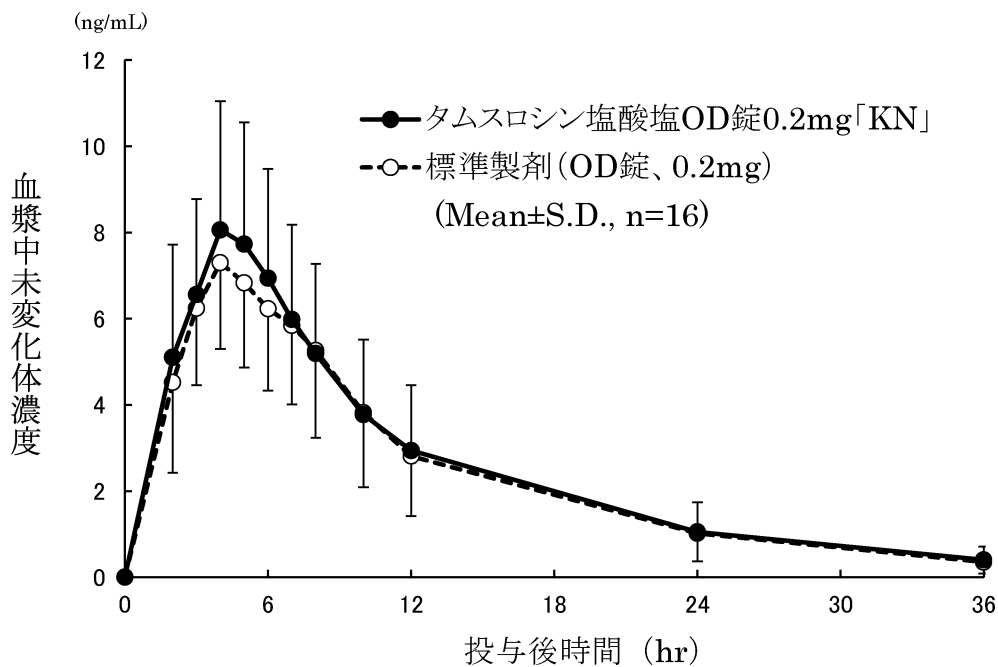
ii) 絶食時投与（水なしで服用した場合）

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」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それぞれ0.2mg）を健康成人男子に絶食時単回経口投与（水なしで服用）して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、 C_{max} ）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。

薬物動態パラメータ

	AUC ₀₋₃₆ (ng·hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」	93.84±39.98	8.69±2.85	4.3±0.9	7.4±1.4
標準製剤（OD錠、0.2mg）	88.79±31.87	8.08±1.80	4.1±1.1	7.2±1.3

(Mean±S.D., n=16)



血漿中未変化体濃度推移

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

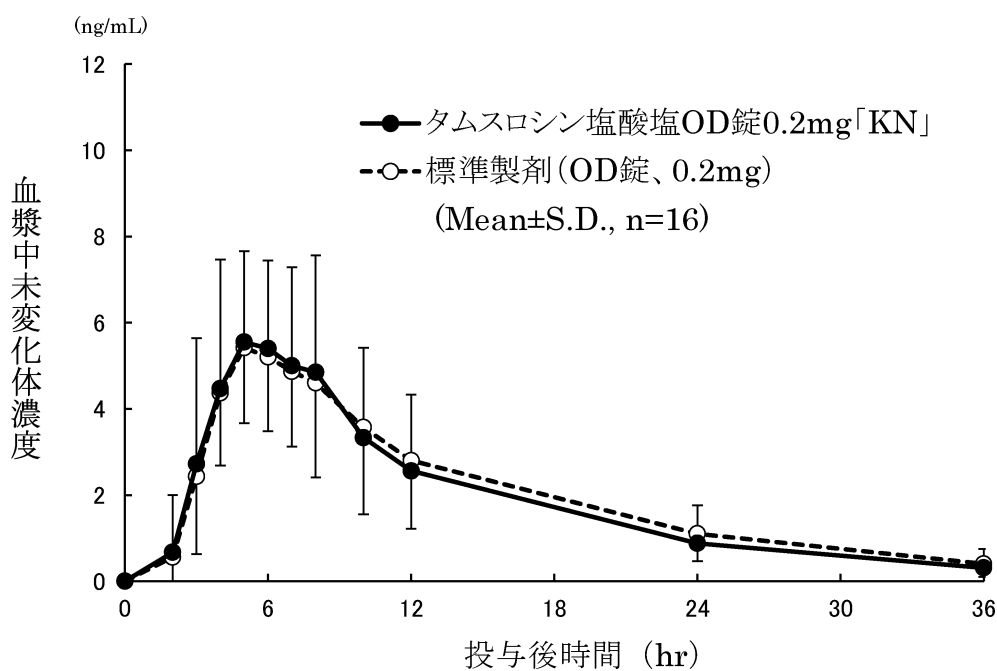
iii) 食後投与（水なしで服用した場合）

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」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それぞれ0.2mg）を健康成人男子に食後単回経口投与（水なしで服用）して血漿中未変化体濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ（AUC、C_{max}）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)~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。

薬物動態パラメータ

	AUC ₀₋₃₆ (ng·hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	T _{max} (hr)	t _{1/2} (hr)
タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」	68.42±29.04	6.62±2.62	5.6±1.7	8.0±1.4
標準製剤（OD錠、0.2mg）	72.36±31.27	6.08±1.83	5.6±1.8	8.1±1.6

(Mean±S.D., n=16)



血漿中未変化体濃度推移

血漿中濃度並びに AUC、C_{max}等のパラメータは、被験者の選択、血液の採取回数・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)解析方法

Moment 法

(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⁶⁾

タムスロシン塩酸塩のバイオアベイラビリティは食事の摂取によりやや低下する。

(4) 消失速度定数⁵⁾

健康成人男子単回投与（1錠）

	タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「KN」		
	絶食時・水で服用 (n=16)	絶食時・水なしで服用 (n=16)	食後・水なしで服用 (n=16)
Kel (hr ⁻¹)	0.1101±0.02546	0.0971±0.01696	0.0895±0.01546

(Mean±S.D.)

(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⁶⁾

95%

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) 乳汁への移行性

該当資料なし

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⁶⁾

主たる代謝は、芳香環に置換したエトキシ基の *O*-脱エチル化、側鎖の酸化的脱アミノ化、さらに生成した代謝物の硫酸抱合またはグルクロン酸抱合等である。

(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

VII. 薬物動態に関する項目

(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. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

8. 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）

【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

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. 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）

6. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

2. 重要な基本的注意

- (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

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

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。
--

(2)重大な副作用と初期症状

4. 副作用
(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

4. 副作用	
(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、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

【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

4. 副作用

(2) その他の副作用

	頻度不明
過敏症 ^{注)}	そう痒感、発疹、蕁麻疹、多形紅斑、血管浮腫

注) 投与を中止すること。

9. 高齢者への投与

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

該当しない

11. 小児等への投与

該当しない

12. 臨床検査結果に及ぼす影響

該当資料なし

13. 過量投与

該当資料なし

14. 適用上の注意

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：

- 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) 本剤は舌の上のに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。

15. その他の注意

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。

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

該当資料なし

(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：処方箋医薬品（注意－医師等の処方箋により使用すること）

有効成分：劇薬

2. 有効期間又は使用期限

使用期限：3年（安定性試験結果に基づく）

3. 貯法・保存条件

室温保存、気密容器

「取扱い上の注意」

開封後は湿気を避けて保存すること。

使用期限内であっても開封後はなるべく速やかに使用すること。

4. 薬剤取扱い上の注意点

(1) 薬局での取扱い上の留意点について

該当資料なし

(2) 薬剤交付時の取扱いについて（患者等に留意すべき必須事項等）

患者向医薬品ガイド：なし、くすりのしおり：あり

「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」及び「X.3.貯法・保存条件」の項を参照

(3) 調剤時の留意点について

「X.3.貯法・保存条件」の項を参照

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「KN」：(PTP)140錠（14錠×10）

タムスロシン塩酸塩 OD錠 0.2mg「KN」：(PTP)140錠（14錠×10）

7. 容器の材質

P T P包装：環状オレフィンコポリマー（COC）、アルミ箔、アルミ袋

バラ包装：ポリエチレン容器、ポリプロピレン蓋

化粧箱：紙

8. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ハルナール D 錠 0.1mg、ハルナール D 錠 0.2mg（アステラス製薬株式会社）

同効薬：シロドシン、ナフトピジル、ウラピジル、テラゾシン塩酸塩水和物、プラゾシン塩酸塩

9. 国際誕生年月日²⁾

1993年7月

10. 製造販売承認年月日及び承認番号

製品名	製造販売承認年月日	承認番号
タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.1mg 「KN」	2015年8月17日	22700AMX00976000
タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「KN」	2015年8月17日	22700AMX00977000

11. 薬価基準収載年月日

2015年12月11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

本剤は厚生労働大臣の定める「投薬期間に上限が設けられている医薬品」に該当しない。

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 「KN」	124447202	2590008F1174	622444701
タムスロシン塩酸塩 OD 錠 0.2mg 「KN」	124448902	2590008F2170	622444801

17. 保険給付上の注意

本剤は保険診療上の後発医薬品である。

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 2008;No.29:190
- 2) 日本薬局方医薬品情報 2011 (日本薬剤師研修センター編) 2011:1043-1047
- 3) 社内資料 (安定性)
- 4) 社内資料 (溶出性)
- 5) 社内資料 (生物学的同等性)
- 6) 第十七改正日本薬局方解説書 廣川書店 2016:C2955-2959

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当資料なし

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XIII. 備 考

その他の関連資料

〔文献請求先・製品情報お問い合わせ先〕
第一三共エスファ株式会社 お客様相談室
〒103-8426 東京都中央区日本橋本町 3-5-1
TEL:0120-100-601