

## ◎ハルナーレD錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】タムスロシン塩酸塩 (U) Tamsulosin Hydrochloride 【分類】前立腺肥大症の排尿障害改善剤 [α1受容体遮断剤]

【単位】◎0.1mg・◎0.2mg/錠

【常用量】0.2mg/日

【用法】分1食後■D錠は噛み砕かず服用する [徐放性粒を含有のため]

【透析患者への投与方法】尿中排泄率が低いため減量の必要はないと思われるが慎重投与 (5)

【その他の報告】腎機能障害のある患者では血中濃度が過度に上昇するおそれがあるため慎重投与 (1) データが少ないが0.4mg/日 (17)

【CRRT】できれば睡ける (17)

【保存期CKD患者への投与方法】腎機能障害では血漿濃度が上昇するため慎重投与 (1)

【その他の報告】腎障害患者での血中濃度上昇は血中AAG濃度上昇に関連している可能性がある (1)

【特徴】下部尿路平滑筋のα1受容体を遮断して弛緩作用を示す。前立腺肥大症に伴う排尿困難、夜間頻尿、残尿感などの排尿障害の自覚症状および尿流動感を改善する。臓器選択性を高めるためR(-)体の徐放性製剤である。血管平滑筋のα1受容体への親和性は前立腺・尿道平滑筋のα1受容体への1/10以下。尿路結石の排石促進目的に用いられることがある [男性]。

【主な副作用・毒性】失神、意識喪失、肝機能障害、黄疸、めまい、頭痛、眠気、血圧低下、頻脈、不整脈、動悸、搔痒感、発疹、蕁麻疹、胃部不快感、口渇、鼻閉、浮腫、尿失禁、味覚異常、女性化乳房、持続勃起症など。術前の中止は通常必要ないと考えられているが、白内障手術を受ける際には眼科医師に服用していることを伝えるように指導する。

【安全性に関する情報】タムスロシンの白内障術前14日以内の使用は術後眼合併症の発現に関連している (Bell CM, et al: JAMA 301:1991-6, 2009) 白内障術中にはα-blockerを服用していることを眼科医に伝えるように指導する[IFISのリスクのため]。IFISのリスクであるが、術前の服用中止がその防止に有用かどうかは結論が出ていない (Chang DF, et al: J Cataract Refract Surg 34:2153-62, 2008)

【吸収】食後投与でAUCが83%に低下 (1) 食物と同時摂取で低下 (13)

【F】100% (13) 90%以上が吸収される (U)

【tmax】7~8hr (1) 5.3hr, 食物と同時摂取により延長 (13) 【Cmax】健常者に0.4mgを単回経口投与後のCmaxは16ng/mL、食物と同時摂取により低下 (13)

【代謝】CYP3A4とCYP2D6により代謝 (13) 代謝物M1~M4, 副生成物R4には未変化体の1/50~同等の活性あり (1) CYPによる代謝を受け、グルクロン酸抱合、硫酸抱合体として腎排泄される (U)

【排泄】尿中未変化体排泄率12~14% [po, 30hrまで] (1) 12.7% (13) 10%未満 (U) 尿中回収率76%, 糞便中回収率21% (168hrまで) (U)

【CL】0.62mL/min/kgで腎障害, 加齢により低下 (13)

【t1/2】9~11.6hr (1) 6.8hr, 腎障害・加齢により上昇 (13) 5~7hr (U)

【蛋白結合率】95.2~98.1%, AAGと結合する (1) 94~99% (U) 腎不全患者では本剤の血漿濃度が上昇しやすいが、血漿タムスロシン濃度とAAG濃度との間には高い相関が認められる (1, Matsushima H, et al: Eur J Clin Pharmacol 55: 437-43, 1999) 99%, 腎障害で上昇 (13)

【Vd】0.20L/kg (13) 中枢移行は軽度 (U)

【MW】444.97

【透析性】蛋白結合率が高いため透析で除去されにくい (U) 資料なし (1)

【TDMのポイント】TDMの対象にならない

PKに影響する4つのSNP (Takata R, et al: J Hum Genet 2013 PMID: 23151678)

【O/W係数】低い (11) 3.25 [1-オクタノール/buffer, pH6.9] (1) 【pKa】8.37, 10.23

【主な臨床報告】ESWL後の結石排出促進にα遮断薬は有用 (Li M, et al: PLoS One 2015)

ESWLに併用して特に下部尿路結石の排出促進に有用 (Chen K, et al: J Endourol 2015)

9mm未満の尿路結石の排石にプラセボ対照RCTで有効性を示さない (Meltzer AC, et al: JAMA Intern Med 178: 1051-1057, 2018 PMID: 29913020)

長期投与によりα1a, α1d受容体の発現が増加する場合があります。長期での効果の変化に関連するかもしれない (Kojima Y, et al: J Urol 2011 PMID: 21855934)

前立腺におけるα1受容体サブタイプの遺伝的発現量の違いが効果に影響する可能性 (Kojima Y, et al: Prostate 2006 PMID: 16425183)

【更新日】20220512

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。