

前列腺肥大症之排尿障礙改善劑

“強生”易利淨 持續釋放膠囊 0.2毫克

ELEGANT S.R. CAPSULES 0.2mg “JOHNSON” (Tamsulosin HCl)

衛署藥製字第048637號 (GMP G-9534)

- 【組成·性狀】 每粒膠囊中含Tamsulosin HCl 0.2mg
- 【賦形劑】 Corn Starch、Eudragit L-30 D-55、Microcrystalline Cellulose 101、Polyethylene Glycol 6000、Talc、Triethyl Citrate
膠囊殼：Gelatin、New Coccin、Pharmaceutical Printing ink-Red、Sodium Lauryl Sulfate、Tartrazine、Titanium Dioxide
- 【適應症】 前列腺肥大症（增生）所伴隨的排尿障礙。
- 【用法·用量】 本藥須由醫師處方使用。
通常，成人1日1次，於飯後口服投與Tamsulosin Hydrochloride 0.2mg。
另外，依年齡、症狀適宜增減之。

【使用上的注意事項】（依文獻記載）

1. 慎重投與（下列患者請慎重投與）

- (1) 有起立性低血壓的患者（症狀有惡化的可能）。
- (2) 有嚴重的肝機能障礙的患者（血漿中濃度有上昇的可能）。
- (3) 高齡者（請參考〈對高齡者的投與〉之項目）。

2. 重要的注意事項

- (1) 因本劑過量投與被預期會使血壓降低，故應注意投與量。
- (2) 有起立性低血壓的情形，故應注意體位變換而引起之血壓變化。
- (3) 請留意本劑之治療並非病因療法，而是對症狀療法，故在投與本劑如無法得到期待的效果時，請考慮採手術療法等其他適當的處置。
- (4) 曾發生眩暈等情形，故從事高處作業、開車等伴有危險性的作業時，須加注意。
- (5) 本劑投與開始時，須先診察病患有無投與降壓劑，有投與降壓劑時，應注意血壓的變化，出現血壓低下時，應採取減量或中止投與等適當的處置。

3. 交互作用

〔合併投與注意〕（小心投與）

藥品名稱等	臨床症狀·處置方法	機轉·危險因子
降壓劑	因可能發生起立性低血壓，宜注意適宜減量。	服用降壓劑的患者，其起立時有血壓調節力低下現象。

4. 副作用

有關於在日本認證時及市場販賣後的使用結果調查，在調查病例4,724例中懷疑和本劑有相關副作用（包括臨床檢查值異常）發現例數計104例（2.2%）。主要為眩暈、胃部不快感等。

(1) 重大副作用

- 1) 昏厥·意識喪失（頻率不明）：有出現因血壓低下伴隨著暫時性意識喪失等現象，必須充分觀察。認定有異常情況時，本劑應中止投與並且做適當處置。
- 2) 肝機能障礙、黃疸（頻率不明）：有出現AST (GOT) 上昇、ALT (GPT) 上昇、黃疸等現象，必須充分觀察。認定有異常情況時，本劑應中止投與並且做適當處置。

(2) 其他的副作用

	0.1%-5%以下	0.1%以下	頻率不明
精神神經系	眩暈、搖晃感	站立時頭暈、頭痛、嗜眠	急躁感
循環系統		血壓低下、起立性低血壓、頻脈、心悸	不整脈
過敏症(註)		搔癢感、發疹等	蕁麻疹
消化系統	胃部不快感	噁心、嘔吐、口渴、便秘、胃重感、胃痛、食慾不振、下痢	
其他		鼻塞、浮腫、吞嚥障礙、尿失禁、咽頭灼燒感、全身倦怠感	味覺障礙、男性女乳、持久勃起

(註) 中止投與

5. 對高齡者的投與

由於高齡者有時有腎功能低下的情形，對腎功能低下者由0.1mg開始投與，經過充分的觀察後才增量至0.2mg。投與0.2mg治療而無法獲得所預期的效果時，請勿再增量，宜採行其他的適當處置。

6. 適用上的注意

- (1) 服用時：請指導患者勿將膠囊內之顆粒咬碎或將膠囊打開服用。（本劑為 Tamsulosin HCl 之緩釋性顆粒充填於硬膠囊，故可能會改變藥物動態）
- (2) 藥品交付時：PTP 鋁箔包裝之藥劑，請指導患者從 PTP 片中取出服用。（曾有因 PTP 鋁箔片之誤食，硬銳角刺入食道粘膜，進而發生穿孔成縱膈炎等併發嚴重合併症的報告。）

（依文獻記載如下：）

【藥物動力學】

1. 血漿中濃度

對健康成人經口投與本劑 0.1~0.6mg 時，血漿中未代謝之 Tamsulosin HCl 濃度在投藥後 7~8 小時達到最高，其半衰期為 9.0~11.6 小時。Cmax 及 AUC 與投與量大致成比例上昇，本劑連續 7 日經口投與時，其半衰期雖有稍微延長，但血漿中濃度變化於第 4 天達到穩定狀態。

(臨床用量下的值)

劑量 (mg)	Tmax (小時)	Cmax (ng / mL)	半衰期 (小時)
0.1	7.0	3.2	11.6
0.2	8.0	5.7	9.0
0.4	7.0	15.6	10.8
0.6	7.5	15.6	9.8

11名腎功能障礙患者經口投與本劑0.2mg時，未見血壓低下，2名腎功能重度障礙者出現本劑之血漿中藥物濃度之上昇。此血漿中藥物濃度之上昇，有可能是因與血漿中 α_1 -AGP (α_1 酸性糖蛋白)發生蛋白結合所引起，血漿中藥物濃度與 α_1 -AGP濃度之間被認為有高的相關性。且跟本劑之藥效或副作用發現直接有關之非結合型藥物濃度，是與腎功能正常者幾乎同樣，此與血漿中 α_1 -AGP濃度無關。

2. 代謝、排泄

對健康成人經口投與本劑0.1~0.6mg時，投與後30小時為止之未變化體的尿中排泄率為12~14%幾乎一定。另外，連續經口投與時，尿中排泄率亦未出現大變動。

【臨床結果】

有意義地減少前列腺部之尿道內壓，尿流率及殘尿量之改善程度，被認為與劑量有關。整體改善度之解析對象309例之成績如下所示。另外雙盲比較試驗的結果，本劑0.2mg 1日1次投與的有用性已被認定。

投與方法	中等度以上改善
0.1mg 1日1次投與	28.3% (15 / 53)
0.2mg 1日1次投與	42.7% (85 / 199)
0.4mg 1日1次投與	38.6% (22 / 57)

【藥效藥理】(藥理作用)

1. 對人的作用

對人前列腺接受體結合之離體實驗，顯示 α_1 接受體阻斷作用是Prazosin HCl的2.2倍，Phentolamine mesilate的40倍強。

2. 對動物的作用

(1) 交感神經 α 接受體阻斷作用

對大白鼠腦膜標本的接受體結合實驗以及對摘出的兔子大動脈體外的實驗顯示，本藥選擇性地對 α_1 接受體作競爭性地阻斷，此作用是Prazosin HCl的1/ 2.2到22倍，Phentolamine mesilate 45~140倍強，另外，對摘出的兔子大動脈、摘出的大白鼠輸精管及摘出的土撥鼠的腸管的實驗顯示本藥對 α_1 接受體的選擇性是對 α_2 接受體的5,400~24,000倍。

(2) 對下部尿道(尿道、膀胱)及前列腺的作用

對摘出兔子尿道、前列腺及膀胱基部平滑肌之體外實驗顯示，本藥對 α_1 接受體的阻斷作用是Prazosin HCl的23~98倍，Phentolamine mesilate的87~320倍強。

另外，對麻醉狗的實驗顯示本藥對 α_1 接受體作用劑所引起的尿道內壓上昇的抑制，是對舒張壓上昇之抑制的13倍強。

(3) 排尿障礙改善作用

對麻醉雄性狗的實驗顯示，本藥可使尿道內壓曲線的前列腺部壓(the prostatic zone of the intraurethral pressure)降低。另外，對麻醉大白鼠的實驗顯示，本藥不影響規律的膀胱收縮以及膀胱內壓曲線。

(作用機序)

本藥經由尿道及前列腺部之 α_1 接受體之阻斷致使尿道內壓曲線之前列腺部壓降低，而改善前列腺肥大症所伴隨之排尿障礙。

【有關有效成分之理化學的資料】

一般名：tamsulosin hydrochloride

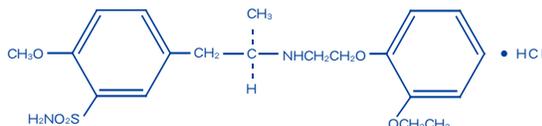
化學名：(-)-(R)-5-[2-[[2-(o-ethoxyphenoxy)ethyl]amino]propyl]-2-methoxybenzenesulfonamide hydrochloride

分子式：C₂₀H₂₈N₂O₅S · HCl

分子量：444.98

融點：約230℃(分解)

構造式：



性 狀：tamsulosin hydrochloride呈白結晶狀，易溶於Formic acid，略溶於水，微溶於ethanol及冰醋酸，幾不溶於ether。

【包裝】 2~1000粒 PTP鋁箔盒裝及塑膠瓶裝。

【保存方式】 1.本藥應置於小兒伸手不及處，以免誤食，造成危險。
2.本藥應貯存於室溫(25℃以下)，避光防潮之緊密容器。
3.請依外包裝標示，於有效期限內使用完畢。



強生化學製藥廠股份有限公司

JOHNSON CHEMICAL PHARMACEUTICAL WORKS CO., LTD.
新北市 241 三重區 三和路 四段 77、79 號
訂貨專線：(02)29894756 FAX：(02)29712579
工廠電話：(02)22878405

Code No.:I-40