

# 速流通® 持續釋放膠囊 0.2 毫克

## Tamsulosin S.R. Capsules 0.2 mg "CYH"

網號：B62

成分名：Tamsulosin Hydrochloride

劑型、含量：Each Capsule contains: Tamsulosin Hydrochloride 0.2 mg

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 0.2 mg。若療效不佳，才增加至 0.4 mg。

每日最大使用劑量為 0.4 mg。

**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 0.1 mg 開始投與，經過充分的觀察後才增量至 0.2 mg。投與 0.2 mg 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。

注意事項：依文獻記載

**1. 禁忌** (以下的患者請勿投與)

對 tamsulosin 或對本藥任何賦形劑過敏者。

姿勢性低血壓病史的患者。

嚴重肝功能不全的患者。

**2. 重要的注意事項：**(1) 與使用其他  $\alpha_1$ -交感神經拮抗劑一樣，個案在使用 tamsulosin 治療期間，可能會發生血壓降低，導致可能發生昏厥 (罕見)，出現姿勢性低血壓的早期徵兆時 (頭暈、無力)，患者應該坐下或躺下直到症狀消失。告知病患開始使用 tamsulosin 治療，應避免可能發生昏厥，導致受傷的情況。

(2) 使用每日最大使用劑量 (0.4 mg) 時，應避免可能發生昏厥導致受傷的情形。

(3) 治療嚴重腎功能不全的患者 (肌酸酐廓清率 &lt; 10 mL/min)，應小心，因為尚未執行這類患者的臨床研究。

(4) 一些正在使用或以前用過 tamsulosin 治療的患者在進行白內障手術期間曾發生虹膜鬆弛症候群 (Intraoperative Floppy Iris Syndrome, 簡稱 IFIS, 一種縮瞳症候群的病變)。虹膜鬆弛症候群可能會增加手術期間過程的合併症，對於已安排要行白內障手術的患者，不建議使用 tamsulosin。進行白內障手術 1-2 週，停止使用 tamsulosin 是認為有幫助的，但在白內障手術前停藥時間之長短與其助益性，尚未確立。

在手術前評估的期間，白內障手術的醫師和眼科團隊，應該考慮已安排白內障手術的患者是否正在使用或以前用過 tamsulosin 治療，以確保手術期間發生虹膜鬆弛症候群時能採取適當措施。

(5) Tamsulosin 主要經由 CYP3A4 與 CYP2D6 廣泛代謝，本藥不可與 CYP3A4 強效抑制劑 (如 ketoconazole) 合併使用。

(6) 請留意本藥之治療並非病因療法，而是對症療法，故在投與本藥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。

(7) 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。

(8) 本藥投與開始時，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：(併用禁忌) (不可併用)**

藥劑名稱等	臨床症狀、處置方法	機轉、危險因子
Vardenafil HC1 (Levitra)	併用時，有低血壓及起立性低血壓發生的報告。	本藥有 $\alpha$ 接受體阻斷作用，併用時會加強 Vardenafil HC1 的血管擴張作用所產生的降壓作用之虞。

**(併用注意) (小心投與)**

藥劑名稱等	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。
Sildenafil Citrate	與其他 $\alpha$ 接受體阻斷劑併用，有暈眩等自覺症狀，並伴有血壓降低發生等的報告。	本藥有 $\alpha$ 接受體阻斷作用，併用時會加強 Sildenafil Citrate 的血管擴張作用所產生的降壓作用之虞。

**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 例中懷疑和本藥有相關連的副作用 (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**

- 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，本藥應中止投與並且做適當處置。
- 肝功能障礙、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。認為有異常情況時，本藥應中止投與並且適當處置。

**(2) 其他副作用**

	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 (>1/1000, <1/100)、頻脈、心悸	不整脈
過敏症 <sup>(註)</sup>		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、吞嚥障礙	
其他		鼻塞、浮腫、尿失禁、咽頭灼燒感、全身倦怠感、射精異常 (>1/1000, <1/100)	味覺障礙、男性女乳、持久勃起

(註) 中止投與

**5. 適用上的注意**

(1) 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，硬銳角刺入食道黏膜，進而發生穿孔或縱膈炎等併發嚴重合併症的報告。)

(2) 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。(本藥 tamsulosin HCl 之緩釋性顆粒充填於硬膠囊，故可能會改變藥物動態)

藥物動物學：依文獻記載

1. 血漿中濃度

對健康成人經口投與本藥 0.1~0.6 mg 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<sup>1)</sup>。Cmax 及 AUC 與投與量大致成比例上昇，本藥連續 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<sup>2)</sup>。

&lt;臨床用量下的值&gt;

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藥 0.2 mg 時，未見血壓低下，2 名腎功能重度障礙者出現本藥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  $\alpha_1$ -AGP ( $\alpha_1$  酸性糖蛋白) 發生蛋白結合所引起，血漿中藥物濃度與  $\alpha_1$ -AGP 濃度之間被認為有高的相關性。且跟本藥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  $\alpha_1$ -AGP 濃度無關<sup>3)</sup>。

2. 代謝、排泄

對健康成人經口投與本藥 0.1~0.6 mg 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<sup>4)</sup>。另外，連續經口投與時，尿中排泄率亦未出現大變動<sup>5)</sup>。

臨床結果：依文獻記載

有意義地減少前列腺部之尿道內壓<sup>6)</sup>，尿流率及殘尿量之改善程度，被認為與劑量有關<sup>5,6)</sup>。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，本藥 0.2 mg 1 日 1 次投與的有用性已被認定<sup>7)</sup>。

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

藥效藥理：依文獻記載

&lt;藥理作用&gt;

1. 對人的作用

對人前列腺接受體結合之離體實驗，顯示其  $\alpha_1$  接受體阻斷作用是 Prazosin HCl 的 2.2 倍，Phentolamine mesilate 的 40 倍強<sup>8)</sup>。

2. 對動物的作用

(1) 交感神經  $\alpha$  接受體阻斷作用<sup>9,10)</sup>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  $\alpha_1$  接受體作競爭性地阻斷，此作用是 Prazosin HCl 的 1/2.2 到 22 倍，是 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  $\alpha_1$  接受體的選擇性是對  $\alpha_2$  接受體的 5,400~24,000 倍。

(2) 對下部尿路 (尿道、膀胱) 及前列腺的作用 11~13)

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  $\alpha_1$  接受體的阻斷作用是 Prazosin HCl 的 23~98 倍，Phentolamine mesilate 的 8~320 倍強。另外，對麻醉狗的實驗顯示本藥對  $\alpha_1$  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<sup>14)</sup>

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。

&lt;作用機序&gt;

本藥經尿道及前列腺部之  $\alpha_1$  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

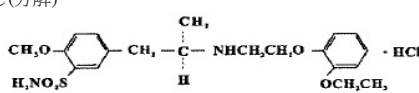
化學名：(1)-(R)-5-2-[(2-(o-ethoxyphenoxy)ethyl)-amino]propyl]-2-methoxybenzenesulfonamide hydrochloride

分子式：C<sub>20</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S · HCl

分子量：444.97

融點：約 230°C (分解)

構造式：



性狀：Tamsulosin hydrochloride 呈白色結晶狀，易溶於 Formic acid，略溶於水，微溶於 ethanol 及冰醋酸，幾乎不溶於 ether。

保存條件：請保存於室溫 (25°C 以下) 及小孩接觸不到之處。

包裝：2~1000 粒塑膠瓶裝、鋁箔盒裝。

賦形劑：Sugar spheres, HPMC (Pharmacoat 603), PEG 6000, Sodium lauryl sulfate, Talc, Surelease, Eudragit L30D, Triethyl citrate, Simethicone  
膠囊：Gelatin, Titanium dioxide, New coccine, Tartrazine, Sodium lauryl sulfate, Glycerin

委託者  
 中化裕民健康事業股份有限公司  
 Chungwa Yuming Healthcare Co., Ltd.  
 C·Y·H  
 總公司：臺北市中正區襄陽路23號8樓

製造廠  
 中國化學製藥股份有限公司  
 CHINA CHEMICAL & PHARMACEUTICAL CO., LTD.  
 新豐工廠：新竹縣新豐鄉坑子口182-1號 ⑥