

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 2018(2019 年更新版)に準拠して作成

選択的 α_{1A} 遮断薬
前立腺肥大症に伴う排尿障害改善薬

日本薬局方 シロドシン口腔内崩壊錠
シロドシンOD錠2_{mg}「杏林」
シロドシンOD錠4_{mg}「杏林」
SILODOSIN OD Tablets

剤形	素錠（口腔内崩壊錠）
製剤の規制区分	劇薬、処方箋医薬品 ^{注）} 注）注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」：1 錠中、日局シロドシン 2mg シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」：1 錠中、日局シロドシン 4mg
一般名	和名：シロドシン（JAN） 洋名：Silodosin（JAN、INN）
製造販売承認年月日 薬価基準収載・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2019 年 2 月 15 日 薬価基準収載年月日：2019 年 6 月 14 日 販売開始年月日：2019 年 6 月 14 日
製造販売（輸入）・ 提携・販売会社名	製造販売元：キョーリンリメディオ株式会社 販売元：杏林製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	キョーリンリメディオ株式会社 学術部 TEL：0120-960189 FAX：0120-189099 受付時間：8 時～22 時（日、祝日、その他当社の休業日を除く） 医療関係者向けホームページ https://www.med.kyorin-rmd.com/

本 IF は 2026 年 4 月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。
最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。



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）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り、製薬企業の医薬情報担当者（以下、MR）等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム（以下、I Fと略す）が誕生した。

1988 年に日本病院薬剤師会（以下、日病薬）学術第 2 小委員会が I F の位置付け、I F 記載様式、I F 記載要領を策定し、その後 1998 年に日病薬学術第 3 小委員会が、2008 年、2013 年に日病薬医薬情報委員会が I F 記載要領の改訂を行ってきた。

I F 記載要領 2008 以降、I F は P D F 等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加した I F が速やかに提供されることとなった。最新版の I F は、医薬品医療機器総合機構（以下、PMD A）の医療用医薬品情報検索のページ（<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>）にて公開されている。日病薬では、2009 年より新医薬品の I F の情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々の I F が添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019 年の添付文書記載要領の変更に合わせ、I F 記載要領 2018 が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. I F とは

I F は「添付文書等の情報を補完し、医師・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造販売又は販売に携わる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。

I F に記載する項目配列は日病薬が策定した I F 記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等は I F 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 I F は、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、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。

I F の提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. I F の利用にあたって

電子媒体の I F は、PMD A の医療用医薬品情報検索の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 I F を作成・提供するが、I F の原点を踏まえ、医療現場に不足している情報や I F 作成時に記載し難い情報等については製薬企業の M R 等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、I F 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、I F が改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、I F の使用にあたっては、最新の添付文書を PMD A の医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り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

I F を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いただきたい。I F は日

病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがI Fの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、I Fを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

目 次

I. 概要に関する項目	1	9. 透析等による除去率	21
1. 開発の経緯	1	10. 特定の背景を有する患者	22
2. 製品の治療学的特性	1	11. その他	22
3. 製品の製剤学的特性	1		
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	23
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	1. 警告内容とその理由	23
6. RMP の概要	1	2. 禁忌内容とその理由	23
		3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	23
II. 名称に関する項目	2	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	23
1. 販売名	2	5. 重要な基本的注意とその理由	23
2. 一般名	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	23
3. 構造式又は示性式	2	7. 相互作用	24
4. 分子式及び分子量	2	8. 副作用	25
5. 化学名(命名法)又は本質	2	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	26
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	2	10. 過量投与	26
		11. 適用上の注意	26
III. 有効成分に関する項目	3	12. その他の注意	26
1. 物理化学的性質	3		
2. 有効成分の各種条件下における安定性	3	IX. 非臨床試験に関する項目	27
3. 有効成分の確認試験法、定量法	3	1. 薬理試験	27
		2. 毒性試験	27
IV. 製剤に関する項目	4		
1. 剤形	4	X. 管理的事項に関する項目	28
2. 製剤の組成	4	1. 規制区分	28
3. 添付溶解液の組成及び容量	5	2. 有効期間	28
4. 力価	5	3. 包装状態での貯法	28
5. 混入する可能性のある夾雑物	5	4. 取扱い上の注意	28
6. 製剤の各種条件下における安定性	5	5. 患者向け資材	28
7. 調製法及び溶解後の安定性	5	6. 同一成分・同効薬	28
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	8	7. 国際誕生年月日	28
9. 溶出性	9	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日	28
10. 容器・包装	11	9. 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	28
11. 別途提供される資材類	12	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容	29
12. その他	12	11. 再審査期間	29
		12. 投薬期間制限に関する情報	29
V. 治療に関する項目	13	13. 各種コード	29
1. 効能又は効果	13	14. 保険給付上の注意	29
2. 効能又は効果に関連する注意	13		
3. 用法及び用量	13	XI. 文献	30
4. 用法及び用量に関連する注意	13	1. 引用文献	30
5. 臨床成績	13	2. その他の参考文献	31
VI. 薬効薬理に関する項目	16	XII. 参考資料	32
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	16	1. 主な外国での発売状況	32
2. 薬理作用	16	2. 海外における臨床支援情報	32
VII. 薬物動態に関する項目	17	XIII. 備考	33
1. 血中濃度の推移	17	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報	33
2. 薬物速度論的パラメータ	19	2. その他の関連資料	35
3. 母集団(ポピュレーション)解析	20		
4. 吸収	20		
5. 分布	20		
6. 代謝	21		
7. 排泄	21		
8. トランスポーターに関する情報	21		

略 語 表

略語	略語内容
Al-P	アルカリホスファターゼ
ALT	アラニンアミノトランスフェラーゼ
AST	アスパラギン酸アミノトランスフェラーゼ
AUC	血中濃度-時間曲線下面積
BUN	血中尿素窒素
$C_{\max}$	最高血中濃度
CRP	C 反応性タンパク
CYP	チトクロム P450
γ -GTP	γ -グルタミルトランスフェラーゼ
IFIS	術中虹彩緊張低下症候群
I-PSS	国際前立腺症状スコア
LDH	乳酸脱水素酵素
SD	標準偏差
$t_{1/2}$	消失半減期
$T_{\max}$	最高血中濃度到達時間

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

シロドシン OD 錠 2mg/4mg「杏林」は、後発医薬品として薬食発 1121 第 2 号(平成 26 年 11 月 21 日)に基づき、規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を行い承認申請し、2019 年 2 月に承認を取得、2019 年 6 月に薬価収載した。

2. 製品の治療学的特性

- 本剤は選択的 α_{1A} 遮断薬/前立腺肥大症に伴う排尿障害改善薬であり、前立腺肥大症に伴う排尿障害の効能又は効果を有している。

(「V. 1. 効能又は効果」の項参照)

- 重大な副作用として、失神・意識喪失、肝機能障害、黄疸がある。

(「VIII. 8. (1) 重大な副作用と初期症状」の項参照)

3. 製品の製剤学的特性

- 水なしでも服用できる口腔内崩壊錠である。

- 錠剤に「シロドシン」、「OD」、「含量」、「杏林」を両面印字している。

(「IV. 1. (2) 製剤の外観及び性状」の項参照)

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資料、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資料	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

(1) 承認条件

該当しない

(2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMP の概要

該当しない

Ⅱ. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」

シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」

(2) 洋名

SILODOSIN OD Tablets 2mg “KYORIN”

SILODOSIN OD Tablets 4mg “KYORIN”

(3) 名称の由来

「一般的名称」＋「剤形」＋「含量」＋「屋号」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」（平成 17 年 9 月 22 日 薬食審査発第 0922001 号）に基づく〕

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

シロドシン（JAN）

(2) 洋名（命名法）

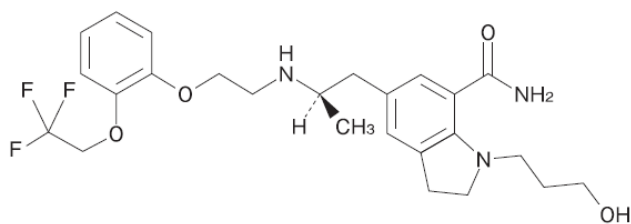
Silodosin（JAN、INN）

(3) ステム

不明

3. 構造式又は示性式

化学構造式：



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₅H₃₂F₃N₃O₄

分子量：495.53

5. 化学名（命名法）又は本質

化学名：1-(3-Hydroxypropyl)-5-[(2*R*)-2-({2-[2-(2,2,2-trifluoroethoxy)phenoxy]ethyl}amino)propyl]-2,3-dihydro-1*H*-indole-7-carboxamide (IUPAC)

6. 慣用名、別名、略号、記号番号

該当しない

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～微黄白色の粉末である。
光によって徐々に黄白色となる。
結晶多形が認められる。

(2) 溶解性

メタノール又はエタノール（99.5）に溶けやすく、水に極めて溶けにくい。

(3) 吸湿性

該当資料なし

(4) 融点（分解点）、沸点、凝固点

融点：105～109℃

(5) 酸塩基解離定数

該当資料なし

(6) 分配係数

該当資料なし

(7) その他の主な示性値

旋光度 $[\alpha]_D^{20}$ ：-13～-17°（脱水物に換算したもの 0.2g、メタノール、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、定量法

● 確認試験法

日本薬局方「シロドシン」の確認試験による。

- (1) フッ化物の定性反応(2)
- (2) 紫外可視吸光度測定法
- (3) 赤外吸収スペクトル測定法（ペースト法）

● 定量法

日本薬局方「シロドシン」の定量法による。

液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

素錠（口腔内崩壊錠）

(2) 製剤の外観及び性状

販売名	シロドシン OD 錠 2mg「杏林」	シロドシン OD 錠 4mg「杏林」
剤形	素錠	割線入り素錠
色調	淡黄赤色	
外形		
本体表示	シロドシン OD 2 杏林	シロドシン OD 4 杏林
直径(mm)	6.5	8.0
厚さ(mm)	3.0	3.9
質量(mg)	105	210

(3) 識別コード

該当しない

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(5) その他

該当資料なし

2. 製剤の組成

(1) 有効成分（活性成分）の含量および添加剤

販売名	シロドシン OD 錠 2mg「杏林」	シロドシン OD 錠 4mg「杏林」
有効成分 (1錠中)	日局シロドシン 2mg	日局シロドシン 4mg
添加剤	D-マンニトール、結晶セルロース、部分アルファー化デンプン、クロスポリドン、トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、炭酸マグネシウム、ステアリン酸マグネシウム、タルク、スクラロース、アミノアルキルメタクリレートコポリマーE、ステアリン酸、ラウリル硫酸ナトリウム、黄色三二酸化鉄、三二酸化鉄、L-メントール	

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

1) 加速試験¹⁾

〈シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」〉

[保存条件]

40℃±1℃、75%RH±5%RH

[試験検体]

PTP 包装品：PTP 包装(ポリプロピレン、アルミ箔)、多層フィルム袋 (ポリエチレン、アルミ箔及びポリエチレンテレフタレート)、紙箱

[試験項目及び規格]

試験項目	規 格
性状	淡黄赤色の素錠
確認試験	液体クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液の主ピークの保持時間は等しい。 また、それらのピークの吸収スペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。
純度試験	相対保持時間約 1.3 の類縁物質：1.0%以下 上記以外の個々の類縁物質：0.25%以下 類縁物質の合計：2.0%以下
製剤均一性	含量均一性試験：判定値 15.0%以下
崩壊性	60 秒
溶出性	水/900mL/パドル法/毎分 50 回転/30 分間/70%以上
定量法	含量：95.0～105.0%

[結果]

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適			適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適			適
崩壊性	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量)※	99.8%	99.8%	99.5%	98.5%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

〈シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」〉

[保存条件]

40℃±1℃、75%RH±5%RH

[試験検体]

PTP 包装品：PTP 包装(ポリプロピレン、アルミ箔)、多層フィルム袋（ポリエチレン、アルミ箔及びポリエチレンテレフタレート）、紙箱

[試験項目及び規格]

試験項目	規 格
性状	淡黄赤色の割線入りの素錠
確認試験	液体クロマトグラフィー：試料溶液及び標準溶液の主ピークの保持時間は等しい。 また、それらのピークの吸収スペクトルは同一波長のところに同様の強度の吸収を認める。
純度試験	相対保持時間約 1.3 の類縁物質：1.0%以下 上記以外の個々の類縁物質：0.25%以下 類縁物質の合計：2.0%以下
製剤均一性	含量均一性試験：判定値 15.0%以下
崩壊性	60 秒
溶出性	水/900mL/パドル法/毎分 50 回転/30 分間/70%以上
定量法	含量：95.0～105.0%

[結果]

試験項目	開始時	1 ヶ月	3 ヶ月	6 ヶ月
性状	適	適	適	適
確認試験	適			適
純度試験	適	適	適	適
製剤均一性	適			適
崩壊性	適	適	適	適
溶出性	適	適	適	適
定量法(含量)※	99.8%	100.0%	99.1%	98.6%

※1 ロット n=3 の 3 ロットの平均値

2) 無包装状態での安定性

〈シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」〉²⁾

保存条件	結 果					
	性状	純度試験	崩壊性	溶出性	定量法	硬度
温度 [40℃、3 ヶ月、褐色ガラス瓶 (密栓)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 [25℃、75%RH、3 ヶ月、褐色 ガラス瓶(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
光 ^{注)} [曝光量 120 万 lx・hr、25℃、 60%RH、シャーレ(開放)]	変化なし	変化あり (規格外)※	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

[規格] 性状：淡黄赤色の素錠、純度試験：相対保持時間約 1.3 の類縁物質 1.0%以下、左記以外の個々の類縁物質 0.25%以下、類縁物質の合計：2.0%以下、崩壊性：60 秒以内、溶出性：30 分間 70%以上、定量法：95.0～105.0%、硬度：参考値

注) 遮光下では全て変化なし

※ 規格内(開始時)→規格内(60 万 lx・hr)、規格外(120 万 lx・hr)

〈シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」〉³⁾

保存条件	結 果					
	性状	純度試験	崩壊性	溶出性	定量法	硬度
温度 [40℃、3 ヶ月、褐色ガラス瓶 (密栓)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
湿度 [25℃、75%RH、3 ヶ月、褐色 ガラス瓶(開放)]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
光 ^{注)} [曝光量 120 万 lx・hr、25℃、 60%RH、シャーレ(開放)]	変化なし	変化あり (規格外) [※]	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし

[規格] 性状：淡黄赤色の割線入りの素錠、純度試験：相対保持時間約 1.3 の類縁物質 1.0%以下、
左記以外の個々の類縁物質 0.25%以下、類縁物質の合計：2.0%以下、崩壊性：60 秒以内、
溶出性：30 分間 70%以上、定量法：95.0～105.0%、硬度：参考値

注)遮光下では全て変化なし

※ 規格内(開始時)→規格内(60 万 lx・hr)、規格外(120 万 lx・hr)

＜参考＞評価基準

分類	性状	純度試験 崩壊性 溶出性	定量法	硬度
変化なし	外観上の変化を、ほとんど 認めない場合	規格値内の 場合	含量低下が 3%未 満の場合	硬度変化が 30%未満の 場合
変化あり (規格内)	わずかな色調変化（退色 等）等々を認めるが、品質上、 問題とならない程度の変 化であり、規格を満たして いる場合		含量低下が 3%以 上で、規格値内の 場合	硬度変化が 30%以上 で、硬度が 2.0kgf 以上 の場合
変化あり (規格外)	形状変化や著しい色調変 化等を認め、規格を逸脱し ている場合		規格値外の場合	硬度変化が 30%以上 で、硬度が 2.0kgf 未満 の場合

本試験は、「(社)日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について（答
申）、平成 11 年 8 月 20 日」を参考に評価しました。本剤の安定性に関する結果であり、無包装で保
存した本剤を使用した場合の有効性・安全性についての評価は実施しておりません。

3) 分割後の安定性

〈シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」〉⁴⁾

保存条件	結 果				
	性状	純度試験	崩壊性	溶出性	定量法
25℃、60%RH、3 ヶ月 褐色ガラス瓶 (開放)	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
光 ^{注)} [曝光量 120 万 lx・hr、25℃、 60%RH、シャーレ (開放)]	変化なし	変化あり* (規格外)	変化なし	変化なし	変化なし

[規格] 性状：淡黄赤色の素錠で分割面は淡黄赤色、純度試験：相対保持時間約 1.3 の類縁物質 1.0% 以下、左記以外の個々の類縁物質 0.25% 以下、類縁物質の合計：2.0% 以下、崩壊性：60 秒 以内、溶出性：30 分間 70% 以上、定量法：95.0～105.0%

注) 遮光下では全て変化なし

※ 規格内 (開始時) → 規格外 (60 万 lx・hr、120 万 lx・hr)

＜参考＞評価基準

分類	性状	純度試験、崩壊性、 溶出性	定量法
変化なし	外観上の変化を、ほとんど認めない 場合	規格値内の場合	含量低下が 3% 未満の場合
変化あり (規格内)	わずかな色調変化 (退色等) 等を認め るが、品質上、問題とならない程度の変 化であり、規格を満たしている場合		含量低下が 3% 以上 で、規格値内の場合
変化あり (規格外)	形状変化や著しい色調変化等を認め 、規格を逸脱している場合	規格値外の場合	規格値外の場合

本試験は、「(社) 日本病院薬剤師会：錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について (答
申)、平成 11 年 8 月 20 日」を参考に評価しました。本剤の安定性に関する結果であり、分割、無包
装で保存した本剤を使用した場合の有効性・安全性についての評価は実施しておりません。

7. 調製法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化 (物理化学的变化)

該当資料なし

9. 溶出性

1) 溶出挙動における類似性及び同等性⁵⁾

〈シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」〉

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 日付 薬食審査発 0229 第 10 号)の A 水準に準じて試験を実施した。

標準製剤	シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」			
試験方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)			
試験条件	試験液量：900mL 試験液の温度：37℃±0.5℃			
	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	溶出試験第 1 液
			pH4.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	溶出試験第 2 液
			水	水

①平均溶出率

[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における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。
	pH4.0	
	pH6.8	
	水	標準製剤の平均溶出率が約 60%及び 85%となる適当な 2 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。

[結果]

回転数	試験液	判定時点 (分)	12 ベッセルの平均溶出率(%)			判定
			シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」	標準製剤	差	
50rpm	pH1.2	15	99.0	98.3	0.7	適合
	pH4.0	15	99.0	100.1	-1.1	適合
	pH6.8	15	95.3	98.9	-3.6	適合
	水	15	72.4	77.7	-5.3	適合
		30	84.6	86.6	-2.0	適合

②個々の溶出率

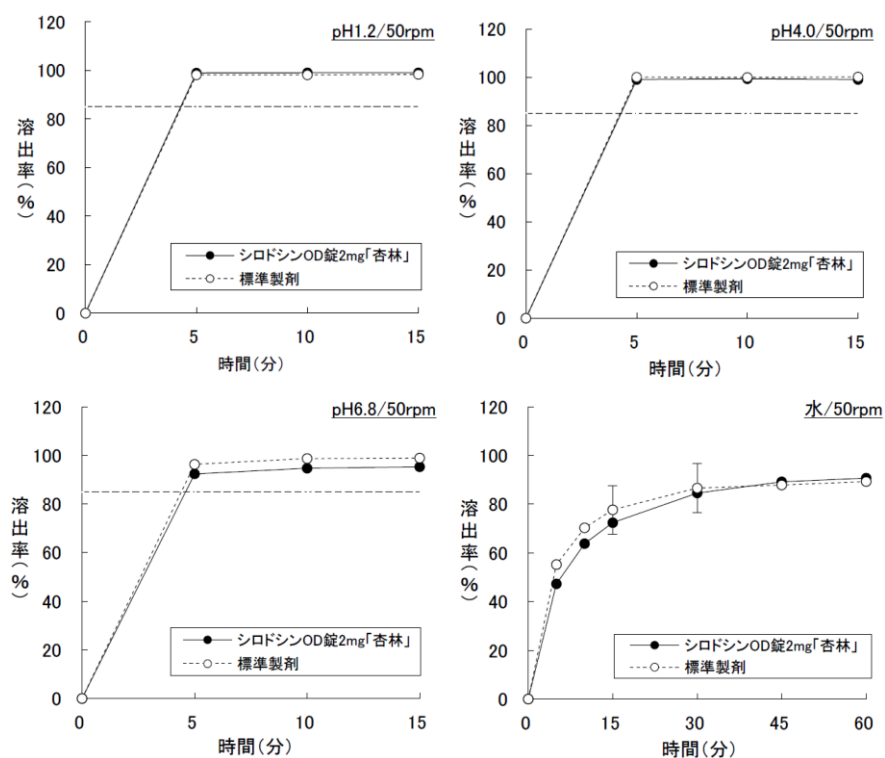
[判定基準]

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がない。

[結果]

回転数	試験液	判定時点 (分)	12 ベッセルの溶出率(%)		判定
			平均値	範囲 (最小値～最大値)	
50rpm	pH1.2	15	99.0	97.1～100.4	適合
	pH4.0	15	99.0	96.9～102.2	適合
	pH6.8	15	95.3	92.6～98.5	適合
	水	15	84.6	81.9～88.0	適合

以上の結果より、平均溶出率、個々の溶出率ともに溶出挙動の同等性の判定基準に適合したため、シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」は標準製剤と溶出挙動が同等であると判定された。



〈シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」〉

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 日付 薬食審査発 0229 第 10 号)に準じて試験を実施した。

標準製剤	ユリーフ OD 錠 4mg			
試験方法	日本薬局方 一般試験法 溶出試験法(パドル法)			
試験条件	試験液量：900mL 試験液の温度：37℃±0.5℃			
	回転数/試験液	50rpm	pH1.2	溶出試験第 1 液
			pH4.0	薄めた McIlvaine の緩衝液
			pH6.8	溶出試験第 2 液
			水	水

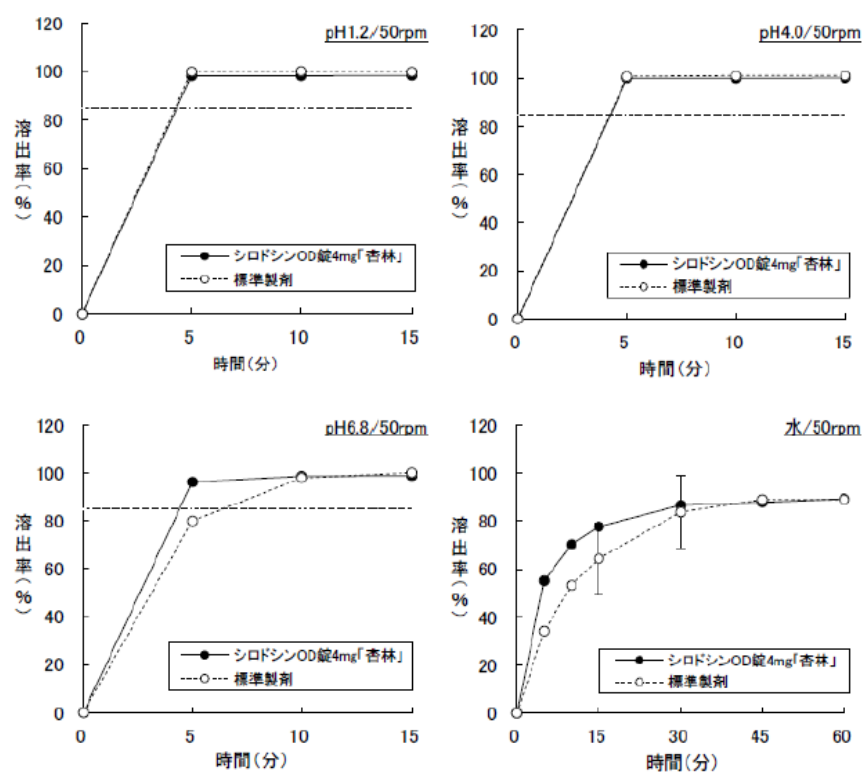
[判定基準]

回転数	試験液	判定基準
50rpm	pH1.2	試験製剤が 15 分以内に平均 85%以上溶出するか、又は 15 分における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。
	pH4.0	
	pH6.8	
	水	標準製剤の平均溶出率が 40%及び 85%付近の適当な 2 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 関数の値は 42 以上である。

[結果]

回転数	試験液	判定時点 (分)	12 ベッセルの平均溶出率 (%)			判定
			シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」	標準製剤	差	
50rpm	pH1.2	15	98.3	99.8	-1.5	適合
	pH4.0	15	100.1	101.1	-1.0	適合
	pH6.8	15	98.9	100.2	-1.3	適合
	水	15	77.7	64.4	13.3	適合
		30	86.6	83.8	2.8	

以上の結果より、すべての試験条件において溶出挙動の類似性の判定基準に適合したため、シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」は標準製剤と溶出挙動が類似していると判定された。



2) 公的溶出規格への適合性⁵⁾

シロドシン OD 錠 2mg「杏林」及びシロドシン OD 錠 4mg「杏林」は、日本薬局方医薬品各条に定められたシロドシン口腔内崩壊錠の溶出規格に適合していることが確認されている。

販売名	試験条件	規格
シロドシン OD 錠 2mg「杏林」	溶出試験第 2 液/900mL/パドル法/50rpm	15 分間 80%以上
シロドシン OD 錠 4mg「杏林」	溶出試験第 2 液/900mL/パドル法/50rpm	15 分間 80%以上

10. 容器・包装

(1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

該当しない

(2) 包装

〈シロドシン OD 錠 2mg「杏林」〉

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]

〈シロドシン OD 錠 4mg「杏林」〉

100 錠 [10 錠 (PTP) × 10]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

[PTP 包装品]

PTP 包装：ポリプロピレン、アルミ箔

多層フィルム袋：ポリエチレン、アルミ箔、ポリエチレンテレフタレート

箱：紙

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4.効能又は効果

前立腺肥大症に伴う排尿障害

2. 効能又は効果に関連する注意

5.効能又は効果に関連する注意

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、手術療法など、他の適切な処置を考慮すること。

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

6.用法及び用量

通常、成人にはシロドシンとして1回4mgを1日2回朝夕食後に経口投与する。なお、症状に応じて適宜減量する。

(2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

設定されていない

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

17.臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内第 II 相二重盲検比較試験

前立腺肥大症に伴う排尿障害患者を対象に、シロドシンカプセル 1 回 2mg^{注)}、4mg 又はプラセボを、1 日 2 回、4 週間経口投与した結果、シロドシンカプセル 1 回 4mg 投与はプラセボと比較して自覚症状（I-PSS トータルスコア）を有意に改善した（表 17-1）。副作用発現割合は、15.6%（42/270 例）であった。用量別の副作用発現割合は、プラセボ群 7.9%（7/89 例）、4mg/日群 16.9%（15/89 例）、8mg/日群 21.7%（20/92 例）であった。主な副作用は、射精障害 0%（0/89 例）、11.2%（10/89 例）、6.5%（6/92 例）（プラセボ、4mg/日、8mg/日の順、以下同様）、口渇 1.1%（1/89 例）、0%（0/89 例）、5.4%（5/92 例）であった。副作用（臨床検査値）発現割合は、6.7%（18/270 例）であった。用量別の副作用（臨床検査値）発現割合は、プラセボ群 5.6%（5/89 例）、4mg/日群 6.7%（6/89 例）、8mg/日群 7.6%（7/92 例）であった。主な副作用（臨床検査値）は、トリグリセリド上昇 2.3%（2/86 例）、3.7%（3/82 例）、2.4%（2/84 例）（プラセボ群、4mg/日群、8mg/日群）であった^{6)~8)}。

表 17-1 I-PSS^{a)} トータルスコアの投与前後の変化

投与群	投与開始時測定値	投与 4 週後変化量	プラセボ群との群間比較
			Dunnett 型多重比較検定
プラセボ	18.1±5.6(88)	-3.0±5.8(88)	-
2mg×2/日	18.3±6.5(84)	-5.7±6.1(84)	P=0.013
4mg×2/日	18.7±6.0(87)	-6.6±5.5(86)	P=0.000

単位：点 平均値±SD ()：症例数

a) I-PSS：国際前立腺症状スコア（軽症：0-7、中等症：8-19、重症：20-35）

注)本剤の承認されている用法・用量は「1 回 4mg を 1 日 2 回朝夕食後に経口投与する。なお、症状に応じて適宜減量する。」である。

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験

17.臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.2 国内第 III 相二重盲検比較試験

前立腺肥大症に伴う排尿障害患者を対象に、シロドシンカプセル 1 回 4mg 1 日 2 回又はプラセボを 12 週間経口投与した結果、終了時の I-PSS トータルスコアは投与開始時に比較して、シロドシンで 8.3 及びプラセボで 5.3 それぞれ低下した（図 17-1、表 17-2）。また、投与開始時に比較して I-PSS トータルスコアが 25%以上改善した症例の割合は、シロドシン 76.4%（133/174 例）及びプラセボ 50.6%（45/89 例）であり、重症度が軽症（I-PSS トータルスコア 8 未満）まで改善した症例の割合は、シロドシン 47.7%（83/174 例）及びプラセボ 31.5%（28/89 例）であった。シロドシンでは自覚症状は投与 1 週後の早期から改善し、重症例に対しても改善効果が認められた。副作用発現割合は、シロドシン群 54.9%（96/175 例）、プラセボ群 22.5%（20/89 例）であった。主な副作用は、シロドシン群で射精障害 22.3%（39/175 例）、軟便及び口渇各 8.6%（15/175 例）、尿失禁 5.7%（10/175 例）、下痢 4.6%（8/175 例）、鼻閉 4.0%（7/175 例）、プラセボ群で軟便、口渇及び頭痛各 4.5%（4/89 例）であった。副作用（臨床検査値）発現割合は、シロドシン群 31.4%（55/175 例）、プラセボ群 21.6%（19/88 例）であった。主な副作用（臨床検査値）は、シロドシン群ではトリグリセリド上昇 12.0%（21/175 例）、CRP 上昇 5.7%（10/175 例）、γ-GTP 上昇 3.4%（6/175 例）、プラセボ群ではトリグリセリド上昇 10.2%（9/88 例）、LDH 上昇及び CRP 上昇各 3.4%（3/88 例）であった^{9)~11)}。

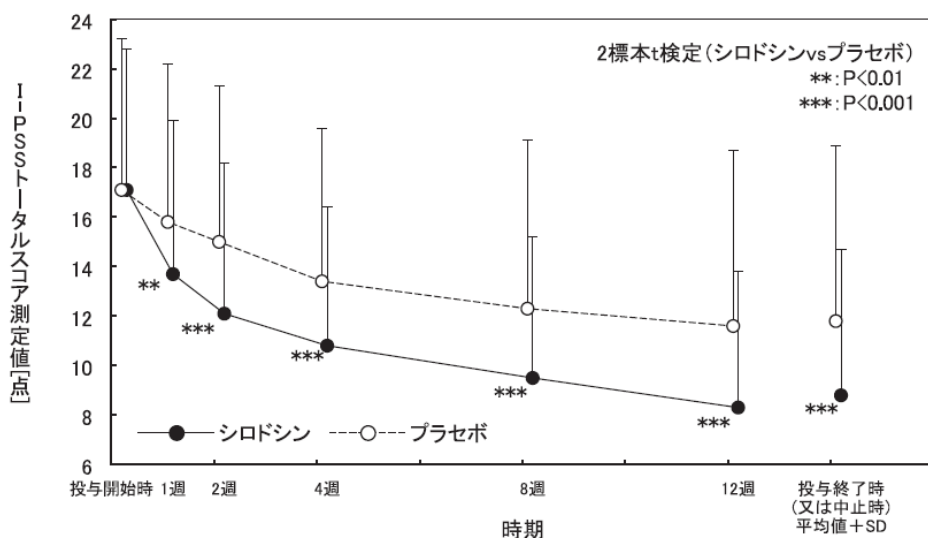


図 17-1 I-PSS トータルスコア測定値の推移

表 17-2 I-PSS トータルスコアの測定値、変化量及び群間差

投与群	例数	投与開始時 測定値 ^{a)}	終了時 測定値 ^{a)}	変化量 ^{a)}	変化量 群間差	両側 95% 信頼区間
シロドシン	174	17.1 ± 5.7	8.8 ± 5.9	-8.3 ± 6.4	-3.0	-4.6, -1.3
プラセボ	89	17.1 ± 6.1	11.8 ± 7.1	-5.3 ± 6.7		

a) 平均値 ± SD

2) 安全性試験

17.臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.3 国内長期投与試験

前立腺肥大症に伴う排尿障害患者 364 例を対象としたシロドシンカプセル 1 回 4mg1 日 2 回 52 週間による長期投与試験では、持続的な改善効果と安全性が確認され、安定した自覚症状（I-PSS トータルスコア）及び最大尿流率の改善が認められた。副作用発現割合は、65.4% (238/364 例) であった。主な副作用は、射精障害 25.0% (91/364 例)、下痢 7.4% (27/364 例)、口渇 7.1% (26/364 例)、立ちくらみ 6.6% (24/364 例)、鼻閉 5.8% (21/364 例)、ふらつき（感）5.2% (19/364 例) であった。副作用（臨床検査値）発現割合は、31.1% (112/360 例) であった。主な副作用（臨床検査値）は、トリグリセリド上昇 9.2% (33/359 例)、ALT 上昇 4.2% (15/360 例)、白血球数減少 3.9% (14/358 例)、ヘモグロビン量減少 3.6% (13/357 例)、ヘマトクリット値減少 3.6% (13/357 例)、AST 上昇 3.6% (13/360 例)、赤血球数減少 3.4% (12/358 例) 及び CRP 上昇 3.1% (11/359 例) であった¹²⁾、¹³⁾。

(5) 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（一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査）、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

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調査・試験の概要

該当資料なし

(7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群

α_1 遮断薬：ウラピジル、タムスロシン塩酸塩、ナフトピジル、プラゾシン塩酸塩 等

注意：関連のある化合物の効能・効果等は，最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

下部尿路組織である前立腺、尿道及び膀胱三角部に分布する α_{1A} -アドレナリン受容体サブタイプを介する交感神経系を遮断することにより、下部尿路組織平滑筋の緊張を緩和し、尿道内圧の上昇を抑制し、前立腺肥大症に伴う排尿障害を改善する¹⁴⁾。

(2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 ヒト組織での作用

18.2.1 交感神経系 α -アドレナリン受容体に対する親和性

ヒト α_1 -アドレナリン受容体に対する受容体結合試験において、 α_{1A} -アドレナリン受容体サブタイプへの高い親和性を示した¹⁵⁾ (*in vitro*)。

18.2.2 前立腺に対する作用

ヒト前立腺膜標本を用いた受容体結合試験において、 α_{1A} -アドレナリン受容体サブタイプへの高い親和性を示した¹⁶⁾。

ノルアドレナリンによるヒト前立腺平滑筋の収縮を抑制した¹⁶⁾ (*in vitro*)。

18.3 動物での作用

18.3.1 下部尿路組織（前立腺、尿道及び膀胱三角部）に対する作用

摘出ウサギ前立腺、尿道及び膀胱三角部において、ノルアドレナリンによる収縮に対して強い拮抗作用を示した¹⁵⁾ (*in vitro*)。

18.3.2 尿道内圧に対する作用

麻酔雄性ラットにおいて、血圧低下作用を示すよりも低い用量で、フェニレフリンによる前立腺部尿道内圧上昇を選択的に抑制した¹⁷⁾。

麻酔雄性イヌにおいても、血圧低下作用を示すよりも低い用量で、下腹神経の電気刺激による前立腺部尿道内圧上昇を選択的に抑制した¹⁸⁾。

18.3.3 前立腺肥大モデルに対する作用

性ホルモン投与にて作製した雄性ラット前立腺肥大モデルにおいて、蓄尿時に生じた膀胱刺激症状を抑制した¹⁹⁾。

(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

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

健康成人男性（各群 6 例）にシロドシン 0.5mg から 12mg（カプセル）を単回経口投与したとき^{注)}、血漿中シロドシン濃度は投与量の増加に伴って上昇し、 C_{max} 及び $AUC_{0-\infty}$ は線形性を示した^{20)~22)}。

16.1.2 反復投与

健康成人男性 5 例にシロドシン 4mg（カプセル）を 1 日 2 回 7 日間反復経口投与したとき（1 日目及び 7 日目は 1 日 1 回投与）、血漿中シロドシン濃度は投与 3 日後には定常状態に達し、初回投与からの累積率は 1.1 倍であった^{20)、23)}（表 16-1）。

表 16-1 健康成人男性における食後 4mg 投与時の薬物動態パラメータ

	C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ (ng・hr/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
単回	26.8±9.2	143.9±57.1	2.2±0.5	6.9±3.1
反復	28.7±7.6	134.3±39.0	2.0±0.0	10.4±4.6

（平均値±SD）

反復投与時のパラメータは、6 日目までの積み重なり濃度を差し引いた 7 日目の濃度推移から得た結果を示した。

16.1.3 前立腺肥大症に伴う排尿障害患者での薬物動態

前立腺肥大症に伴う排尿障害患者を対象とした長期投与試験（カプセル）における探索的な母集団薬物動態解析（258 例）の結果、定常状態時の投与 2 時間後及び 12 時間後の推定血漿中シロドシン濃度（平均値±SD）はそれぞれ 24.8±8.0ng/mL 及び 7.4±3.3ng/mL であった。血漿中シロドシン濃度に対する変動要因について検討した結果、シロドシンのクリアランスは体重、年齢、CRP、ALT 及び血清クレアチニンによって、分布容積は体重、年齢、CRP 及び ALT によって影響を受けることが示唆された。これら影響因子のうち、ALT について、シロドシンの血漿中濃度に対する影響が大きいことが推察され、ALT の上昇（23→83IU/L）によりシロドシンのクリアランス及び分布容積はそれぞれ約 47%及び約 27%低下する可能性が示唆された²⁴⁾。[9.3、9.8 参照]

注)本剤の承認されている用法・用量は「1 回 4mg を 1 日 2 回朝夕食後に経口投与する。なお、症状に応じて適宜減量する。」である。

生物学的同等性試験²⁵⁾

〈シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」〉

シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」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 日付薬食審査発 0229 第 10 号)」に基づき、シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」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. 9. 溶出性」の項参照)

〈シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」〉

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 0229 第 10 号)に従い、健康成人男子を対象に生物学的同等性試験を実施した。

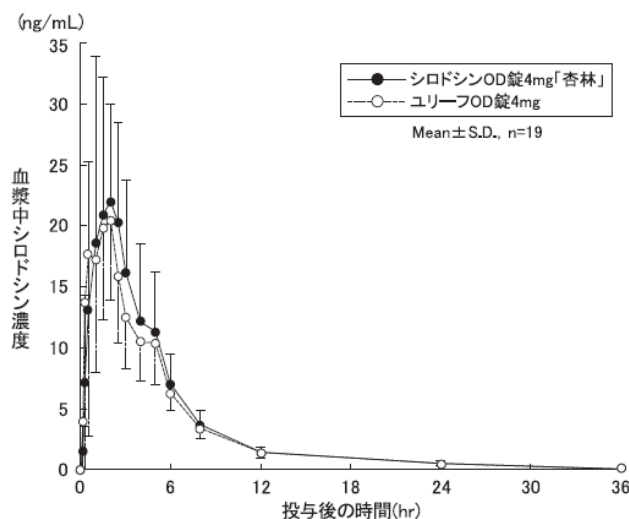
シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」とユリーフ OD 錠 4mg をクロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠(シロドシンとして 4mg)健康成人男子に絶食単回経口投与(水なしで服用及び水で服用)して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、 C_{max})について 90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、 $\log(0.80) \sim \log(1.25)$ の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

ー水なしで服用ー

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0-36hr} (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」	122±38	30.4±10.7	1.68±0.85	6.19±0.98
ユリーフ OD 錠 4mg	113±22	30.0±10.6	1.03±0.57	6.70±1.54

(平均値±SD, n=19)



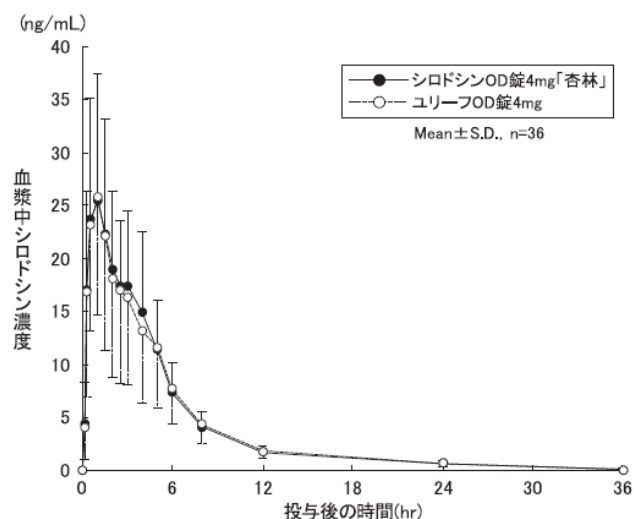
血漿中濃度並びに AUC、 C_{max} 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

ー水で服用ー

薬物動態パラメータ

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUC _{0-36hr} (ng・hr/mL)	C_{max} (ng/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」	139.3±41.0	31.24±10.83	1.28±0.90	6.89±1.81
ユリーフ OD 錠 4mg	138.1±47.0	30.54±10.29	1.39±0.97	6.92±1.41

(平均値±SD, n=36)



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、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。

(3) 中毒域

該当資料なし

(4) 食事・併用薬の影響

1) 食事の影響

「VII. 4. 吸収」の項参照

2) 併用薬の影響

16.7 薬物相互作用

16.7.1 ケトコナゾール（経口剤：国内未発売）併用

健康男性（外国人）16 例にケトコナゾール 200mg を 1 日 1 回 4 日間経口投与し、2 日目にシロドシン 4mg（カプセル）を単回経口投与した場合^{注)}、併用時のシロドシンの C_{max} 及び $AUC_{0-\infty}$ は、シロドシン単独投与時に比べてそれぞれ 3.7 及び 2.9 倍に増加した²⁰⁾。[10.2 参照]

注) 本剤の承認されている用法・用量は「1 回 4mg を 1 日 2 回朝夕食後に経口投与する。なお、症状に応じて適宜減量する。」である。

2. 薬物速度論的パラメータ

(1) 解析方法

該当資料なし

(2) 吸収速度定数

該当資料なし

(3) 消失速度定数

該当資料なし

(4) クリアランス

該当資料なし

(5) 分布容積

「VII. 5. (6) 血漿蛋白結合率」の項参照

- (6) その他
該当資料なし

3. 母集団（ポピュレーション）解析

- (1) 解析方法
該当資料なし
- (2) パラメータ変動要因
該当資料なし

4. 吸収

16.2 吸収
16.2.1 食事の影響

健康成人男性 11 例にシロドシン 4mg（カプセル）を食後 30 分及び空腹時に単回経口投与したとき^{注)}、食後投与及び空腹時投与でそれぞれ、 C_{max} は 23.0 及び 28.0ng/mL、 AUC_{0-48hr} は 128.8 及び 135.9ng・hr/mL、 T_{max} は 2.1 及び 1.4 時間、 $t_{1/2}$ は 6.0 及び 4.7 時間であった²⁰⁾（表 16-4）。

表 16-4 健康成人男性における 4mg 投与時の薬物動態パラメータ

	C_{max} (ng/mL)	AUC_{0-48hr} (ng・hr/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
食後	23.0±10.8	128.8±64.1	2.1±0.7	6.0±4.8
空腹時	28.0±9.6	135.9±55.4	1.4±1.1	4.7±3.7

（平均値±SD）

16.2.2 生物学的利用率

シロドシン 4mg（カプセル）を単回経口投与したときの生物学的利用率は 32.2%であった²⁶⁾。

注)本剤の承認されている用法・用量は「1 回 4mg を 1 日 2 回朝夕食後に経口投与する。なお、症状に応じて適宜減量する。」である。

5. 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
- (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

(6) 血漿蛋白結合率

16.3 分布

健康成人男性 11 例にシロドシン 2mg (溶液) を 4 時間静脈内点滴投与時^{注)}のクリアランス及び分布容積はそれぞれ $167.0 \pm 33.8 \text{ mL/min}$ 及び $49.5 \pm 17.3 \text{ L}$ であった²⁶⁾。シロドシンのヒト血漿タンパクに対する結合率は、95.6% (100ng/mL 添加時) であり、主な結合タンパクは α_1 -酸性糖タンパクであった²⁰⁾ (*in vitro*)。

注) 本剤の承認されている用法・用量は「1 回 4mg を 1 日 2 回朝夕食後に経口投与する。なお、症状に応じて適宜減量する。」である。

6. 代謝

(1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

シロドシンは主として CYP3A4、UDP-グルクロン酸転移酵素、アルコール脱水素酵素及びアルデヒド脱水素酵素により代謝され、血漿中の主な代謝物はシロドシンのグルクロン酸抱合体及び酸化代謝物であった²⁰⁾。健康男性 (外国人) 6 例に「 ^{14}C 」標識シロドシン 8mg (溶液) を単回経口投与したとき^{注)}、血漿中の総放射能 $\text{AUC}_{0-12\text{hr}}$ に対して、血漿中のシロドシン、シロドシンのグルクロン酸抱合体及び酸化代謝物の $\text{AUC}_{0-12\text{hr}}$ は、それぞれ 24.0、21.9 及び 34.9% であった。その他の代謝物の割合は、いずれも 5% 以下であった^{20)、27)}。[10. 参照]

注) 本剤の承認されている用法・用量は「1 回 4mg を 1 日 2 回朝夕食後に経口投与する。なお、症状に応じて適宜減量する。」である。

(2) 代謝に関与する酵素 (CYP 等) の分子種、寄与率

「VII. 6. (1) 代謝部位及び代謝経路」及び「VIII. 7. 相互作用」の項参照

(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活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

健康男性 (外国人) 6 例に「 ^{14}C 」標識シロドシン 8mg (溶液) を単回経口投与したとき^{注)}、投与後 240 時間までに、投与放射能の 33.5% が尿中に、54.9% が糞中に排泄された²⁰⁾。

注) 本剤の承認されている用法・用量は「1 回 4mg を 1 日 2 回朝夕食後に経口投与する。なお、症状に応じて適宜減量する。」である。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

該当資料なし

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

腎機能低下者（クレアチニンクリアランス 27～49mL/min）6 例及び腎機能正常者（クレアチニンクリアランス 125～176mL/min）7 例にシロドシン 4mg（カプセル）を単回経口投与したとき^{注)}、腎機能低下者では腎機能正常者に比べて、シロドシンの血漿中総薬物濃度の上昇がみられた（ C_{max} 3.1 倍、 $AUC_{0-\infty}$ 3.2 倍）。この血漿中総薬物濃度の上昇は血清中 α_1 -酸性糖タンパクとのタンパク結合による可能性があり、血漿中総薬物濃度と血清中 α_1 -酸性糖タンパク濃度の間には高い相関が認められた。なお、シロドシンの薬効及び副作用発現に直接関与すると考えられる血漿中非結合形シロドシン濃度の上昇は総薬物濃度より小さかった（ C_{max} 1.5 倍、 $AUC_{0-\infty}$ 2.0 倍）²⁰⁾（表 16-5）。[9.2、9.8 参照]

表 16-5 腎機能低下者及び腎機能正常者に空腹時 4mg 単回投与時の薬物動態パラメータ

	C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ (ng・hr/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
腎機能低下者	72.22±44.12 (1.48±1.30)	305.76±115.38 (6.34±3.43)	0.67±0.26 (0.83±0.26)	7.55±1.50 (8.71±3.94)
腎機能正常者	21.51±8.52 (0.71±0.13)	94.75±41.28 (2.96±1.09)	0.86±0.56 (0.86±0.56)	3.94±1.57 (4.39±1.34)

（平均値±SD）

（ ）内の値は血漿中非結合形シロドシン

16.6.2 高齢者

高齢男性（65～75 歳）12 例にシロドシン 4mg（カプセル）を食後に単回経口投与したとき、非高齢男性（21～31 歳）9 例との薬物動態に明らかな違いはみられなかった²⁰⁾（表 16-6）。

また、投与後 48 時間までの尿中累積排泄率は高齢男性、非高齢男性でそれぞれシロドシンが 2.3 及び 2.4%、シロドシンのグルクロン酸抱合体が 1.6 及び 1.8%、酸化代謝物が 4.5 及び 4.9%であった²⁰⁾。

表 16-6 高齢男性及び非高齢男性における食後 4mg 単回投与時の薬物動態パラメータ

	C_{max} (ng/mL)	$AUC_{0-\infty}$ (ng・hr/mL)	T_{max} (hr)	$t_{1/2}$ (hr)
高齢男性	21.8±11.6	142.4±54.7	2.5±1.4	10.5±4.0
非高齢男性	20.5±6.5	121.5±38.1	2.3±0.5	8.7±3.1

（平均値±SD）

注)本剤の承認されている用法・用量は「1 回 4mg を 1 日 2 回朝夕食後に経口投与する。なお、症状に応じて適宜減量する。」である。

11. その他

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

設定されていない

2. 禁忌内容とその理由

2.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注意とその理由

「V. 2. 効能又は効果に関連する注意」を参照すること。

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

設定されていない

5. 重要な基本的注意とその理由

8.重要な基本的注意

8.1 本剤は副作用の発現率が高く、特徴的な副作用として射精障害が高頻度に認められているため、本剤の使用にあたっては、本剤のリスクを十分に検討の上、患者に対しては副作用の説明を十分に行った上で使用すること。[11.2 参照]

8.2 起立性低血圧があらわれることがあるので、体位変換による血圧変化に注意すること。[9.1.1 参照]

8.3 めまいなどがあらわれることがあるので、高所作業、自動車の運転など危険を伴う作業に従事する場合には注意させること。

8.4 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。[10.2 参照]

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

(1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 起立性低血圧のある患者

症状が悪化するおそれがある。[8.2 参照]

(2) 腎機能障害患者

9.2 腎機能障害患者

患者の状態を観察しながら低用量（1回 2mg）から投与を開始するなど考慮すること。シロドシンの血漿中濃度が上昇する。[16.6.1 参照]

(3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

患者の状態を観察しながら低用量（1 回 2mg）から投与を開始するなどを検討すること。シロドシンの血漿中濃度が上昇するおそれがある。[16.1.3 参照]

(4) 生殖能を有する者

設定されていない

(5) 妊婦

設定されていない

(6) 授乳婦

設定されていない

(7) 小児等

設定されていない

(8) 高齢者

9.8 高齢者

肝機能又は腎機能が低下している場合は低用量（1 回 2mg）から投与を開始するなど、患者の状態を十分に観察しながら投与すること。高齢者では一般に生理機能が低下している。[16.1.3、16.6.1 参照]

7. 相互作用

10.相互作用

シロドシンは主としてチトクローム P450 3A4（CYP3A4）により代謝される。[16.4 参照]

(1) 併用禁忌とその理由

設定されていない

(2) 併用注意とその理由

10.2 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 [8.4 参照]	起立性低血圧があらわれることがあるので、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 シルデナフィルクエン酸塩 バルデナ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。
アゾール系抗真菌剤 イトラコナゾール等 [16.7.1 参照]	強力に CYP3A4 を阻害するケトコナゾール（経口剤：国内未発売）との併用によりシロドシンの血漿中濃度の上昇が認められている。 アゾール系抗真菌剤との併用により、シロドシンの血漿中濃度が上昇	アゾール系抗真菌剤は CYP3A4 を阻害することから、これらの薬剤との併用時には、シロドシンの血漿中濃度が上昇するおそれがある。

	するおそれがあるので、減量するなど注意すること。	
--	--------------------------	--

8. 副作用

11.副作用

次の副作用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。

(1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 失神・意識喪失（頻度不明）

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。

11.1.2 肝機能障害（頻度不明）、黄疸（頻度不明）

AST 上昇、ALT 上昇等を伴う肝機能障害、黄疸があらわれることがある。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	5%以上	1～5%未満	1%未満	頻度不明
泌尿・生殖器	射精障害（逆行性射精等） (17.2%) ^{注)}	インポテンス、尿失禁		
消化器	口渇	胃不快感、下痢、軟便、便秘	嘔吐、嘔気、食欲不振、胃痛、腹痛、腹部膨満感、上腹部異和感、下腹部痛、胃潰瘍、胃炎、萎縮性胃炎、胸やけ、胃もたれ感、十二指腸潰瘍、放屁増加、排便回数増加、残便感、肛門不快感	口内炎
精神神経系		めまい、立ちくらみ、ふらつき、頭痛	肩こり、頭がボーとする感じ、眠気、性欲減退、頭重感	しびれ
呼吸器		鼻出血、鼻閉	鼻汁、咳	
循環器			心房細動、動悸、頻脈、不整脈、上室性期外収縮、起立性低血圧、血圧低下、血圧上昇	
過敏症			発疹、皮疹、湿疹、蕁麻疹、そう痒感	口唇腫脹、舌腫脹、咽頭浮腫、顔面腫脹、眼瞼浮腫
眼			眼の充血、目のかゆみ、結膜出血	術中虹彩緊張低下症候群（IFIS）、かすみ目
肝臓		AST 上昇、ALT 上昇、 γ -GTP 上昇、総ビリルビン上昇、Al-P 上昇、LDH 上昇		
腎臓			BUN 上昇、クレアチニン上昇	
血液		白血球数減少、赤血球	白血球数増多、血小板数減少	

		数減少、血色素量減少、ヘマトクリット値減少		
その他	トリグリセリド上昇	倦怠感、CRP 上昇、総コレステロール上昇、尿糖上昇、尿沈渣上昇	顔のほてり、耳鳴、苦味、胸痛、腰痛、下肢脱力感、発汗、ほてり、気分不良、血清カリウム値上昇、総蛋白低下、前立腺特異抗原増加、尿酸上昇、尿蛋白上昇	浮腫、女性化乳房
注) [8.1 参照]				

9. 臨床検査結果に及ぼす影響

設定されていない

10. 過量投与

設定されていない

11. 適用上の注意

14. 適用上の注意

14.1 薬剤交付時の注意

14.1.1 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、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

14.1.2 本剤は舌の上のせて唾液を浸潤させると崩壊するため、水なしで服用可能である。また、水で服用することもできる。

14.1.3 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用しないこと。

12. その他の注意

(1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

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。[11.2 参照]

(2) 非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

15.2.1 マウスでの 104 週間投与試験

20mg/kg/日以上投与群で精囊腺拡張の頻度の上昇が認められたとの報告がある²⁸⁾。

15.2.2 ラットでの受胎能及び着床までの初期胚発生に関する試験

200mg/kg/日以上投与群で精細管に精子細胞の脱落が、600mg/kg/日投与群で精細管の萎縮・変性、精子生存率及び精子数の減少が認められたとの報告がある²⁹⁾。

Ⅸ. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験

「Ⅵ. 薬効薬理に関する項目」の項参照

(2) 安全性薬理試験

該当資料なし

(3) 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) 遺伝毒性試験

該当資料なし

(4) がん原性試験

「Ⅷ. 12. (2)非臨床試験に基づく情報」の項参照

(5) 生殖発生毒性試験

「Ⅷ. 12. (2)非臨床試験に基づく情報」の項参照

(6) 局所刺激性試験

該当資料なし

(7) 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：シロドシン OD 錠 2mg/4mg 「杏林」 劇薬、処方箋医薬品^{注)}

注) 注意－医師等の処方箋により使用すること

有効成分：シロドシン 劇薬

2. 有効期間

有効期間：3 年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

20.取扱い上の注意

20.1 アルミピロー包装開封後は遮光し、湿気を避けて保存すること。

20.2 製剤の特性上、吸湿により錠剤表面がざらつくことがある。

20.3 錠剤表面に使用色素による茶色、赤色又は黄色の斑点がみられることがある。

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり

くすりのしおり：あり

6. 同一成分・同効薬

同一成分薬：ユリーフ錠 2mg/4mg、ユリーフ OD 錠 2mg/4mg

同 効 薬： α_1 遮断薬（ウラピジル、タムスロシン塩酸塩、ナフトピジル、プラゾシン塩酸塩 等）

7. 国際誕生年月日

2006 年 1 月 23 日

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

販売名	製造販売承認年月日	承認番号	薬価基準収載年月日	販売開始年月日
シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」	2019 年 2 月 15 日	23100AMX00171000	2019 年 6 月 14 日	2019 年 6 月 14 日
シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」	2019 年 2 月 15 日	23100AMX00172000	2019 年 6 月 14 日	2019 年 6 月 14 日

9. 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

10. 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

11. 再審査期間

該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報

本剤は、投薬期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

販売名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT（9桁）番号	レセプト電算処理 システム用コード
シロドシン OD錠 2mg 「杏林」	2590010F3018	2590010F3115	126728001	622672801
シロドシン OD錠 4mg 「杏林」	2590010F4111	2590010F4111	126729701	622672901

14. 保険給付上の注意

本剤は診療報酬上の後発医薬品である。

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
シロドシン OD 錠 2mg「杏林」・シロドシン OD 錠 4mg「杏林」の安定性試験に関する資料（加速試験）
- 2) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
シロドシン OD 錠 2mg「杏林」の安定性試験に関する資料（無包装状態での安定性）
- 3) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
シロドシン OD 錠 4mg「杏林」の安定性試験に関する資料（無包装状態での安定性）
- 4) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
シロドシン OD 錠 4mg「杏林」の安定性試験に関する資料（分割後の安定性試験）
- 5) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
シロドシン OD 錠 2mg「杏林」・シロドシン OD 錠 4mg「杏林」の溶出性に関する資料
- 6) 前立腺肥大症に伴う排尿障害患者を対象とした後期第Ⅱ相臨床試験（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.7.6.3）
- 7) 後期第Ⅱ相臨床試験（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.7.3.2）
- 8) 後期第Ⅱ相試験（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、審査報告書）
- 9) 前立腺肥大症に伴う排尿障害患者を対象とした第Ⅲ相臨床試験（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.7.6.3）
- 10) 塩酸タムスロシン及びプラセボとの比較に関する有効性評価について（第Ⅲ相検証試験）（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.5.4.1）
- 11) 有効性及び安全性試験成績の概要 第Ⅲ相試験（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、審査報告書）
- 12) 前立腺肥大症に伴う排尿障害患者を対象とした第Ⅲ相長期投与試験（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.7.6.3）
- 13) 河邊香月ほか：泌尿器外科. 2006；19(2)：153-164
- 14) 作用機作（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.6.2.4）
- 15) 立道聡ほか：薬学雑誌. 2006；126(S)：209-216
- 16) Murata, S. et al.：J. Urol.2000；164(2)：578-583
- 17) 立道聡ほか：薬学雑誌. 2006；126(S)：217-223
- 18) イヌ下腹神経刺激誘発尿道内圧上昇モデルにおける作用（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
- 19) ラット前立腺肥大モデルにおける作用（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.6.2.2）
- 20) 清水智司ほか：薬学雑誌. 2006；126(S)：257-263
- 21) 健康成人を対象とした第Ⅰ相臨床試験（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 22) 健康成人を対象とした第Ⅰ相臨床試験（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 23) 第Ⅰ相臨床試験（反復）（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.7.6.2）
- 24) 前立腺肥大症に伴う排尿障害患者を対象とした長期投与試験（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 25) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
シロドシン OD 錠 2mg「杏林」・シロドシン OD 錠 4mg「杏林」の生物学的同等性試験に関する資料
- 26) 健康成人を対象とした臨床薬理試験（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.7.1.2）
- 27) 臨床薬理試験（マスバランス）（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.7.2.2）
- 28) マウスでの 104 週間投与試験（ユリーフカプセル m：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.6.6.5）
- 29) ラットでの受胎能及び着床までの初期胚発生に関する試験（ユリーフカプセル：2006 年 1 月 23 日承認、申請資料概要 2.6.6.6）
- 30) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
シロドシン OD 錠 2mg「杏林」の安定性試験に関する資料（粉碎品の安定性試験）
- 31) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
シロドシン OD 錠 4mg「杏林」の安定性試験に関する資料（粉碎品の安定性試験）

- 32) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」 の経管投与試験に関する資料
- 33) キョーリンリメディオ株式会社社内資料：
シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」 の経管投与試験に関する資料

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

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当資料なし

XII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：

本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

掲載根拠：「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドラインに関する Q&A について（その 3）」

令和元年 9 月 6 日付 厚生労働省医薬・生活衛生局監視指導・麻薬対策課 事務連絡

(1) 粉砕

〈シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」〉³⁰⁾

●湿度に対する安定性 [25℃、60%RH、褐色ガラス瓶(開放)] (n=1、定量法は n=2)

試験項目	規格（参考）		開始時	2 週間	1 ヶ月	3 ヶ月
性状	淡黄赤色の粉末		淡黄赤色の粉末	淡黄赤色の粉末	淡黄赤色の粉末	淡黄赤色の粉末
純度試験	RRT 約 1.3	1.0%以下	0.36%	0.37%	0.37%	0.40%
	個々 ^{注1}	0.25%以下	0.05%	0.05%	0.05%	0.05%
	合計	2.0%以下	0.46%	0.42%	0.47%	0.45%
溶出性 ^{注2}	30 分間 70%以上		87.5%	30.0%	30.3%	29.9%
定量法 ^{注3}	95.0～105.0%		99.26%	98.93%	98.51%	98.14%

●光に対する安定性 [3000 lx、25℃、60%RH、シャーレ(開放)] (n=1、定量法は n=2)

試験項目	規格（参考）		開始時	遮光		曝光	
				200 時間 (60 万 lx・hr)	400 時間 (120 万 lx・hr)	200 時間 (60 万 lx・hr)	400 時間 (120 万 lx・hr)
性状	淡黄赤色の粉末		淡黄赤色の粉末	淡黄赤色の粉末	淡黄赤色の粉末	表面はくすんだ淡黄赤色、内部は淡黄赤色、混和後は淡黄赤色の粉末	表面はくすんだ淡黄赤色、内部は淡黄赤色、混和後は淡黄赤色の粉末
純度試験	RRT 約 1.3	1.0%以下	0.36%	0.37%	0.38%	0.85%	0.96%
	個々 ^{注1}	0.25%以下	0.05%	0.05%	0.05%	0.15%	0.19%
	合計	2.0%以下	0.46%	0.42%	0.43%	1.32%	1.53%
溶出性 ^{注2}	30 分間 70%以上		87.5%	26.3%	25.8%	27.2%	25.6%
定量法 ^{注3}	95.0～105.0%		99.26%	101.13%	98.81%	97.91%	96.59%

RRT:相対保持時間、<LOQ：定量限界(0.05%)未満

注 1:RRT 約 1.3 以外の類縁物質の最大値を記載

注 2：6 個の平均値を記載

注 3：2 回の平均値を記載

〈シロドシン OD 錠 4mg「杏林」〉³¹⁾

●湿度に対する安定性 [25℃、60%RH、褐色ガラス瓶(開放)] (n=1、定量法は n=2)

試験項目	規格 (参考)		開始時	2 週間	1 ヶ月	3 ヶ月
性状	淡黄赤色の粉末		淡黄赤色の粉末	淡黄赤色の粉末	淡黄赤色の粉末	淡黄赤色の粉末
純度試験	RRT 約 1.3	1.0%以下	0.33%	0.34%	0.35%	0.37%
	個々 ^{注1}	0.25%以下	0.05%	0.05%	0.05%	0.05%
	合計	2.0%以下	0.38%	0.39%	0.40%	0.42%
溶出性 ^{注2}	30 分間 70%以上		57.6%	17.9%	21.4%	18.5%
定量法 ^{注3}	95.0～105.0%		98.74%	97.51%	98.41%	97.60%

●光に対する安定性 [3000 lx、25℃、60%RH、シャーレ(開放)] (n=1、定量法は n=2)

試験項目	規格 (参考)		開始時	遮光		曝光	
				200 時間 (60 万 lx・hr)	400 時間 (120 万 lx・hr)	200 時間 (60 万 lx・hr)	400 時間 (120 万 lx・hr)
性状	淡黄赤色の粉末		淡黄赤色の粉末	淡黄赤色の粉末	淡黄赤色の粉末	表面はくすんだ淡黄赤色、内部は淡黄赤色、混和後は淡黄赤色の粉末	表面はくすんだ淡黄赤色、内部は淡黄赤色、混和後は淡黄赤色の粉末
純度試験	RRT 約 1.3	1.0%以下	0.33%	0.35%	0.34%	0.75%	0.85%
	個々 ^{注1}	0.25%以下	0.05%	0.05%	0.05%	0.14%	0.16%
	合計	2.0%以下	0.38%	0.50%	0.49%	1.14%	1.35%
溶出性 ^{注2}	30 分間 70%以上		57.6%	16.0%	18.3%	14.8%	16.2%
定量法 ^{注3}	95.0～105.0%		98.74%	98.18%	98.87%	97.68%	96.28%

RRT: 相対保持時間

注 1: RRT 約 1.3 以外の類縁物質の最大値を記載

注 2: 6 個の平均値を記載

注 3: 2 回の平均値を記載

(2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

〈シロドシン OD 錠 2mg/4mg「杏林」〉^{32)、33)}

[試験方法]

崩壊懸濁試験

注入器のピストン部を抜き取り、注入器内に錠剤をそのまま 1 個入れてピストンを戻し注入器に 55℃の温湯 20mL を吸い取り、筒先の蓋をして 5 分間自然放置する。5 分後に注入器を手で 90 度 15 往復横転し、崩壊・懸濁の状態を観察する。5 分後に崩壊しない場合、さらに 5 分間放置後、同様の操作を行う。10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、この方法を中止する。錠剤 1 個につきシートの上から乳棒で数回叩いてコーティング破壊してから注入器内に入れて同様の試験を行う。この方法で 10 分間放置しても崩壊・懸濁しない場合、経管投与不可と判断する。

通過性試験

崩壊懸濁試験で得られた懸濁液をディスペンサーに吸い取り、経管チューブの注入端より 2～3mL/秒の速度で注入する。チューブはベッド上の患者を想定し、体内挿入端から 3 分の 2 を水平にし、他端(注入端)を 30cm の高さにセットする。サイズ 8Fr.、12Fr.、14Fr.、16Fr.、18Fr. のチューブに注入し、通過性を観察する。ただし、チューブサイズ 8Fr. を通過した場合は、その他のチューブサイズでの試験はする必要はない。薬を注入した後に適量の水を同じ注入器で吸い取り、注入してチューブ内を洗う時、注入器内・チューブ内に薬が残存していなければ通過性に問題なしとする。

[結果]

販売名	崩壊懸濁試験	通過性試験
シロドシン OD 錠 2mg 「杏林」	5 分後に崩壊・懸濁した。	8Fr. のチューブを通過した。
シロドシン OD 錠 4mg 「杏林」	5 分後に崩壊・懸濁した。	8Fr. のチューブを通過した。

2. その他の関連資料

該当資料なし