

## 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 $\alpha_{1A}$ 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2mg「サワイ」  
シロドシンOD錠4mg「サワイ」

SILODOSIN OD Tablets [SAWAI]

剤形	OD錠2mg：素錠(口腔内崩壊錠) OD錠4mg：割線入り素錠(口腔内崩壊錠)
製剤の規制区分	劇薬、処方箋医薬品 <sup>注)</sup> 注)注意－医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	OD錠2mg：1錠中日局シロドシン2mg含有 OD錠4mg：1錠中日局シロドシン4mg含有
一般名	和名：シロドシン(JAN) 洋名：Silodosin(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 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：沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL：0120-381-999、FAX：06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト： <a href="https://med.sawai.co.jp/">https://med.sawai.co.jp/</a>

本IFは2022年12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。

# 医薬品インタビューフォーム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)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、IF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IFの位置付け、IF記載様式、IF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IF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF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IFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)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IF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・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせ、IF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. IFとは

IF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。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF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、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。

IF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. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDA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IFを作成・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利用者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、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、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDA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

IF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。IF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IF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、IF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。

(2020年4月改訂)

# 目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	29
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	29
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	29
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	29
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	29
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	5. 重要な基本的注意とその理由	29
6. RMPの概要	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	29
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	30
1. 販売名	3	8. 副作用	31
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	32
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	32
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	32
5. 化学名(命名法)又は本質	3	12. その他の注意	33
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	IX. 非臨床試験に関する項目	34
III. 有効成分に関する項目	5	1. 薬理試験	34
1. 物理化学的性質	5	2. 毒性試験	34
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	X. 管理的事項に関する項目	35
3. 有効成分の確認試験法、定量法	5	1. 規制区分	35
IV. 製剤に関する項目	6	2. 有効期間	35
1. 剤形	6	3. 包装状態での貯法	35
2. 製剤の組成	7	4. 取扱い上の注意	35
3. 添付溶解液の組成及び容量	7	5. 患者向け資材	35
4. 力価	7	6. 同一成分・同効薬	35
5. 混入する可能性のある夾雑物	7	7. 国際誕生年月日	35
6. 製剤の各種条件下における安定性	8	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	36
7. 調製法及び溶解後の安定性	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	36
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	11	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	36
9. 溶出性	12	11. 再審査期間	36
10. 容器・包装	14	12. 投薬期間制限に関する情報	36
11. 別途提供される資材類	14	13. 各種コード	36
12. その他	15	14. 保険給付上の注意	36
V. 治療に関する項目	16	XI. 文献	37
1. 効能又は効果	16	1. 引用文献	37
2. 効能又は効果に関連する注意	16	2. その他の参考文献	38
3. 用法及び用量	16	XII. 参考資料	39
4. 用法及び用量に関連する注意	16	1. 主な外国での発売状況	39
5. 臨床成績	16	2. 海外における臨床支援情報	39
VI. 薬効薬理に関する項目	20	XIII. 備考	40
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	20	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	40
2. 薬理作用	20	2. その他の関連資料	41
VII. 薬物動態に関する項目	21		
1. 血中濃度の推移	21		
2. 薬物速度論的パラメータ	25		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	25		
4. 吸収	26		
5. 分布	26		
6. 代謝	27		
7. 排泄	27		
8. トランスポーターに関する情報	27		
9. 透析等による除去率	27		
10. 特定の背景を有する患者	28		
11. その他	28		

## I. 概要に関する項目

### 1. 開発の経緯

シロドシンOD錠 2mg/4mg「サワイ」は、日局シロドシンを含有する選択的 $\alpha_{1A}$ 遮断薬 前立腺肥大症に伴う排尿障害改善薬である。

本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに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実施し、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成26年11月21日 薬食発1121第2号
承認	2019年2月
上市	2019年6月

### 2. 製品の治療学的特性

- 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の $\alpha_{1A}$ -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。<sup>1)</sup>
- 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。(Ⅷ. -8. 参照)

### 3. 製品の製剤学的特性

- 水なし(唾液のみ)でも服用可能な口腔内崩壊錠である。(Ⅳ. -1. 参照)
- バニラ様芳香で、添加剤由来の甘みを有する。(Ⅳ. -1. 参照)
- 錠剤本体に成分名及び規格を両面ストレート印字している。(Ⅳ. -1. 参照)
- PTPシートに「排尿障害改善薬」、「口腔内崩壊錠」の文字を記載している。
- 個装箱はWカード仕様(2枚の切り取り両面カード)で、使用期限の管理あるいは調剤棚カードとして利用可能である。

### 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材、最適使用ガイドライン等	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材	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

(2023年2月6日時点)

### 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

I. 概要に関する項目

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「サワイ」

シロドシンOD錠 4mg「サワイ」

## 2) 洋名

SILODOSIN OD Tablets [SAWAI]

## 3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

## 2. 一般名 .....

## 1) 和名(命名法)

シロドシン(JAN)

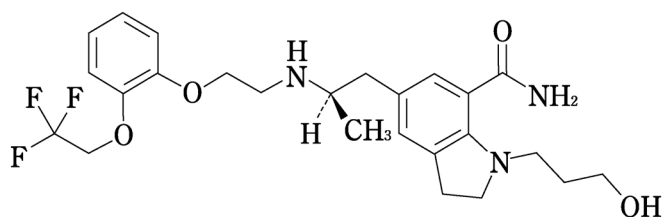
## 2) 洋名(命名法)

Silodosin(JAN、INN)

## 3) ステム(stem)

不明

## 3. 構造式又は示性式 .....



## 4. 分子式及び分子量 .....

分子式：C<sub>25</sub>H<sub>32</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>

分子量：495.53

## 5. 化学名(命名法)又は本質 .....

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)

II. 名称に関する項目

6. 慣用名、別名、略号、記号番号 .....  
特になし



---

## 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。

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

水分：0.1%以下(1.5g、電量滴定法)。ただし、水分気化装置を用いる(加熱温度：150℃、加熱時間：2分)。

#### 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

光によって徐々に黄白色となる。

保存条件：遮光して保存する。

容器：密閉容器。

### 3. 有効成分の確認試験法、定量法

#### <確認試験法>

日局「シロドシン」の確認試験に準ずる。

1) フッ化物の定性反応

2) 紫外可視吸光度測定法

3) 赤外吸収スペクトル測定法

#### <定量法>

日局「シロドシン」の定量法に準ずる。(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

口腔内崩壊錠

## 2) 製剤の外観及び性状

品名	表 (直径mm)	裏 (重量mg)	側面 (厚さmm)	性状
シロドシンOD錠2mg「サワイ」	 6.5	 約100	 3.0	淡黄赤色
シロドシンOD錠4mg「サワイ」	 8.0	 約200	 3.8	淡黄赤色

バニラ様芳香、添加剤由来の甘みを有する。

## 3) 識別コード

## ●シロドシンOD錠2mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：サワイ シロドシン OD2

## ●シロドシンOD錠4mg「サワイ」

表示部位：錠剤本体(両面)

表示内容：シロドシン サワイ OD4

## 4) 製剤の物性

製剤均一性：日局シロドシン口腔内崩壊錠 製剤均一性の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

崩壊性：日局一般試験法 崩壊試験法の項により試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局シロドシン口腔内崩壊錠 溶出性の項により試験を行うとき、規格に適合する。

摩損度：日本薬局方 参考情報 錠剤の摩損度試験法により試験を行う。(25rpm、4分間)  
0.03%(OD錠2mg)、0.00%(OD錠4mg)

## 5) その他

該当しない

## 2. 製剤の組成

## 1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

品名	シロドシンOD錠 2mg「サワイ」	シロドシンOD錠 4mg「サワイ」
有効成分 [1錠中]	日局シロドシン	
	2mg	4mg
添加剤	アミノアルキルメタクリレートコポリマーE、エチルバニリン、クロスポビドン、結晶セルロース、三二酸化鉄、スクラロース、ステアリン酸、タルク、トウモロコシデンプン、バニリン、ヒドロキシプロピルセルロース、部分アルファー化デンプン、フマル酸ステアリルNa、D-マンニトール、メタケイ酸アルミン酸Mg、ラウリル硫酸Na、香料	

## 2) 電解質等の濃度

該当資料なし

## 3) 熱量

該当資料なし

## 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

IV. 製剤に関する項目

6. 製剤の各種条件下における安定性

●シロドシンOD錠2mg「サワイ」

1) 加速試験<sup>2)</sup>

本製剤の安定性を確認するため、加速試験を実施した。  
その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔  
[ピロー]アルミ袋、脱酸素剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	淡黄赤色の口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.7	97.7

※：表示量に対する含有率(%)

2) 長期保存試験<sup>2)</sup>

本製剤の安定性を確認するため、長期保存試験を実施した。  
その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔  
[ピロー]アルミ袋、脱酸素剤

	イニシャル	25°C60%RH・遮光 24ヵ月
性状	淡黄赤色の口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.7	99.6

※：表示量に対する含有率(%)

3) 無包装下の安定性試験<sup>3)</sup>

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度の条件で性状変化、光の条件で性状変化、不純物増加及び含量低下が観察された。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光3ヵ月)	湿度(25°C75%RH・遮光)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	淡黄赤色の 口腔内崩壊錠	変化なし	変化なし	淡黄赤色の口腔内 崩壊錠*1(規格内)
硬度(kg)	4.6	4.8	3.6	3.7
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	98.4	99.5	101.3

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

\*1：わずかに表面のざらつきあり

IV. 製剤に関する項目

	イニシャル	光		室温 (25°C60%RH・ 遮光3ヵ月)
		総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr	
性状	淡黄赤色の 口腔内崩壊錠	淡黄赤色の口腔内 崩壊錠*2(規格内)	淡黄赤色の口腔内 崩壊錠*2(規格内)	変化なし
硬度(kg)	4.6	4.1	4.5	3.8
純度試験	問題なし	不純物増加	不純物増加	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	97.7	96.4	99.5

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

\*2：斑点がわずかに濃くなる、数が増加

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

4) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験<sup>4)</sup>

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。  
その結果、光の条件で性状変化が観察された。

	イニシャル	光		室温 (25°C60%RH・ 遮光6ヵ月)
		総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr	
性状	淡黄赤色の口腔 内崩壊錠	変化なし	淡黄赤色の口腔内 崩壊錠*(規格内)	変化なし
硬度(kg)	5.1	—	—	4.6
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	—	—	問題なし
溶出試験	問題なし	—	—	問題なし
定量試験※	100.0	—	—	98.2

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

\*：斑点がわずかに濃くなる、数の増加

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

●シロドシンOD錠4mg「サワイ」

1) 加速試験<sup>5)</sup>

本製剤の安定性を確認するため、加速試験を実施した。

その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔  
[ピロー]アルミ袋、脱酸素剤

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	淡黄赤色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.3	97.2

※：表示量に対する含有率(%)

#### IV. 製剤に関する項目

##### 2) 長期保存試験<sup>5)</sup>

本製剤の安定性を確認するため、長期保存試験を実施した。  
その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔  
[ピロー]アルミ袋、脱酸素剤

	イニシャル	25°C60%RH・遮光 24ヵ月
性状	淡黄赤色の割線入り口腔内崩壊錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
純度試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
崩壊試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験 <sup>*</sup>	99.3	98.1

※：表示量に対する含有率(%)

##### 3) 無包装下の安定性試験<sup>6)</sup>

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度の条件で性状変化及び硬度低下、光の条件で性状変化及び不純物増加が観察された。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光3ヵ月)	湿度(25°C75%RH・遮光)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	淡黄赤色の割線入り口腔内崩壊錠	変化なし	変化なし	淡黄赤色の割線入り口腔内崩壊錠 <sup>*1</sup> (規格内)
硬度(kg)	6.1	6.0	3.9	4.1
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験 <sup>*</sup>	100.0	99.2	99.9	100.1

	イニシャル	光		室温 (25°C60%RH・遮光3ヵ月)
		総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr	
性状	淡黄赤色の割線入り口腔内崩壊錠	淡黄赤色の割線入り口腔内崩壊錠 <sup>*2</sup> (規格内)	淡黄赤色の割線入り口腔内崩壊錠 <sup>*2</sup> (規格内)	変化なし
硬度(kg)	6.1	4.8	4.9	4.4
純度試験	問題なし	問題なし	不純物増加	問題なし
崩壊試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験 <sup>*</sup>	100.0	98.4	99.0	99.2

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

\*1：わずかに表面のざらつきあり

\*2：斑点がわずかに濃くなる、数が増加

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

4) PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験<sup>7)</sup>

PTP包装品(ピロー包装なし)の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。  
その結果、光の条件で性状変化が観察された。

	イニシャル	光		室温 (25°C60%RH・ 遮光6ヵ月)
		総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr	
性状	淡黄赤色の割線 入り口腔内崩壊錠	変化なし	淡黄赤色の割線入 り口腔内崩壊錠* (規格内)	変化なし
硬度(kg)	5.9	—	—	4.9
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
崩壊試験	問題なし	—	—	問題なし
溶出試験	問題なし	—	—	問題なし
定量試験*	100.0	—	—	98.1

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

\*：斑点がわずかに濃くなる、数の増加

「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 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

5) 分割後の安定性試験<sup>8)</sup>

本製剤を分割後、下記条件で保存し、安定性試験を行った。  
その結果、光の条件で性状変化、不純物増加及び含量低下が観察された。

保存条件		イニシャル	室温 (25°C60%RH・ 遮光3ヵ月)	光	
				総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr
性状	表面	淡黄赤色	変化なし	淡黄赤色* (規格内)	淡黄赤色* (規格内)
	分割面	淡黄赤色	変化なし	淡黄赤色*	淡黄赤色*
純度試験		問題なし	問題なし	問題なし	不純物増加
定量試験*		100.0	98.4	97.6	96.6
含量均一性試験 (参考)		問題なし			

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

\*：イニシャルと比較して斑点がわずかに濃くなる、数の増加

## 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(物理化学的変化)

該当資料なし

IV. 製剤に関する項目

9. 溶出性

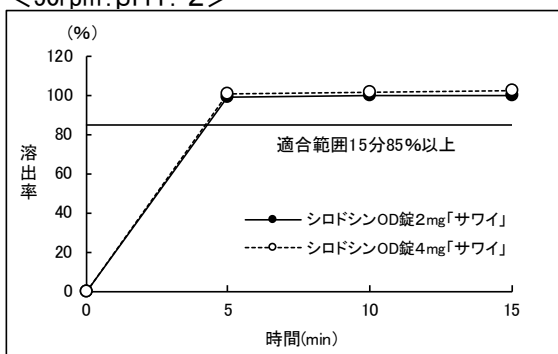
本製剤は、日本薬局方に定められた規格に適合していることが確認されている。

<溶出挙動における同等性及び類似性>

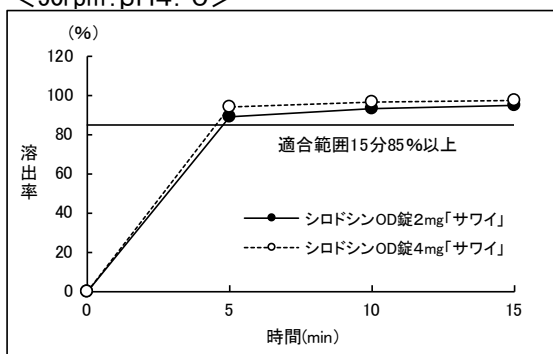
●シロドシンOD錠2mg「サワイ」<sup>9)</sup>

通知等	「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	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、4.0、6.8、水)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	シロドシンOD錠2mg「サワイ」	
標準製剤	シロドシンOD錠4mg「サワイ」	
結果及び考察	<p>&lt;50rpm：pH1.2&gt;                      両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。                      最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、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かった。</p> <p>&lt;50rpm：pH4.0&gt;                      両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。                      最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、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かった。</p> <p>&lt;50rpm：pH6.8&gt;                      両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。                      最終比較時点(15分)における試験製剤の個々の溶出率は、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かった。</p> <p>&lt;50rpm：水&gt;                      標準製剤の平均溶出率が60%(5分)及び85%(30分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±10%の範囲にあった。                      最終比較時点(30分)における試験製剤の個々の溶出率は、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かった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は同等であると判断した。                      本剤の処方変更水準はA水準であり、両製剤の溶出挙動は同等であったことから、両製剤は生物学的に同等であるとみなした。</p>	

<50rpm:pH1.2>

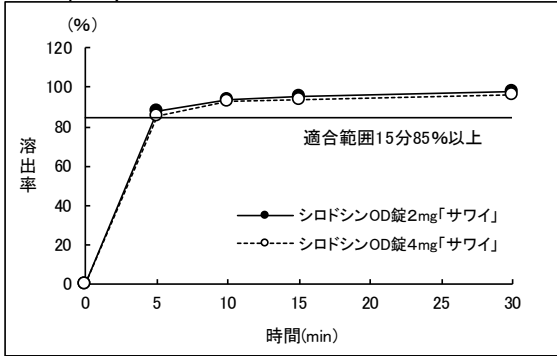


<50rpm:pH4.0>

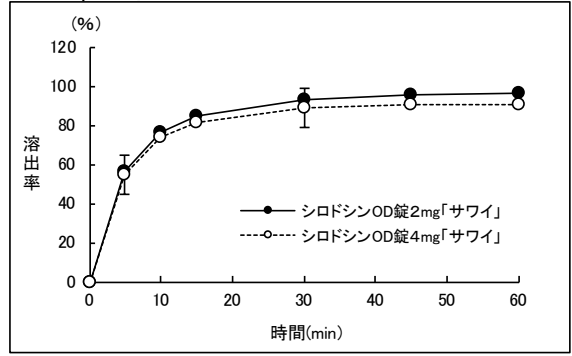




<50rpm:pH6.8>



<50rpm:水>

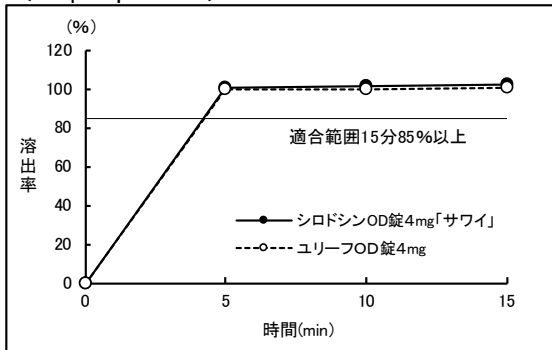


( [ ] : 判定基準の適合範囲)

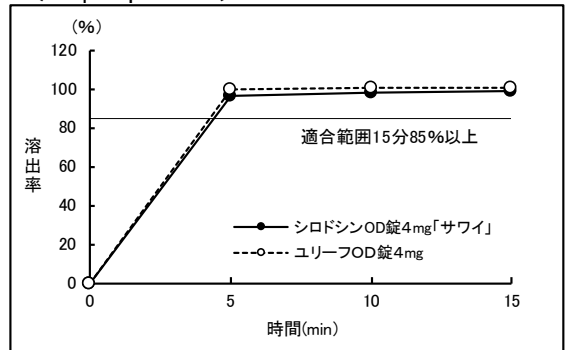
●シロドシンOD錠4mg「サワイ」<sup>10)</sup>

通知等	「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	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1.2、5.0、6.8、水)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	シロドシンOD錠4mg「サワイ」	
標準製剤	ユリーフOD錠4mg	
結果及び考察	<p>&lt;50rpm:pH1.2&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm:pH5.0&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm:pH6.8&gt; 両製剤とも15分以内に平均85%以上溶出した。</p> <p>&lt;50rpm:水&gt; 標準製剤の平均溶出率が60% (10分) 及び85% (30分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p>	

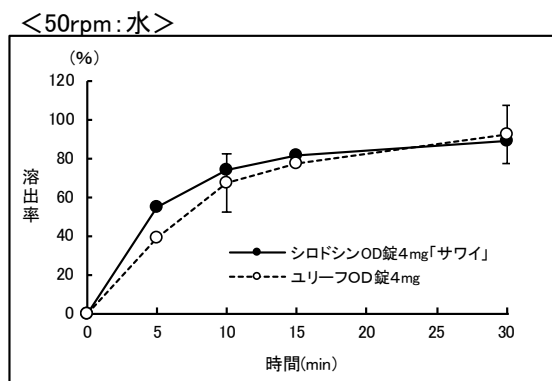
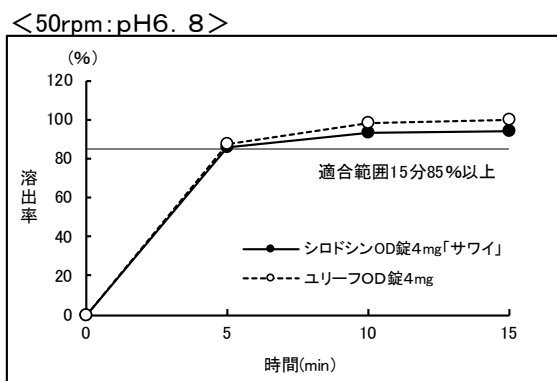
<50rpm:pH1.2>



<50rpm:pH5.0>



IV. 製剤に関する項目



( [ ] : 判定基準の適合範囲)

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

該当資料なし

2) 包装

22. 包装

<シロドシンOD錠 2mg「サワイ」>

PTP[脱酸素剤入り] : 100錠 (10錠×10)

<シロドシンOD錠 4mg「サワイ」>

PTP[脱酸素剤入り] : 100錠 (10錠×10)、140錠 (14錠×10)、500錠 (10錠×50)

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

PTP : [PTPシート]ポリ塩化ビニルフィルム、アルミ箔

[ピロー]アルミ袋、脱酸素剤

11. 別途提供される資材類

該当しない

## 12. その他

## &lt;自動分包機錠剤落下試験&gt;

●シロドシンOD錠2mg「サワイ」<sup>11)</sup>

湯山製作所製自動分包機による試験

試験機器：YS-TR-330FDS II (ユヤマ)

試験方法：本剤の無包装品について、最上段のカセットから錠剤を落下させ、1錠ずつ50包に分包した。

試験結果

イニシャル	25°C75%RH2週間保存品
一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。

## &lt;参考：加湿による錠剤サイズの変化&gt;

イニシャル		→	25°C75%RH2週間保存品	
厚さ (mm)	硬度 (kg)		厚さ (mm)	硬度 (kg)
3.00	5.9		3.12	4.0

●シロドシンOD錠4mg「サワイ」<sup>12)</sup>

湯山製作所製自動分包機による試験

試験機器：YS-TR-330FDS II (ユヤマ)

試験方法：本剤の無包装品について、最上段のカセットから錠剤を落下させ、1錠ずつ50包に分包した。

試験結果

イニシャル	25°C75%RH2週間保存品
一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。	一包化された錠剤に割れ、欠けは認められなかった。

## &lt;参考：加湿による錠剤サイズの変化&gt;

イニシャル		→	25°C75%RH2週間保存品	
厚さ (mm)	硬度 (kg)		厚さ (mm)	硬度 (kg)
3.74	5.8		3.90	4.1

---

## 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

シロドシン製剤の臨床試験成績が以下のとおり報告されている。

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

## 17.1.1 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<sup>注)</sup>、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6)。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<sup>13)</sup>。

表6 I-PSS<sup>a)</sup>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

## 17.1.2 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4mg1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1、表7)。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<sup>14)</sup>。

V. 治療に関する項目

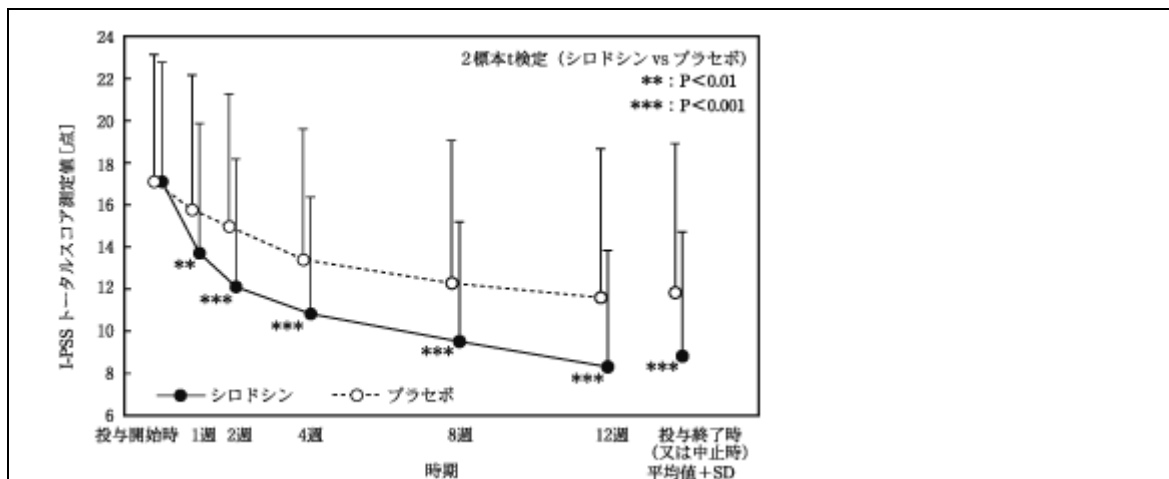


図1 I-PSSトータルスコア測定値の推移

表7 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 <sup>a)</sup>	終了時測定値 <sup>a)</sup>	変化量 <sup>a)</sup>	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

17.1.3 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<sup>15, 16)</sup>。

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

該当しない

7) その他

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

$\alpha_1$ 受容体遮断作用：タムスロシン塩酸塩、ナフトピジル、ウラピジル、テラゾシン塩酸塩、プラゾシン塩酸塩<sup>17)</sup>

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

### 2. 薬理作用

シロドシンの薬理作用について以下のとおり報告されている。

#### 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 $\alpha_{1A}$ -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<sup>1)</sup>。

#### 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 $\alpha$ アドレナリン受容体に対する親和性

ヒト $\alpha_1$ -アドレナリン受容体に対する受容体結合試験において、 $\alpha_{1A}$ -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<sup>18)</sup> (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、 $\alpha_{1A}$ -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<sup>19)</sup>。

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<sup>19)</sup> (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<sup>18)</sup> (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<sup>20)</sup>。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<sup>21)</sup>。

###### 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<sup>22)</sup>。

#### 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

シロドシン製剤の薬物動態について以下のとおり報告されている。

### 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<sup>注)</sup>、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<sup>23~25)</sup>。

##### 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<sup>23,26)</sup>(表1)。

表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たことが推察され、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<sup>27)</sup>。[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。

VII. 薬物動態に関する項目

16.1.4 生物学的同等性試験

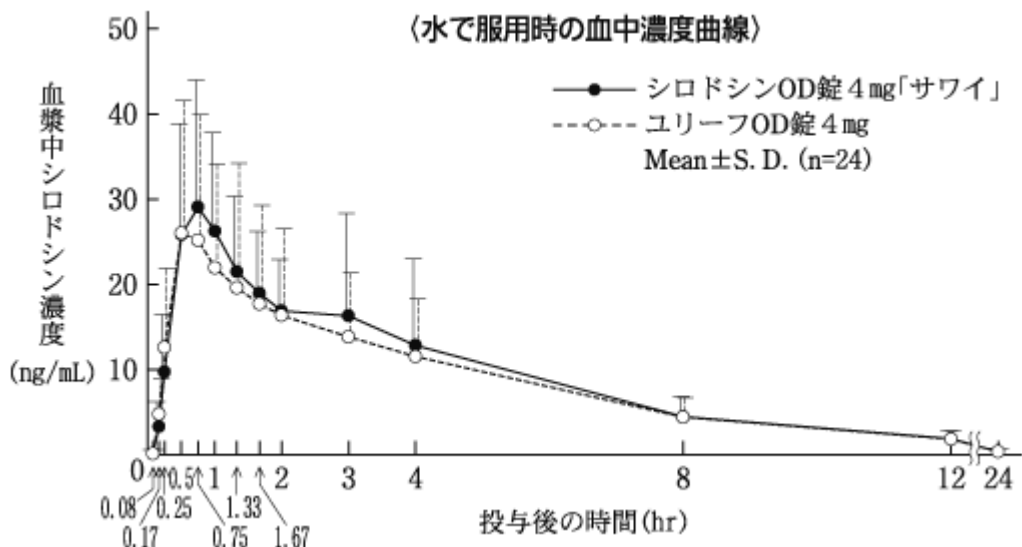
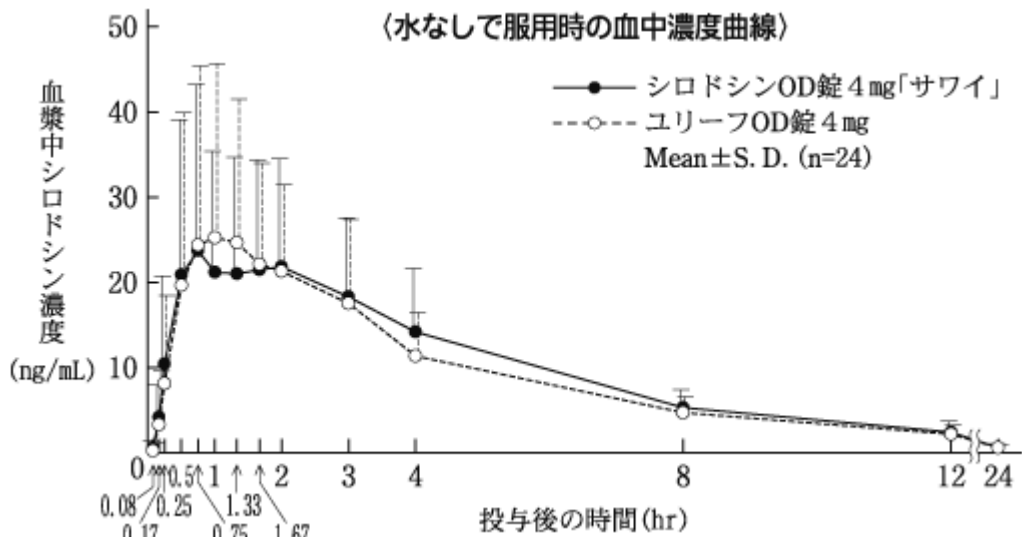
〈シロドシンOD錠 4mg「サワイ」〉

シロドシンOD錠 4mg「サワイ」とユリーフOD錠 4mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(シロドシンとして4mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中シロドシン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC、Cmax)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<sup>28)</sup>。

表2 各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>0-24hr</sub> (ng・hr/mL)
水なし	シロドシンOD錠 4mg「サワイ」	35.4±15.1	1.3±0.8	5.2±1.4	146.4±57.7
	ユリーフOD錠 4mg	35.7±18.7	1.4±0.8	5.6±1.5	136.2±54.7
水あり	シロドシンOD錠 4mg「サワイ」	32.5±15.4	0.9±0.5	4.4±1.5	131.9±67.7
	ユリーフOD錠 4mg	29.2±14.8	0.7±0.3	4.4±1.5	122.6±65.1

(Mean±S. D.)



血漿中濃度ならびにAUC、Cmax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。

<生物学的同等性試験>

●シロドシンOD錠 2mg「サワイ」<sup>9)</sup>

16.8 その他

<シロドシンOD錠 2mg「サワイ」>

シロドシンOD錠 2mg「サワイ」は溶出挙動に基づき、シロドシンOD錠 4mg「サワイ」と生物学的に同等とみなされた。

IV. -9. 参照

●シロドシンOD錠 4mg「サワイ」<sup>28, 29)</sup>

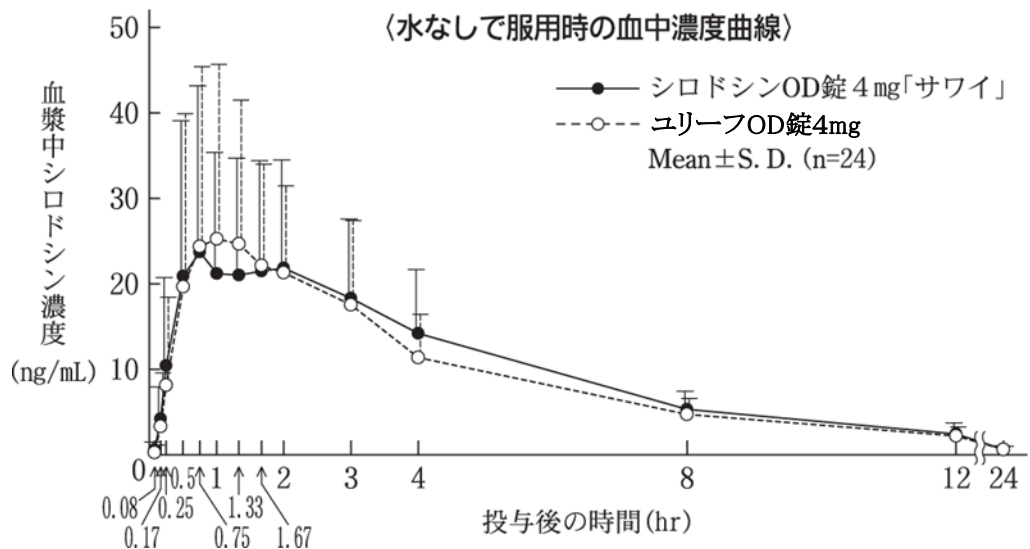
通知等	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」： 平成24年 2月29日 薬食審査発0229第10号
採血時点	0、0.08、0.17、0.25、0.5、0.75、1、1.33、1.67、2、3、4、8、12、24hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	シロドシンOD錠 4mg「サワイ」
標準製剤	ユリーフOD錠 4mg

シロドシンOD錠 4mg「サワイ」とユリーフOD錠 4mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(シロドシンとして4mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中シロドシン濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUC<sub>t</sub>, C<sub>max</sub>)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。

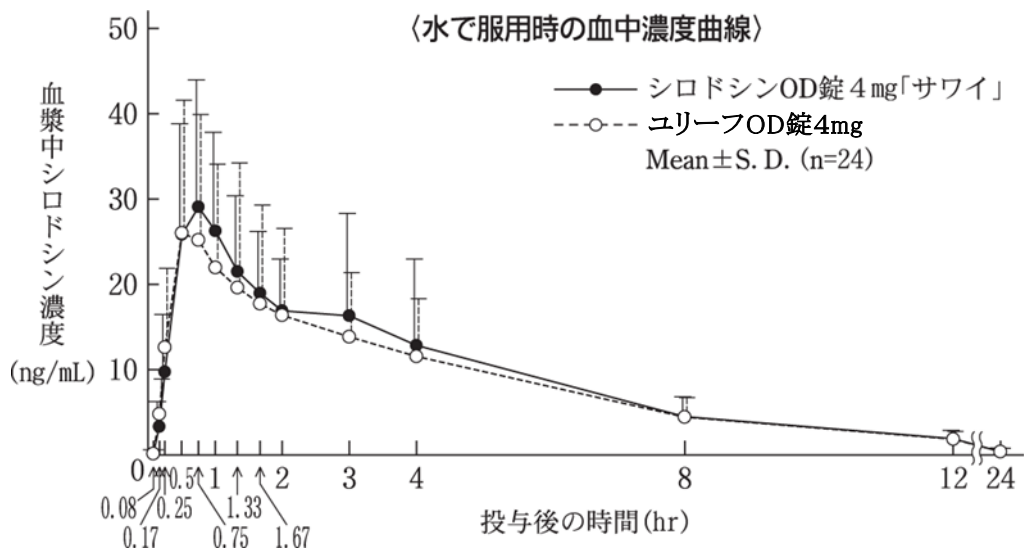
各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

		C <sub>max</sub> (ng/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)	AUC <sub>t</sub> (ng·hr/mL)
水なし	シロドシンOD錠 4mg「サワイ」	35.4±15.1	1.3±0.8	5.2±1.4	146.4±57.7
	ユリーフOD錠 4mg	35.7±18.7	1.4±0.8	5.6±1.5	136.2±54.7
水あり	シロドシンOD錠 4mg「サワイ」	32.5±15.4	0.9±0.5	4.4±1.5	131.9±67.7
	ユリーフOD錠 4mg	29.2±14.8	0.7±0.3	4.4±1.5	122.6±65.1

(Mean±S. D.)



VII. 薬物動態に関する項目



		対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
水なし	AUC <sub>t</sub>	log(1.09)	log(1.02) ~ log(1.16)
	C <sub>max</sub>	log(1.03)	log(0.92) ~ log(1.16)
水あり	AUC <sub>t</sub>	log(1.08)	log(1.00) ~ log(1.17)
	C <sub>max</sub>	log(1.10)	log(0.99) ~ log(1.23)

血漿中濃度ならびにAUC<sub>t</sub>、C<sub>max</sub>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

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 4 mg(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<sup>注)</sup>、食後投与及び空腹時投与でそれぞれ、C<sub>max</sub>は23.0及び28.0ng/mL、AUC<sub>0-48hr</sub>は128.8及び135.9ng・hr/mL、T<sub>max</sub>は2.1及び1.4時間、t<sub>1/2</sub>は6.0及び4.7時間であった<sup>23)</sup>(表3)。

表3 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 <sub>max</sub> (ng/mL)	AUC <sub>0-48hr</sub> (ng・hr/mL)	T <sub>max</sub> (hr)	t <sub>1/2</sub> (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)

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。

## 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<sup>22)</sup>、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<sup>23)</sup>。[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。

## VIII. -7. 参照

## 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

シロドシンOD錠4mg「サワイ」を健康成人男子に1錠(シロドシンとして4mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数<sup>28, 29)</sup>

[水なし]0.146±0.052hr<sup>-1</sup>、[水あり]0.178±0.066hr<sup>-1</sup>

## 4) クリアランス

VII. -5. -6) 参照

## 5) 分布容積

VII. -5. -6) 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

## VII. 薬物動態に関する項目

### 4. 吸収

#### 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<sup>30)</sup>。

VII. -1. -4) 参照

### 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<sup>注)</sup>のクリアランス及び分布容積はそれぞれ $167.0 \pm 33.8$  mL/min及び $49.5 \pm 17.3$  Lであった<sup>30)</sup>。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 $\alpha_1$ -酸性糖タンパクであった<sup>23)</sup> (*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<sup>23)</sup>。健康男性(外国人)6例に「<sup>14</sup>C」標識シロドシン8mg(溶液)を単回経口投与したとき<sup>注)</sup>、血漿中の総放射能AUC<sub>0-12hr</sub>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AUC<sub>0-12hr</sub>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<sup>23)</sup>。  
[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)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「<sup>14</sup>C」標識シロドシン8mg(溶液)を単回経口投与したとき<sup>注)</sup>、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<sup>23)</sup>。

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

VII. 薬物動態に関する項目

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<sup>注)</sup>、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 $\alpha_1$ -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 $\alpha_1$ -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)<sup>23)</sup>(表4)。<sup>[9.2、9.8 参照]</sup>

表4 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<sup>23)</sup>(表5)。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<sup>23)</sup>。

表5 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……………  
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。

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]

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

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。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
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 中濃度が上昇するおそれ があるので、減量するなど注 意すること。	アゾール系抗真菌剤はCYP 3A4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。

## 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%) <sup>注)</sup>	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	

注) [8.1 参照]

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

	5%以上	1～5%未満	1%未満	頻度不明
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、 $\gamma$ -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、赤血球数減少、血色素量減少、ヘマトクリット値減少	白血球数増多、血小板数減少	
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、尿酸上昇、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

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 .....

<p>14. 適用上の注意</p> <p>14.1 薬剤交付時の注意</p> <p>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。</p> <p>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。</p> <p>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。</p>
---

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

$\alpha_1$ 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、 $\alpha_1$ 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/日以上投与群で精嚢腺拡張の頻度の上昇が認められたとの報告がある<sup>31)</sup>。

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<sup>32)</sup>。

---

## IX. 非臨床試験に関する項目

---

シロドシンの非臨床試験成績について以下のとおり報告されている。

1. 薬理試験……………
  - 1) 薬効薬理試験  
「VI. 薬効薬理に関する項目」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  
該当資料なし
  - 5) 生殖発生毒性試験  
該当資料なし
  - 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

規制区分	
製剤	劇薬、処方箋医薬品 <sup>注)</sup>
有効成分	劇薬

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

### 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、湿気を避けて遮光して保存すること。

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

その他の患者向け資材

シロドシンOD錠「サワイ」を服用される方へ(XIII. -2. 参照)

### 6. 同一成分・同効薬

同一成分：ユリーフ錠 2 mg/錠 4 mg/OD錠 2 mg/OD錠 4 mg

同効薬： $\alpha_1$ 受容体遮断作用

タムスロシン塩酸塩、ナフトピジル、ウラピジル、テラゾシン塩酸塩、プラゾシン塩酸塩<sup>17)</sup>

### 7. 国際誕生年月日

該当しない

X. 管理的事項に関する項目

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……………

●シロドシンOD錠2mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2019年2月15日、承認番号：23100AMX00229000

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

●シロドシンOD錠4mg「サワイ」

製造販売承認年月日：2019年2月15日、承認番号：23100AMX00228000

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

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(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード……………

製品名	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「サワイ」	2590010F3018	2590010F3131	126798301	622679801
シロドシンOD錠 4mg「サワイ」	2590010F4014	2590010F4138	126799001	622679901

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) 作用機序(ユリーフカプセル：2006年1月23日承認、申請資料概要2.6.2.1)
- 2) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験] シロドシンOD錠 2mg「サワイ」
- 3) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] シロドシンOD錠 2mg「サワイ」
- 4) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] シロドシンOD錠 2mg「サワイ」
- 5) 沢井製薬(株) 社内資料[安定性試験] シロドシンOD錠 4mg「サワイ」
- 6) 沢井製薬(株) 社内資料[無包装下の安定性試験] シロドシンOD錠 4mg「サワイ」
- 7) 沢井製薬(株) 社内資料[PTP包装品(ピロー包装なし)の安定性試験] シロドシンOD錠 4mg「サワイ」
- 8) 沢井製薬(株) 社内資料[分割後の安定性試験] シロドシンOD錠 4mg「サワイ」
- 9) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] シロドシンOD錠 2mg「サワイ」
- 10) 沢井製薬(株) 社内資料[溶出試験] シロドシンOD錠 4mg「サワイ」
- 11) 沢井製薬(株) 社内資料[自動分包機錠剤落下試験] シロドシンOD錠 2mg「サワイ」
- 12) 沢井製薬(株) 社内資料[自動分包機錠剤落下試験] シロドシンOD錠 4mg「サワイ」
- 13) 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2.7.3.2, 2.7.6.3)
- 14) 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2.5.4.1, 2.7.6.3)
- 15) 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①(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)
- 16) 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②(ユリーフカプセル：2006年1月23日承認、審査報告書)
- 17) 薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2023/2/6 アクセス)
- 18) 立道聡他：薬学雑誌，2006；126(S)：209-216
- 19) Murata, S. et al. : J. Urol. , 2000；164(2)：578-583
- 20) 立道聡他：薬学雑誌，2006；126(S)：217-223
- 21) 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)
- 22) 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)
- 23) 清水智司他：薬学雑誌，2006；126(S)：257-263
- 24) 健康成人を対象とした第Ⅰ相臨床試験①(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) 健康成人を対象とした第Ⅰ相臨床試験②(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)
- 26) 反復投与(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)
- 27) 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)
- 28) 竹内譲他：診療と新薬，2019；56(4)：273-281
- 29) 沢井製薬(株) 社内資料[生物学的同等性試験] シロドシンOD錠 4mg「サワイ」

## X I. 文献

- 30) 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)
- 31) マウスでの104週間投与試験(ユリーフカプセル : 2006年1月23日承認、申請資料概要2.6.6.5)
- 32) 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)
- 33) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] シロドシンOD錠 4mg「サワイ」
- 34) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] シロドシンOD錠 2mg「サワイ」
- 35) 沢井製薬(株) 社内資料[崩壊・懸濁及びチューブ通過性試験] シロドシンOD錠 4mg「サワイ」

## 2. その他の参考文献 .....

---

## XII. 参考資料

---

1. 主な外国での発売状況 .....
  
  2. 海外における臨床支援情報 .....
- 該当資料なし

### XIII. 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。

##### 1) 粉砕

###### 粉砕後の安定性試験

###### ●シロドシンOD錠2mg「サワイ」

シロドシンOD錠2mg「サワイ」は、4mg製剤と同一処方(有効成分及び各添加物の含有比率が同じ)で錠剤重量のみが異なる製剤であるため、シロドシンOD錠2mg「サワイ」の粉砕後の安定性試験は、4mg製剤と同様であると考えられる。

###### ●シロドシンOD錠4mg「サワイ」<sup>33)</sup>

本製剤を粉砕後、下記条件で保存し、安定性試験を行った。

その結果、光の条件において不純物増加が観察された。

	イニシャル	室温 (25°C60%RH・ 遮光3ヵ月)	光	
			総照射量 10万lx・hr	総照射量 30万lx・hr
性状	淡黄赤色の粉末	変化なし	変化なし	変化なし
純度試験	問題なし	問題なし	問題なし	不純物増加
定量試験※	100.0	99.0	99.6	97.3

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

##### 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「サワイ」<sup>34)</sup>

###### 試験方法

1. 本剤を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55°C)20mLを採取した。
2. 5分放置後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。  
崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返した。(最大20分まで)
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、水(20mL)でフラッシュ後、通過状態を観察した。

###### 結果

懸濁状態	錠剤は1分以内に崩壊し、転倒混和により懸濁液となったが、試料は沈殿しやすかった
チューブ通過性	通過した

●シロドシンOD錠4mg「サワイ」<sup>35)</sup>

試験方法

1. 本剤を1錠、シリンジにとり(ピストン部を抜き取り、錠剤を入れてピストン部を戻す)、温湯(約55℃)20mLを採取した。
2. 5分放置後シリンジを15回転倒混和し、崩壊・懸濁状態を確認した。  
崩壊しない場合、5分毎に同様の操作を繰り返した。(最大20分まで)
3. シリンジ内の液を8Fr.(外径2.7mm)フィーディングチューブに注入し、水(20mL)でフラッシュ後、通過状態を観察した。

結 果

懸濁状態	錠剤は1分以内に崩壊し、転倒混和により懸濁液となったが、試料は沈殿しやすかった
チューブ通過性	通過したが、シリンジに若干の付着が認められた

2. その他の関連資料 .....

患者向け資料

- ・シロドシンOD錠「サワイ」を服用される方へ

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照





