astellas

＊＊2026年11月改訂（第３版）
＊2024年４月改訂

日本標準商品分類番号
８７２５９

	D錠0.1mg	D錠0.2mg
承認番号	21600AMZ00554	21600AMZ00555
販売開始	2005年６月	

前立腺肥大症の排尿障害改善剤
タムスロシン塩酸塩口腔内崩壊錠

処方箋医薬品
注意－医師等の処方箋により使用すること

ハルナール®D錠0.1mg
ハルナール®D錠0.2mg

Harnal® D Tablets 0.1mg・0.2mg

処方箋医薬品
注意－医師等の処方箋により使用すること

貯法：室温保存
＊＊有効期間：４年

2.禁忌（次の患者には投与しないこと）
2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3.組成･性状
3.1 組成

	有効成分（１錠中）	添加剤
ハルナールD錠0.1mg	日局 タムスロシン塩酸塩 0.1mg	セルロース、ヒプロメロース、エチルセルロース、メタクリル酸コポリマーLD、ラウリル硫酸ナトリウム、ポリソルベート80、セタノール、アクリル酸エチル・メタクリル酸メチルコポリマー、ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテル、D-マンニトール、乳糖水和物、アメ粉、ステアリン酸カルシウム
ハルナールD錠0.2mg	日局 タムスロシン塩酸塩 0.2mg	

3.2 製剤の性状

	剤形	色	外形・大きさ・重量			識別コード
			表	裏	側面	
ハルナールD錠0.1mg	口腔内崩壊錠	白色				➢HA0.1
			直径	厚さ	重量	
			7.5mm	3.3mm	0.12g	
ハルナールD錠0.2mg	口腔内崩壊錠	白色	表	裏	側面	➢HA0.2
						
			直径	厚さ	重量	
			8.5mm	4.2mm	0.20g	

4.効能又は効果
前立腺肥大症に伴う排尿障害

5.効能又は効果に関連する注意
5.1 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、手術療法等、他の適切な処置を考慮すること。
5.2 前立腺肥大症の診断・診療については、国内外のガイドライン等の最新の情報を参考にすること。

6.用法及び用量
通常、成人にはタムスロシン塩酸塩として0.2mgを１日１回食後に経口投与する。
なお、年齢、症状により適宜増減する。

7.用法及び用量に関連する注意
高齢者で腎機能が低下している場合は0.1mgから投与を開始し、経過を十分に観察した後に0.2mgに増量すること。0.2mgで期待する効果が得られない場合にはそれ以上の増量は行わず、他の適切な処置を行うこと。[9.8 参照]

8.重要な基本的注意
8.1 本剤の過剰投与により血圧低下が予想されるので、投与量には注意すること。
8.2 立位血圧が低下することがあるので、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 めまい等があらわれることがあるので、高所作業、自動車の運転等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]

9.特定の背景を有する患者に関する注意
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]
9.2 腎機能障害患者
9.2.1 重篤な腎機能障害のある患者
血漿中濃度が上昇するおそれがある。[16.6.1 参照]
9.3 肝機能障害患者
9.3.1 重篤な肝機能障害のある患者
血漿中濃度が上昇するおそれがある。
9.8 高齢者
腎機能が低下していることがある。[7.、16.6.1 参照]

10.相互作用
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]	起立性低血圧が起こるおそれがあるので、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。

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。

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、黄疸（いずれも頻度不明）

AST上昇、ALT上昇、黄疸等があらわれることがある。

11.2 その他の副作用

	0.1～5％未満	頻度不明
精神神経系	めまい、ふらふら感	立ちくらみ、頭痛、眠気、いらいら感、しびれ感
循環器	頻脈	血圧低下、起立性低血圧、動悸、不整脈
** 過敏症	発疹	そう痒感、蕁麻疹、多形紅斑、血管性浮腫
消化器	胃不快感、嘔気、嘔吐、胃重感、胃痛、食欲不振、嚥下障害	口渇、便秘、下痢
* その他	咽頭灼焼感、全身倦怠感	鼻閉、浮腫、尿失禁、味覚異常、女性化乳房、持続勃起症、射精障害、術中虹彩緊張低下症候群、霧視、視力障害、ほてり、熱感、灼熱感、胸部不快感

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 本剤は噛み砕かずに服用させること。本剤はタムスロシン塩酸塩の徐放性粒を含有しており、噛み砕いた際に徐放性粒が壊れ、薬物動態が変わる可能性がある。

14.1.3 本剤は舌の上に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。

14.1.4 本剤は寝たままの状態では、水なしで服用させないこと。

15. その他の注意

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。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

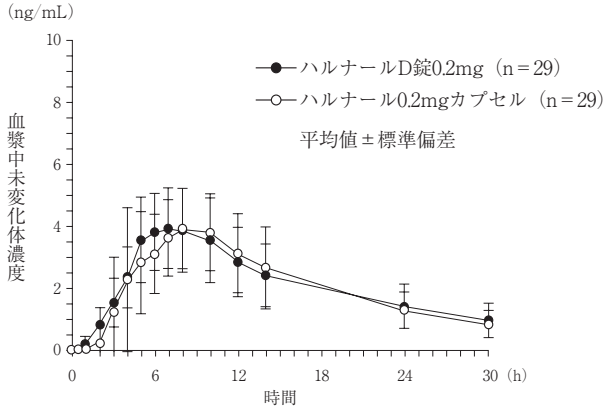
健康成人にハルナールカプセルを0.1～0.6mg[注)]経口投与したとき、血漿中未変化体濃度は投与後7～8時間にピークを示し、半減期は9.0～11.6時間であった[1)]。Cmax及びAUCは投与量にほぼ比例して上昇した。ハルナールカプセルを7日間連続経口投与したとき、半減期はやや延長したが、血漿中未変化体濃度推移は4日目で定常状態に達した[2)]。

ハルナールカプセルの臨床用量での値

用量[注)] (mg)	Tmax (h)	Cmax (ng/mL)	$t_{1/2}$ (h)
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

16.1.2 生物学的同等性試験

健康成人にハルナールD錠0.2mgあるいはハルナール0.2mgカプセルをそれぞれクロスオーバー法で単回経口投与した場合、タムスロシン塩酸塩の血漿中未変化体濃度は下記の図に示したとおりである[3)]。ハルナールD錠とハルナールカプセルは生物学的に同等であった[3)～5)]。



製剤	投与量	Cmax (ng/mL)	AUCt (ng·h/mL)	$t_{1/2}$ (h)	Tmax (h)
ハルナールD錠0.2mg	0.2mg	4.34±1.32	63.5±22.9	11.70±2.96	7.00±2.04
ハルナール0.2mgカプセル	0.2mg	4.71±1.81	62.0±20.8	10.27±3.27	7.83±2.42

16.5 排泄

健康成人にハルナールカプセルを0.1～0.6mg[注)]経口投与したとき、投与後30時間までの未変化体の尿中排泄率は12～14%とほぼ一定であった[1)]。また、連続経口投与したときも尿中排泄率に大きな変動は認められなかった[2)]。

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎機能障害患者

腎機能障害患者11名にハルナール0.2mgカプセルを経口投与したとき、血圧低下はみられなかったが、腎機能重度障害者の2名でタムスロシン塩酸塩の血漿中薬物濃度の上昇がみられた。この血漿中薬物濃度の上昇は、血漿中α_1-AGP（α_1酸性糖蛋白）との蛋白結合による可能性があり、血漿中薬物濃度とα_1-AGP濃度の間には高い相関が認められた。[9.2.1、9.8参照]

なお、タムスロシン塩酸塩の薬効あるいは副作用発現に直接関与すると考えられる非結合型薬物濃度は、血漿中α_1-AGP濃度にかかわらず腎機能正常者のそれとほぼ同様であった[6)]。

注）本剤の承認された1日用量は、0.2mgである。なお、年齢、症状により適宜増減する。

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及びⅢ相試験

前立腺部の尿道内圧を有意に減少させ[7)]、用量依存的な尿流率及び残尿量の改善が認められた[8)9)]。全般改善度の解析対象276例の成績を次に示した。また、二重盲検比較試験の結果、ハルナール0.2mgカプセル1日1回投与において有用性が認められた[10)]。

投与方法	中等度改善以上
0.1mg1日1回投与	28.3%（15/53）
0.2mg1日1回投与	37.3%（62/166）
0.4mg1日1回投与	38.6%（22/57）

注）本剤の承認された1日用量は、0.2mgである。なお、年齢、症状により適宜増減する。

18.薬効薬理

18.1 作用機序

尿道及び前立腺部のα_1受容体を遮断することにより、尿道内圧曲線の前立腺部圧を低下させ、前立腺肥大症に伴う排尿障害を改善する。

18.2 ヒトでの作用

ヒト前立腺標本での受容体結合実験において、プラゾシン塩酸塩より2.2倍、フェントラミンメシル酸塩より40倍強いα_1受容体遮断作用を示した[11]（*in vitro*試験）。

18.3 動物での作用

18.3.1 交感神経α受容体遮断作用

ラット脳膜標本での受容体結合実験及びウサギ大動脈標本での摘出実験において、α_1受容体を選択的かつ競合的に遮断し、その作用はプラゾシン塩酸塩より1/2.2～22倍、フェントラミンメシル酸塩より45～140倍強力であった[12)13)]。なお、ウサギ大動脈、ラット輸精管及びモルモット腸管標本での摘出実験において、本薬はα_2受容体よりもα_1受容体に対して5,400～24,000倍の選択性を示した[12)13)]（*in vitro*試験）。

18.3.2 下部尿路（尿道・膀胱）及び前立腺に対する作用

ウサギ尿道、前立腺及び膀胱基部平滑筋標本での摘出実験において、プラゾシン塩酸塩より23～98倍、フェントラミンメシル酸塩より87～320倍強いα_1受容体遮断作用を示した[14)15)]（*in vitro*試験）。

また、麻酔イヌにおいて、α_1受容体刺激薬による尿道内圧上昇を拡張期血圧上昇よりも13倍強く抑制した[16]。

18.3.3 排尿障害改善作用

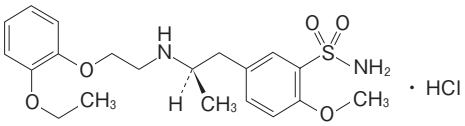
麻酔雄性イヌにおいて、尿道内圧曲線の前立腺部圧を低下させた[17]。一方、麻酔ラットにおいて、律動的膀胱収縮及び膀胱内圧曲線に影響を及ぼさなかった[18]。

19.有効成分に関する理化学的知見

一般名：タムスロシン塩酸塩（Tamsulosin Hydrochloride）

化学名：5-{(2*R*)-2-[2-(2-Ethoxyphenoxy)ethylamino]propyl}-2-methoxybenzenesulfonamide monohydrochloride

構造式：



分子式：$C_{20}H_{28}N_2O_5S \cdot HCl$

分子量：444.97

融　点：約230℃（分解）

性　状：タムスロシン塩酸塩は白色の結晶である。ギ酸に溶けやすく、水にやや溶けにくく、酢酸（100）に溶けにくく、エタノール（99.5）に極めて溶けにくい。

20.取扱い上の注意

PTP品はアルミ袋により品質保持をはかっているので、アルミ袋開封後は湿気を避けて保存すること。ボトル品は乾燥剤で品質保持をはかっているので、蓋を開けたままにしないこと。

22.包装

〈ハルナールD錠0.1mg〉

140錠（14錠×10、乾燥剤入り）

〈ハルナールD錠0.2mg〉

140錠（14錠×10、乾燥剤入り）

23.主要文献

1）角尾道夫 他：臨床医薬 1990；6(12)：2529-2551［HA-0011］

2）角尾道夫 他：臨床医薬 1991；7(1)：63-83［HA-0012］

3）横山　修 他：薬理と治療 2005；33(6)：521-526［HA-05486］

4）横山　修 他：薬理と治療 2005；33(6)：535-540［HA-05485］

5）横山　修 他：薬理と治療 2005；33(6)：527-533［HA-05483］

6）Koiso, K. et al.：J. Clin. Pharmacol. 1996；36(11)：1029-1038［HA-00314］

7）Kawachi, Y.：Curr. Ther. Res. 1998；59(3)：149-161［HA-04828］

8）河邉香月 他：泌尿器外科 1990；3(10)：1247-1259［HA-0027］

9）Kawabe, K. et al.：J. Urol. 1990；144(4)：908-912［HA-0038］

10）河邉香月 他：泌尿器外科 1991；4(2)：231-242［HA-0026］

11）Yamada, S. et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther. 1987；242(1)：326-330［HA-0003］

12）Honda, K. et al.：Naunyn-Schmiedeberg's Arch. Pharmacol. 1985；328(3)：264-272［HA-0036］

13）Honda, K. et al.：Naunyn-Schmiedeberg's Arch. Pharmacol. 1987；336(3)：295-302［HA-0035］

14）Honda, K. et al.：J. Pharmacol. Exp. Ther. 1986；239(2)：512-516［HA-0006］

15）Honda, K. et al.：Naunyn-Schmiedeberg's Arch. Pharmacol. 1985；330(1)：16-21［HA-0004］

16）Shibasaki, M. et al.：J. Auton. Pharmacol. 1992；12(4)：263-268［HA-0037］

17）Sudoh, K. et al.：J. Auton. Pharmacol. 1996；16(3)：147-154［HA-00242］

18）Sudoh, K. et al.：Gen. Pharmacol. 1997；28(4)：521-524［HA-07004］

24.文献請求先及び問い合わせ先

アステラス製薬株式会社　メディカルインフォメーションセンター

〒103-8411　東京都中央区日本橋本町２丁目５番１号

フリーダイヤル　0120-189-371

26.製造販売業者等

26.1 製造販売

アステラス製薬株式会社

東京都中央区日本橋本町2丁目5番1号

AsL

HA031203Z31