

\*\*2010年2月改訂(第9版,「指定医薬品」の表記削除を含む改訂)  
\*2008年12月改訂

日本標準商品分類番号 87259

## 頻尿治療剤

\* **ウロステート錠200mg**

UROSTATE® TABLETS 200mg

フラボキサート塩酸塩錠

承認番号	22000AMX01856
薬価収載	2008年12月
販売開始	1987年10月

貯 法：室温保存  
使用期限：外箱等に表示

## 【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

1. 幽門、十二指腸及び腸管が閉塞している患者  
[弱い副交感神経抑制作用により、腸管運動が抑制される.]
2. 下部尿路に高度の通過障害のある患者  
[弱い副交感神経抑制作用があるので、排尿筋を弛緩、膀胱括約筋を収縮させるおそれがある.]

## 【組成・性状】

販売名	ウロステート錠 200mg		
成分・含量	1錠中 日局フラボキサート塩酸塩 200mg		
添加物	カルナウバロウ、カルメロースカルシウム、酸化チタン、ステアリン酸マグネシウム、タルク、トウモロコシデンプン、ヒプロメロース、マクロゴール6000、メチルセルロース		
剤形	白色フィルムコーティング錠		
外形	表	側面	裏
	直径約9.1mm 厚さ約4.4mm 重量256mg		
識別コード	TZ331		

## 【効能・効果】

下記疾患に伴う頻尿、残尿感  
神経性頻尿、慢性前立腺炎、慢性膀胱炎

## 【用法・用量】

通常成人1回1錠、1日3回経口投与する。  
年齢、症状により適宜増減する。

## 【使用上の注意】

1. 慎重投与 (次の患者には慎重に投与すること)
  - (1) 緑内障の患者  
[弱い副交感神経抑制作用により眼圧が上昇し、症状を悪化させるおそれがある.]
  - (2) 肝障害あるいはその既往歴のある患者  
[副作用として肝障害が報告されている.]
2. 副作用  
本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない(再審査対象外)。
  - (1) 重大な副作用 (頻度不明)
    - 1) ショック、アナフィラキシー様症状：ショック、アナフィラキシー様症状があらわれることがあるので、観察を十分に行い、蕁麻疹、冷汗、呼吸困難、喉頭浮腫、血圧低下等の異常が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
    - 2) 肝機能障害、黄疸 (初期症状：全身倦怠感、食欲不振、発熱、痒疹、眼球黄染等)：AST (GOT)、ALT (GPT)、 $\gamma$ -GTP、ALP、ビリルビンの著しい上昇等を伴う肝機能障害、黄疸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し、適切な処置を行うこと。

## (2) その他の副作用

	頻度不明
消化器	嘔吐、胃痛、腹痛、胸やけ、胃部不快感、食欲不振、悪心、口渇、下痢、便秘等
過敏症 <sup>(1)</sup>	発疹、痒疹等の過敏症状
精神神経系	眠気、不眠、頭痛、めまい、頭部のふらふら感、しびれ感等
眼	つかれ目、眼圧亢進、調節障害
血液 <sup>(2)</sup>	好酸球増多、白血球減少
泌尿器	排尿困難、尿閉
その他	下腹部膨満感、顔面熱感、動悸、胸部不快感、熱感、咽頭部異和感、嗝声等

注) 投与を中止すること。

3. 高齢者への投与  
一般に高齢者では生理機能が低下しているため、減量するなど注意すること。
4. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与  
妊婦又は妊娠している可能性のある女性には投与しないことが望ましい。  
[動物実験(マウス、ラット)で胎児毒性が認められている。]
5. 小児等への投与  
小児に対する臨床評価及び安全性は確立していないので投与しないことが望ましい。
6. 適用上の注意  
薬剤交付時

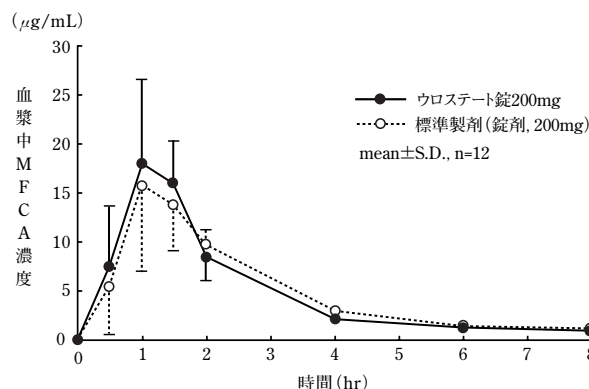
PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること(PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔を起して縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている)。

## 【薬物動態】

1. 生物学的同等性試験<sup>1)</sup>  
健康成人男性にウロステート錠200mgと標準製剤それぞれ1錠(フラボキサート塩酸塩として200mg)をクロスオーバー法により単回経口投与して血漿中主代謝物(MFCA: 3-methylflavone-8-carboxylic acid)濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC, Cmax)について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された。

	AUC <sub>0-8</sub> ( $\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$ )	Cmax ( $\mu\text{g}/\text{mL}$ )	Tmax (hr)	T <sub>1/2</sub> (hr)
ウロステート錠 200mg	38.14 $\pm 8.13$	21.17 $\pm 5.41$	1.17 $\pm 0.25$	1.34 $\pm 0.09$
標準製剤 (錠剤, 200mg)	38.75 $\pm 9.35$	19.01 $\pm 6.89$	1.17 $\pm 0.39$	1.44 $\pm 0.26$

(mean  $\pm$  S.D., n=12)



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

## 2. 溶出挙動<sup>2)</sup>

本剤は、日本薬局方外医薬品規格第3部に定められた溶出規格に適合していることが確認されている。

## 【薬効薬理】<sup>3)</sup>

1. 膀胱充満時の周期的収縮を抑制し、排尿を抑制する。(ラット)
2. 膀胱平滑筋に対し弛緩的に作用するが、低緊張状態においては筋直接作用により、緊張性を保って、正常排尿力を保持する。(モルモット in vitro)
3. 排尿量、電解質排泄量にはほとんど影響しない。(ラット)

## 【有効成分に関する理化学的知見】

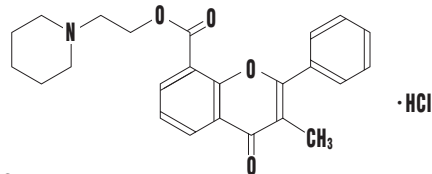
一般名：フラボキサート塩酸塩

Flavoxate Hydrochloride [JAN]

化学名：2-(Piperidin-1-yl)ethyl 3-methyl-4-oxo-2-phenyl-4H-chromene-8-carboxylate monohydrochloride

分子式：C<sub>24</sub>H<sub>25</sub>NO<sub>4</sub> · HCl

化学構造式：



分子量：427.92

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。酢酸(100)又はクロロホルムにやや溶けにくく、水又はエタノール(95)に溶けにくく、アセトニトリル又はジエチルエーテルにほとんど溶けない。

## 【取扱い上の注意】

### 安定性試験<sup>4)</sup>

最終包装製品を用いた長期保存試験(室温, 3年)の結果、本剤は通常の市場流通下において3年間安定であることが確認された。

## 【包装】

ウロステート錠 200mg： 100錠 (10錠×10)  
1,000錠 (10錠×100)

## 【主要文献】

- 1) 社内資料 (生物学的同等性試験)
- 2) 社内資料 (溶出試験)
- 3) 布施 宏 昭 他：薬理と治療, 15：3985, 1987
- 4) 社内資料 (安定性試験)

## \*\*【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

主要文献に記載の社内資料につきましても下記にご請求ください。

あすか製薬株式会社 くすり相談室  
〒108-8532 東京都港区芝浦二丁目5番1号  
TEL 0120-848-339 03-5484-8339  
FAX 03-5484-8358

製造販売元

**あすか製薬株式会社**  
東京都港区芝浦二丁目5番1号

販売

**武田薬品工業株式会社**  
大阪府中央区道修町四丁目1番1号