

◎アボルブカプセル, ○デュタステリド錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】デュタステリド (U) Dutasteride 【分類】前立腺肥大症治療薬

【単位】◎0.5mg/Cap

【常用量】1回0.5mg1日1回

【用法】1日1回 [嚥んだり開けたりせずに服用]

【透析患者への投与方法】常用量 (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】常用量 (1)

【特徴】テストステロンをより活性の高いジヒドロテストステロン (DHT) に変換する1型および2型の5 $\alpha$ 還元酵素を阻害し, DHTの生成を抑制する。勃起障害などの副作用は少ない。前立腺体積の大きい例に対する効果は, デュタステリド, タムスロシンそれぞれの単独よりも併用で高い (Roehrborn CG, et al: Eur Urol 57: 123-31, 2010)

【主な副作用・毒性】勃起不全, リビドー減退, 乳房障害 (女性化乳房, 乳頭痛, 乳房痛, 乳房不快感), 抑うつ気分, 浮動性めまい, 味覚異常, 精巣痛, 肝機能障害, 消化器症状, 倦怠感など。男性乳癌が報告されている。

【吸収】食事の影響を受けない (1)

【F】59% (1) 60% (U)

【tmax】2hr (1) 2~3hr (U)

【代謝】CYP3A4/5で代謝 (1,U) 主代謝物は1,2-二水素化体, 4'-水酸化体, 6-水酸化体 (1) 1,2-二水素化体への代謝経路は血中デュタステリド濃度の増加に伴って飽和するが, それを触媒する酵素は明らかになっていない (1) 線形の代謝経路である6-水酸化体及び4'-水酸化体の生成に

関与するのはCYP3A4/5 (1) 未変化体に対する代謝物の活性は4'-水酸化体で1/10, 6-水酸化体は同程度, 1,2-二水素化体は阻害形式は異なる可能性があるが, 5ARに対するIC50は同程度 (1)

【排泄】非線形に消失 (1) 尿中には排泄されず, 主に代謝物として糞便中に回収される (1) 尿中未変化体排泄率0.1%未満 (1,U) 糞便中未変化体排泄率5% (1,U) 40%が代謝物として糞便中に回収 (U)

【CL】CL/F 0.35~0.40L/hr (1) 高濃度で0.58L/hr, 低濃度で6.2L/hr (Gisleskog PO, et al: Br J Clin Pharmacol 47: 53-8, 1999 PMID: 10073740)

【t1/2】非常に長く, 健康成人への単回投与時では4~7日, 前立腺肥大患者の定常状態では3.4±1.2週間 (1) 投与量依存的に消失半減期が延長 (1) 加齢により延長 (U) 定常状態まで5週間 (U)

【蛋白結合率】99.8% [Alb, AAG, ステロイド結合グロブリン等] (1) Albと99%, AAGと96.6%結合 (U)

【Vd】Vd: 159L/man [F=59%] (1) Vd/F: 232 ~ 298L/man (1) 511L/man (Gisleskog PO, et al: Br J Clin Pharmacol 47: 53-8, 1999 PMID: 10073740) 300~500L/man (U) 精液中に血中の11.5%が移行する (U)

【MW】528.53

【透析性】透析されないとされる (5) データなし (1)

【薬物動態】用量依存的にクリアランスが低下する非線形動態を示す (Gisleskog PO, et al: Br J Clin Pharmacol 47: 53-8, 1999 PMID: 10073740) 消失が遅いので内服中止後4~6か月にわたり血中に検出される (U)

【O/W 係数】log P=4.9 [1-オクタノール/水系, 理論値] (1)

【相互作用】CYP3A4を阻害するベラパミルの併用により全身クリアランスが37%低下, ジルチアゼム併用で全身クリアランスが44%低下する (1)

【効果発現時間】12週以降 (1)

【備考】通常6か月投与で効果を評価 (1) 一包化不可 (1) 経皮吸収されるのでカプセルから漏れた薬剤には女性, 小児等が触らないようにするなど取り扱いに注意 (1) 前立腺容積の低下と相関して血中PSA値が低下し, 定常状態ではPSA値を2倍した値で評価する必要がある (1) BPHに $\alpha$ 1-blockerと併用されることがある。

【更新日】20240530

※正確な情報を掲載するように努力していますが, その正確性, 完全性, 適切性についていかなる責任も負わず, いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし, それらを利用した結果, 直接または間接的に生じた一切の問題について, 当院ではいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は, 日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。