

▼アドシルカ錠 [内]

【重要度】【透析患者に投与禁忌】 【一般製剤名】タダラフィル (U) Tadalafil 【分類】肺高血圧症治療薬 [PDE-5 阻害剤]

【単位】▼20mg/錠

【常用量】40mg/日

【用法】1日1回

【透析患者への投与方法】AUCが2倍に増大し禁忌 (1)

【その他の報告】避ける (FDA)

【CRRT】データなし (FDA)

【保存期 CKD 患者への投与方法】軽度～中等度腎障害患者は20mg/日、高度腎障害患者は禁忌 (1)

【その他の報告】Ccr 31～80mL/min : 20mg/日として忍容性があれば40mg/日、Ccr 30mL/min 未満 : 避ける (FDA)

軽度～中等度腎障害患者でAUCが2倍に上昇、腎不全では代謝物のAUCが3倍になる (Forgue ST, et al: Br J Clin Pharmacol 63: 24-35, 2007 PMID: 16869816)

【特徴】PDE5 阻害剤の肺動脈性肺高血圧症治療薬。肺動脈平滑筋内のcGMPの分解を阻害することより、肺動脈平滑筋を弛緩させ肺循環を改善させる。血中濃度半減期が約14～15hrと長く、1日1回の経口投与で治療できる。

【主な副作用・毒性】頭痛、潮紅、浮動性めまい、筋痛、過敏症 (SJSを含む)、動悸、血圧低下、視力障害、消化器症状など

【吸収】食事の影響を受けない (U)

【F】検討されていない (1,U) 用量依存的に低下する可能性がある (1)

【tmax】2hr [30min～6hr] (U) 3hr (1) 2hr (Forgue ST, et al: Br J Clin Pharmacol 61: 280-8, 2006 PMID: 16487221)

【代謝】主にCYP3A4により代謝される (U) カテコール体はメチル化、グルクロン酸抱合によりさらに代謝される。メチルカテコール体はグルクロン酸抱合体の10%未満であり、どちらも活性はない (U)

【排泄】尿中に36%、糞便中に61%回収 (1,U,17)

【CL/F】2.5L/hr (U, Fogue ST, et al: Br J Clin Pharmacol 61: 280-8, 2006 PMID: 16487221) 3.39L/hr (1) 1.6L/hr でγGT 上昇により低下 (Troconiz IF, et al: Eur J Clin Pharmacol 63: 583-90, 2007 PMID: 17431603)

【t1/2】17.5hr (U, Fogue ST, et al: Br J Clin Pharmacol 61: 280-8, 2006 PMID: 16487221) 14～15hr (1)

【蛋白結合率】94% (1,U) アルブミン、AAGと結合 (1)

【Vd】63L/man (U, Fogue ST, et al: Br J Clin Pharmacol 61: 280-8, 2006 PMID: 16487221) 精液中移行率は低い (U) Vd/F=77.1L/man (1)

【MW】389.40

【透析性】低いと思われる (U) 除去されない (1)

【薬物動態】合併症によりPKは変化しない (Troconiz IF, et al: Eur J Clin Pharmacol 63: 583-90, 2007 PMID: 17431603)

【O/W 係数】2.89 [1-オクタノール/水系] (1)

【相互作用】NO 供給剤、CYP3A4の強力な阻害剤、CYP3A4誘導剤との併用禁忌 (1) ポセンタン [CYP3A4誘導剤] 併用によりAUCが41.4%低下 (Wrishko RE, et al: J Clin Pharmacol 48: 610-8, 2007) アンプリセンタンとの相互作用は認められない (Spence R, et al: J Pharm Sci 98:4962-74, 2009)

【備考】単回投与でレイノー病における血流改善効果は認めない (Eriedman EA, et al: Clin Pharmacol Ther 81: 503-9, 2007) この項のPKの記載はED治療時のものを含んでいる (5)

【更新日】20210222

※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。