▼デトルシトールカプセル　［内］＜2025.3 販売中止＞

【重要度】★★　【一般製剤名】トルテロジン酒石酸塩（U）　Tolterodine Tartrate　【分類】過活動膀胱治療剤［抗コリン剤］
【単位】▼2mg・▼4mg/Cap
【常用量】4mg/日
■腎障害がある患者，肝障害がある患者，又はマクロライド系抗生物質及びアゾール系抗真菌薬等の CYP3A4 阻害薬を併用している患者においてはトルテロジン及び DD01（薬理活性を有するトルテロジン水酸化代謝物）の血清中濃度が増加する可能性があるので，2mg を 1 日 1 回（1）
【用法】1 日 1 回
【透析患者への投与方法】2mg/日（1）
【保存期 CKD 患者への投与方法】1 日 1 回 2mg ：トルテロジン及び DD01（活性のあるトルテロジン水酸化代謝物）の血清中濃度が増加する可能性があるため（1）
【その他の報告】Ccr 10～30mL/min：1mg を 1 日 2 回，Ccr 10mL/min 未満：データなく推奨されない（FDA）
【特徴】ムスカリン受容体拮抗剤で膀胱選択性が高く，過活動膀胱（OAB）における尿意切迫感、頻尿及び切迫性尿失禁に用いられる徐放性カプセル製剤．ムスカリンサブタイプ選択性は高くないが，他剤に比べると M2 への選択性が高く，口腔乾燥の頻度は低め．通常はフェソテロジン製剤を選択する．
【主な副作用･毒性】尿閉，口内乾燥，便秘・消化不良などの消化器症状，健忘，失見当識，心悸亢進，QT 延長，排尿障害，視力異常，霧視，味覚異常，口渇，鼻炎，皮膚乾燥，末梢浮腫，アナフィラキシー（血管浮腫を含む）など
【安全性に関する情報】臨床的に有意な QT 延長をきたさない（Malhotra BK, et al: Clin Pharmacol Ther 81: 377-85, 2007）
【F】CYP2D6 の EM 17±9.5%，PM 65±26%（1）放射活性として 77%（U）
【tmax】トルテロジン：4.0±1.8，DD01：4.4±1.5（1）
【代謝】CYP2D6 及び CYP3A4 で代謝される（1）CYP2D6 によりフェニル基 5 位のメチル基が酸化され DD01 を生成する．トルテロジン及び DD01 は CYP3A4 により脱アルキル化され，その後酸化または脱アルキル化により代謝される（1）PM における主代謝経路は CYP3A4 による N-脱メチル化であると考えられている（1）肝で活性な 5-ヒドロキシメチル体に変換（U）活性体の水酸化体も CYP2D6 で代謝され，intermediate metabolizer は活性体の曝露量が EM や PM に比べ高くなる（Oishi M, et al: Drug Metab Dispos 38:1456-63, 2010）
【排泄】尿中未変化体排泄率 1%未満（PM1.7%），DD01 の尿中排泄率 7.2%［po］（1）尿中回収率 77%（1,U）尿中未変化体排泄率：EM1%未満，PM2.5%未満（U）DD01 としての尿中排泄率：EM 5～14%，PM1%未満（U）未変化体として 1～2%，活性代謝物として 3～12%が尿中に回収（17）
【CL】 CYP2D6 の EM ： 45±12L/hr，PM ： 9.5±1.8L/hr（1）
【t1/2】未変化体：11.3±5.41hr，DD01：8.53±2.58hr（1）1.9～3.7hr（U）
【腎障害患者の体内動態】GFR30mL/min 以下への 2mg を単回経口投与試験 ： 未変化体および代謝物 DD01 の血清中濃度は、健康成人に比べて 2～3 倍高値を示し、代謝物（N-脱アルキルトルテロジン，トルテロジン酸，N-脱アルキルトルテロジン酸，N-脱アルキル DD01）の曝露量は 10～30 倍高値（1）
【蛋白結合率】主に AAG と結合（1）非結合率（注意！）：トルテロジン：3.7±0.13%，DD01：36±4.0%（1）96.3%（U）DD01：64%（U）
【Vd】113L/man［iv］（1）中枢移行性は低いと思われ，中枢神経系への影響は軽度である可能性（5）113±26.7L/man（U）
【MW】475.57
【透析性】データなし（1）蛋白結合率が高く，Vd が大きいため透析されにくいと思われる（5）
【O/W 係数】1.40［1-オクタノール/リン酸 buffer，pH7.3］（1）
【相互作用】CYP3A4、CYP2D6 阻害薬との併用により本剤の血中濃度が上昇する（1）デュロキセチンとの相互作用は軽微（Hua TC, et al: Br J Clin Pharmacol 57: 652-6, 2004）
【肝障害患者における情報】中等度肝障害例には常用量適用可（Cawello W, et al: Eur J Drug Metab Pharmacokinet 39: 155-63, 2014）
【主な臨床報告】前立腺肥大を伴う中等度までの過活動膀胱例に対するタムスロシンとの併用は単剤よりも有効率が高い（Kaplan SA, et al: JAMA 296: 2319-28, 2006）
【更新日】20240905

※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。