▼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　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（Ccr＜30）は禁忌［臨床試験から除外］（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 2007 PMID: 16869816）
PAH における試験では，透析や Ccr 30 未満は除外（1）
【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, Forgue ST, et al: Br J Clin Pharmacol 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 2007 PMID: 17431603）
【t1/2】17.5hr（U, Forgue ST, et al: Br J Clin Pharmacol 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, Forgue ST, et al: Br J Clin Pharmacol 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 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）ボセンタン［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）
アンブ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）
アムロジピン併用でタダラフィル AUC1.57 倍，アムロジン AUC0.93 倍（Kim H, et al: Drug Des Devel Ther 2022 PMID: 35221673）
【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】20240921

※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。