

△ザルティア錠 [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】前立腺肥大に伴う排尿障害治療薬 [PDE5 阻害剤]

【単位】△2.5mg・△5mg/錠

【常用量】5mg/日 [CYP3A4 を強く阻害する薬剤併用時は2.5mg/日から開始]

【用法】1 日 1 回

【透析患者への投与方法】禁忌 (1)

1 回 5mg, 週 2 回による改善率 36.6% (Bolat MS, et al: Ren Fail 2017 PMID: 28742406)

【保存期 CKD 患者への投与方法】中等度腎障害患者では血中濃度上昇の可能性および投与経験が限られているため 2.5mg/日への減量を考慮 (1)

【特徴】下部尿路に発現している PDE5 を阻害することで、血管を拡張させ下部尿路組織への血流および酸素供給量を増加させる。頻尿に効果あり。

【主な副作用・毒性】SJS, 剥脱性皮膚炎, 動悸, ほてり, 潮紅, 眼痛, 霧視, 突発性難聴, 消化器症状, 筋肉痛, 頭痛, 浮動性めまい, 勃起増強, 呼吸困難, 多汗症, CK 上昇など

【吸収】初回通過効果を受けない (1)

【F】静注製剤がないので算出できないが, 尿中回収率より 36%以上 (1)

【tmax】3hr (1)

【代謝】主に CYP3A4 でカテコール体に代謝され, さらにメチル化, グルクロン酸抱合を受ける (1) 主代謝物のメチルカテロールグルクロン酸抱合体の活性はない (1)

【排泄】尿中回収率 36% [po, 312hr まで] (1) 尿中回収物の大部分は代謝物 (1)

【CL/F】1.84L/hr (1)

【t1/2】24hr (1)

【蛋白結合率】94% [Alb, AAG] (1)

【Vd/F】68.5L/man (1)

【MW】389.40

【透析性】除去されない (1)

【O/W 係数】2.89 [1-オクタノール/水系] (1)

【相互作用】NO 供与剤との併用禁忌 (1) 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)

【主な臨床報告】α1 遮断薬抵抗性の前立腺肥大に伴う下部尿路症状に 5mg/日を追加投与して 4~8 週目の評価で有用性があつた (林圭一郎, 他: 日泌尿会誌 107: 28-33, 2016) 抗炎症作用を有している可能性 (Vignozzi L, et al: Prostate 73: 1391-1402, 2013)

【備考】

【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。