

医薬品インタビューフォーム

日本病院薬剤師会のIF記載要領2018(2019年更新版)に準拠して作成

勃起不全治療剤

タダラフィル錠

タダラフィル錠 10mg CI「サワイ」

タダラフィル錠 20mg CI「サワイ」

TADALAFIL Tablets CI [SAWAI]

剤形	フィルムコーティング錠
製剤の規制区分	処方箋医薬品 ^{注)} 注)注意—医師等の処方箋により使用すること
規格・含量	錠10mgCI: 1錠中タダラフィル10mg含有 錠20mgCI: 1錠中タダラフィル20mg含有
一般名	和名: タダラフィル(JAN) 洋名: Tadalafil(JAN)
製造販売承認年月日 薬価基準収載年月日 販売開始年月日	製造販売承認年月日: 2020年2月19日 薬価基準収載年月日: 薬価基準未収載 販売開始年月日: 2020年3月26日(錠10mgCI) 2020年3月19日(錠20mgCI)
製造販売(輸入)・提携・ 販売会社名	製造販売元: 沢井製薬株式会社
医薬情報担当者の連絡先	
問い合わせ窓口	沢井製薬株式会社 医薬品情報センター TEL: 0120-381-999、FAX: 06-7708-8966 医療関係者向け総合情報サイト: https://med.sawai.co.jp/

本IFは2024年5月改訂の電子添文の記載に基づき改訂した。

最新の情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構の医薬品情報検索ページで確認してください。

医薬品インタビューフォーム利用の手引きの概要 —日本病院薬剤師会—

1. 医薬品インタビューフォーム作成の経緯

医療用医薬品の基本的な要約情報として、医療用医薬品添付文書(以下、添付文書)がある。医療現場で医師・薬剤師等の医療従事者が日常業務に必要な医薬品の適正使用情報を活用する際には、添付文書に記載された情報を裏付ける更に詳細な情報が必要な場合があり、製薬企業の医薬情報担当者(以下、MR)等への情報の追加請求や質疑により情報を補完してきている。この際に必要な情報を網羅的に入手するための項目リストとして医薬品インタビューフォーム(以下、IFと略す)が誕生した。

1988年に日本病院薬剤師会(以下、日病薬)学術第2小委員会がIFの位置付け、IF記載様式、IF記載要領を策定し、その後1998年に日病薬学術第3小委員会が、2008年、2013年に日病薬医薬情報委員会がIF記載要領の改訂を行ってきた。

IF記載要領2008以降、IFはPDF等の電子的データとして提供することが原則となった。これにより、添付文書の主要な改訂があった場合に改訂の根拠データを追加したIFが速やかに提供されることとなった。最新版のIFは、医薬品医療機器総合機構(以下、PMDA)の医療用医薬品情報検索のページ(<http://www.pmda.go.jp/PmdaSearch/iyakuSearch/>)にて公開されている。日病薬では、2009年より新医薬品のIFの情報を検討する組織として「インタビューフォーム検討会」を設置し、個々のIFが添付文書を補完する適正使用情報として適切か審査・検討している。

2019年の添付文書記載要領の変更に合わせて、IF記載要領2018が公表され、今般「医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン」に関連する情報整備のため、その更新版を策定した。

2. IFとは

IFは「添付文書等の情報を補完し、医師・薬剤師等の医療従事者にとって日常業務に必要な、医薬品の品質管理のための情報、処方設計のための情報、調剤のための情報、医薬品の適正使用のための情報、薬学的な患者ケアのための情報等が集約された総合的な個別の医薬品解説書として、日病薬が記載要領を策定し、薬剤師等のために当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業に作成及び提供を依頼している学術資料」と位置付けられる。

IFに記載する項目配列は日病薬が策定したIF記載要領に準拠し、一部の例外を除き承認の範囲内の情報が記載される。ただし、製薬企業の機密等に関わるもの及び利用者自らが評価・判断・提供すべき事項等はIFの記載事項とはならない。言い換えると、製薬企業から提供されたIFは、利用者自らが評価・判断・臨床適用するとともに、必要な補完をするものという認識を持つことを前提としている。

IFの提供は電子データを基本とし、製薬企業での製本は必須ではない。

3. IFの利用にあたって

電子媒体のIFは、PMDAの医療用医薬品情報検索のページに掲載場所が設定されている。

製薬企業は「医薬品インタビューフォーム作成の手引き」に従ってIFを作成・提供するが、IFの原点を踏まえ、医療現場に不足している情報やIF作成時に記載し難い情報等については製薬企業のMR等へのインタビューにより利用者自らが内容を充実させ、IFの利用性を高める必要がある。また、随時改訂される使用上の注意等に関する事項に関しては、IFが改訂されるまでの間は、製薬企業が提供する改訂内容を明らかにした文書等、あるいは各種の医薬品情報提供サービス等により薬剤師等自らが整備するとともに、IFの使用にあたっては、最新の添付文書をPMDAの医薬品医療機器情報検索のページで確認する必要がある。

なお、適正使用や安全性の確保の点から記載されている「V. 5. 臨床成績」や「XII. 参考資料」、「XIII. 備考」に関する項目等は承認を受けていない情報が含まれることがあり、その取り扱いには十分留意すべきである。

4. 利用に際しての留意点

IFを日常業務において欠かすことができない医薬品情報源として活用していただきたい。IFは日病薬の要請を受けて、当該医薬品の製造販売又は販売に携わる企業が作成・提供する、医薬品適正使用のための学術資料であるとの位置づけだが、記載・表現には薬機法の広告規則や医療用医薬品の販売情報提供活動に関するガイドライン、製薬協コード・オブ・プラクティス等の制約を一定程度受けざるを得ない。販売情報提供活動ガイドラインでは、未承認薬や承認外の用法等に関する情報提供について、製薬企業が医療従事者からの求めに応じて行うことは差し支えないとされており、MR等へのインタビューや自らの文献調査などにより、利用者自らがIFの内容を充実させるべきものであることを認識しておかなければならない。製薬企業から得られる情報の科学的根拠を確認し、その客観性を見抜き、医療現場における適正使用を確保することは薬剤師の本務であり、IFを活用して日常業務を更に価値あるものにしていただきたい。

(2020年4月改訂)

目次

I. 概要に関する項目	1	VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目	27
1. 開発の経緯	1	1. 警告内容とその理由	27
2. 製品の治療学的特性	1	2. 禁忌内容とその理由	27
3. 製品の製剤学的特性	1	3. 効能又は効果に関連する注意とその理由	27
4. 適正使用に関して周知すべき特性	1	4. 用法及び用量に関連する注意とその理由	27
5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項	2	5. 重要な基本的注意とその理由	27
6. RMPの概要	2	6. 特定の背景を有する患者に関する注意	28
II. 名称に関する項目	3	7. 相互作用	29
1. 販売名	3	8. 副作用	30
2. 一般名	3	9. 臨床検査結果に及ぼす影響	31
3. 構造式又は示性式	3	10. 過量投与	31
4. 分子式及び分子量	3	11. 適用上の注意	31
5. 化学名(命名法)又は本質	3	12. その他の注意	32
6. 慣用名、別名、略号、記号番号	4	IX. 非臨床試験に関する項目	33
III. 有効成分に関する項目	5	1. 薬理試験	33
1. 物理化学的性質	5	2. 毒性試験	33
2. 有効成分の各種条件下における安定性	5	X. 管理的事項に関する項目	34
3. 有効成分の確認試験法、定量法	5	1. 規制区分	34
IV. 製剤に関する項目	6	2. 有効期間	34
1. 剤形	6	3. 包装状態での貯法	34
2. 製剤の組成	6	4. 取扱い上の注意	34
3. 添付溶解液の組成及び容量	7	5. 患者向け資材	34
4. 力価	7	6. 同一成分・同効薬	34
5. 混入する可能性のある夾雑物	7	7. 国際誕生年月日	34
6. 製剤の各種条件下における安定性	7	8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準 収載年月日、販売開始年月日	34
7. 調製法及び溶解後の安定性	9	9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等 の年月日及びその内容	34
8. 他剤との配合変化(物理化学的変化)	9	10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその 内容	34
9. 溶出性	9	11. 再審査期間	35
10. 容器・包装	13	12. 投薬期間制限に関する情報	35
11. 別途提供される資材類	14	13. 各種コード	35
12. その他	14	14. 保険給付上の注意	35
V. 治療に関する項目	15	XI. 文献	36
1. 効能又は効果	15	1. 引用文献	36
2. 効能又は効果に関連する注意	15	2. その他の参考文献	37
3. 用法及び用量	15	XII. 参考資料	38
4. 用法及び用量に関連する注意	15	1. 主な外国での発売状況	38
5. 臨床成績	15	2. 海外における臨床支援情報	38
VI. 薬効薬理に関する項目	19	XIII. 備考	39
1. 薬理学的に関連ある化合物又は化合物群	19	1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあ たっての参考情報	39
2. 薬理作用	19	2. その他の関連資料	40
VII. 薬物動態に関する項目	20		
1. 血中濃度の推移	20		
2. 薬物速度論的パラメータ	23		
3. 母集団(ポピュレーション)解析	24		
4. 吸収	24		
5. 分布	24		
6. 代謝	25		
7. 排泄	25		
8. トランスポーターに関する情報	25		
9. 透析等による除去率	25		
10. 特定の背景を有する患者	26		
11. その他	26		

I. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

タダラフィル錠10mgCI/錠20mgCI「サワイ」は、タダラフィルを含有する勃起不全治療剤である。本剤は、後発医薬品として下記通知に基づき、製造方法並びに規格及び試験方法を設定、安定性試験、生物学的同等性試験を実施し、承認を得て上市に至った。

承認申請に際し準拠した通知名	平成26年11月21日 薬食発1121第2号
承認	2020年2月
上市	2020年3月

2. 製品の治療学的特性

- 1) 本剤は、「勃起不全(満足な性行為を行うに十分な勃起とその維持が出来ない患者)」の効能又は効果を有する。(V. -1. 参照)
- 2) 本剤の用法は、「1日1回投与」である。(V. -3. 参照)
- 3) 性的刺激により一酸化窒素(NO)の局所的な遊離が生じる際に、タダラフィルは、cGMP分解酵素であるPDE5を阻害することにより海綿体のcGMP濃度を上昇させる。その結果、平滑筋が弛緩し、陰茎組織への血流が増大して勃起が達成される¹⁾。(VI. -2. 参照)
- 4) 重大な副作用として、過敏症が報告されている。(VIII. -8. 参照)

3. 製品の製剤学的特性

- 1) 円形の錠剤である。(IV. -1. 参照)
- 2) 個装箱と封緘シールに偽造防止技術を採用している。
 - ①チェンジング箔付き個装箱

「医療用医薬品の偽造品流通防止のための施策のあり方に関する検討会 最終とりまとめ」(平成29年12月28日)に基づき、見る角度によって見える文字が変化する印刷技術を採用している。
 - ②改ざん防止用ラベル

「医薬品の封・密閉性の確保に関するガイドライン(2019年版)」(2019年5月30日 日薬連発第431号)に基づき、一度開封されると「開封済」と表示される封かんシールを採用している。
- 3) PTPシートに1錠単位で「ニトログリセリンなどの硝酸薬と本剤は併用できません。」と記載している(裏面)。(IV. -10. 参照)

4. 適正使用に関して周知すべき特性

適正使用に関する資材、最適使用ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小化活動として作成されている資材	無
最適使用推進ガイドライン	無
保険適用上の留意事項通知	無

(2025年2月3日時点)

I. 概要に関する項目

5. 承認条件及び流通・使用上の制限事項

1) 承認条件

該当しない

2) 流通・使用上の制限事項

該当しない

6. RMPの概要

該当しない

II. 名称に関する項目

1. 販売名

1) 和名

タダラフィル錠10mgCI「サワイ」

タダラフィル錠20mgCI「サワイ」

2) 洋名

TADALAFIL Tablets CI [SAWAI]

3) 名称の由来

通知「平成17年9月22日 薬食審査発第0922001号」に基づき命名した。

2. 一般名

1) 和名(命名法)

タダラフィル(JAN)

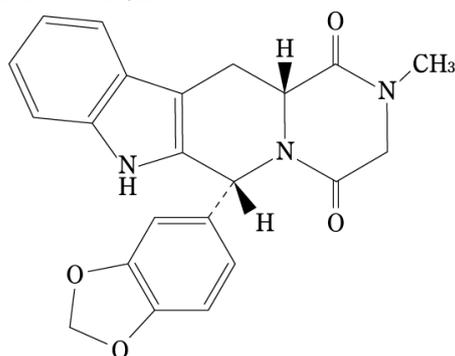
2) 洋名(命名法)

Tadalafil(JAN)

3) ステム(stem)

-afil : inhibitors of phosphodiesterase PDE 5 with vasodilator action

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式 : $C_{22}H_{19}N_3O_4$

分子量 : 389.40

5. 化学名(命名法)又は本質

(6*R*, 12*aR*)-6-(1,3-Benzodioxol-5-yl)-2-methyl-2,3,6,7,12,12*a*-hexahydropyrazino[1',2':1,6]pyrido[3,4-*b*]indole-1,4-dione (IUPAC)

II. 名称に関する項目

6. 慣用名、別名、略号、記号番号
特になし

Ⅲ. 有効成分に関する項目

1. 物理化学的性質……………
 - 1) 外観・性状
白色の粉末である。
 - 2) 溶解性
ジメチルスルホキシドに溶けやすく、水にほとんど溶けない。
 - 3) 吸湿性
乾燥減量：0.5%以下
 - 4) 融点(分解点)、沸点、凝固点
該当資料なし
 - 5) 酸塩基解離定数
該当資料なし
 - 6) 分配係数
該当資料なし
 - 7) その他の主な示性値
比旋光度 $[\alpha]_D^{20}$ ：+78.0～+84.0°（乾燥後、0.25g、ジメチルスルホキシド、25mL、100mm）
2. 有効成分の各種条件下における安定性……………
該当資料なし
3. 有効成分の確認試験法、定量法……………
 - <確認試験法>
赤外吸収スペクトル測定法
 - <定量法>
液体クロマトグラフィー

IV. 製剤に関する項目

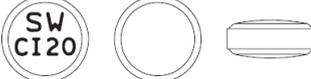
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

1) 剤形の区別

フィルムコーティング錠

2) 製剤の外観及び性状

品名	タダラフィル錠10mgCI「サワイ」	タダラフィル錠20mgCI「サワイ」
外形		
性状	うすい黄色	
直径(mm)	8.1	9.1
厚さ(mm)	3.8	4.0
重量(mg)	約208	約281

3) 識別コード

●タダラフィル錠10mgCI「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW CI 10

●タダラフィル錠20mgCI「サワイ」

表示部位：錠剤本体(片面)、PTPシート

表示内容：SW CI 20

4) 製剤の物性

製剤均一性：日局一般試験法 製剤均一性試験法の項により含量均一性試験を行うとき、規格に適合する。

溶出性：日局一般試験法 溶出試験法(パドル法)の項により試験を行うとき、規格に適合する。

5) その他

該当しない

2. 製剤の組成

1) 有効成分(活性成分)の含量及び添加剤

品名	タダラフィル錠10mgCI「サワイ」	タダラフィル錠20mgCI「サワイ」
有効成分 [1錠中]	タダラフィル	
	10mg	20mg
添加剤	カルナウバロウ、クロスカルメロースNa、結晶セルロース、酸化チタン、三二酸化鉄、ステアリン酸Mg、タルク、乳糖、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒプロメロース、マクロゴール6000、ラウリル硫酸Na	

2) 電解質等の濃度

該当資料なし

3) 熱量

該当資料なし

3. 添付溶解液の組成及び容量

該当しない

4. 力価

該当しない

5. 混入する可能性のある夾雑物

該当資料なし

6. 製剤の各種条件下における安定性

●タダラフィル錠10mgCI「サワイ」

1) 加速試験²⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験を実施した。

その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム、アルミ箔

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6ヵ月
性状	うすい黄色のフィルムコーティング錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	99.7	100.0

ロット数：3，繰り返し回数：3

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験³⁾

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度及び室温の条件で硬度低下が観察された。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光3ヵ月)	湿度(25°C75%RH・遮光)	
			1ヵ月	3ヵ月
性状	うすい黄色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	8.5	8.6	5.0	5.5
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.3	100.8	100.6

IV. 製剤に関する項目

	イニシャル	光* (総照射量 120万lx・hr)	室温 (25°C60%RH・遮光)	
			1 ヵ月	3 ヵ月
性状	うすい黄色の フィルムコー ティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	8.5	6.0	5.9	6.5
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	99.6	99.5	99.8

ロット数：1，繰り返し回数：1

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

*：25°C60%RH、D65蛍光ランプ(1000lx)、開放シャーレ

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

●タダラフィル錠20mgCI「サワイ」

1) 加速試験⁴⁾

本製剤の安定性を確認するため、加速試験を実施した。

その結果、規格に適合した。

PTP： [PTPシート]ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム、アルミ箔

	イニシャル	40°C75%RH・遮光 6 ヵ月
性状	うすい黄色のフィルムコー ティング錠	同左
確認試験	規格に適合	同左
含量均一性試験	規格に適合	同左
溶出試験	規格に適合	同左
定量試験※	100.0	99.4

ロット数：3，繰り返し回数：3

※：表示量に対する含有率(%)

2) 無包装下の安定性試験⁵⁾

無包装の本製剤を、下記条件で保存し、安定性試験を行った。

その結果、湿度、光及び室温の条件で硬度低下が観察された。

	イニシャル	温度 (40°C・遮光3 ヵ月)	湿度(25°C75%RH・遮光)	
			1 ヵ月	3 ヵ月
性状	うすい黄色の フィルムコー ティング錠	変化なし	変化なし	変化なし
硬度(kg)	10.6	10.4	6.4	6.6
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	100.0	101.3	100.0

IV. 製剤に関する項目

	イニシャル	光*		室温 (25°C60%RH・遮光)	
		総照射量 60万lx・hr	総照射量 120万lx・hr	1 ヶ月	3 ヶ月
性状	うすい黄色のフィルムコーティング錠	変化なし	変化なし	変化なし	変化なし
硬度 (kg)	10.6	8.0	6.8	7.3	7.5
溶出試験	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし	問題なし
定量試験※	100.0	100.0	100.4	100.4	99.7

ロット数：1，繰り返し回数：1

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

*：25°C60%RH、D65蛍光ランプ(1000lx)、開放シャーレ

「錠剤・カプセル剤の無包装状態での安定性試験法について(答申)」(平成11年8月20日 日本病院薬剤師会)に準じて試験を実施した。

7. 調製法及び溶解後の安定性
該当しない

8. 他剤との配合変化(物理化学的变化)
該当資料なし

9. 溶出性
＜溶出挙動における同等性及び類似性＞

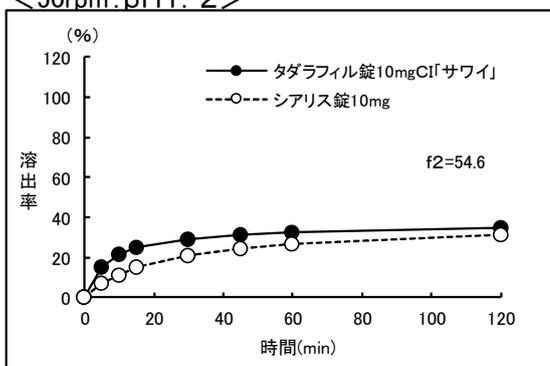
●タダラフィル10mgCI「サワイ」⁶⁾

試験方法	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に従い、試験を実施した。	
試験条件	パドル法	50rpm(pH1.2、4.0、6.8、水) 50rpm(ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加：pH1.2、4.0、6.8) 100rpm(ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加：pH4.0)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	タダラフィル錠10mgCI「サワイ」	
標準製剤	シアリス錠10mg	
結果及び考察	<p><50rpm：pH1.2> f2 関数の値が53以上であった。</p> <p><50rpm：pH4.0> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p> <p><50rpm：pH6.8> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p> <p><50rpm：水> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p>	

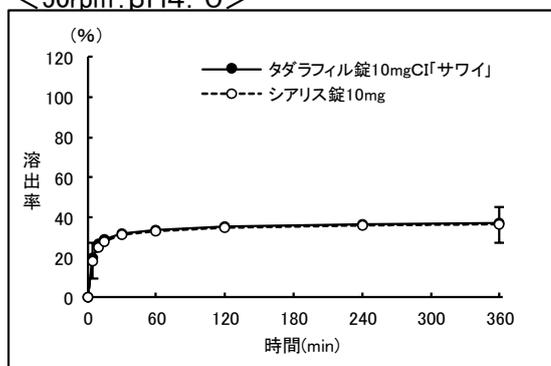
IV. 製剤に関する項目

結果及び考察	<p><50rpm : pH1.2ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加> 標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(10分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±12%の範囲にあった。</p> <p><50rpm : pH4.0ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加> 標準製剤の平均溶出率が40%(10分)及び85%(240分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p><50rpm : pH6.8ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加> 標準製剤の平均溶出率が40%(10分)及び85%(180分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p><100rpm : pH4.0ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加> 標準製剤の平均溶出率が40%(5分)及び85%(90分)付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p>
--------	---

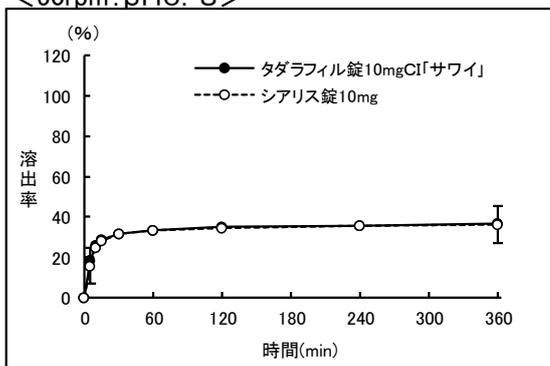
<50rpm : pH1.2>



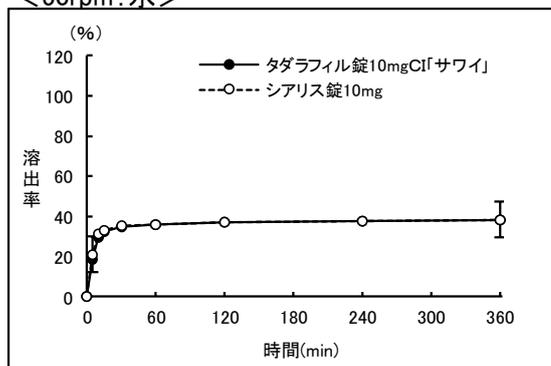
<50rpm : pH4.0>



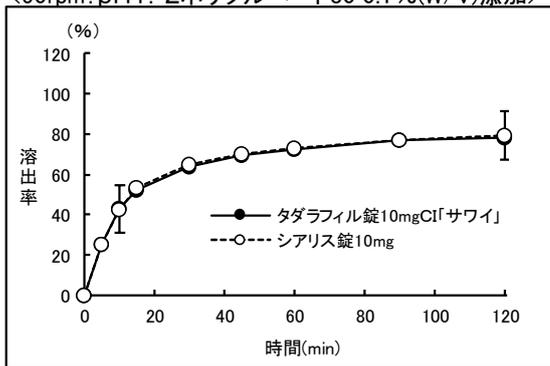
<50rpm : pH6.8>



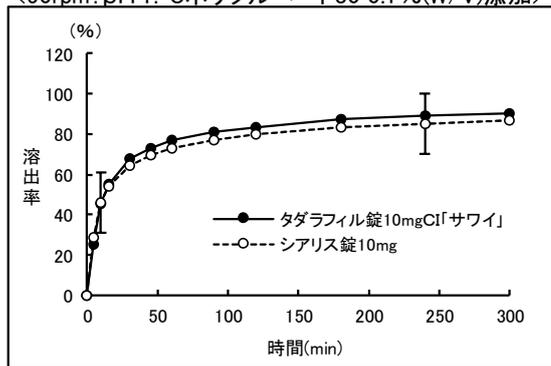
<50rpm : 水>



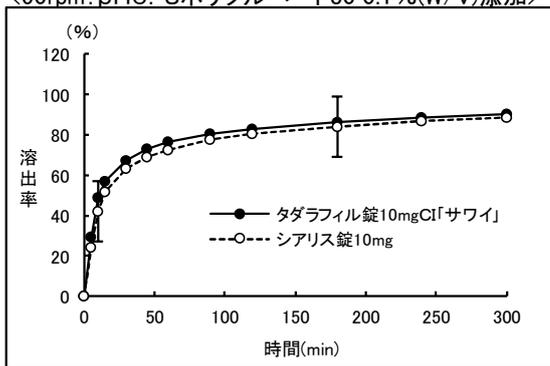
<50rpm : pH1.2ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



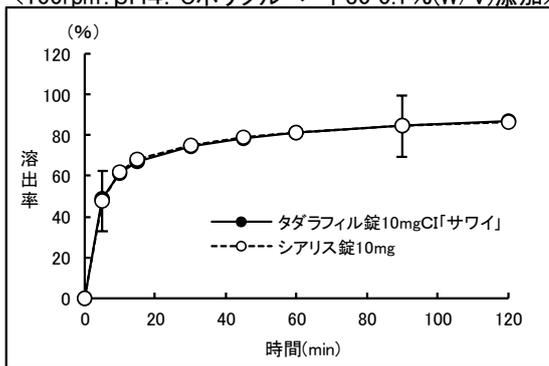
<50rpm : pH4.0ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



<50rpm: pH6. 8ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



<100rpm: pH4. 0ポリソルベート80 0.1%(W/V)添加>



([] : 判定基準の適合範囲)

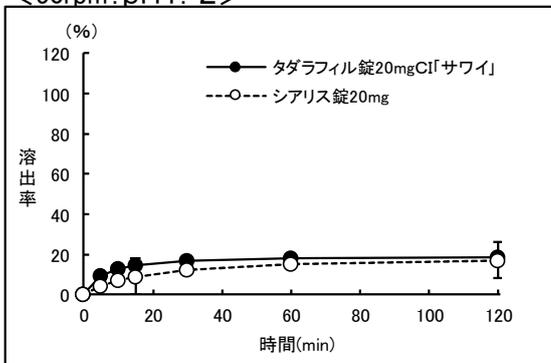
●タダラフィル錠20mgCI「サワイ」⁷⁾

試験方法	「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に従い、試験を実施した。	
試験条件	パドル法	50rpm (pH1. 2、4. 0、6. 8、水) 50rpm (ポリソルベート80 0. 5% (W/V) 添加: pH1. 2、4. 0、6. 8) 100rpm (ポリソルベート80 0. 5% (W/V) 添加: pH4. 0)
試験回数	12ベッセル	
試験製剤	タダラフィル錠20mgCI「サワイ」	
標準製剤	シアリス錠20mg	
結果及び考察	<p><50rpm: pH1. 2> 標準製剤が規定された試験時間(120分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(15分)及び規定された試験時間(120分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p> <p><50rpm: pH4. 0> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p> <p><50rpm: pH6. 8> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p> <p><50rpm: 水> 標準製剤が規定された試験時間(360分)における平均溶出率の1/2の平均溶出率を示す時点(5分)及び規定された試験時間(360分)において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±9%の範囲にあった。</p> <p><50rpm: pH1. 2ポリソルベート80 0. 5% (W/V) 添加> 標準製剤の平均溶出率が40% (10分) 及び85% (60分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p><50rpm: pH4. 0ポリソルベート80 0. 5% (W/V) 添加> 標準製剤の平均溶出率が40% (10分) 及び85% (60分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p><50rpm: pH6. 8ポリソルベート80 0. 5% (W/V) 添加> 標準製剤の平均溶出率が40% (10分) 及び85% (60分) 付近の2時点において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p>	

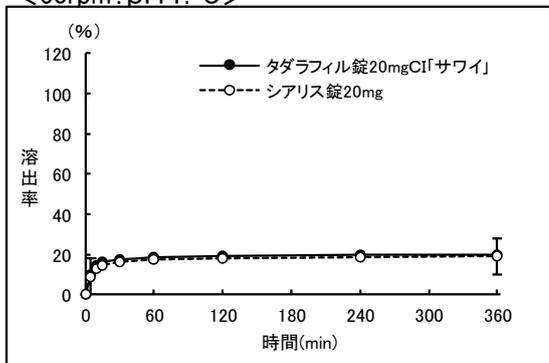
IV. 製剤に関する項目

結果及び考察	<p><100rpm: pH4.0ポリソルベート80 0.5%(W/V)添加> 15分において、試験製剤の平均溶出率は標準製剤の平均溶出率±15%の範囲にあった。</p> <p>以上の結果より、両製剤の溶出挙動は類似していると判断した。</p>
--------	---

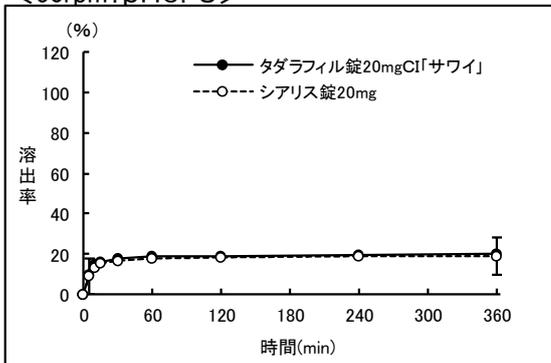
<50rpm: pH1.2>



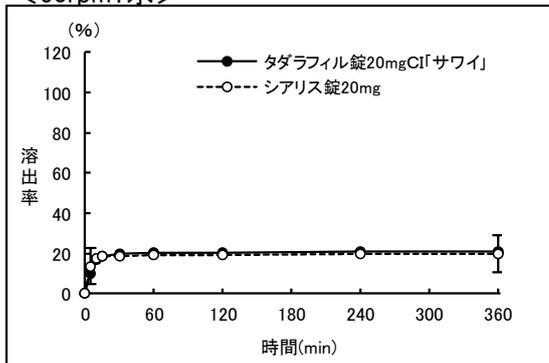
<50rpm: pH4.0>



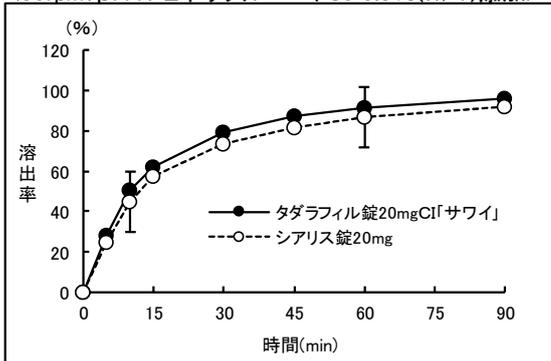
<50rpm: pH6.8>



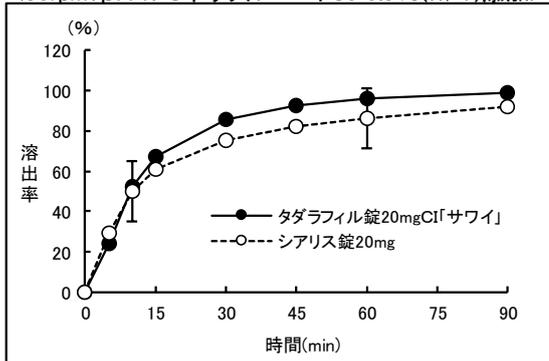
<50rpm: 水>



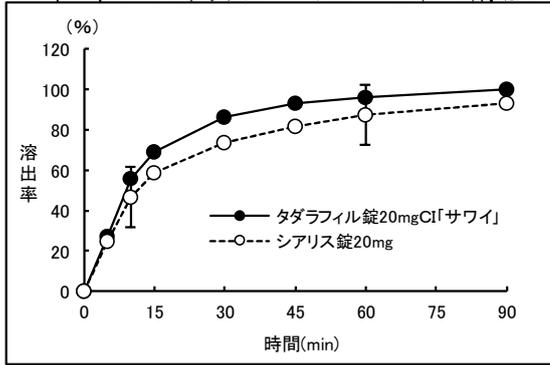
<50rpm: pH1.2ポリソルベート80 0.5%(W/V)添加>



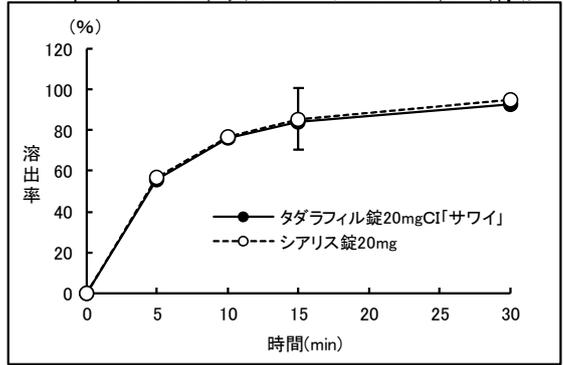
<50rpm: pH4.0ポリソルベート80 0.5%(W/V)添加>



<50rpm: pH6. 8ポリソルベート80 0.5%(W/V)添加>



<100rpm: pH4. 0ポリソルベート80 0.5%(W/V)添加>



([] : 判定基準の適合範囲)

10. 容器・包装

1) 注意が必要な容器・包装、外観が特殊な容器・包装に関する情報

● タダラフィル錠10mgCI「サワイ」



イメージ

● タダラフィル錠20mgCI「サワイ」



イメージ

VIII. - 1. 参照

IV. 製剤に関する項目

2) 包装

22. 包装 〈タダラフィル錠10mgCI「サワイ」〉 PTP：20錠(10錠×2) 〈タダラフィル錠20mgCI「サワイ」〉 PTP：20錠(10錠×2)、40錠(10錠×4)

3) 予備容量

該当しない

4) 容器の材質

PTP：[PTPシート]ポリクロロトリフルオロエチレンフィルム、アルミ箔
[ピロー]ポリエチレンフィルム

11. 別途提供される資材類

該当しない

12. その他

該当資料なし

V. 治療に関する項目

1. 効能又は効果

4. 効能又は効果

勃起不全(満足な性行為を行うに十分な勃起とその維持が出来ない患者)

2. 効能又は効果に関連する注意

5. 効能又は効果に関連する注意

5.1 投与に際しては、勃起不全及びその基礎疾患の診断のため、既往歴の調査や諸検査を行い、客観的な診断に基づき臨床上治療が必要とされる患者に限定すること。

5.2 本剤は催淫剤又は性欲増進剤ではない。

3. 用法及び用量

1) 用法及び用量の解説

6. 用法及び用量

通常、成人には1日1回タダラフィルとして10mgを性行為の約1時間前に経口投与する。10mgの投与で十分な効果が得られず、忍容性が良好と判断された器質性又は混合型勃起不全患者に対しては、20mgに増量することができる。軽度又は中等度の肝障害のある患者では10mgを超えないこと。なお、いずれの場合も1日の投与は1回とし、投与間隔は24時間以上とすること。

中等度又は重度の腎障害のある患者では、5mgから開始し、投与間隔は24時間以上とすること。なお、中等度の腎障害のある患者では最高用量は10mgを超えないこととし、10mgを投与する場合には投与間隔を48時間以上とすること。重度の腎障害のある患者では5mgを超えないこと。

2) 用法及び用量の設定経緯・根拠

該当資料なし

4. 用法及び用量に関連する注意

7. 用法及び用量に関連する注意

チトクロームP450 3A4(CYP3A4)を強く阻害する薬剤を投与中の患者では、本剤の血漿中濃度が上昇することが認められているので、低用量(5mg)から開始し、投与間隔を十分にあげる(10mgを投与する場合は投与間隔を48時間以上)など注意して投与すること。なお、投与量は10mgを超えないこと。[10.2参照]

5. 臨床成績

1) 臨床データパッケージ

該当資料なし

2) 臨床薬理試験

該当資料なし

V. 治療に関する項目

3) 用量反応探索試験

V. -5. -4) 参照

4) 検証的試験

(1) 有効性検証試験

17.1 有効性及び安全性に関する試験

タダラフィルの臨床効果は、国内用量反応試験、外国第Ⅲ相試験共に同一の指標を用いて評価を行った。主な指標はIIEF (International Index of Erectile Function : 国際勃起機能スコア) 質問票 (15問) における勃起機能ドメイン (6問) (表1)、SEP (Sexual Encounter Profile : 患者日記中の性交に関する質問) の質問2及び質問3 (表2) に対する回答とした⁸⁾。

表1) IIEF勃起機能ドメインの質問と回答

質問番号	質問	回答選択肢(点)
1	ここ4週間、性的行為におよんでいる時、何回勃起を経験しましたか。	<ul style="list-style-type: none"> ・性的行為一度も無し^{注1)}……(0) ・毎回又はほぼ毎回(10回中9回以上)……(5) ・おおかた毎回(半分よりかなり上回る回数:10回中7回程度)……(4)
2	ここ4週間、性的刺激による勃起の場合、何回挿入可能な勃起の硬さになりましたか。	<ul style="list-style-type: none"> ・時々(10回中5回)……(3) ・たまに(半分よりかなり下回る回数:10回中3回程度)……(2)
3	ここ4週間、性交を試みた時、何回挿入することが出来ましたか。	<ul style="list-style-type: none"> ・全く無し又はほとんど無し(10回中1回以下)……(1)
4	ここ4週間、性交中、挿入後何回勃起を維持することが出来ましたか。	注1) 質問2では「性的刺激一度も無し」、質問3、4では「性交の試み一度も無し」
5	ここ4週間で、性交中に、性交を終了するまで勃起を維持するのはどれくらい困難でしたか。	<ul style="list-style-type: none"> ・性交の試み一度も無し……(0) ・困難でない……(5) ・やや困難……(4) ・困難……(3) ・かなり困難……(2) ・ほとんど困難……(1)
15	ここ4週間、勃起を維持する自信の程度はどれくらいありましたか。	<ul style="list-style-type: none"> ・非常に高い……(5) ・高い……(4) ・普通……(3) ・低い……(2) ・非常に低い……(1)
勃起機能ドメイン計		30点

表2) SEPの質問と回答

質問番号	質問	回答
2	パートナーの膣への挿入ができましたか?	「はい」又は「いいえ」
3	勃起は十分に持続し、性交に成功しましたか?	

17.1.1 国内第Ⅱ相試験

国内用量反応試験において、タダラフィル5～20mg投与によりIIEFの勃起機能ドメインスコア、SEPの質問2及び3に「はい」と回答した割合におけるベースラインからの変化量に、プラセボ投与との統計的な有意差が認められた^{9,10)}。

表3) 国内用量反応試験におけるIIEFの勃起機能ドメインスコア並びにSEPの質問2及び3に「はい」と回答した割合のベースラインからの変化量

評価項目	統計量 ^{注2)}	ベースラインからの変化量			
		プラセボ群	タダラフィル群		
			5mg群	10mg群	20mg群
IIEF勃起機能ドメイン	最小二乗平均値 (標準誤差) [症例数]	2.05 (0.71) [86]	7.51 (0.72) [84]	9.10 (0.71) [86]	9.38 (0.71) [86]
	p値(対プラセボ群)	-	<0.001	<0.001	<0.001
SEP質問2	最小二乗平均値 (標準誤差) [症例数]	8.59 (2.99) [86]	28.50 (3.02) [84]	35.97 (2.99) [86]	36.52 (2.99) [86]
	p値(対プラセボ群)	-	<0.001	<0.001	<0.001
SEP質問3	最小二乗平均値 (標準誤差) [症例数]	12.29 (3.46) [86]	34.31 (3.49) [84]	47.26 (3.46) [86]	50.80 (3.45) [86]
	p値(対プラセボ群)	-	<0.001	<0.001	<0.001

注2) 最小二乗平均値、標準誤差及びp値は、施設、治療法、ベースライン値を含む共分散分析により導いた。プラセボ群と各用量の多重比較ではDunnnett法により調整を行った。

安全性評価対象症例257例中70例(27.2%)に副作用が認められた。主な副作用は頭痛29例(11.3%)、潮紅13例(5.1%)、ほてり9例(3.5%)、消化不良6例(2.3%)等であった。

17.1.2 外国第Ⅲ相試験

外国で実施されたプラセボ対照二重盲検並行群間比較試験(第Ⅲ相試験)の11試験(2266例)を併合解析した結果、タダラフィル5～20mg投与によりIIEFの勃起機能ドメインスコア、SEPの質問2及び3に「はい」と回答した割合におけるベースラインからの変化量に、プラセボ投与との統計的な有意差が認められた¹¹⁾。

表4) 外国プラセボ対照二重盲検比較試験におけるIIEFの勃起機能ドメインスコア並びにSEPの質問2及び3に「はい」と回答した割合のベースラインからの変化量

評価項目	統計量 ^{注3)}	ベースラインからの変化量			
		プラセボ群	タダラフィル群		
			5mg群	10mg群	20mg群
IIEF勃起機能ドメイン	最小二乗平均値 (標準誤差) [症例数]	1.03 (0.30) [540]	5.02 (0.75) [149]	6.79 (0.57) [245]	8.94 (0.23) [1179]
	p値(対プラセボ群)	-	<0.001	<0.001	<0.001
SEP質問2	最小二乗平均値 (標準誤差) [症例数]	2.63 (1.19) [547]	15.37 (2.94) [149]	25.57 (2.24) [247]	31.32 (0.92) [1192]
	p値(対プラセボ群)	-	<0.001	<0.001	<0.001
SEP質問3	最小二乗平均値 (標準誤差) [症例数]	9.08 (1.34) [547]	26.46 (3.29) [149]	37.48 (2.51) [247]	44.26 (1.03) [1192]
	p値(対プラセボ群)	-	<0.001	<0.001	<0.001

注3) 最小二乗平均値、標準誤差及びp値は、施設、治療法、ベースライン値を含む共分散分析により導いた。

V. 治療に関する項目

(2) 安全性試験

該当資料なし

5) 患者・病態別試験

該当資料なし

6) 治療的使用

(1) 使用成績調査(一般使用成績調査、特定使用成績調査、使用成績比較調査)、製造販売後データベース調査、製造販売後臨床試験の内容

該当資料なし

(2) 承認条件として実施予定の内容又は実施した調査・試験の概要

該当しない

7) その他

該当資料なし

VI. 薬効薬理に関する項目

1. 薬理的に関連ある化合物又は化合物群

ホスホジエステラーゼ(PDE) 5 阻害作用：シルденаフィルクエン酸塩¹²⁾

注意：関連のある化合物の効能又は効果等は、最新の電子添文を参照すること。

2. 薬理作用

1) 作用部位・作用機序

18.1 作用機序

性的刺激により一酸化窒素(NO)の局所的な遊離が生じる際に、タダラフィルは、cGMP分解酵素であるPDE 5を阻害することにより海綿体のcGMP濃度を上昇させる。その結果、平滑筋が弛緩し、陰茎組織への血流が増大して勃起が達成される¹⁾。

2) 薬効を裏付ける試験成績

18.2 PDE 5 阻害作用

タダラフィルは選択的なPDE 5 阻害剤である。タダラフィルはヒト遺伝子組換えPDE 5を約1 nMのIC₅₀値で阻害した。タダラフィルのPDE 5に対する阻害効力は、PDE 6及びPDE 11と比較して、それぞれ700及び14倍であり、その他のPDEサブタイプとの比較では、9000倍以上であった¹³⁾ (*in vitro*)。

18.3 陰茎海綿体内cGMP濃度上昇作用

タダラフィル(30nM)は、NO供与体であるニトロプルシドナトリウム(SNP)の存在下で、ヒト摘出陰茎海綿体平滑筋中のcGMP濃度を有意に上昇させた¹⁴⁾ (*in vitro*)。

18.4 陰茎動脈及び海綿体の弛緩増強作用

タダラフィルはヒト摘出陰茎動脈及び海綿体平滑筋の弛緩を誘発(EC₅₀値：それぞれ34及び13nM)し、また、SNP及びアセチルコリンの弛緩作用を増強させた(30nM)¹⁴⁾ (*in vitro*)。

3) 作用発現時間・持続時間

本剤は投与後36時間まで有効性が認められている^{15~17)}。(VIII. -11. 参照)

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移

1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

2) 臨床試験で確認された血中濃度

16.1 血中濃度

16.1.1 単回投与

日本人健康成人36例にタダラフィル5、10、20、40mg^{注1)}を単回経口投与したときのタダラフィルの血漿中濃度は、投与0.5～4時間(T_{max} の中央値、3時間)の間にピークに達した後、消失した。消失半減期は約14～15時間であった¹⁸⁾。

注1)承認最大用量は20mgである。

表1)健康成人にタダラフィル5mg、10mg、20mg、40mgを単回投与したときの血漿中タダラフィル濃度より算出した薬物動態パラメータ

用量	n	AUC _{0-∞} ($\mu\text{g}\cdot\text{h/L}$)	C _{max} ($\mu\text{g/L}$)	T _{max} (h) ^{注2)}	T _{1/2} (h)
5mg	23	1784(35.3)	95.6(30.0)	3.00(0.500～4.00)	14.2(19.9)
10mg	23	3319(32.5)	174(26.5)	3.00(0.500～4.00)	14.6(20.9)
20mg	24	5825(23.2)	292(26.1)	3.00(1.00～4.03)	13.6(17.1)
40mg	23	10371(32.3)	446(20.2)	3.00(0.500～4.00)	14.9(20.0)

幾何平均値(変動係数%)

注2)中央値(範囲)

16.1.2 反復投与

日本人健康成人18例にタダラフィル20mgを1日1回10日間反復経口投与したときのタダラフィルの血漿中濃度は、投与4日目までに定常状態に達した。定常状態でのタダラフィルのAUC及びC_{max}は初回投与時と比較して約40%増加した¹⁹⁾。

表2)健康成人にタダラフィル20mgを1日1回10日間反復投与したときの血漿中タダラフィル濃度より算出した薬物動態パラメータ

日数	n	AUC ($\mu\text{g}\cdot\text{h/L}$) ^{注3)}	C _{max} ($\mu\text{g/L}$)	T _{max} (h) ^{注4)}	T _{1/2} (h)
1日目	18	4478 (14.9)	339 (16.3)	3.00 (1.00～4.00)	-
10日目	17	6430 ^{注5)} (18.7)	461 ^{注6)} (18.4)	3.00 (2.00～4.00)	14.5 (17.9)

幾何平均値(変動係数%)

注3)投与間隔間(24時間)での血漿中薬物濃度下面積

注4)中央値(範囲)

注5)定常状態における投与間隔間(24時間)での血漿中薬物濃度下面積

注6)定常状態における最高血漿中薬物濃度

<生物学的同等性試験>

●タダラフィル錠10mgCI「サワイ」^{20, 21)}

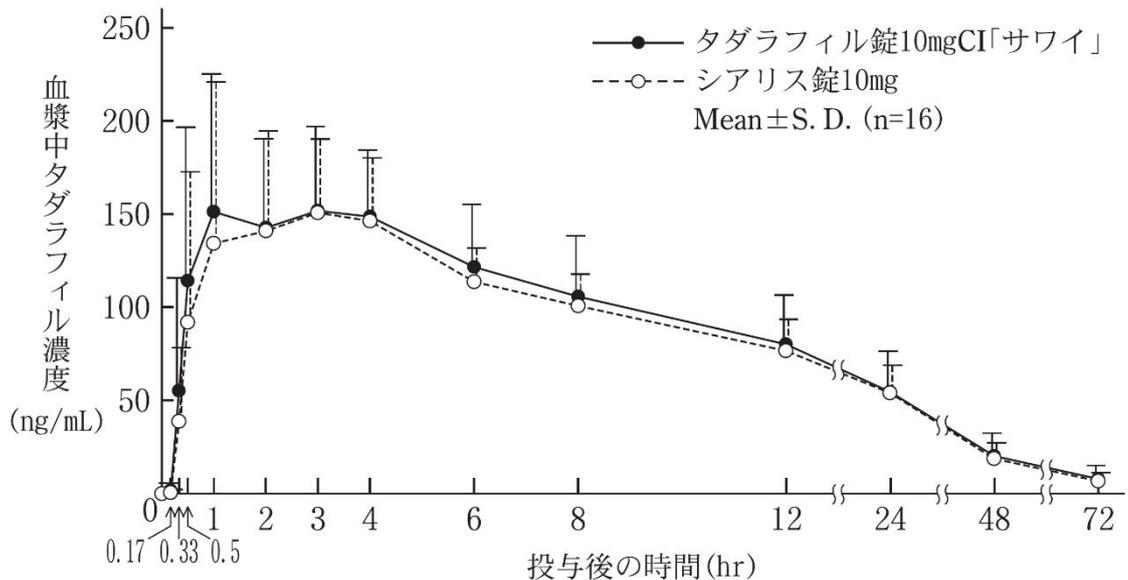
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に準じ、タダラフィル錠10mgCI「サワイ」とシアリス錠10mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(タダラフィルとして10mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中タダラフィル濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

採血時点	0、0.17、0.33、0.5、1、2、3、4、6、8、12、24、48、72hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	タダラフィル錠10mgCI「サワイ」
標準製剤	シアリス錠10mg

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-72hr} (ng・hr/mL)
タダラフィル錠10mg CI「サワイ」	192.7±51.4	1.9±1.5	16.4±4.8	3437±1153
シアリス錠10mg	187.0±55.3	2.5±1.9	15.5±3.4	3286±724

(Mean±S.D., n=16)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC _{0-72hr}	log(1.03)	log(0.97)~log(1.08)
Cmax	log(1.04)	log(0.92)~log(1.17)

血漿中濃度ならびにAUCt、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

VII. 薬物動態に関する項目

●タダラフィル錠20mgCI「サワイ」^{20, 22)}

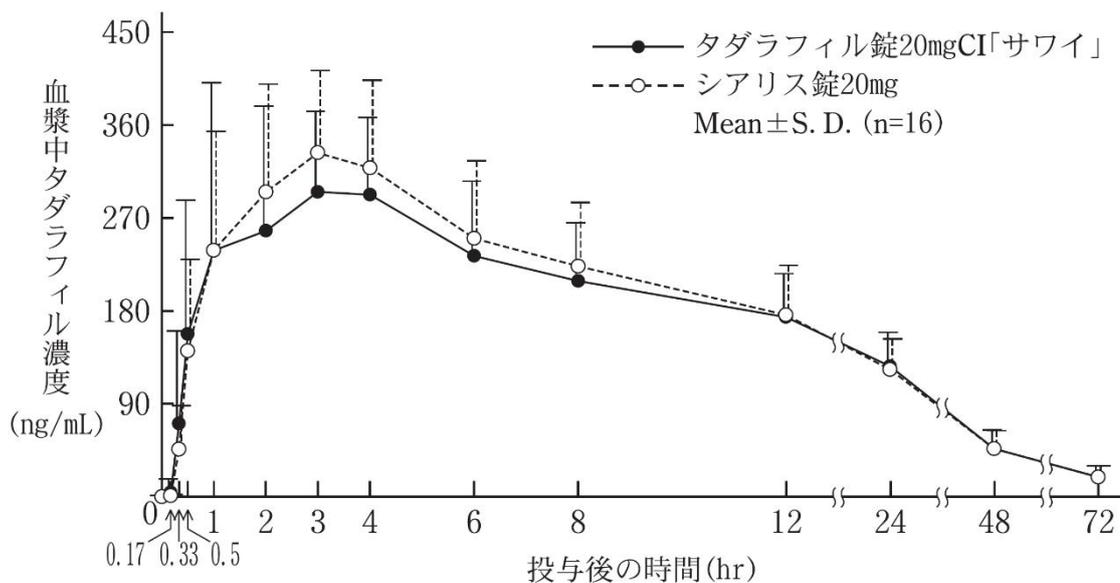
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日 薬食審査発0229第10号)に準じ、タダラフィル錠20mgCI「サワイ」とシアリス錠20mgを健康成人男子にそれぞれ1錠(タダラフィルとして20mg)空腹時単回経口投与(クロスオーバー法)し、血漿中タダラフィル濃度を測定した。得られた薬物動態パラメータ(AUCt、Cmax)について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、log(0.80)~log(1.25)の範囲内であり、両剤の生物学的同等性が確認された。

採血時点	0、0.17、0.33、0.5、1、2、3、4、6、8、12、24、48、72hr
休薬期間	7日間
測定方法	LC/MS法
試験製剤	タダラフィル錠20mgCI「サワイ」
標準製剤	シアリス錠20mg

各製剤1錠投与時の薬物動態パラメータ

	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	T _{1/2} (hr)	AUC _{0-72hr} (ng・hr/mL)
タダラフィル錠20mg CI「サワイ」	333.1±106.7	2.6±1.3	17.0±4.0	7329±1963
シアリス錠20mg	359.3±86.1	2.8±0.9	17.3±4.6	7464±1768

(Mean±S.D., n=16)



	対数値の平均値の差	対数値の平均値の差の90%信頼区間
AUC _{0-72hr}	log(0.97)	log(0.94)~log(1.01)
Cmax	log(0.91)	log(0.84)~log(0.99)

血漿中濃度ならびにAUCt、Cmax等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

3) 中毒域

該当資料なし

4) 食事・併用薬の影響

16.2.1 食事の影響

健康成人18例にタダラフィル20mgを食後(高脂肪食)又は空腹時に単回経口投与したとき、 $AUC_{0-\infty}$ 及び C_{max} 共に食事摂取による影響は認められなかった²³⁾(外国人データ)。
[14.1.3参照]

16.7 薬物相互作用

16.7.1 経口ケトコナゾール

健康成人12例にケトコナゾール400mg(1日1回経口投与、国内未発売)とタダラフィル20mgを併用投与したとき、タダラフィルの $AUC_{0-\infty}$ 及び C_{max} は、それぞれ312%及び22%増加した²⁴⁾(外国人データ)。

健康成人11例にケトコナゾール200mg(1日1回経口投与)とタダラフィル10mgを併用投与したとき、タダラフィルの $AUC_{0-\infty}$ 及び C_{max} はそれぞれ107%及び15%増加した²⁵⁾(外国人データ)。
[10.2参照]

16.7.2 リトナビル

健康成人16例にリトナビル500mg又は600mg(1日2回)とタダラフィル20mgを併用投与したとき、タダラフィルの C_{max} は30%低下したが、 $AUC_{0-\infty}$ は32%増加した²⁶⁾(外国人データ)。

健康成人8例にリトナビル200mg(1日2回)とタダラフィル20mgを併用投与したとき、タダラフィルの C_{max} は同程度であったが、 $AUC_{0-\infty}$ は124%増加した²⁴⁾(外国人データ)。
[10.2参照]

16.7.3 α 遮断剤

(1) ドキサゾシン

健康成人18例にドキサゾシン8mgを反復経口投与時の定常状態で、タダラフィル20mgを単回経口投与したとき、立位の収縮期及び拡張期血圧の最大下降量はそれぞれ9.81mmHg及び5.33mmHg、臥位の収縮期及び拡張期血圧の最大下降量はそれぞれ3.64mmHg及び2.78mmHgであった^{27,28)}(外国人データ)。
[10.2参照]

(2) タムスロシン

健康成人18例にタムスロシン0.4mgを反復経口投与時の定常状態で、タダラフィル10mg又は20mgを単回投与したとき、立位の収縮期及び拡張期血圧の最大下降量はそれぞれ2.3mmHg及び2.2mmHg、臥位の収縮期及び拡張期血圧の最大下降量はそれぞれ3.2mmHg及び3.0mmHgであり、明らかな血圧への影響は認められなかった²⁷⁾(外国人データ)。

16.7.4 その他の薬剤

他剤(ニザチジン、制酸配合剤)又はアルコールがタダラフィルに及ぼす影響について検討した結果、ニザチジン、制酸配合剤又はアルコールによるタダラフィルの薬物動態に対する明らかな影響は認められなかった。また、タダラフィルが他剤(ミダゾラム、テオフィリン、ワルファリン及びアムロジピン)又はアルコールに及ぼす影響について検討した結果、タダラフィルによるミダゾラム、テオフィリン、ワルファリン、アムロジピン又はアルコールの薬物動態に対する明らかな影響は認められなかった^{29~36)}(外国人データ)。

VIII. -7. 参照

2. 薬物速度論的パラメータ

1) 解析方法

該当資料なし

2) 吸収速度定数

該当資料なし

VII. 薬物動態に関する項目

3) 消失速度定数

- タダラフィル錠10mgCI「サワイ」を健康成人男子に1錠(タダラフィルとして10mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{20, 21)}

0.046±0.013hr⁻¹

- タダラフィル錠20mgCI「サワイ」を健康成人男子に1錠(タダラフィルとして20mg)空腹時単回経口投与した場合の消失速度定数^{20, 22)}

0.043±0.009hr⁻¹

4) クリアランス

該当資料なし

5) 分布容積

該当資料なし

6) その他

該当資料なし

3. 母集団(ポピュレーション)解析

1) 解析方法

該当資料なし

2) パラメータ変動要因

該当資料なし

4. 吸収

VII. -1. -4) 参照

5. 分布

1) 血液-脳関門通過性

該当資料なし

2) 血液-胎盤関門通過性

該当資料なし

3) 乳汁への移行性

該当資料なし

4) 髄液への移行性

該当資料なし

5) その他の組織への移行性

該当資料なし

6) 血漿蛋白結合率

16.3 分布

16.3.1 血漿蛋白結合率

タダラフィルの血漿蛋白結合率は94% (*in vitro*、平衡透析法)であり³⁷⁾、主にアルブミン及び α_1 酸性糖蛋白と結合する³⁸⁾。

6. 代謝

1) 代謝部位及び代謝経路

16.4 代謝

健康成人6例に¹⁴C-タダラフィル100mg^{注1)}を単回経口投与したとき、血漿中には主にタダラフィル未変化体及びメチルカテコールグルクロン酸抱合体が認められた。血漿中のメチルカテコール体はメチルカテコールグルクロン酸抱合体の10%未満であった³⁹⁾(外国人データ)。

注1)承認最大用量は20mgである。

2) 代謝に關与する酵素(CYP等)の分子種、寄与率

VIII. -7. 参照

3) 初回通過効果の有無及びその割合

該当資料なし

4) 代謝物の活性の有無及び活性比、存在比率

該当資料なし

7. 排泄

16.5 排泄

健康成人6例に¹⁴C-タダラフィル100mg^{注1)}を単回経口投与したときの、投与後312時間までの放射能回収率は糞便中60.5%、尿中36.1%であった。糞便中には主にメチルカテコール体、カテコール体、尿中には主にメチルカテコールグルクロン酸抱合体及びカテコールグルクロン酸抱合体が認められた⁴⁰⁾(外国人データ)。

注1)承認最大用量は20mgである。

8. トランスポーターに関する情報

該当資料なし

9. 透析等による除去率

VIII. -10. 参照

VII. 薬物動態に関する項目

10. 特定の背景を有する患者

16.6 特定の背景を有する患者

16.6.1 腎障害患者

(1) 軽度及び中等度腎障害患者

健康成人12例、軽度腎障害患者 (CLcr=51~80mL/min) 8例、中等度腎障害患者 (CLcr=31~50mL/min) 8例にタダラフィル 5mg及び10mgを単回経口投与したとき、 $AUC_{0-\infty}$ 及び C_{max} は健康成人のそれぞれ約100%及び20~30%増加した^{41, 42)} (外国人データ)。

(2) 血液透析を受けている末期腎不全患者

血液透析を受けている末期腎不全患者16例にタダラフィル 5mg、10mg及び20mgを単回経口投与したとき、 $AUC_{0-\infty}$ 及び C_{max} は健康成人のそれぞれ約109%及び41%増加した⁴¹⁾ (外国人データ)。

16.6.2 肝障害患者

健康成人 8例及び肝障害患者25例^{注7)}にタダラフィル10mgを単回経口投与したとき、軽度肝障害患者 (Child-Pugh class A)と中等度肝障害患者 (Child-Pugh class B)の $AUC_{0-\infty}$ は健康成人とほぼ同様であった⁴¹⁾ (外国人データ)。

注7) 軽微肝障害 (脂肪肝が認められた患者)、n=8 : 軽度肝障害 (Child-Pugh class A)、n=8 : 中等度肝障害 (Child-Pugh class B)、n=8 : 重度肝障害 (Child-Pugh class C)、n=1。

16.6.3 高齢者

健康高齢者12例 (65~78歳) 及び健康若年者12例 (19~45歳) にタダラフィル10mgを単回経口投与したとき、 C_{max} は高齢者と若年者とでほぼ同様であったが、高齢者の $AUC_{0-\infty}$ は若年者に比べ約25%高値であった^{41, 43)} (外国人データ)。[9. 8参照]

表5) 高齢者及び若年者にタダラフィル10mgを単回投与したときの血漿中タダラフィル濃度より算出した薬物動態パラメータ

	n	$AUC_{0-\infty}$ ($\mu\text{g} \cdot \text{h/L}$)	C_{max} ($\mu\text{g/L}$)	T_{max} (h) ^{注8)}	$T_{1/2}$ (h)
高齢者	12	4881 (31.7)	196 (26.9)	2.00 (1.00~4.00)	21.6 (39.0)
若年者	12	3896 (42.6)	183 (25.5)	2.50 (1.00~6.00)	16.9 (29.1)

幾何平均値 (変動係数%)

注8) 中央値 (範囲)

11. その他

該当資料なし

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

1. 警告内容とその理由

1. 警告

- 1.1 本剤と硝酸剤又は一酸化窒素(NO)供与剤(ニトログリセリン、亜硝酸アミル、硝酸イソソルビド、ニコランジル等)との併用により降圧作用が増強し、過度に血圧を下降させることがあるので、本剤投与の前に、硝酸剤又は一酸化窒素(NO)供与剤が投与されていないことを十分確認し、本剤投与中及び投与後においても硝酸剤又は一酸化窒素(NO)供与剤が投与されないよう十分注意すること。[2. 2、10. 1参照]
- 1.2 死亡例を含む心筋梗塞等の重篤な心血管系等の有害事象が報告されているので、本剤投与の前に、心血管系障害の有無等を十分確認すること。[2. 4-2. 8、8. 1、11. 2参照]

2. 禁忌内容とその理由

2. 禁忌(次の患者には投与しないこと)

- 2.1 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 2.2 硝酸剤又は一酸化窒素(NO)供与剤(ニトログリセリン、亜硝酸アミル、硝酸イソソルビド、ニコランジル等)を投与中の患者[1. 1、10. 1参照]
- 2.3 可溶性グアニル酸シクラーゼ(sGC)刺激剤(リオシグアト)を投与中の患者[10. 1参照]
- 2.4 心血管系障害を有するなど性行為が不相当と考えられる患者[1. 2、8. 1参照]
- 2.5 不安定狭心症のある患者又は性交中に狭心症を発現したことのある患者[1. 2、8. 1参照]
- 2.6 コントロール不良の不整脈、低血圧(血圧<90/50mmHg)又はコントロール不良の高血圧(安静時血圧>170/100mmHg)のある患者[1. 2、8. 1参照]
- 2.7 心筋梗塞の既往歴が最近3ヵ月以内にある患者[1. 2、8. 1参照]
- 2.8 脳梗塞・脳出血の既往歴が最近6ヵ月以内にある患者[1. 2、8. 1参照]
- 2.9 重度の肝障害のある患者[9. 3. 1参照]
- 2.10 網膜色素変性症患者[網膜色素変性症の患者にはホスホジエステラーゼ(PDE)の遺伝的障害を持つ症例が少数認められる。]

3. 効能又は効果に関連する注意とその理由

V. -2. 参照

4. 用法及び用量に関連する注意とその理由

V. -4. 参照

5. 重要な基本的注意とその理由

8. 重要な基本的注意

- 8.1 性行為は心臓へのリスクを伴うため勃起不全の治療を開始する前に心血管系の状態に注意をはらうこと。[1. 2、2. 4-2. 8参照]
- 8.2 4時間以上の勃起の延長又は持続勃起(6時間以上持続する痛みを伴う勃起)が外国にてごくまれに報告されている。持続勃起に対する処置を速やかに行わないと陰茎組織の損傷又は勃起機能を永続的に損なうことがあるので、勃起が4時間以上持続する症状がみられた場合、直ちに医師の診断を受けるよう指導すること。
- 8.3 本剤投与後に急激な視力低下又は急激な視力喪失があらわれた場合には、本剤の服用を中止し、速やかに眼科専門医の診察を受けるよう、患者に指導すること。[15. 1. 1参照]

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

8.4 臨床試験において、めまいや視覚障害が認められているので、高所作業、自動車の運転等危険を伴う機械を操作する際には注意させること。

6. 特定の背景を有する患者に関する注意

1) 合併症・既往歴等のある患者

9.1 合併症・既往歴等のある患者

9.1.1 陰茎の構造上欠陥(屈曲、陰茎の線維化、Peyronie病等)のある患者

性行為が困難であり痛みを伴うおそれがある。

9.1.2 持続勃起症の素因となり得る疾患(鎌状赤血球性貧血、多発性骨髄腫、白血病等)のある患者

9.1.3 PDE 5 阻害剤又は他の勃起不全治療剤を投与中の患者

併用使用の経験がない。

9.1.4 出血性疾患又は消化性潰瘍のある患者

*in vitro*試験でニトロプルシドナトリウム(NO供与剤)の血小板凝集抑制作用を増強することが認められている。出血性疾患又は消化性潰瘍のある患者に対する安全性は確立していない。

9.1.5 重度勃起不全患者

勃起不全の治療を開始する前に心血管系の状態に注意を払うこと。心血管系イベントの危険因子を有する割合が高いと考えられる。

9.1.6 コントロールが十分でない高血圧患者

本剤の血管拡張作用により血圧下降を生じる可能性があるので注意すること。

2) 腎機能障害患者

設定されていない

3) 肝機能障害患者

9.3 肝機能障害患者

9.3.1 重度の肝障害患者

投与しないこと。これらの患者は臨床試験では除外されている。[2.9参照]

4) 生殖能を有する者

設定されていない

5) 妊婦

設定されていない

6) 授乳婦

設定されていない

7) 小児等

設定されていない

8) 高齢者

9.8 高齢者

一般に生理機能が低下している。[16.6.3参照]

7. 相互作用

10. 相互作用

本剤は主にCYP3A4により代謝される。

1) 併用禁忌とその理由

10.1 併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
硝酸剤及びNO供与剤 ニトログリセリン 亜硝酸アミル 硝酸イソソルビド ニコランジル等 [1.1、2.2参照]	併用により、降圧作用を増強するとの報告がある ^{44~46)} 。	NOはcGMPの産生を刺激し、一方、本剤はcGMPの分解を抑制することから、両剤の併用によりcGMPの増大を介するNOの降圧作用が増強する。
sGC刺激剤 リオシグアト(アデムパス) [2.3参照]	併用により、血圧低下を起こすおそれがある。	併用により、細胞内cGMP濃度が増加し、全身血圧に相加的な影響を及ぼすおそれがある。

2) 併用注意とその理由

10.2 併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
CYP3A4阻害剤 ケトコナゾール イトラコナゾール クラリスロマイシン テラプレビル グレープフルーツジュース等 [7、16.7.1参照]	強いCYP3A4阻害作用を有するケトコナゾール(経口剤、国内未発売)との併用により、本剤のAUC及びC _{max} が312%及び22%増加するとの報告がある ²⁴⁾ 。	CYP3A4阻害によるクリアランスの減少。
HIVプロテアーゼ阻害剤 リトナビル インジナビル サキナビル ダルナビル等 [16.7.2参照]	リトナビルとの併用により、本剤のAUCが124%増加するとの報告がある ²⁴⁾ 。	
CYP3A4誘導剤 リファンピシン フェニトイン フェノバルビタール等	リファンピシンとの併用により、本剤のAUC及びC _{max} がそれぞれ88%及び46%低下するとの報告がある ²⁵⁾ 。	CYP3A4誘導によるクリアランスの増加。
α遮断剤 ドキサゾシン テラゾシン等 [16.7.3(1)参照]	ドキサゾシンとの併用により、立位収縮期血圧及び拡張期血圧は最大それぞれ9.81mmHg及び5.33mmHg下降するとの報告がある ²⁷⁾ 。 また、α遮断剤との併用で失神等の症状を伴う血圧低下を来したとの報告がある。	本剤は血管拡張作用による降圧作用を有するため、併用により降圧作用を増強するおそれがある。

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
降圧剤 アムロジピン メトプロロール エナラプリル カンデサルタン等	アンジオテンシンⅡ受容体拮抗剤(単剤又は多剤)との併用により、自由行動下収縮期血圧及び拡張期血圧は最大それぞれ8 mmHg及び4 mmHg下降するとの報告がある ⁴⁷⁾ 。	本剤は血管拡張作用による降圧作用を有するため、併用により降圧作用を増強するおそれがある。
カルペリチド	併用により降圧作用が増強するおそれがある。	
ベルイシグアト	症候性低血圧を起こすおそれがある。治療上の有益性と危険性を十分に考慮し、治療上やむを得ないと判断された場合にのみ併用すること。	細胞内cGMP濃度が増加し、降圧作用を増強するおそれがある。

8. 副作用

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

1) 重大な副作用と初期症状

11.1 重大な副作用

11.1.1 過敏症(頻度不明)

発疹、蕁麻疹、顔面浮腫、剥脱性皮膚炎、Stevens-Johnson症候群等があらわれることがある。

2) その他の副作用

11.2 その他の副作用

	1%以上	0.2~1%未満	0.2%未満	頻度不明
循環器	潮紅	動悸、ほてり	血管拡張、心拍数増加、胸痛、狭心症、頻脈、高血圧、低血圧	心筋梗塞 ^{注1)} 、心臓突然死 ^{注1)} 、失神、起立性低血圧
感覚器		霧視、眼の充血、眼の異常感	耳鳴、視覚障害、眼痛、流涙増加、眼刺激、結膜充血、視野欠損、結膜炎、乾性角結膜炎、眼瞼腫脹	色覚変化、回転性眩暈、網膜静脈閉塞、非動脈炎性前部虚血性視神経症 ^{注2)} 、網膜動脈閉塞、中心性漿液性脈絡網膜症
消化器	消化不良	上腹部痛、悪心、胃食道逆流性疾患、下痢、口内乾燥、胃炎、嘔吐、腹痛、胃(胸部)不快感	便秘、腹部膨満、軟便、胃刺激症状、嚥下障害	食道炎

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

	1%以上	0.2～1%未満	0.2%未満	頻度不明
肝臓		肝機能異常(AST上昇、ALT上昇、 γ -GTP上昇を含む)	ALP上昇	
腎臓			腎機能障害、尿酸値上昇	
筋骨格	背部痛、筋痛、四肢痛	関節痛、筋痙攣(筋収縮)、筋骨格痛	筋骨格硬直、頸部痛、殿部痛	
精神・神経系	頭痛	めまい、睡眠障害	錯感覚、傾眠、不安、片頭痛	脳卒中 ^{注1)} 、感覚鈍麻
泌尿・生殖器			排尿困難、勃起増強、意図しない勃起	持続勃起症、勃起の延長
呼吸器	鼻閉	鼻炎、副鼻腔うっ血	呼吸困難、喀血	鼻出血、咽頭炎
皮膚			紅斑、多汗、爪囲炎	そう痒症
その他		疲労、無力症、疼痛、体重増加、倦怠感	熱感、末梢性浮腫、粘膜浮腫、口渇	

注1) これらのほとんどの症例が本剤投与前から心血管系障害等の危険因子を有していたことが報告されており、これらの事象が本剤、性行為又は患者が以前から有していた心血管系障害の危険因子に起因して発現したものなのか、又は、これらの要因の組合せにより発現したものなのかを特定することはできない。[1.2参照]

注2) [15.1.1参照]

9. 臨床検査結果に及ぼす影響
 設定されていない

10. 過量投与

<p>13. 過量投与 13.1 処置 特異的な解毒薬はない。なお、腎透析によるクリアランスの促進は期待できない。</p>

11. 適用上の注意

<p>14. 適用上の注意 14.1 薬剤交付時の注意 14.1.1 PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。 14.1.2 本剤は投与後36時間まで有効性が認められていることから^{15~17)}、その期間は安全性について十分配慮すること。 14.1.3 本剤は食事の有無にかかわらず投与できる。[16.2.1参照] 14.1.4 本剤には性行為感染症を防ぐ効果はない。</p>

VIII. 安全性(使用上の注意等)に関する項目

12. その他の注意

1) 臨床使用に基づく情報

15.1 臨床使用に基づく情報

- 15.1.1 薬剤との因果関係は明らかではないが、外国において本剤を含むPDE 5 阻害剤投与中に、まれに、視力低下や視力喪失の原因となりうる非動脈炎性前部虚血性視神経症 (NAION) の発現が報告されている^{48,49)}。これらの患者の多くは、NAIONの危険因子[年齢(50歳以上)、糖尿病、高血圧、冠動脈障害、高脂血症、喫煙等]を有していた⁵⁰⁾。外国において、NAIONを発現した45歳以上の男性を対象として実施された自己対照研究では、PDE 5 阻害剤の投与から消失半減期($T_{1/2}$)の5倍の期間内(タダラフィルの場合約4日以内に相当)は、NAION発現リスクが約2倍になることが報告されている⁵¹⁾。[8.3、11.2参照]
- 15.1.2 薬剤との因果関係は明らかではないが、外国において本剤を含むPDE 5 阻害剤投与後に、まれに、痙攣発作の発現が報告されている^{52,53)}。
- 15.1.3 薬剤との因果関係は明らかではないが、外国において本剤を含むPDE 5 阻害剤投与後に、まれに、急激な聴力低下又は突発性難聴が報告されている。これらの患者では、耳鳴りやめまいを伴うことがある。
- 15.1.4 アルコール飲用時に本剤を投与した外国の臨床薬理試験において、アルコール血中濃度、本剤の血漿中濃度のいずれも相互に影響を受けなかったが、アルコールを高用量(0.7g/kg)飲用した被験者において、めまいや起立性低血圧が報告された^{29,30)}。

2) 非臨床試験に基づく情報

15.2 非臨床試験に基づく情報

25mg/kg/day以上の用量でタダラフィルをイヌに3～12ヵ月間連日経口投与した毒性試験において、精巣重量の低下、精細管上皮の変性、精巣上体の精子数の減少が認められたとの報告がある。ヒトにおける精子形成能に対する影響を検討した外国臨床試験の一部では平均精子濃度の減少が認められたが、精子運動率、精子形態及び生殖ホルモン値はいずれの試験においても変化が認められなかった^{54,55)}。

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験
 - 1) 薬効薬理試験
「VI. 薬効薬理に関する項目」参照
 - 2) 安全性薬理試験
該当資料なし
 - 3) その他の薬理試験
該当資料なし

2. 毒性試験
 - 1) 単回投与毒性試験
該当資料なし
 - 2) 反復投与毒性試験
VIII. -12. -2) 参照
 - 3) 遺伝毒性試験
該当資料なし
 - 4) がん原性試験
該当資料なし
 - 5) 生殖発生毒性試験
該当資料なし
 - 6) 局所刺激性試験
該当資料なし
 - 7) その他の特殊毒性
該当資料なし

X. 管理的事項に関する項目

1. 規制区分

	規制区分
製剤	処方箋医薬品 ^{注)}
有効成分	劇薬

注) 注意一医師等の処方箋により使用すること

2. 有効期間

有効期間：3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 取扱い上の注意

該当しない

5. 患者向け資材

患者向医薬品ガイド：あり、くすりのしおり：あり

その他の患者向け資材

XIII. -2. 参照

6. 同一成分・同効薬

同一成分：シアリス錠 5mg/錠10mg/錠20mg

同効薬：ホスホジエステラーゼ (PDE) 5 阻害作用

シルデナフィルクエン酸塩¹²⁾

7. 国際誕生年月日

該当しない

8. 製造販売承認年月日及び承認番号、薬価基準収載年月日、販売開始年月日

製品名	製造販売承認 年月日	承認番号	薬価基準収載 年月日	販売開始 年月日
タダラフィル錠10mgCI 「サワイ」	2020年2月19日	30200AMX00413000	薬価基準未収載	2020年3月26日
タダラフィル錠20mgCI 「サワイ」	2020年2月19日	30200AMX00414000	薬価基準未収載	2020年3月19日

9. 効能又は効果追加、用法及び用量変更追加等の年月日及びその内容

該当しない

10. 再審査結果、再評価結果公表年月日及びその内容

該当しない

11. 再審査期間
 該当しない

12. 投薬期間制限に関する情報
 本剤は、投薬(あるいは投与)期間に関する制限は定められていない。

13. 各種コード

製品名	厚生労働省薬価基準 収載医薬品コード	個別医薬品コード (YJコード)	HOT番号	レセプト電算処理 システム用コード
タダラフィル錠10mgCI 「サワイ」	薬価基準未収載	薬価基準未収載	187802801	薬価基準未収載
タダラフィル錠20mgCI 「サワイ」	薬価基準未収載	薬価基準未収載	187803501	薬価基準未収載

14. 保険給付上の注意

<p>25. 保険給付上の注意 本剤は保険給付の対象とならない(薬価基準未収載)。</p>
--

XI . 文献

1. 引用文献
- 1)作用機序(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.6.1)
 - 2)沢井製薬(株)社内資料[加速試験] タダラフィル錠10mgCI「サワイ」
 - 3)沢井製薬(株)社内資料[無包装下の安定性試験] タダラフィル錠10mgCI「サワイ」
 - 4)沢井製薬(株)社内資料[加速試験] タダラフィル錠20mgCI「サワイ」
 - 5)沢井製薬(株)社内資料[無包装下の安定性試験] タダラフィル錠20mgCI「サワイ」
 - 6)沢井製薬(株)社内資料[溶出試験] タダラフィル錠10mgCI「サワイ」
 - 7)沢井製薬(株)社内資料[溶出試験] タダラフィル錠20mgCI「サワイ」
 - 8)臨床的有効性の概要(試験デザインの概略、有効性の評価項目)(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.3.1)
 - 9)Nagao, K. et al. : Urology, 2006 ; 68(4) : 845-851
 - 10)国内第Ⅱ相試験(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.7.3.2, 2.7.4.2)
 - 11)外国第Ⅲ相試験(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.7.3.3)
 - 12)薬剤分類情報閲覧システム<<https://shinryohoshu.mhlw.go.jp/shinryohoshu/yakuzaiMenu/>> (2025/2/3 アクセス)
 - 13)Saenz de Tejada, I. et al. : Int. J. Impot. Res., 2002 ; 14(Suppl. 4) : S20
 - 14)ヒト陰茎動脈及び海綿体平滑筋に対する弛緩作用(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.6.2.2)
 - 15)Carson, C. C. et al. : BJU Int., 2004 ; 93(9) : 1276-1281
 - 16)Young, J. M. et al. : J. Androl., 2005 ; 26(3) : 310-318
 - 17)Porst, H. et al. : Urology, 2003 ; 62(1) : 121-125
 - 18)健康成人における薬物動態(単回投与)(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.7.2.2.1.1)
 - 19)健康成人における薬物動態(反復投与)(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.7.2.2.1.2)
 - 20)中川美聡他, 診療と新薬, 2020 ; 57(2) : 65-73
 - 21)沢井製薬(株)社内資料[生物学的同等性試験] タダラフィル錠10mgCI「サワイ」
 - 22)沢井製薬(株)社内資料[生物学的同等性試験] タダラフィル錠20mgCI「サワイ」
 - 23)食事の影響(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.1.3.2)
 - 24)リトナビル及びケトコナゾールとの薬物相互作用(シアリス錠： 2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.2.2.3.2)
 - 25)リファンピシン及びケトコナゾールとの薬物相互作用(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.2.2.3.1)
 - 26)リトナビルとの薬物相互作用(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.2.2.3.3)
 - 27)Kloner, R. A. et al. : J. Urol., 2004 ; 172(5 Pt 1) : 1935-1940
 - 28)ドキサゾシンとの薬物相互作用(アドシルカ錠：2009年10月16日承認、申請資料概要 2.7.2.2.4.2.2)
 - 29)アルコールとの薬物相互作用(タダラフィル10mg)(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.7.2.2.3.9, 2.7.2.2.4.7)

- 30) アルコールとの薬物相互作用(タダラフィル20mg)(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.7.2.2.2.3.9, 2.7.2.2.2.4.7)
- 31) 制酸剤及びH₂受容体拮抗剤との薬物相互作用(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.7.2.2.2.3.8)
- 32) ミダゾラムとの薬物相互作用(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.2.2.2.3.5)
- 33) テオフィリンとの薬物相互作用(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.2.2.2.3.7)
- 34) ワルファリンとの薬物相互作用(タダラフィル10mg)(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.2.2.2.3.6)
- 35) ワルファリンとの薬物相互作用(タダラフィル20mg)(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.2.2.2.3.6)
- 36) アムロジピンとの薬物相互作用(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.2.2.2.3.10)
- 37) 蛋白結合(*in vitro* ; ラット、イヌ及びヒト血漿)(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.6.4.4.3)
- 38) 蛋白結合(*in vitro* ; ヒト血漿蛋白)(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.2.2.1.1)
- 39) 放射性標識体投与時の薬物動態(代謝)(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.7.2.2.2.1.3, 2.7.2.3.1.3)
- 40) 放射性標識体投与時の薬物動態(排泄)(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.7.2.2.2.1.3, 2.7.2.3.1.4)
- 41) Forgue, S. T. et al. : Br. J. Clin. Pharmacol., 2007 ; 63(1) : 24-35
- 42) 軽度及び中等度腎障害患者(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.2.2.2.2.1)
- 43) 高齢者(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要 2.7.2.2.2.2.1)
- 44) Kloner, R. A. et al. : Am. J. Cardiol., 2003 ; 92(Suppl.) : 37M-46M
- 45) Patterson, D. et al. : Br. J. Clin. Pharmacol., 2005 ; 60(5) : 459-468
- 46) Kloner, R. A. et al. : J. Am. Coll. Cardiol., 2003 ; 42(10) : 1855-1860
- 47) Kloner, R. A. et al. : Am. J. Cardiol., 2003 ; 92(Suppl.) : 47M-57M
- 48) Pomeranz, H. D. et al. : J. Neuroophthalmol., 2005 ; 25(1) : 9-13
- 49) McGwin, G. et al. : Br. J. Ophthalmol., 2006 ; 90(2) : 154-157
- 50) Lee, A. G. et al. : Am. J. Ophthalmol., 2005 ; 140(4) : 707-708
- 51) Campbell, U. B. et al. : J. Sex. Med., 2015 ; 12(1) : 139-151
- 52) Gilad, R. et al. : BMJ, 2002 ; 325(7369) : 869
- 53) Striano, P. et al. : BMJ, 2006 ; 333(7572) : 785
- 54) Hellstrom, W. J. G. et al. : J. Urol., 2003 ; 170(3) : 887-891
- 55) 精液特性に及ぼす影響(シアリス錠：2007年7月31日承認、申請資料概要2.7.4.4.3)
- 56) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] タダラフィル錠10mgCI「サワイ」
- 57) 沢井製薬(株) 社内資料[粉碎後の安定性試験] タダラフィル錠20mgCI「サワイ」

2. その他の参考文献

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

 2. 海外における臨床支援情報
- 該当資料なし

XIII. 備考

1. 調剤・服薬支援に際して臨床判断を行うにあたっての参考情報

本項の情報に関する注意：本項には承認を受けていない品質に関する情報が含まれる。試験方法等が確立していない内容も含まれており、あくまでも記載されている試験方法で得られた結果を事実として提示している。医療従事者が臨床適用を検討する上での参考情報であり、加工等の可否を示すものではない。

1) 粉砕

<粉砕後の安定性試験>

●タダラフィル錠10mgCI「サワイ」⁵⁶⁾

本製剤を粉砕後、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、光の条件で性状変化及び含量低下が観察された。

	イニシャル	光*		室温 (25°C60%RH ・遮光3ヵ月)
		総照射量 10万lx・hr	総照射量 30万lx・hr	
性状	白色の粉末中にうすい黄色のフィルム片が混在	変化なし	うすい黄色の粉末中にうすい黄色のフィルム片が混在	変化なし
定量試験※	100.0	100.0	96.5	100.4

ロット数：1，繰り返し回数：1

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

*：25°C60%RH、D65蛍光ランプ(2000lx)、開放シャーレ

●タダラフィル錠20mgCI「サワイ」⁵⁷⁾

本製剤を粉砕後、下記条件で保存し、安定性試験を行った。
その結果、光の条件で性状変化及び含量低下が観察された。

	イニシャル	光*		室温 (25°C60%RH ・遮光3ヵ月)
		総照射量 10万lx・hr	総照射量 30万lx・hr	
性状	白色の粉末中にうすい黄色のフィルム片が混在	変化なし	うすい黄色の粉末中にうすい黄色のフィルム片が混在	変化なし
定量試験※	100.0	99.8	95.8	99.7

ロット数：1，繰り返し回数：1

※：イニシャルを100としたときの含有率(%)

*：25°C60%RH、D65蛍光ランプ(2000lx)、開放シャーレ

2) 崩壊・懸濁性及び経管投与チューブの通過性

該当資料なし

2. その他の関連資料

患者向け資材

- ・タダラフィル錠CI「サワイ」を服用される方へ
- ・自動車運転等は注意してください・お知らせ指導箋
- ・タダラフィル錠10mg/20mgCI「サワイ」を服用されている方へ(個装箱封入)

沢井製薬株式会社「医療関係者向け総合情報サイト」<https://med.sawai.co.jp/> 参照

