

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 10mgCI 「FCI」

タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」

Tadalafil Tablets 10mg・20mg CI 「FCI」

販 売 名	タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」	タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」
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	1錠中タダラフィル 10mg 含有	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・販売開始年月日	製造販売承認年月日：2021年2月16日 薬価基準収載年月日：薬価基準未収載 販売開始年月日：2021年7月1日	
開発・製造販売（輸入） 提携・販売会社名	製造販売元：富士化学工業株式会社	
医薬情報担当者の 連 絡 先		
問 い 合 せ 窓 口	富士化学工業株式会社 学術担当 〒105-0011 東京都港区芝公園1丁目8番21号 TEL (03) 6435-6956 FAX (03) 6435-9912 受付時間 9:00～15:00（土・日・祝日を除く）	
本IFは2021年2月作成の添付文書の記載に基づき作成した。 最新の添付文書情報は、独立行政法人 医薬品医療機器総合機構ホームページ「医薬品に関する情報」 http://www.pmda.go.jp/safety/info-services/drugs/0001.html にてご確認ください。		

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に審査・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

I F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。I F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I F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、I F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。

目 次

I.	概要に関する項目	1	1.	効能又は効果	13		
	1.	開発の経緯	1	2.	効能又は効果に関連する注意	13	
	2.	製品の治療学的・製剤学的特性	1	3.	用法及び用量	13	
	3.	製品の製剤学的特性	1	4.	用法及び用量に関する注意	13	
	4.	適正使用に関して周知すべき特性	1	5.	臨床成績	13	
	5.	承認条件及び流通・使用上の制限事項	1	VI.	薬効薬理に関する項目	15	
	6.	RMP の概要	2		1.	薬理的に関連ある化合物又は化合物群	15
II.	名称に関する項目	3		2.	薬理作用	15	
	1.	販売名	3	VII.	薬物動態に関する項目	16	
	2.	一般名	3		1.	血中濃度の推移・測定法	16
	3.	構造式又は示性式	3		2.	薬物速度論的パラメータ	18
	4.	分子式及び分子量	3		3.	母集団（ポピュレーション）解析	18
	5.	化学名（命名法）	4		4.	吸収	18
	6.	慣用名、別名、略号、記号番号	4		5.	分布	18
	7.	CAS 登録番号	4		6.	代謝	19
III.	有効成分に関する項目	5		7.	排泄	19	
	1.	物理化学的性質	5		8.	トランスポーターに関する情報	19
	2.	有効成分の各種条件下における安定性	5		9.	透析等による除去率	19
	3.	有効成分の確認試験法、定量法	5		10.	特定の背景を有する患者	19
IV.	製剤に関する項目	6			11.	その他	19
	1.	剤形	6	VIII.	安全性（使用上の注意等）に関する項目	20	
	2.	製剤の組成	7		1.	警告内容とその理由	20
	3.	添付溶解液の組成及び容量	7		2.	禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）	20
	4.	力価	7		3.	効能又は効果に関連する使用上の注意とその理由	20
	5.	混入する可能性のある夾雑物	7		4.	用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由	20
	6.	製剤の各種条件下における安定性	7		5.	重要な基本的注意とその理由及び処置方法	21
	7.	調整法及び溶解後の安定性	8		6.	特定の背景を有する患者に関する注意	21
	8.	他剤との配合変化	9				
	9.	溶出性	9				
	10.	容器・包装	11				
	11.	別途提供される資材類	12				
	12.	その他	12				
V.	治療に関する項目	13					

7.	相互作用	21
8.	副作用	23
9.	臨床検査結果に及ぼす影響	24
10.	過量投与	24
11.	適用上の注意	25
12.	その他の注意	25
IX.	非臨床試験に関する項目	27
1.	薬理試験	27
2.	毒性試験	27
X.	管理的事項に関する項目	28
1.	規制区分	28
2.	有効期間	28
3.	包装状態での貯法	28
4.	薬剤取扱上の注意点	28
5.	患者向け資材	28
6.	同一成分・同効薬	28
7.	国際誕生年月日	28
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	28
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	28
10.	再審査結果、再評価結果公表年月日及び その内容	29
11.	再審査期間	29
12.	投薬期間制限医薬品に関する情報	29
13.	各種コード	29
14.	保険給付上の注意	29
XI.	文献	30
1.	引用文献	30
2.	その他の参考文献	30
XII.	参考資料	31
1.	主な外国での発売状況	31
2.	海外における臨床支援情報	31
XIII.	備考	32
	その他の関連資料	32

1. 概要に関する項目

1. 開発の経緯

タダラフィルは、選択的なホスホジエステラーゼ タイプ 5 (PDE5) 阻害作用を有する化合物として創薬され、1995 年から勃起不全治療剤としての開発が開始された薬剤であり、本邦では 2007 年に上市されている。

タダラフィル錠 10mgCI「FCI」及びタダラフィル錠 20mgCI「FCI」は富士化学工業株式会社が後発医薬品として開発を企画し、薬食発第 1121 第 2 号（平成 26 年 11 月 21 日）に基づき、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、2021 年 2 月に承認を取得した。

2. 製品の治療学的・製剤学的特性

有効性：タダラフィル錠 10mgCI「FCI」及びタダラフィル錠 20mgCI「FCI」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）に対して、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ことにより、有効性が認められている。（「V. 1. 効能又は効果」及び「V. 3. 用法及び用量」の項参照）

安全性：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。

重大な副作用：過敏症（発疹、蕁麻疹、顔面浮腫、剥脱性皮膚炎、Stevens-Johnson 症候群）（「VIII. 8. (1) 重大な副作用」の項参照）

3. 製品の製剤学的特性

- ・ 本剤は円形錠である。
- ・ 10mg 錠には割線を付与。

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、最適使用推進ガイドライン等	有無
RMP	無
追加のリスク最小過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

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

II. 名称に関する項目

1. 販売名

(1) 和名

タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」

タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」

(2) 洋名

Tadalafil Tablets 10mg CI 「FCI」

Tadalafil Tablets 20mg CI 「FCI」

(3) 名称の由来

一般名+剤形+規格（含量）+「FCI」

〔「医療用後発医薬品の承認申請にあたっての販売名の命名に関する留意事項について」（平成 17 年 9 月 22 日薬食審査発第 0922001 号）に基づく〕

2. 一般名

(1) 和名（命名法）

タダラフィル（JAN）

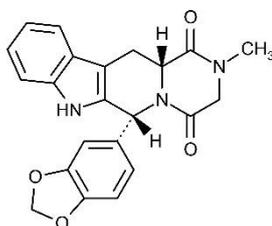
(2) 洋名（命名法）

Tadalafil（JAN）

(3) ステム

血管拡張作用を持つホスホジエステラーゼ 5 阻害剤：-afil

3. 構造式又は示性式



4. 分子式及び分子量

分子式：C₂₂H₁₉N₃O₄

分子量：389.40

-
5. 化学名 (命名法)
(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)
6. 慣用名、別名、略号、記号番号
該当資料なし
7. CAS 登録番号
171596-29-5

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

溶 媒	1g を溶かすのに要する溶媒量	溶 解 性
ジメチルスルホキシド	1mL 以上 10mL 未満	溶けやすい
エタノール (99.5)	100mL 以上 1000mL 未満	溶けにくい
水	10000mL 以上	ほとんど溶けない

(3) 吸湿性

該当資料なし

(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

該当資料なし

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

(1) 紫外可視吸光度測定法

(2) 赤外吸収スペクトル測定法（臭化カリウム錠剤法）

定量法

液体クロマトグラフィー

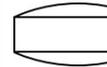
IV. 製剤に関する項目

1. 剤形

(1) 剤形の区別

販売名	タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」	タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」
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

販売名	タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」			タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」			
性状	黄色の割線入りのフィルムコーティング錠			明るい赤みの黄色～つよい赤みの黄色のフィルムコーティング錠			
本体表示	表	FCI 10			FCI 293		
	裏	20			20		
外形	表	裏	側面	表	裏	側面	
							
錠径 (mm)	7.1			9.0			
厚さ (mm)	3.0			4.4			
質量 (mg)	125			310			

(3) 識別コード

タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」 : FCI 10

タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」 : FCI 293 20

(4) 製剤の物性

該当資料なし

(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

販売名	タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」	タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」
有効成分	1錠中タダラフィル 10mg 含有	1錠中タダラフィル 20mg 含有
添加剤	乳頭水和物、結晶セルロース、クロスカルメロースナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、タルク、マクロゴール 6000、酸化チタン、リボフラビン	乳頭水和物、結晶セルロース、クロスカルメロースナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸マグネシウム、ヒプロメロース、酸化チタン、タルク、トリアセチン、黄色三二酸化鉄

(2) 電解質等の濃度

該当しない

(3) 熱量

該当しない

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¹⁾

(1) タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」

1) 加速試験

試験方法	保存形態	保存条件	保存期間	結果
加速試験	PTP 包装	40℃±1℃ 75±5%RH	6 箇月	全ての試験項目について規格内であった。

試験項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、溶出性、定量法

2) 無包装状態の安定性試験

試験方法	保存形態	保存条件	保存期間	結果
温度	遮光・気密容器（瓶）	40±1℃	3 箇月	変化は認められなかった。
湿度	遮光・開放	75±5%RH 25±1℃	3 箇月	変化は認められなかった。
光	気密容器	120 万 lx・hr	1000lx 50 日	変化は認められなかった。

試験項目：性状、純度試験、溶出性、定量法、硬度

(2) タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」

1) 加速試験

試験方法	保存形態	保存条件	保存期間	結果
加速試験	PTP 包装	40±2℃ 75±5%RH	6 箇月	全ての試験項目において規格内であった。

試験項目：性状、確認試験、純度試験、製剤均一性、溶出性、定量法

2) 無包装状態の安定性試験

試験方法	保存形態	保存条件	保存期間	結果
温度	密閉、遮光	60℃	3 箇月	全ての項目で規格に適合し、明確な品質の低下は認めなかった。
湿度	開放、遮光	25±2℃ 75±5%RH	3 箇月	全ての項目で規格に適合し、明確な品質の低下は認めなかった。
光	開放、室温	120 万 lx・hr 200W・h/m ² 以上		全ての項目で規格に適合し、明確な品質の低下は認めなかった。

試験項目：性状、純度試験、溶出性、定量法、硬度

最終包装製品を用いた加速試験（40℃、相対湿度 75%、6 箇月）の結果、タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」及びタダラフィル錠 20mgCI 「FCI」は通常の市場流通下においてそれぞれ 3 年間安定であることが推測された。

7. 調整法及び溶解後の安定性

該当しない

8. 他剤との配合変化
該当しない

9. 溶出性

(1) 溶出挙動における類似性²⁾

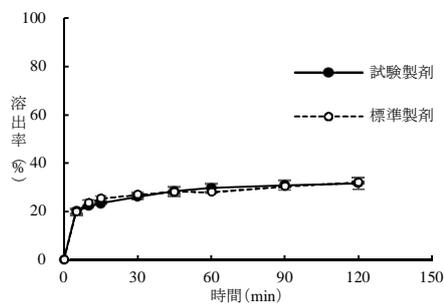
「後発医薬品の生物学的同等性試験ガイドライン」(平成24年2月29日薬食審査発0229第10号)に従い、溶出試験を行った。

1) タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」

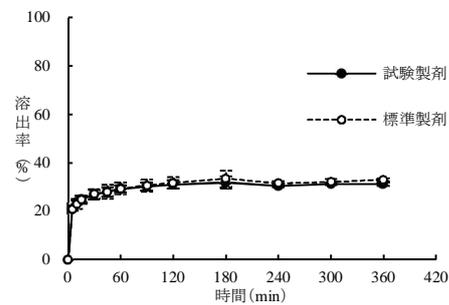
(試験条件)

試験方法	日本薬局方 溶出試験 パドル法
回転数	50rpm、100rpm (pH1.2 ^{注)} のみ)
試験液	pH1.2、pH4.0、pH6.8、水、pH1.2 ^{注)} 、pH4.0 ^{注)} 、pH6.8 ^{注)} 注) 0.5% (w/v) ポリソルベート 80 添加
試験液の量	900mL
試験液の温度	37±0.5°C
試験結果	全ての条件において判定基準に適合した。

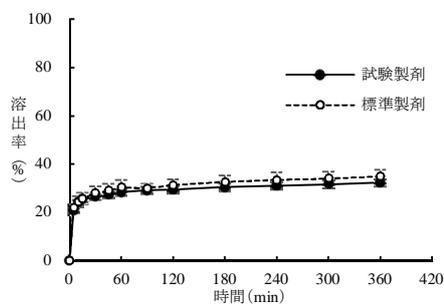
pH1.2、50rpm



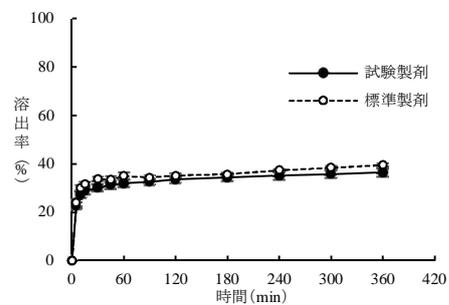
pH4.0、50rpm



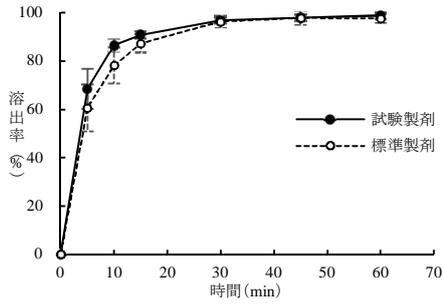
pH6.8、50rpm



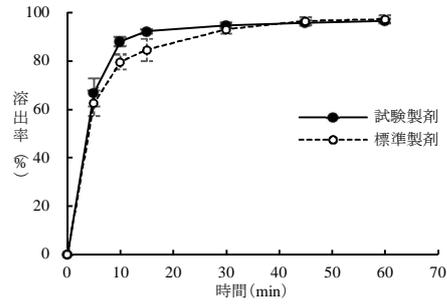
水、50rpm



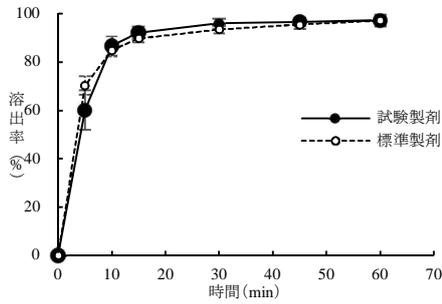
pH1.2^{注)}、50rpm



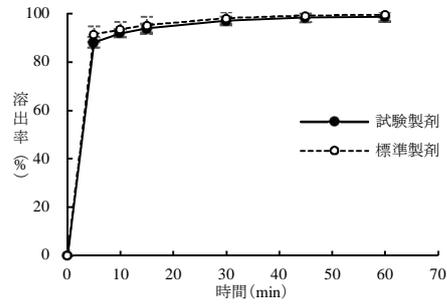
pH4.0^{注)}、50rpm



pH6.8^{注)}、50rpm



pH1.2^{注)}、100rpm



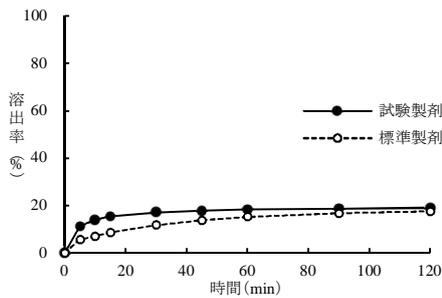
注) 0.5% (w/v) ポリソルベート 80 添加

2) タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」

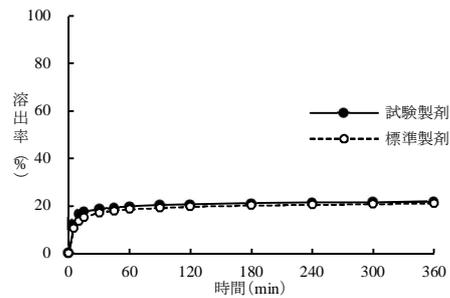
(試験条件)

試験方法	日本薬局方 溶出試験 パドル法
回転数	50rpm、100rpm (pH6.8 ^{注)} のみ)
試験液	pH1.2、pH4.0、pH6.8、水、pH1.2 ^{注)} 、pH4.0 ^{注)} 、pH6.8 ^{注)} 注) 0.5% (w/v) ポリソルベート 80 添加
試験液の量	900mL
試験液の温度	37±0.5°C
試験結果	全ての条件において判定基準に適合した。

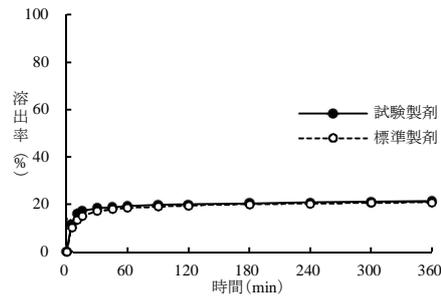
pH1.2、50rpm



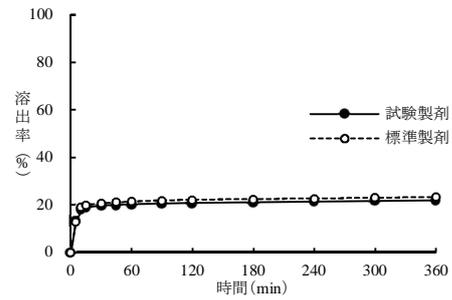
pH4.0、50rpm



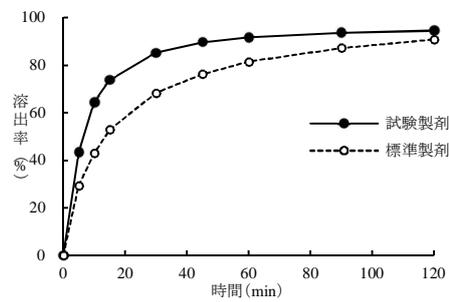
pH6.8、50rpm



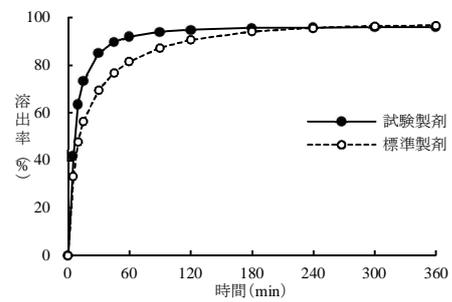
水、50rpm



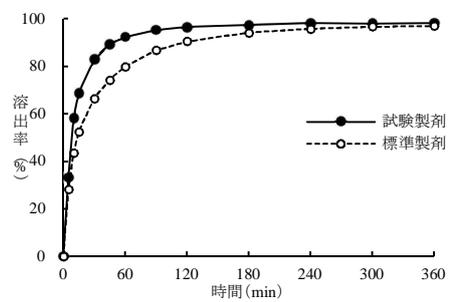
pH1.2^{注)}、50rpm



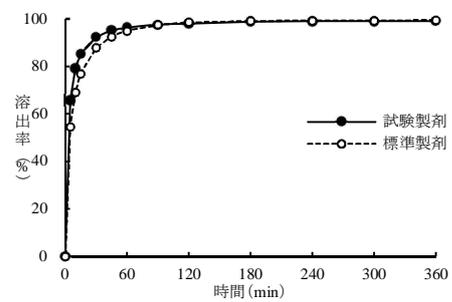
pH4.0^{注)}、50rpm



pH6.8^{注)}、50rpm



pH6.8^{注)}、100rpm



注) 0.5% (w/v) ポリソルベート 80 添加

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
該当しない

(2) 包装

販売名	包装形態	内容量（重量、用量又は個数等）
タダラフィル錠 10mg CI「FCI」	PTP包装	20錠 [10錠×2]
タダラフィル錠 20mg CI「FCI」	PTP包装	20錠 [10錠×2]

(3) 予備容量

該当しない

(4) 容器の材質

販売名	包装形態	材質
タダラフィル錠 10mg CI「FCI」	PTP包装	ポリ塩化ビニル、アルミ箔
タダラフィル錠 20mg CI「FCI」	PTP包装	ポリ塩化ビニル／ポリクロロトリフルオロ エチレンラミネート、アルミ箔

11. 別途提供される資材類

該当資料なし

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

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

該当しない

3. 用法及び用量

(1) 用法及び用量の解説

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. 用法及び用量に関する注意

10mg錠と20mg錠の生物学的同等性は示されていないため、投与量を調節する際には10mg錠と20mg錠の互換使用を行わないこと。

5. 臨床成績

(1) 臨床データパッケージ

該当しない

(2) 臨床薬理試験

該当資料なし

(3) 用量反応探索試験

該当資料なし

(4) 検証的試験

1) 有効性検証試験
該当資料なし

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試験の概要
該当しない

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

シルденаフィルクエン酸塩、バルденаフィル塩酸塩水和物

2. 薬理作用

(1) 作用部位・作用機序

一酸化窒素（NO）は平滑筋細胞内の cGMP の産生を促進し、細胞内の Ca イオン濃度が低下して平滑筋が弛緩する。PDE5 阻害薬であるタダラフィルは、cGMP の分解を阻害することにより、NO の作用を増強する。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。³⁾

(2) 薬効を裏付ける試験成績

該当資料なし

(3) 作用発現時間・持続時間

VIII. 14. 適用上の注意の項の 2)参照

VII. 薬物動態に関する項目

1. 血中濃度の推移・測定法

(1) 治療上有効な血中濃度

該当資料なし

(2) 最高血中濃度到達時間

(3) 臨床試験で確認された血中濃度の項を参照

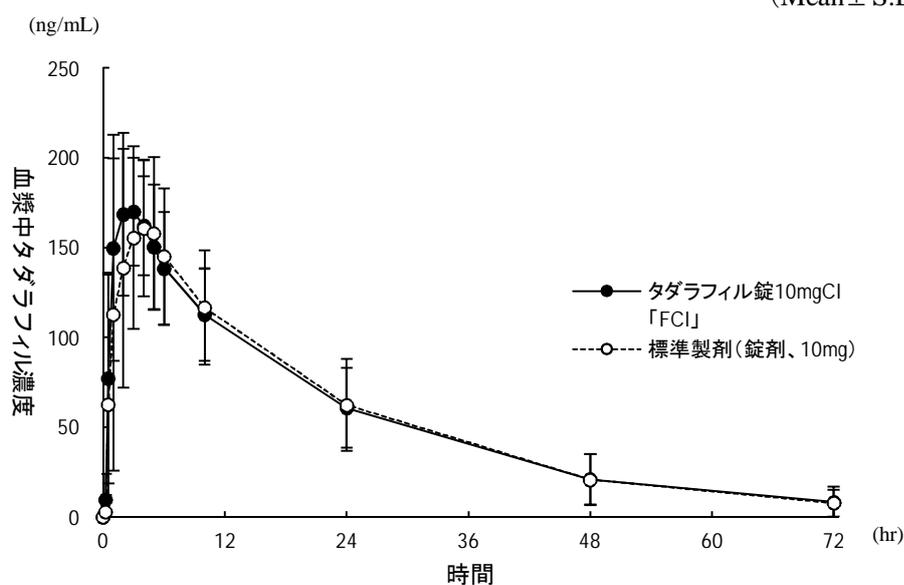
(3) 臨床試験で確認された血中濃度⁴⁾

1) タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」

タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」と標準製剤(錠剤、10mg)をクロスオーバー法により、それぞれ1錠(タダラフィルとして10mg)を健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中タダラフィル濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、AUC及びC_{max}について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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)	AUCt (ng・hr/mL)	C _{max} (ng/mL)
タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」	3936±1222	192±40	2.06±1.16	15.5±5.1
標準製剤(錠剤、 10mg)	3959±1366	193±48	2.67±1.37	14.8±3.7

(Mean±S.D., n=18)

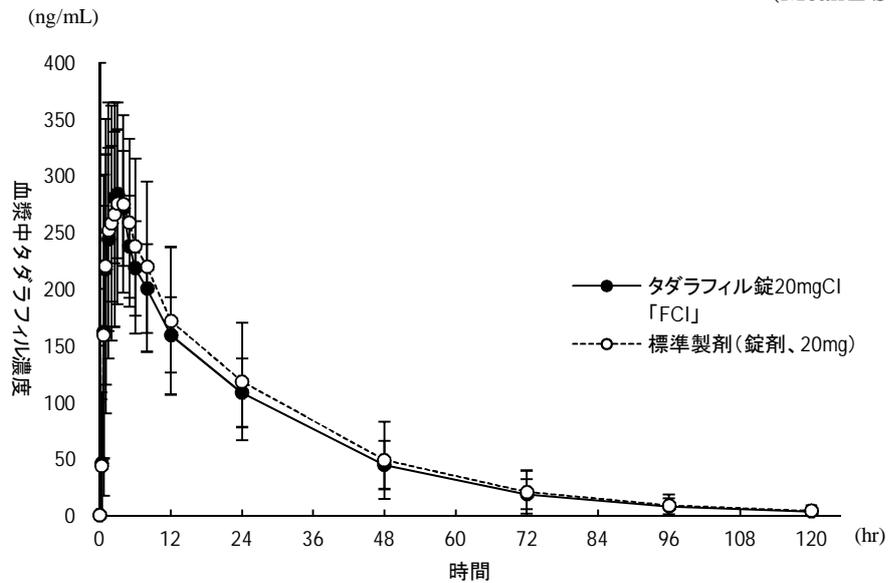


2) タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」

タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」と標準製剤(錠剤、20mg)をクロスオーバー法により、それぞれ1錠(タダラフィルとして20mg)を健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中タダラフィル濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ(AUC、C_{max})について90%信頼区間法にて統計解析を行った結果、AUC及びC_{max}について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。

	判定パラメータ		参考パラメータ	
	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)	AUCt (ng・hr/mL)	Cmax (ng/mL)
タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」	7165.17±1900.48	316.33±58.48	2.3±1.1	17.11±4.29
標準製剤(錠剤、 20mg)	7712.65±3404.14	340.48±94.33	2.5±1.5	17.09±4.57

(Mean±S.D., n=39)



(4) 中毒域
該当資料なし

(5) 食事・併用薬の影響
VIII. 15. その他の注意の項 5)を参照

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

(3) 消失速度定数

タダラフィル錠 10mgCI 「FCI」

kel : 0.0483 ± 0.0127 (hr⁻¹) (Mean ± S.D., n=18)

タダラフィル錠 20mgCI 「FCI」

kel : 0.04311 ± 0.01108 (hr⁻¹) (Mean ± S.D., n=39)

(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

該当資料無し

4. 吸収

該当資料なし

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
該当資料なし
6. 代謝
- (1) 代謝部位及び代謝経路
該当資料なし
 - (2) 代謝に関与する酵素（CYP等）の分子種、寄与率
主に CYP3A4 により代謝される
 - (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
該当資料なし
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
該当資料なし
10. 特定の背景を有する患者
高齢者
高齢者では一般に生理機能が低下しているため、患者の状態を十分に観察しながら投与すること
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

【警告】

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。[「禁忌」の項参照]
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。[「禁忌」の項及び「副作用」の項参照]

2. 禁忌内容とその理由（原則禁忌を含む）

禁忌（次の患者には投与しないこと）

1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
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、硝酸イソソルビド等）を投与中の患者 [「相互作用」の項参照]
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 [「相互作用」の項参照]
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
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
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
7. 心筋梗塞の既往歴が最近3か月以内にある患者
8. 脳梗塞・脳出血の既往歴が最近6か月以内にある患者
9. 重度の肝障害のある患者
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）の遺伝子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使用上の注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること

4. 用法及び用量に関連する使用上の注意とその理由

「V. 治療に関する項目」を参照すること

5. 重要な基本的注意とその理由及び処置方法

重要な基本的注意

- (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治療が必要とされる患者に限定すること。
- (2) 性行為は心臓へのリスクを伴うため、また、重度勃起不全患者においては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払うこと。
- (3) コントロールが十分でない高血圧患者においては、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ため注意すること。
- (4) 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ため、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。
- (5) 本剤は催淫剤又は性欲増進剤ではない。
- (6) 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。[「その他の注意」の項参照]
- (7) 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) 高齢者への投与

高齢者では一般に生理機能が低下しているため、慎重に投与すること

(2) 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

女性に対する適応はない

(3) 小児等への投与

小児等に対する適応はない

7. 相互作用

3. 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

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 硝酸イソソルビド等	併用により、降圧作用を増強するとの報告がある ^{5~7)} 。	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)	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

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	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 Cmax が 312% 及び 22% 増加するとの報告がある。	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	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。	
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 Cmax がそれぞれ 88% 及び 46% 低下するとの報告がある。	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	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 ⁸⁾ 。また、α 遮断剤との併用で失	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。

	神等の症状を伴う血圧低下を来したとの報告がある。
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 8mmHg 及び 4mmHg 下降するとの報告がある ⁹⁾ 。
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。

8. 副作用

本剤は使用成績調査等の副作用発現頻度が明確となる調査を実施していない。

(1) 重大な副作用と初期症状

過敏症（発疹、蕁麻疹、顔面浮腫、剥脱性皮膚炎、Stevens-Johnson 症候群）（頻度不明）：本剤の投与により（男性勃起不全治療剤及び肺動脈性肺高血圧症治療剤としての投与を含む）発疹、蕁麻疹、顔面浮腫、剥脱性皮膚炎、Stevens-Johnson 症候群等の過敏症が、ごくまれに報告されている。このような症状が認められた場合には、本剤の投与を中止し、適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

11.2 その他の副作用	
副作用分類	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、目の充血、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、非動脈性炎症性前部虚血性視神経症 ^{注2)} 、網膜動脈閉塞
消 化 器	消化不良、上腹部痛、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
肝 臓	肝機能異常（AST(GOT)上昇、ALT(GPT)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、脳卒中 ^{注1)} 、感覚鈍麻、片頭痛
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) 心筋梗塞、心臓突然死、脳卒中等の重篤な有害事象がタダラフィル製剤の投与後に報告されている。しかし、これらのほとんどの症例がタダラフィル製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、これらの事象がタダラフィル製剤、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。

注2) 「その他の注意」の項参照

(3) 項目別副作用発現頻度及び臨床検査値異常
該当資料なし

(4) 基礎疾患、合併症、重症度及び手術の有無等背景別の副作用発現頻度
該当資料なし

(5) 薬物アレルギーに対する注意及び試験法

禁忌（次の患者には投与しないこと）

1. 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

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

9. 過量投与

(1) 徴候・症状

外国において、健康成人にタダラフィル製剤を 500mg まで単回投与した場合の副作用は、20mg 以下の用量で認められた副作用の種類（頭痛、背部痛、消化不良、潮紅、筋痛等）と同様であった。

(2) 処置

過量投与の際の特異的な薬物療法はないが、適切な対症療法を行うこと。なお、腎透析によりクリアランスは促進されない。

11. 適用上の注意

7. 適用上の注意

- (1) 薬剤交付時：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、更には穿孔を起こして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]
- (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^{10)~12)}、その期間は安全性について十分配慮すること。
- (3) 本剤は食事の有無にかかわらず投与できる。

12. その他の注意

8. その他の注意

- (1) 薬剤との因果関係は明らかではないが、外国において男性勃起不全治療剤として使用されたタダラフィルを含むPDE5阻害剤投与後に、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^{13), 14)}。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¹⁵⁾。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、PDE5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¹⁶⁾。
- (2) 薬剤との因果関係は明らかではないが、外国においてタダラフィル製剤を含むPDE5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^{17), 18)}。
- (3) 薬剤との因果関係は明らかではないが、外国においてタダラフィル製剤を含むPDE5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。
- (4) 本剤には性行為感染症を防ぐ効果はない。
- (5) アルコール飲用時にタダラフィル製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、タダラフィル製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。
- (6) 25mg/kg/day以上の用量でタダラフィルをイヌに3~12か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¹⁹⁾。

IX. 非臨床試験に関する項目

IX. 非臨床試験に関する項目

1. 薬理試験

(1) 薬効薬理試験
該当資料なし

(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
該当資料なし

(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

製剤：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

有効成分：タダラフィル

2. 有効期間

3年

3. 包装状態での貯法

室温保存

4. 薬剤取扱上の注意点

設定されていない

5. 患者向け資材

患者向け医薬品ガイド：有

くすりのしおり：有

その他の患者向け資材：有

6. 同一成分・同効薬

同一成分：シアリス錠 5mg/10mg/20mg、アドシルカ錠 20mg、ザルティア錠 2.5mg/5mg

同効薬：シルデナフィルクエン酸塩、バルデナフィル塩酸塩水和物

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

販売名	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「FCI」	2021年2月16日	30300AMX 00232000	薬価基準未収載	2021年7月1日
タダラフィル錠 20mgCI「FCI」	2021年2月16日	30300AMX 00233000	薬価基準未収載	2021年7月1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

X. 管理的事項に関する項目

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. 投薬期間制限医薬品に関する情報
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

販売名	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(9桁) 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「FCI」	薬価基準未収載	259000CF2119	187833201	薬価基準未収載
タダラフィル錠 20mgCI「FCI」	薬価基準未収載	259000CF3115	187834901	薬価基準未収載

14. 保険給付上の注意
該当しない

XI. 文献

1. 引用文献

- 1) 社内資料：「安定性試験」
- 2) 社内資料：「溶出試験」
- 3) Francis, S. H. : Int. J. Impot. Res., 20(4), 333 (2008)
- 4) 社内資料：「生物学的同等性試験」
- 5) Kloner, R. A. et al. : Am. J. Cardiol., 92 (Suppl.) , 37M (2003)
- 6) Patterson, D. et al. : Br. J. Clin. Pharmacol., 60 (5) , 459 (2005)
- 7) Kloner, R. A. et al. : J. Am. Coll. Cardiol., 42 (10) , 1855 (2003)
- 8) Kloner, R. A. et al. : J. Urol., 172 (5 Pt 1) , 1935 (2004)
- 9) Kloner, R. A. et al. : Am. J. Cardiol., 92 (Suppl.) , 47M (2003)
- 10) Carson, C. C. et al. : BJU international, 93, 1276 (2004)
- 11) Young, J. M. et al. : J. Androl., 26 (3) , 310 (2005)
- 12) Porst, H. et al. : Urology, 62 (1) , 121 (2003)
- 13) Pomeranz, H. D. et al. : J. Neuro. Ophthalmol., 25 (1) , 9 (2005)
- 14) McGwin, G. et al. : Br. J. Ophthalmol., 90, 154 (2006)
- 15) Lee, A. G. et al. : Am. J. Ophthalmol., 140 (4) , 707 (2005)
- 16) Campbell, U. B. et al. : J. Sex. Med., 12 (1) , 139 (2015)
- 17) Gilad, R. et al. : BMJ, 325 (7369) , 869 (2002)
- 18) Striano, P. et al. : BMJ, 333 (7572) , 785 (2006)
- 19) Hellstrom, W. J. G. et al. : J. Urol., 170 (3) , 887 (2003)

2. その他の参考文献

該当資料なし

XII. 参考資料

XII. 参考資料

1. 主な外国での発売状況

該当しない

2. 海外における臨床支援情報

該当しない

XIII. 備考

その他の関連資料

該当資料なし