

* 2024年4月作成(第1版)

男性型脱毛症治療薬
5 α -還元酵素1型/2型阻害薬

デュタステリド錠 0.5mg

デュタライズ™-0.5

Dutasteride Tablets USP 0.5mg
DUTARAISE™-0.5

販売開始	2024年4月
貯法	室温保存
使用期限	外装に表示

【禁忌】(次の患者には投与しないこと)

- 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- 他の5 α -還元酵素阻害薬に対し過敏症の既往歴のある患者
- 重度の肝機能障害のある患者
- 女性(妊婦、産婦、授乳婦等を含む)
- 小児等

【組成・性状】

販売名	デュタライズ™-0.5
有効成分	1錠中デュタステリド0.5mg
剤形	フィルムコーティング錠
色調	淡青色
識別コード	-
外形	
直径	約6mm
厚さ	約2.75mm
質量	約130mg

【効果・効能】

男性における男性型脱毛症

【効能・効果に関連する注意】

本剤は男性における男性型脱毛症のみの適応である。

他の脱毛症に対する適応はない。

20歳未満での安全性、及び有効性は確立されていない。

【用法・用量】

通常、成人男性にはデュタステリドとして0.1mgを1日1回、経口投与する。

必要に応じて0.5mgを1日1回経口投与する。

【用法・用量に関連する注意】

投与開始後12週間で改善が認められる場合もあるが、治療効果が確認できるまで通常6ヵ月間の治療が必要である。

本剤を6ヵ月以上投与しても男性型脱毛症の改善がみられない場合には投与を中止すること。

また、6ヵ月以上投与する場合であっても定期的に効果を確認し、継続投与の必要性について検討すること。

慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- 肝機能障害のある患者への投与

本剤は主に肝臓で代謝され、半減期は約3週間～5週間である。

肝機能障害のある患者に投与した場合の薬物動態は検討されていない。

- 高齢者への投与

高齢者に関する安全性は確立していない。

一般的に高齢者は生理機能が低下しており、副作用の発現率が高い傾向が認められているため、経過を十分に観察し、慎重に投与すること。

【重要な基本的注意】

- 本剤を分割・粉砕しないこと。
- 本剤は噛まずに舐めずに服用すること。
- 本剤を1日1回(1回0.5mg)を超えて投与しないこと。
- 本剤は経皮吸収されるため、女性(妊婦、産婦、授乳婦等を含む)や小児等は分割・粉砕・破損した薬剤に触れないこと。
分割・粉砕・破損した薬剤に触れた場合には、直ちに石鹸と水で洗うこと。
- 本剤は血清前立腺特異抗原(PSA)に影響を与えるため、前立腺癌等の検査の際には注意すること。

【相互作用】

併用禁忌(併用しないこと)

特になし。

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・機序等
CYP3A4阻害作用を有する薬剤	リトナビル等のCYP3A4阻害作用を有する薬剤との併用により本剤の血中濃度が上昇する恐れがある。

その他の相互作用

- コレステラミンを含む薬剤
本剤との併用において薬物相互作用は認められなかった。
- ワルファリンを含む薬剤
本剤との併用において薬物相互作用は認められなかった。
- ジゴキシンを含む薬剤
本剤との併用において薬物相互作用は認められなかった。
- タムスロシン塩酸塩を含む薬剤
本剤との併用において薬物相互作用は認められなかった。
- テラゾシン塩酸塩を含む薬剤
本剤との併用において薬物相互作用は認められなかった。

【副作用】

重大な副作用

肝機能障害、貧血(いずれも頻度不明)

AST、ALT、ビリルビンの上昇等を伴う肝機能障害や口血を引き起こした例が報告されている。

本剤の投与後は観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

その他の副作用

次の副作用が認められた場合には、症状に応じて適切な処置を行うこと。

種類\頻度	頻度不明
過敏症	発疹、蕁麻疹、アレルギー反応、疼痛症、眼局性浮腫、血管性浮腫
精神神経系	頭痛、抑うつ気分、浮動性めまい、味覚異常
生殖系 乳房障害	性機能不全(リビドー減退、勃起不全、射精障害)※、乳房障害(女性化乳房、乳頭痛、乳房痛、乳房不快感)精巣痛、精巣腫脹
皮膚	脱毛症(主に体毛脱落)、多毛症
消化器	腹部不快感、腹痛、下痢
その他	倦怠感、血中CK増加

※投与中止後も持続したとの報告がある

【過量投与】

1日1回(1回0.5mg)を超える用量(過量投与)によって追加の効果は得られない。

過量投与した場合の特異的な処置・解毒薬はない。

本剤の過量投与が明白、または疑われた場合には症状を24時間観察する必要がある。

【薬物動態】

本剤は主に肝臓で代謝される。

吸収

健康成人男性にデュタステリド2.5mgを食後単回経口投与した時、薬物動態パラメータに若干の変化を認め、AUC0-∞は空腹時投与の2,573ng・hr/mLから2,197ng・hr/mLに減少した。

この変化は临床上影響を与えるものではない。

健康成人男性にデュタステリド0.5mgを単回経口投与した時、生物学的利用率は59%であった。

分布

デュタステリドは99.8%が血漿タンパク質に結合していた。

また、血清アルブミンでは99%、α1-酸性糖タンパク質(AGP)では96.6%、コルチコステロイド結合グロブリン(CBG)では89.2%、性ホルモン結合グロブリン(SHBG)では87.6%という結合率であった。

健康成人男性にデュタステリド0.5mgを反復経口投与した時、精液中の血漿中薬物濃度比は平均11.5%であった。

代謝

デュタステリドはCYP3A4、CYP3A5によって水酸化されたが、CYP1A2、CYP2A6、CYP2B6、CYP2C8、CYP2C9、CYP2C19、CYP2D6、CYP2E1では代謝されなかった。

デュタステリドはCYP1A2、CYP2C9、CYP2D6の活性を阻害しなかったが、CYP2C19、CYP3A4の活性を阻害し、IC50値(50%阻害濃度)は50μMであった。

デュタステリドはPXR活性化によるCYP3A4誘導能を示さなかった。

前立腺肥大症患者にデュタステリド0.5mgを1日1回反復経口投与した時、主な代謝物として1,2-二水素化体、4'-水酸化体、6-水酸化体が確認された。

排泄

健康成人男性にデュタステリド1mg～20mgを単回経口投与した時、投与後48時間以内に排泄した尿中に未変化体は検出されなかった。

健康成人男性にデュタステリド0.5mgを1日1回6か月以上反復経口投与した時、排泄した糞中に約5%の未変化体が検出され、関連物質(未変化体+代謝

物)として約42%が回収された。

排泄した尿中の未変化体は0.1%未満であり、関連物質の排泄も微量であった。このことから、排泄経路は主に排便であることが確認された。

【薬効薬理】

作用機序

デュタステリドはテストステロン(男性ホルモン)をより強力なジヒドロテストステロン(DHT)に変換する5α-還元酵素1型と5α-還元酵素2型に対する阻害剤である。

テストステロンから活性化されたDHTが男性型脱毛症の発症に大きく関係している。

テストステロンからDHTの変換を阻害し、発毛作用を示すものと考えられる。

5α-還元酵素阻害作用

5α-還元酵素1型/2型の働きを阻害する作用を認め血清中、頭皮中のDHT濃度の低下が確認された。

【有効成分に関する理化学的知見】

一般名：デュタステリド(Dutasteride)

化学名：N-[2,5-Bis(trifluoromethyl)phenyl]-3-oxo-4-aza-5α-androst-1-ene-17β-carboxamide

分子式：C₂₇H₃₆F₃N₂O₂

分子量：528.53g/mol

性 状：デュタステリドは白色～微黄色の結晶性の粉末である。

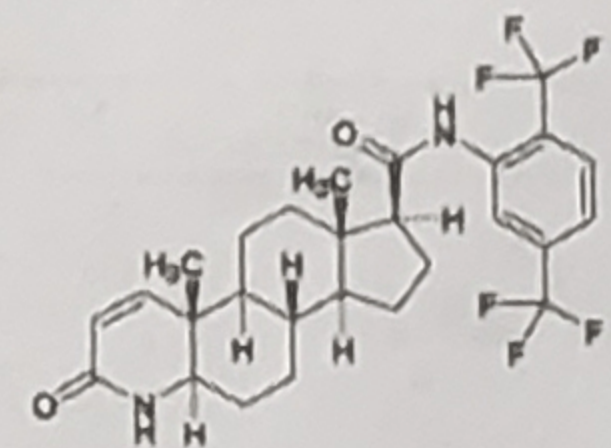
N-メチルピロリドンに溶けやすい。

メタノールやエタノール(99.5)にやや溶けやすい。

アセトニトリルに溶けにくい。

水にほとんど溶けない。

構造式：



【包装】

デュタライズ™-0.5

100錠[10錠(PTP)×10]

【製造元】

HOF Pharmaceuticals Ltd.(HOFファーマシューティカルズ)

211-4/5/6, Village - Pipan, Sanand - Bavla Road, Sanand, Ahmedabad, Gujarat - 382110, India.

【販売元】

Express Works Ltd.(エクスプレスワークス)

公式Webサイト:https://ex-works.biz/