



Potential Testosterone-Tolterodine Interaction

Wen-Gui HE*, Jian-Fei ZHAN, Rong CHEN & Li-De SONG

Department of Urology, Zhuji People's Hospital of Zhejiang,
No. 9, Jianmin Road, Zhuji, Shaoxing City, Zhejiang Province, 311800 China

SUMMARY. Tolterodine is an antimuscarinic drug employed to treat urinary incontinence, and the safety problems remain not fully elucidated. This study aims to determine the inhibition of tolterodine on the glucuronidation metabolism of testosterone. *In vitro* glucuronidation metabolism incubation system was used to screen the inhibition potential, determine inhibition kinetics of tolterodine towards testosterone glucuronidation. UPLC-UV instrument was used to well separate the parent compound testosterone and its glucuronide. Tolterodine 100 μ M inhibited approximately 50% activity of testosterone glucuronidation. Furthermore, concentration-dependent inhibition of tolterodine on the glucuronidation of testosterone was found. In conclusion, the inhibition of tolterodine on the activity of glucuronidation of testosterone was demonstrated in this study, which mentions us the importance to monitor the plasma content of testosterone when taking tolterodine.

RESUMEN. La tolterodina es un fármaco antimuscarínico empleado para tratar la incontinencia urinaria, pero los problemas de seguridad siguen sin dilucidarse. Este estudio tiene como objetivo determinar la inhibición de la tolterodina sobre el metabolismo de glucuronidación de la testosterona. Se utilizó el sistema de incubación *in vitro* del metabolismo de la glucuronidación para analizar el potencial de inhibición y determinar la cinética de inhibición de la tolterodina para la glucuronidación de la testosterona. UPLC-UV se usó para separar el compuesto original testosterona y su glucurónido. Tolterodina 100 μ M inhibió aproximadamente el 50% de actividad de la glucuronidación de testosterona. Además, se encontró que la inhibición depende de la concentración de tolterodina sobre la glucuronidación de la testosterona. En conclusión, la inhibición de la tolterodina sobre la actividad de la glucuronidación de testosterona se demostró en este estudio, que nos menciona la importancia de controlar los niveles plasmáticos de testosterona al tomar tolterodina.

KEY WORDS: glucuronidation, inhibition, testosterone, tolterodine, urinary incontinence.

* Author to whom correspondence should be addressed. *E-mail:* hewenguizhuji@126.com