

◎ユリフ OD 錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】シロドシン Silodosin 【分類】選択的 α 1A 遮断薬 [前立腺肥大症に伴う排尿障害改善薬]

【単位】 Δ 2mg・ \odot 4mg/OD 錠

【常用量】1回 4mg を1日2回 (症状に応じて適宜減量)

【用法】分2 (朝・夕食後)

【透析患者への投与方法】1回2mg [1日2回] など低用量から開始する (1)

【保存期 CKD 患者への投与方法】1回2mg [1日2回] など低用量から開始する (1)

【その他の報告】GFR 51~80mL/min : 8mg/日 [食後], GFR 30~50mL/min : 4mg/日 [食後], GFR 30mL/min 未満 : 禁忌 (FDA)

【特徴】前立腺に存在する α 1A アドレナリン受容体サブタイプに高い選択性を示し、血圧低下の副作用が軽減されている。BPH のうち排尿障害の強い症例に適用。射精障害の発現率が他の α 遮断薬より多いため、性的活動性の高い例には注意が必要。

【主な副作用・毒性】失神・意識消失、肝障害・黄疸、射精障害 (逆行性射精は大部分可逆的)、下痢、軟便、たちくらみ、口渇、鼻閉、めまい、ふらつき、頭痛など。

【吸収】食事の影響はほとんど受けず、小腸全体から吸収される (1)

【F】吸収率は60%であるが消化管および肝で初回通過効果を受け $32.2 \pm 11.3\%$ (1)

【tmax】0.9~2.5hr (1)

【代謝】肝代謝される。アルコール脱水素酵素およびアルデヒド脱水素酵素、UDP-グルクロン酸転移酵素、CYP3A4 により代謝される (1) ヒトの主代謝物はグルクロン酸抱合体および酸化代謝物の KMD-3293 である (1) 腸肝循環による胆汁からの再吸収率は27.7%以上存在する [ラット] (1) 未変化体に比べ α 1A 受容体に対する主要代謝物の活性はグルクロン酸抱合体 1/8, KMD-3293 1/42 と低い (1) また、グルクロン酸抱合体の活性は未変化体の 1/8 で前立腺組織への移行は未変化体の 1/10 (1) P-gp の基質である (1) CYP3A4, UGT2B7 の遺伝的多型が PK の個人差に関与 (Wang Z, et al: Drug Metab Pharmacokinet 28: 239-43, 2013 PMID: 23257391) UGT2B7 と ADH/ALDH による代謝物が主に血中に存在 (Matsubara Y, et al: Yakugaku Zasshi 126: 237-45, 2006 PMID: 16518089)

【排泄】尿中未変化体排泄率 2%程度 (1) 尿中回収率 33.5% [240hr まで] (1)

【CL】 167.0 ± 33.8 mL/min (1) 全身 CL は炎症時の AAG 濃度の上昇により低下し、肝機能の低下により低下するが、腎障害 (mild) の影響は軽度である (清水貴子, 他: 医療薬学 34: 623-9, 2008)

【t_{1/2}】3.0~6.5hr (1) 腎機能低下者 7.6hr (1) 【腎障害患者の体内動態】腎機能正常者 (Ccr 125~176mL/min) に比べ腎障害患者 (Ccr 27~49mL/min) での Cmax および AUC はそれぞれ 3.1 倍, 3.2 倍になる (1) この現象は腎障害患者の AAG 値の上昇と関連があるかもしれない (1)

【蛋白結合率】95.6% [AAG] (1) 94.6~95.8% (清水貴子, 他: 薬学雑誌 126: 257-63, 2006)

【Vd】 49.5 ± 17.3 L/man (1) Vd/F: 143L/man (清水貴子, 他: 医療薬学 34: 623-9, 2008)

【MW】495.53

【透析性】HD, PD ともデータなし (1) 蛋白結合率が高いため透析性は低いと思われる (5)

【薬物動態】線形動態 (Zhou Y, et al: Biol Pharm Bull 34: 1240-5, 2011 PMID: 21804212)

【O/W 係数】1.7 [1-オクタノール水系, pH6.0] (1)

【相互作用】CYP3A4 を強く阻害する薬剤との併用に注意 (1)

【主な臨床報告】BPH に対する適用のレビュー (Cantrell MA, et al: Ann Pharmacother 44: 302-10, 2010 PMID: 20071497, Schilit S, et al: Clin Ther 31: 2489-502, 2009 PMID: 20109995)

ナフトピジルよりも射精障害が多い (Yamaguchi K, et al: Int J Urol 2013 PMID: 23731168)

【備考】白内障手術時の IFIS の発症にタムスロシンと同程度に関連している (豊野哲也, 石井 清: 眼科手術 22: 521-524, 2009)

【更新日】20220428

※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、当院では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。