

▼レバチオ錠 [内]

【重要度】★ 【一般製剤名】シルデナフィルクエン酸塩 (U) sildenafil citrate 【分類】肺動脈性肺高血圧症治療薬 [PDE5 阻害薬]

【単位】▼20mg/錠

【常用量】1回20mg1日3回

【用法】1日3回(食後でも空腹時でもよい)

【透析患者への投与方法】設定されていない(1)が慎重投与(5)

【保存期CKD患者への投与方法】Ccr 30mL/min未満では慎重投与(1) Ccr 30mL/min未満ではCmax, ACUが2倍高くなる(1)

【特徴】肺血管に多く分布し、NOやANPによって増加するcGMPの加水分解を行うPDE-5を阻害して平滑筋内のcGMP濃度を上昇させ肺動脈を拡張させる。

【主な副作用・毒性】頭痛、消化不良、ほてり、悪心、下痢、視力障害、血小板減少(Ann Intern Med. 149:437-9, 2008)など

【吸収】食後投与によりCmaxが42%、AUCが14%低下する(1)食後投与ではCmaxやAUCが低下するが、治療の面から考えると特に空腹時に投与しなければならぬ理由はない(5)

【F】ほぼ完全に吸収されるが初回通過効果を受けて41%(1)

【tmax】食後投与3hr、空腹時投与1.2hr(1)

【代謝】CYP3A4によりN-脱メチル体で代謝される(1)CYP2C9もわずかに関与する(1)未変化体と比較した主代謝物のPDE-5阻害作用は、UK-103.320で1/2.5、UK-150,564で1/11と寄与は低い(1)

【排泄】尿中未変化体排泄率0.3~0.6% [po, 48hrまで](1)主に糞便中に排泄される(1)13%が代謝物として尿中排泄、80%が代謝物として糞便中排泄(U)【CL】40.8L/hr [iv](1)

【t1/2】約3hr(1)4hr(U)【腎障害患者の体内動態】Ccr30mL/min未満でCmaxが約2倍に上昇し、CL/Fは約1/2に低下するがt1/2は変わらない(1)

【蛋白結合率】96.2~96.5% [Alb](1)96%(U)

【Vd】定常状態105L/man(1,U) 精液中への移行率は0.001%(U)

【MW】666.70

【透析性】除去率1%と低い(1)代謝物のHD除去率も低い(1)蛋白結合率が高く、透析されにくいと思われる(5)

【腎障害患者の体内動態】Ccr 30mL/minでは、腎機能正常者に比べCmax, AUCがそれぞれ約2倍に上昇する(1)【OW係数】LogP=2.7 [1-オクタノール水系, pH7.4](1)

【相互作用】CYP3A4阻害薬その併用で血中濃度上昇(1)ボセンタンとの併用でシルデナフィルのCmaxが45%に、AUCが37%に低下する(1)一方でボセンタンのCmaxは1.4倍、AUCは1.5倍に上昇する(1)フロセミド併用で聴覚毒性の増強に注意(Skeith L, et al: J Popul Ther Clin Pharmacol 20: e128-31, 2013)

【更新日】20170119

※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。