

## △バイアグラ錠 [内]

【重要度】 【一般製剤名】シルденаフィルクエン酸塩 (U) sildenafil citrate 【分類】勃起不全治療薬

【単位】△25mg・△50mg/錠

【常用量】25～50mg/回

【用法】経口投与

【透析患者への投与方法】活性体の尿中排泄率が低いいため減量の必要なし (5)

【その他の報告】透析患者 50 名に 1 回 50～100mg を週 2 回投与した研究では、副作用が生じたのは 3 名だけであった (2 名：呼吸苦, 1 名：頭痛) その際の有効性は投与前の陰茎血流量と相関を示した (Turk S, et al: Nephrol Dial Transplant 16: 1818-22, 2001)

【保存期 CKD 患者への投与方法】Cr30mL/min 未満：血漿中濃度が増加するため開始用量を 25mg とする [投与間隔 24hr 以上] (1)

【その他の報告】CKD 患者では CL が 50%低下する (Muirhead GJ, et al: Br J Clin Pharmacol 53: 21S-30S, 2002)

【特徴】cGMP 特異的ホスホジエステラーゼタイプ 5 (PDE5) に対する選択的阻害薬。陰茎海綿体には PDE5 が主たる cGMP 分解酵素として存在しており、その PDE5 を選択的に阻害することにより、神経及び海綿体内皮細胞由来の NO 存在下で NO-cGMP を介する陰茎海綿体血管平滑筋の弛緩機能を増強し、血流を増加させ陰茎勃起を誘発又は増強する新規の経口勃起不全治療薬。糖尿病、脊髄損傷などによる ED 患者に対し効果が認められている。

【主な副作用・毒性】ほてり、高血圧症、潮紅、動悸、不整脈、不完全右脚ブロック、頭痛、昏迷、めまい、傾眠、記憶力低下、興奮、不眠症、血清総蛋白・アルブミン低下、肝障害、消化器障害、口裂乾燥、陰茎疼痛、半勃起持続、朝立ちの延長、射精障害、かゆみ、眼瞼痒痒感、皮膚乾燥、ヘマトクリット値減少、白血球増多症、好酸球増多症、リンパ球の増多、彩視症、光視症、眼球充血、CK 上昇、BUN 上昇、尿沈渣赤血球増加、筋肉痛、NAION (非動脈炎性前部虚血性視神経症：50 歳以上、HT、高コレステロール血症、DM などが危険因子) など

【安全性に関する情報】急性間質性腎炎の症例 (Burkhart R, et al: Case Rep Nephrol. 2015 PMID: 26491581)

【吸収】ほぼ 100%吸収される。食事と共に投与すると、空腹時に投与した場合に比べ効果発現時間が遅れることがある (1) 速やかに吸収される。高脂肪食では吸収が低下し、Cmax を 29%、tmax を 60min 遅らせる (U)

【F】41%(1) 40% (U) 38% (13)

【tmax】0.8～0.9 時間 (1) 空腹時 30～120min, 高脂肪食は tmax を 60min 遅らせる (U) 1.2hr (13) 【Cmax】50mg 単回経口投与で Cmax は 212ng/mL、加齢では遊離型濃度が上昇する (13)

【代謝】肝臓。代謝は主として CYP3A4 が関与しており、CYP2C9 もわずかであるが関与している (1) N-デスメチル化によって親化合物と同等の活性を持つ活性代謝物になるが、さらに代謝を受ける (U) 主に CYP3A4, その次に CYP2D6 が関与しており、piperazine N-desmethyl metabolite には親化合物の半分足らずの活性がある (13)

【排泄】尿中未変化体排泄率 0.2～0.9% (1) 0% (13) 13%が代謝物として尿中に排泄 (U) 80%が代謝物として糞便中に排泄 (U) 糞便中排泄率 79% (1) 【CL】6.0mL/min/kg、肝障害・末期腎不全・加齢では低下 (13)

【t1/2】3.2～3.3 時間 (1) 親化合物、主要代謝物ともに 4hr (U) 2.4hr (13)

【蛋白結合率】96.5% (1,U) 96% (13, Grossman EB, et al: Kidney Int 66: 367, 2004)

【Vd】105L/man (1,U) 1.2L/kg (13) 【分布】投与 90 分後の精子中には 0.001%以下しか残存しない (U)

【MW】666.71

【透析性】蛋白結合率が 96.5%と高く、尿中排泄率が低いため透析によるクリアランスの促進は期待できない (1) 透析されない。また HD 中の血圧には影響しない (Grossman EB, et al: Kidney Int 66: 367, 2004)

【TDM のポイント】TDM の対象にならない 【O/W 係数】LogP=2.7 [1-オクタノール水系, pH7.4] (1) 【pKa】6.53, 9.17

【相互作用】GFJ 同時飲用により Tmax がおよそ 20 分遅延する (Clin Pharmacol Ther 71: 21-29, 2002) GFJ 同時飲用により Cmax が 42%上昇、AUC は変化しない (Lee M, et al: TDM 23: 21-6, 2001) 赤ワインとの血行動態における相互作用は認めない (Leslie SJ, et al: Clin Pharmacol Ther 76 365-70, 2004) CYP3A4 誘導剤により血中濃度低下のおそれ (1)

【効果発現時間】投与後 30min (U)

【効果持続時間】4 時間までだが、2 時間でも効果の低下が見られる (U)

【備考】自費治療対象。硝酸剤あるいは NO 供与剤との併用禁忌。低血圧や高血圧、心血管疾患のある患者には要注意。網膜色素変性症患者には禁忌 [網膜色素変性症の患者にはホスホジエステラーゼの遺伝的障害をもつ症例が少数認められる]

【更新日】20170725

※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。