

▼レバチオ錠・▼OD フィルム・▼懸濁液 DS [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・▼20mgOD フィルム・▼DS900mg

【常用量】1回 20mg, 1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 : Cmax, ACU が 2 倍高くなるため慎重投与 (1)

【特徴】肺動脈性肺高血圧症治療薬。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

【安全性に関する情報】

【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-脱メチル体に代謝 (1) CYP2C9 もわずかに関与 (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)

【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)

【主な臨床報告】PAH 患者の eGFR を改善する可能性 (Webb DJ, et al: Br J Clin Pharmacol 2015 PMID: 25727860)

PAH に対して 5mg よりも 80mg/日が優れている (Hoepfer MM, et al: Circulation 2024 PMID: 38752352)

【更新日】20240921

※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。