

医師、医療機関、研究機関の元でのみ使用のこと。

Sildenafil Tablets 100 mg

SILOGRA - 100

シルデナフィル錠 100mg

シログラ - 100

経口使用のみ

(成分) 1錠中

シルデナフィル・クエン酸塩 100mg

(シルデナフィルと同量で換算)

添加剤 q.s.

着色料：インディゴカルミンアルミニウムレーキ、
二酸化チタンBP

(化学名) 1-[4-ethoxy-3-(6,7-dihydro-1-methyl-7-oxo-3-propyl-1H-pyrazolo[4,3-d]pyrimidin-5-yl)phenylsulfonyl]-4-methylpiperazine

(分類) シナデルフィルは、勃起不全のための経口療法である。

(説明)

シルデナフィル・クエン酸塩は、肺動脈高血圧症の経口治療のためのものであり、シルデナフィルのクエン酸塩である。また、環状グアノシンーリン酸(cGMP)の選択的抑制剤であり、陰茎の勃起を止める酵素PDE5(ホスホジエステラーゼタイプ5)を抑制する。クエン酸シルデナフィルは、白からオフホワイト色の結晶質の粉で、水の溶解性は、3.5mg/mLであり、分子量は、666.7である。

(薬学)

シルデナフィルは勃起不全のための経口療法である。勃起不全とは、陰茎が十分に勃起せず、性行為が満足に行えることができないことである。

性的刺激などの自然な方法で、陰茎へ血流を増加することによって、勃起機能を回復させる。

陰茎の勃起のための生理学的メカニズムは、性的刺激時の海綿体における一酸化窒素(NO)の放出を伴う。一酸化窒素は、次に酵素グアニル酸シクラーゼを活性化し、その結果、環状グアノシンーリン酸(cGMP)が増加する。それにより、海綿体平滑筋を弛緩させ、血液の流入を可能にする。

シルデナフィルは海綿体のcGMPに特有の、ホスホジエステラーゼ5型(PDE5)の強力で選択的抑制剤であり、PDE5はcGMPの分解の原因となる。シルデナフィルは、勃起する上において末梢作用がある。シルデナフィルは、単離された人体の海綿体に直接弛緩効果はないが、この組織に効果を強化する事ができる。

NO/cGMP経路が性的刺激によって活性化するように、シルデナフィルによるPDE5の抑制は、cGMPの海綿体レベルでの増加をもたらす。従って、シルデナフィルがその目的とする有益な薬理学効果を生み出すためには、性的刺激が必要である。

(効果・効能)

シルデナフィルは陰茎が十分に勃起せず、性行為が満足に行えない、または、陰茎勃起を維持できない男性を治療するために適応されている。

(用法・用量)

経口使用のみ。

成人への投与

推奨用量は、性行為の約1時間前に50mgを必要に応じ服用する。また、有効性と許容限界量に基づき、100mgまで増加または、25mgまで減少してもよい。最大推奨用量は100mgである。最大推奨された投薬頻度は、1日につき1

回である。食事と共に本剤を投与すると、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。

高齢者への投与

投薬量調整は、高齢患者に必要とされない。

腎機能障害患者への投与

「成人への投与」で説明した投薬勧告は、腎障害を軽・中等度の患者に適用されるクレアチニンクリアランス＝30～80ミリリットル/分)。シルデナフィルクリアランスは、重度の腎機能障害患者への投与を低減しているため、25mgの投与量(クレアチニンクリアランス<30ミリリットル/分)が考慮されること。有効性および許容限界量に基づき、投与量は50mgと100mgまで増量させることができる。

肝機能障害のある患者への投与

シルデナフィルクリアランスは、肝機能障害患者例、肝硬変)への投与量を25mgに低減することを考慮すること。有効性と許容限界量に基づき、容量は、50mgと100mgに増量させることができる。

小児および青年への投与

シルデナフィルは、18歳以下の個人へ適応していない。

他の薬を服用している患者への投与

リトナビルとシルデナフィルの同時投与は推奨しない。25mgの開始量は、CYP3A4抑制薬で付随する治療を受けている患者において考慮されること。

起立性低血圧を発症する可能性を最小限するために、患者はシルデナフィル治療を開始する前にアルファ遮断薬療法で安定させること。また、シルデナフィルの投与開始用量25mgであることを考慮すること。

(禁忌)

作用物質に対する、または、添加剤のいずれかに対する過敏性をもつ者。

シルデナフィルは硝酸塩の低血圧効果を強化することが示された。従って、一酸化窒素提供物(例: 亜硝酸アミル)または硝酸塩によるその共投与はいかなる形でも禁忌である。

シルデナフィルは、シルデナフィルは、性行為を勧められていない男性(例: 不安定狭心症や重篤な心不全などの重篤な心臓血管疾患をもつ者)に投与を禁忌する。

非動脈炎性前部虚血性視神経症 (NAION) のため、片目を失った患者には、PDE5 阻害剤にさらされたかどうかに関わらず禁忌である。

シルデナフィルの安全性は患者の以下のサブグループで研究されなかった。従って、その使用は禁忌である。: 重度の肝機能障害、低血圧(血圧 < 90/50 mmHg の)、脳卒中または心筋梗塞の最近の既往歴と色素性網膜炎などの既知の遺伝退行性網膜障害。(これらの患者の少数に網膜ホスホジエステラーゼの遺伝性疾患あり)

(特別な警告と注意)

薬理学的治療が考慮される前に、潜在的基礎原因を決定するため、病歴と身体診察は勃起障害を診断すること。また、性的行為に関連した心臓のリスクの度合いがあるため、勃起不全の治療を開始する前に、医師は、その患者の心臓血管状態を考慮すること。シルデナフィルには、血管拡張特性を有するため、血圧の軽度と一過性の減少をもたらす。医師は、シルデナフィルを処方する前に、特に性行為との組み合わせにより血管拡張作用によって患者に悪影響をもたらす可能性があるか否かを慎重に検討する必要がある。

左室流出閉塞(例：大動脈弁狭窄、肥大型閉塞性心筋症) または、多系統萎縮症のまれな症候群の患者などの血管拡張に対する増加した感染性を有する患者に 血圧の自律神経制御重度障害が現れる。

シルデナフィルの投与は、陰茎の解剖学的変形を有する患者(例：屈曲角形成、海綿体線維症、ペイロニー病)、あるいは、持続勃起症にかかりやすい(鎌状赤血球貧血、多発性骨髄腫、白血病など)患者に対して注意する必要がある。

リトナビルとのシルデナフィルの同時投与は推奨されない。

α -遮断薬を服用している患者にシルデナフィルを同時投与場合、少数の影響を受けやすい患者において、症候性低血圧につながる可能性があるため注意すること。シルデナフィルは、女性による使用に適応していない。

(妊娠と授乳期)

シルデナフィルは、女性による使用に適応していない。シルデナフィルの経口投与後のネズミとウサギの繁殖実験において、投与による副作用は見られなかった。

(運転及び機械使用への影響)

運転及び機械使用への影響に関する研究は行われていない。シルデナフィルを使った臨床試験において、眩暈や視覚異常の報告があるため、運転や機械を使用する際、患者はシルデナフィルがどのように影響しているかを注意する必要がある。

(副作用)

シルデナフィルの安全性プロファイルは、67件のプラセボ対照臨床試験で推奨された投薬法を受けた8691例の患者に基づく。シルデナフィル治療患者による臨床試験において、最も一般的に報告されている副作用は、頭痛、頭痛、顔面紅潮、消化不良、視覚障害、鼻閉、尿路感染症、原因不明の発疹、眩暈と色覚障害であった。

医薬品市販後、約9年間の監視調査から、副作用が報告されている。全ての副作用反応が安全性データベースを含む医薬品市販承認取得者に報告されているわけではないため、これらの反応の頻度を確実に測定することができない。

(過量)

800mgまでの用量の単回投与ボランティア研究において、副作用が、低量用で見られるものと類似していたが、出現率及び重症度は増加した。200mgの用量は、有効性に帰着しなかったが、副作用(頭痛、顔面紅潮、眩暈、消化不良、鼻炎、視覚異常)の発生率は上昇した。

過剰摂取の場合は、必要に応じて、適切な対症療法を行うこと。シルデナフィルは、血漿蛋白結合率が高く尿中排泄率が低いため腎透析によるクリアランスの促進は期待できない。

(包装) ブリスター 4錠

(保管方法)

直射日光を避け、30℃以下の湿気のない涼しい場所に保管すること。

小児の手の届かない場所に保管すること。

(最終更新) 2016年3月

ZIMMAR

ZIMMAR PHARMA LIMITED
85 Tottenham Court Road,
London, W1T 4TQ,
United Kingdom