

医師、医療機関、研究機関の元でのみ使用のこと。

Vardenafil Tablets

ZIMATRA - 20

バルデナフィル錠

ジマトラ - 20

(成分) 1錠中

バルデナフィル塩酸塩三水和物 20mg

(バルデナフィルと同量で換算)

添加剤 q.s.

着色料：酸化鉄黄色NF、赤色酸化鉄NF

(化学名) Piperazine, 1-[[3-(1,4-dihydro-5-methyl-4-oxo-7-propylimidazo[5,1-f][1,2,4]triazin-2-yl)-4-ethoxyphenyl]sulfonyl]-4-ethyl-, monohydrochloride.

(分類) ホスホジエステラーゼ5(PDE5)抑制薬

(薬学)

薬力学

バルデナフィルの塩酸塩は、環状グアノシンーリン酸(cGMP) — 特定のホスホジエステラーゼ5型(PDE5) — の選択的抑制剤である。勃起陰茎は、海綿体とそれに関連する細動脈の平滑筋の緩和によって開始される血行動態過程である。性的に刺激している間、一酸化窒素が海綿体の末端神経および内皮細胞から放出される。一酸化窒素が、酵素グアニル酸シクラーゼを活性化させた結果、海綿体の平滑筋細胞に於いて環状グアノシンーリン酸(cGMP)の更なる合成を促進させる。環状グアノシンーリン酸(cGMP)は平滑筋を連続的に弛緩させることにより陰茎への血流量が増大する。環状グアノシンーリン酸(cGMP)の組織濃度は、ホスホジエステラーゼを介し、合成と分解の速度(PDE類)の両方によって調節される。ヒト海綿体の中で最も豊富なPDEは、環状グアノシンーリン酸(cGMP)に於ける特徴的なホスホジエステラーゼタイプ5(PDE5)である。従って、PDE5の抑制が、環状グアノシンーリン酸(cGMP)の量を増加させ、それが勃起機能を増長させることになる。一酸化窒素の局所放出を開始するために性的刺激が必要とされるため、性的刺激がない場合、PDE5の抑制には効果がない。バルデナフィルは、このように性的刺激に対する自然な反応を生み出す。バルデナフィルは、内因性一酸化窒素合成に依存しており、一酸化窒素供与体によって陰茎勃起を引き起こす。

(薬物動態)

吸収

バルデナフィルは、経口投与の後急速に吸収される。最高血中濃度には、早い場合15分ほどで達する。食事前の被験者の90%は、最高血中濃度には30分から120分の間に達する。

分布

バルデナフィルの平均安定状態に於ける分布(VSS)は、広範な範囲に広がりを見せ、その数値は208Lである。バルデナフィル及び、その主要な循環代謝産物であるM1は、高度に血漿タンパク質(約95%は、親薬物とM1)と結合されている。この結合タンパク質は、可逆的であり、かつ総薬物濃度とは無関係である。

代謝

バルデナフィルは、CYP3A5及び、CYP2Cのアイソフォームからの寄与であり、肝酵素CYP3A4によって主に代謝される。主要循環代謝物は、M1である。M1の血漿中濃度は、親化合物の約26%である。M1は、全薬理活性の約7%を占める。M1は、全薬理活性の約7%を占める。

排泄

バルデナフィルの全身クリアランスは56L/時間である。また、バルデナフィルとその一次代謝産物(M1)の半減期は約4-5時間である。経口投与後、バルデナフィルは主に大便(経口投与の約91-95%)や、小さい値ではあるが小便(経口投与の約2-6%)として排泄される。

(特定年齢層)

腎機能不全

腎機能障害患者へ用量調整は必要としない。バルデナフィルの薬動学は透析を必要としている患者において研究されていない。しかし、この透析を必要としている患者にはバルデナフィル錠剤を使ってはいけない。

肝機能障害

中軽度の肝機能障害(重症度分類AとB)患者のバルデナフィルのクリアランスは、肝機能障害の程度と比例して低下した。バルデナフィルの薬動学は、重篤な肝機能障害(重症度分類C)患者において研究されていない。こういった患者にはバルデナフィル錠剤を使ってはいけない。

(効果・効能)

バルデナフィルは、勃起不全障害の治療のために使用される。

(用法・用量)

殆どの患者へのバルデナフィル錠剤の推奨される使用量は10mgであり、性行為の約60分前に経口服用する。用量は、最大推奨用量20mgまで増加でき、有効性と副作用に基づき、5mgまで減少させることができる。最大推奨された投薬頻度は、1日につき1回である。バルデナフィル錠剤は、食事の有無にかかわらず服用することができる。性的な刺激は、治療に対する反応のために必要とされる。

老人病医学：65歳の患者に対してのバルデナフィル錠剤の開始量は、5mgとすること。

小児(18歳未満)：バルデナフィル錠剤は、小児には使用できない。

(次の患者には使用しないこと)

本品のうちの有効成分、または添加剤のいずれかに対するアレルギーを持つ患者。

(警告及び使用上の注意)

警告

循環器疾患

性行為に関連した心臓のリスクの度合いがあるため、勃起不全のための任意の治療を開始する前、医師は、その患者の心血管系の状態を考慮する必要がある。バルデナフィルは、血圧の軽度かつ一過性の減少をもたらす得る血管拡張特性を有する。

他の既存の病状

陰茎(例: 屈曲角形成、海綿体線維症、ペーロニー病)に解剖学的変形があり、また、持続性勃起症の素因になる可能性がある状態を持つ患者は(例: 鎌状赤血球性貧血、多発性骨髄腫、白血病)通常、勃起不全障害治療のための薬剤は、注意して使われなければならない。

他の勃起不全障害(他のPDE5抑制薬を含む)治療とバルデナフィルとの組合せの安全性および有効性は研究されていない。従って、そのような組合せの使用は推奨されない。

使用上の注意

勃起不全障害の評価は、潜在的基礎原因、医学的評価と適切な治療の決定を含まなければならない。

α -遮断薬の利用

PDE5抑制薬がアルファ受容体遮断薬と同時に投与される場合、注意すること。バルデナフィル錠および α アドレナリン遮断剤を含むPDE5抑制剤は、血圧低下作用であり、また血管拡張剤である。

(相互作用)

マクロライド系抗生物質

エリスロマイシンや、クラリスロマイシンと組み合わせて使用する場合、バルデナフィルの最大用量の5mgを超えないこと。これは、強力なCYP 3A4抑制薬である。

ケトコナゾール

バルデナフィル錠剤は、200mgを超える投薬量のケトコナゾールと服用してはならない。

インジナビル

インジナビルとバルデナフィルの併用は禁忌である。

リトナビル

リトナビルは、25.7時間までバルデナフィルの半減期を大幅に延長する。リトナビルを使用している患者には使用しないこと。

その他のCYP 3A4抑制薬

ケトコナゾール、イトラコナゾール、エリスロマイシンまたはクラリスロマイシンと組み合わせて使用される場合、バルデナフィル錠剤の最大量は5mgを超えないこと。

硝酸塩、一酸化窒素提供者

硝酸塩との組み合わせで投与された場合のバルデナフィルの潜在的低血圧効果に関する情報は、限られている。

(妊娠と授乳期)

妊娠での(カテゴリー B3)の使用

バルデナフィルは、女性による使用に適応していない。バルデナフィルの妊婦における研究はされていない。

授乳期

バルデナフィルは、授乳婦による使用に適応していない。母乳へのバルデナフィルの影響及びバルデナフィルの乳児に対しての安全に関するデータはない。

(運転及び機械使用への影響)

めまい等の副作用が現れることがあるので、車の運転や機械の操作には十分に注意する必要がある。

(副作用)

バルデナフィルは、体内に取り込まれ易く作られている。副作用があった場合でも、それは一過性で、それほど大きな事象は見られない。

(過量)

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。腎臓透析は、バルデナフィルが血漿タンパク質に直接に結合していて、尿中に溶けにくくなっているため、早急な効果は期待できない。

(包装)

ブリスターバック 10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

ZI02/TB/UK/LF/02