核准日期：2023年10月18日
修改日期：2023年10月23日

枸橼酸西地那非口崩片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

警示语：本品规格为50mg，不适用于起始剂量为25mg患者使用。本品不能够掰开服用。

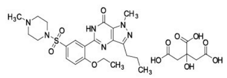
【药品名称】
通用名称：枸橼酸西地那非口崩片
英文名称：Sildenafil Citrate Orodispersible Tablets
汉语拼音：Juyuansuan Xidinafei Koubengpian

【成份】

本品主要成份为枸橼酸西地那非。

化学名称：1-{4-乙氧基-3-(6,7-二氢-1-甲基-7-氧代-3-丙基-1氢-吡唑并[4,3-d] 嘧啶-5-基)苯磺酰}-4-甲基哌嗪枸橼酸盐。

化学结构式：



分子式：$C_{22}H_{30}N_6O_4S \cdot C_6H_8O_7$

分子量：666.70

辅料包括：D-甘露醇、交联聚维酮、聚醋酸乙烯酯和聚维酮的直压预混辅料，微晶纤维素，胶态二氧化硅，交联羧甲纤维素钠，硬脂酸镁，靛蓝铝色淀，三氯蔗糖，橙粉末香精，柠檬粉末香精，薄荷粉末香精。

【性状】 本品为蓝色菱形片。

【适应症】 用于治疗勃起功能障碍。

【规格】 50mg（按$C_{22}H_{30}N_6O_4S$计）。

【用法用量】

剂量

成人用药

本品在性活动前约1小时按需服用。推荐剂量为50mg。

基于药效和耐受性，剂量可增加至100mg(最大推荐剂量)。对于剂量需增加至100mg的患者，可连续服用2片50mg口崩片。推荐每日最多服用1次。

在没有性刺激时，推荐剂量的西地那非不起作用。

特殊人群用药

老年患者用药：老年患者(≥65岁)起始剂量以25mg为宜。

肾功能损害患者用药：

对于有轻度至中度肾功能受损(肌酐清除率＝30 - 80mL/分钟)的患者，推荐剂量同“成人用药”。对于有重度肾功能受损(肌酐清除率<30mL/分钟)的患者，由于西地那非清除率下降，因此可考虑起始剂量25mg。

肝功能损害患者用药：

对于肝功能受损(例如肝硬化)患者，由于西地那非清除率下降，应考虑使用起始剂量25mg。

对于正在服用其他药物的患者的用药：

除不建议利托那韦与西地那非合用外(见【注意事项】)，同时接受CYP3A4抑制剂治疗患者的推荐起始剂量为25mg(见【药物相互作用】)。

西地那非可增强硝酸酯的降压作用，故服用任何剂型的一氧化氮供体和硝酸酯的患者，禁服西地那非。

为尽可能减少发生体位性低血压的可能，接受α受体阻滞剂治疗的患者在开始服用西地那非前，患者已应用α受体阻滞剂治疗达到稳定状态。此外，推荐的西地那非起始剂量为25mg(见【注意事项】和【药物相互作用】)。

给药方法：口服

将口崩片置于舌上，待其崩解后，用水吞咽或直接吞咽。从包装中取出后应立即服用。对于服用剂量为100mg的患者，应在第一片完全崩解后，再服用第二片50mg的口崩片。

与空腹状态相比，口崩片与高脂饮食同服会引起显著的吸收延迟(见【药代动力学】)。推荐空腹服用本品。本品可用水服用或直接服用。

【不良反应】

安全性概况

西地那非的安全性特征基于74项双盲、安慰剂对照临床研究中9570例患者的数据。在临床研究中，西地那非治疗患者最常报告的不良反应为头痛、潮红、消化不良、鼻充血、头晕、恶心、潮热、视觉障碍、蓝视症和视物模糊。

通过上市后监督收集的不良反应，所涵盖年限预计超过10年。由于并非所有不良反应均会报告给上市许可持有人并纳入安全性数据库，因此无法可靠的确定这些反应的发生率。

不良反应列表

下表按系统器官分类和发生率(十分常见(≥1/10)、常见(≥1/100至<1/10)、偶见(≥1/1000至<1/100)、罕见(≥1/10000至<1/1000))列出了临床试验中发生率高于安慰剂的所有有重要医学意义的不良反应。在每个频率组内按严重程度降序列出不良反应。

表1：对照临床研究中发生率大于安慰剂组的有重要医学意义的不良反应、或经上市后监督报告为有重要医学意义的不良反应

系统器官分类	十分常见(≥1/10)	常见(≥1/1,00至<1/10)	偶见(≥1/1,000至<1/100)	罕见(≥1/10,000至<1/1,000)
感染及侵染类疾病			鼻炎	
免疫系统疾病			超敏反应	
各类神经系统疾病	头痛	头晕	嗜睡、感觉减退	脑血管意外、短暂性脑缺血发作、惊厥发作*、惊厥复发*、晕厥
眼器官疾病		视觉彩色失真**、视觉障碍、视物模糊	泪液分泌类疾病***、眼痛、畏光、闪光幻觉、眼充血、视觉亮度、结膜炎	非动脉炎性前部缺血性视神经病变(NAION)*、视网膜血管闭塞*、视网膜出血、动脉硬化性视网膜病、视网膜疾病、青光眼、视野缺损、复视、视觉灵敏度减退、近视、视力疲劳、玻璃体飞蛾症、虹膜疾病、瞳孔散大、虹视、眼睛水肿、眼肿、眼部疾病、结膜充血、眼刺激、眼感觉异常、眼睑水肿、巩膜色调异常
耳及迷路类疾病			眩晕、耳鸣	耳聋
心脏器官疾病			心动过速，心悸	心源性猝死*、心肌梗死、室性心律失常*、房颤、不稳定型心绞痛
血管与淋巴管类疾病		潮红、潮热	高血压、低血压	
呼吸系统、胸及纵隔疾病		鼻充血	鼻衄 鼻窦充血	咽喉缩紧感，鼻水肿，鼻干燥
胃肠系统疾病		恶心，消化不良	胃食管反流症，呕吐，上腹痛，口干	口腔感觉减退
皮肤及皮下组织类疾病			皮疹	Steven Johnson 综合征*(SJS)、中毒性表皮坏死松解症*(TEN)
各种肌肉骨骼及结缔组织疾病			肌痛 肢体疼痛	
肾脏及泌尿系统疾病			血尿症	
生殖系统及乳腺疾病				阴茎出血、阴茎异常勃起*、血精症、勃起增强
全身性疾病及给药部位各种反应			胸痛、疲乏、发热感	易激惹
各类检查			心率加快	

*仅在上市后监督期间报告。

**视觉彩色失真：绿视症、色视症、蓝视症、红视症和黄视症。

***泪液分泌类疾病：干眼、泪腺疾病和流泪增加。

在一项纳入36名中国健康男性(21～38岁)的临床研究中，西地那非口崩片治疗组报告的全因性和与治疗相关TEAE包括：恶心(1例)、血钾降低(1例)、低血糖(1例)、头晕(2例)、头痛(2例)、潮红(1例)，尚不能排除上述不良事件的发生与西地那非的相关性。

【禁忌】

已知对本品中任何活性成份或辅料过敏的患者禁用。

由于已知的本品对一氧化氮/环磷酸鸟苷(cGMP)途径的作用(见【药理毒理】)，西地那非可增强硝酸酯的降压作用。因此禁止与任何剂型的一氧化氮供体(例如亚硝酸异戊酯)合用。

禁止PDE5抑制剂(包括西地那非)与鸟苷酸环化酶激动剂(如利奥西呱)合用，因为可能会潜在地导致低血压症状(见【药物相互作用】)。

治疗勃起功能障碍的药物，包括西地那非，不能用于已被建议禁止性生活的男性患者(例如：重度心血管疾病患者，如不稳定型心绞痛或重度心力衰竭)。

本品禁用于因非动脉性前部缺血性视神经病(NAION)而导致单眼视力丧失的患者，无论发作是否与既往暴露于PDE5抑制剂有关(见【注意事项】)。

目前尚未在以下患者人群中研究西地那非的安全性，此类人群禁止使用西地那非：重度肝功能受损，低血压(血压90/50mmHg以下)，近期卒中或心肌梗死史，已知的遗传性视网膜变性疾病，例如视网膜色素瘤(少数此病患者有视网膜磷酸二酯酶遗传性异常)。

【注意事项】

在考虑药物治疗前应询问病史并进行体格检查以诊断勃起功能障碍，并确定可能的基础病因。

心血管危险因素：

在开始治疗勃起功能障碍前，医师应评估患者的心血管情况，因为性活动有一定程度上的心血管风险。西地那非有扩血管作用，导致血压轻度一过性降低(见【药理毒理】)。开具西地那非处方前，医师应仔细评估扩血管作用是否会给有某些基础疾病的患者带来不良影响，尤其是在性活动时。左心室流出道梗阻(如主动脉狭窄、肥厚性梗阻性心肌病)或罕见的表现为血压自主控制严重受损的多系统萎缩综合征患者，对血管扩张剂的敏感性增强。

本品增强硝酸盐类的降血压效应(见【禁忌】)。

上市后曾报告下列与使用本品有时间关联的严重心血管事件，包括心肌梗死、不稳定型心绞痛、心源性猝死、室性心律失常、脑出血、短暂性脑缺血发作、高血压和低血压。上述患者绝大多数(但非全部)原有心血管危险因素。所报告的事件多发生于性生活过程中或刚刚结束后，个别发生在服用西地那非后不久尚未进行性生活时。对于这些事件，尚无法确定它们是否直接与上述因素或其它因素有关。

阴茎异常勃起：

以下疾病患者慎用包括西地那非在内的治疗勃起功能障碍的药物：阴茎解剖畸形(如阴茎偏曲、海绵体纤维化、Peyronie氏病)、易引起阴茎异常勃起的疾病(如镰状细胞贫血、多发性骨髓瘤、白血病)。

本品在国外获批准上市后，有勃起时间延长和异常勃起的报告。如持续勃起超过4小时，患者应立即就诊。如异常勃起未得到即刻处理，阴茎组织将可能受到损害并可能导致永久性的勃起功能丧失。

与其它PDE5抑制剂或其他勃起功能障碍治疗合用：

对于西地那非与其它PDE5抑制剂，或含有西地那非的其它治疗肺性动脉高血压(PAH)药物联用、或与其它治疗勃起功能障碍药物联用，其安全性与有效性目前尚未研究过。故不推荐联合使用。

对视觉的影响：

应用西地那非和其它PDE5抑制剂后，已有视力缺陷病例的自发报告(见【不良反应】)。在一项应用西地那非与其它PDE5抑制剂的观察性研究中，已有非动脉炎性前部缺血性视神经病变(罕见病例)的自发报告(见【不良反应】)。如患者突发视力缺陷，应建议停用本品，并立即就诊(见【禁忌】)。

与利托那韦合用：

不建议与利托那韦联合应用(见【药物相互作用】)。

与α受体阻滞剂合用：

同时服用α受体阻滞剂的患者慎用西地那非，因为联合用药可能会导致一些敏感患者出现低血压症状(见【药物相互作用】)。这最可能发生于服用西地那非4小时内。为尽可能减少发生体位性低血压的可能，接受西地那非治疗前，应已经达到α受体阻滞剂血流动力学稳定状态。应考虑西地那非起始剂量为25mg(见【用法用量】)。此外，医师应指导患者在出现低血压症状时如何处理。

对出血的影响：

人类血小板研究表明，西地那非在体外可增强硝普钠的抗血小板凝集作用。目前尚无出血性疾病或活动性消化性溃疡患者服用西地那非的安全性信息。因此，这些患者必须在进行细致的获益风险评估后才可应用西地那非。

对驾驶和操纵机器能力的影响：

西地那非可能会对驾驶和操纵机器能力造成轻微影响。

已有报道称，在使用西地那非的临床试验中，患者产生了头晕和视力改变，患者在驾驶或操纵机器之前应了解他们对西地那非的反应情况。

辅料

每片本品中含有少于1 mmol钠（23 mg）。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

西地那非不适用于女性。在妊娠期或哺乳期妇女中尚未开展充分的、严格的对照研究。

【儿童用药】 本品不适用于18岁以下人群。

【老年用药】

健康老年志愿者(65岁及以上)的西地那非清除率降低，导致西地那非及其活性N-去甲基代谢物的血浆浓度比健康年轻志愿者(18 - 45岁)高90%。因血浆蛋白结合率存在年龄差异，游离西地那非血浆浓度相应升高约40%。鉴于血药浓度较高可能同时增加疗效和不良事件的发生，故起始剂量以25mg为宜(见【用法用量】)。

【药物相互作用】

其他药物对西地那非的作用

体外研究：本品代谢主要通过细胞色素P450(CYP)3A4(主要途径)和2C9(次要途径)。故这些同功酶的抑制剂会降低西地那非的清除，而这些同功酶的诱导剂会增加西地那非的清除。

体内研究：

临床试验的人群药代动力学数据亦表明，当与CYP3A4抑制剂(如酮康唑、红霉素、西咪替丁)合用时，西地那非的清除率降低。虽然在这些患者中未观察到不良事件发生率升高，但西地那非与CYP3A4抑制剂同时应用时，推荐起始剂量为25mg。

HIV蛋白酶抑制剂利托那韦(为P450的高效抑制剂)达稳态时(500mg，一日两次)，单剂服用100mg西地那非则后者C_{max}提高300%(4倍)，AUC增加1000%(11倍)。服药24小时后，血浆西地那非浓度仍接近200ng/ml，而单用西地那非时仅约5ng/ml。这与利托那韦对很多CYP450底物有显著作用一致。西地那非不影响利托那韦的药代动力学，不建议西地那非与利托那韦合用(见【注意事项】)，并且48小时内西地那非的剂量决不可以超过25mg。

HIV蛋白酶抑制剂沙奎那韦(另一种CYP3A4抑制剂)达稳态时(1200mg，一日三次)，服用单剂100mg西地那非则后者的C_{max}提高140%，AUC增加210%。西地那非不影响沙喹那韦的药代动力学。相比沙喹那韦，酮康唑和伊曲康唑等更强效的CYP3A4抑制剂，上述作用可能更大。

当单剂西地那非100mg与中效抑制剂红霉素(500mg一日两次，共5天达到稳态)合用时，西地那非的药时曲线下面积(AUC)升高182%。在健康男性志愿者中，尚无证据表明阿奇霉素(每天500mg，共3天)会影响西地那非或其主要循环代谢产物的AUC、C_{max}、T_{max}、清除速率常数或半衰期。健康志愿者同时服用本品50mg和西咪替丁(细胞色素P450抑制剂和非特异性CYP3A4抑制剂)800mg，导致血浆西地那非浓度增高56%。

西柚汁是CYP3A4肠壁代谢的弱抑制剂，可能导致西地那非血浆浓度轻度升高。

单剂抗酸药(氢氧化镁/氢氧化铝)对本品的生物利用度没有影响。

虽然尚未对所有药品进行专门的相互作用研究，临床试验中患者的药代动力学数据显示，合用CYP2C9抑制剂(如甲苯磺丁脲、华法林、苯妥英)、CYP2D6抑制剂(如选择性5-羟色胺再摄取抑制剂、三环抗抑郁药)、噻嗪类药物及噻嗪类利尿剂、袢利尿剂和保钾利尿剂、血管紧张素转换酶抑制剂、钙通道阻滞剂、β肾上腺素能受体拮抗剂或CYP450代谢诱导剂(如利福平、巴比妥)时，对西地那非的药代动力学没有影响。这些对西地那非代谢产物的影响不会引起临床变化。

一项男性健康志愿者的研究发现，联合应用稳态剂量的西地那非(80mg，每日三次)与稳态剂量的内皮素受体拮抗剂波生坦(125mg，每日两次，一种CYP3A4、CYP2C9的中等强度诱导剂，也可能是CYP2C19的中等强度诱导剂)时，西地那非AUC下降62.6%，C_{max}下降55.4%。可以预测，同时服用强效CYP3A4诱导剂(如利福平)会引起血浆西地那非水平更多地下降。

尼可地尔既是一种钾通道激活剂，也是一种硝酸盐类药物。因有硝酸盐成份，可能与西地那非有严重的相互作用。

西地那非对其他药物的作用

体外研究：本品是一种细胞色素P450亚型1A2、2C9、2C19、2D6、2E1和3A4(IC_{50}>150μM)的弱抑制剂。由于服用推荐剂量西地那非后其血浆峰浓度约为1μM，故西地那非不会改变这些同功酶作用底物的清除。

目前尚无西地那非与非特异性磷酸二酯酶抑制剂(如茶碱或双嘧达莫)相互作用的数据。

体内研究：

与西地那非已知的对一氧化氮/cGMP通路的作用一致(见【药理毒理】)，西地那非可增强硝酸盐类的降血压作用，因此禁止与一氧化氮供体或任何剂型的硝酸盐类合用(见【不良反应】)。

利奥西呱：临床前研究显示，当PDE5抑制剂与利奥西呱合用时全身血压降低效应累加。临床研究已证明，利奥西呱可增强PDE5抑制剂的降压作用。在研究人群中未发现两者合用具有良好的临床疗效。禁止利奥西呱与包括西地那非在内的PDE5抑制剂合用(见【不良反应】)。

接受α受体阻滞剂治疗的患者联合应用西地那非，可能会导致一些敏感患者出现低血压症状，这最可能发生于服用西地那非4小时内。在3项专门的药物相互作用研究中，接受多沙唑嗪治疗达稳定状态的良性前列腺增生(BPH)患者同时服用α受体阻滞剂多沙唑嗪(4mg和8mg)和西地那非(25mg、50mg或100mg)，在这些研究人群中，观察到仰卧位血压平均分别进一步降低7/7mmHg、9/5mmHg 和8/4mmHg，立位血压平均分别进一步降低6/6mmHg、11/4mmHg和4/5mmHg。稳定使用多沙唑嗪的患者如同时服用西地那非和多沙唑嗪，有个别患者出现体位性低血压的报告，包括头晕和头晕目眩，而无晕厥。

未发现经CYP4502C9代谢的甲苯磺丁脲(250mg)和华法林(40mg)与西地那非(50mg)有明显的相互作用。

西地那非(50mg)不增加阿司匹林(150mg)所致的出血时间延长。

健康志愿者平均最大血浆酒精浓度为80mg/dl时，西地那非(50mg)不增强酒精的降压作用。

与安慰剂治疗相比，下列抗高血压药与使用西地那非的患者中出现的副作用并无差异：利尿剂、β受体阻滞剂、ACE抑制剂、血管紧张素II拮抗剂、抗高血压药物(扩血管剂和中枢作用药物)、肾上腺素能神经阻滞剂、钙通道阻滞剂和α肾上腺素受体阻滞剂。在一项专门的相互作用研究中，高血压患者同时服用西地那非(100mg)和氨氯地平，仰卧位收缩压平均进一步降低8mmHg，舒张压平均进一步降低7mmHg。这些进一步的降血压效应与西地那非单独用于健康志愿者中的作用相似。

西地那非(100mg)不影响HIV蛋白酶抑制剂沙喹那韦和利托那韦稳态时的药代动力学，后两者都是CYP4503A4的底物。

对于健康男性志愿者，稳态剂量的西地那非(80mg，每日三次)引起波生坦(125 mg，每日两次)的AUC增加49.8%，C_{max}提高42%。

与只服用沙库巴曲/缬沙坦相比，高血压患者在稳定状态下加用单剂量西地那非与血压显著地更大幅地降低有关。因此，服用沙库巴曲/缬沙坦的患者在使用西地那非时需谨慎。

【药物过量】

健康志愿者单次剂量至800mg，不良反应与低剂量时相似，但发生率和严重程度有所增加。200mg剂量不会导致疗效增加，但不良反应(头痛、潮红、头晕、消化不良、鼻充血、视力改变)的发生率增加。

当发生药物过量时，应根据需要采取常规支持疗法。因西地那非与血浆蛋白结合率高，且不从尿中清除，故肾脏透析不会增加清除率。

【药理毒理】

药理作用

西地那非是一种环磷酸鸟苷(cGMP)特异的5型磷酸二酯酶(PDE5)的选择性抑制剂。

在性刺激过程中，阴茎勃起的生理机制包括阴茎海绵体内一氧化氮(NO)的释放。NO激活鸟苷酸环化酶，导致cGMP水平增高，使得海绵体内平滑肌松弛，血液流入。西地那非通过抑制海绵体内分解cGMP的PDE5从而增强NO的作用，故对离体人海绵体无直接松弛作用。当性刺激引起局部NO释放时，西地那非抑制PDE5可增加海绵体内cGMP 水平，松弛平滑肌，血液流入海绵体。在没有性刺激时，推荐剂量的西地那非不起作用。

体外试验显示，西地那非对PDE5具有选择性。它对PDE5的作用远比对其他已知的磷酸二酯酶强(是对PDE6作用的10倍，对PDE1作用的80多倍，对PDE2、PDE3、PDE4、PDE7、PDE8、PDE9、PDE10、PDE11作用的700多倍)。西地那非对PDE5的选择性大约为对PDE3的4000倍，后者参与调节心肌收缩力。西地那非对PDE5的作用仅是对PDE6作用的10倍。

PDE6是存在于视网膜中的一种酶，与视网膜的光转化通路有关。西地那非对PDE6的选择性相对较低是它在高剂量或高血浆浓度时出现色觉异常的原因。

除人海绵体平滑肌外，PDE5也存在于血小板、血管和内脏平滑肌以及骨骼肌、大脑、心脏、肝脏、肾脏、肺脏、胰腺、前列腺、膀胱、睾丸和精囊中。西地那非对这些组织中PDE5的抑制，可能是其增强一氧化氮的抗血小板聚集作用(体外试验)、抑制血小板血栓形成以及舒张外周动静脉(体内试验)的基础。

毒理研究

遗传毒性：细菌回复突变试验、中国仓鼠卵巢细胞致突变试验、人外周血淋巴细胞染色体畸变试验、小鼠体内骨髓微核试验结果均为阴性。

生殖毒性：雌雄大鼠分别连续36天和102天给予西地那非60mg/kg/天(该剂量下雄性大鼠AUC约为临床上男性AUC的25倍以上)，未见生殖毒性。

健康志愿者单剂口服西地那非100mg后，精子的活动力和形态未受影响。

胚胎-胎仔发育毒性试验显示，大鼠和兔给予西地那非200mg/kg/天(按体表面积换算，分别约为50kg受试者人最大推荐剂量(MRHD)的16倍和32倍)，未见致畸性、胚胎毒性或胎仔毒性。在大鼠围产期毒性试验中，大鼠连续36天给药，未观察到临床不良反应的剂量水平(NOAEL)为30mg/kg/天(按体表面积换算，约为50kg受试者MRHD的2倍)。

致癌性：雌性和雄性大鼠连续24个月给予西地那非，未见致癌性。该致癌试验剂量下，大鼠体内的游离药物及其主要代谢产物的AUCs分别约为男性受试者服用MRHD(100mg/人)时的20倍和38倍。小鼠连续18-21个月给予西地那非10mg/kg/天(小鼠最大耐受剂量，按体表面积换算，约为50kg受试者MRHD的0.4倍)，未见致癌性。

【药代动力学】

吸收

本品吸收迅速。空腹状态下口服30至120分钟(中位值60分钟)后达到血浆峰浓度。平均绝对口服生物利用度是41%（范围25 - 63%）。在推荐剂量范围内(25 - 100mg)，口服西地那非后AUC和C_{max}与剂量成比例增加。

当薄膜衣片与食物同服时，西地那非的吸收速率降低，达峰时间(t_{max})平均延迟60分钟，血浆峰浓度(C_{max})平均下降29%。

在一项纳入36名健康男性(≥45岁)的临床研究中，50mg口崩片(不用水送服)与 50mg薄膜衣片具有生物等效性。在该研究中，与50mg薄膜衣片比较，用水送服50mg口崩片时，AUC未发生变化，但平均血浆峰浓度(C_{max})降低14%。

在一项纳入36名中国健康男性(18-40岁【含】)的临床研究中，50mg口崩片(不用水或用水送服)与50mg薄膜衣片(用水送服)具有生物等效性。在该研究中，与50mg薄膜衣片(用水送服)比较，不用水或用水送服50mg口崩片时，AUC和平均血浆峰浓度(C_{max})均无明显变化。

与空腹状态下服用相比，当口崩片与高脂饮食同服时，西地那非的吸收速率降低，中位达峰时间(T_{max})延迟约3.4小时，平均血浆峰浓度(C_{max})和AUC分别降低约59%和12%。

分布

西地那非的平均稳态分布容积(Vd)为105L，说明其在组织中有分布。

口服单剂量100mg西地那非后，最大总血浆浓度的平均值约为440ng/mL (CV 40%)。因西地那非(及其主要循环 N-去甲基代谢物)96%与血浆蛋白结合，这导致西地那非最大游离血浆浓度的平均值约为18ng/mL(38nM)。蛋白结合与总药物浓度无关。

在接受西地那非(100mg单次给药)的健康志愿者中，给药90分钟后精液中的西地那非量低于0.0002%(平均188ng)。

生物转化

西地那非主要通过肝脏微粒体同功酶CYP3A4(主要途径)和CYP2C9(次要途径)清除。主要的循环代谢物通过西地那非N-去甲基化产生。该代谢物有类似于西地那非的磷酸二酯酶选择性，在体外对PDE5的作用约为母体药物的50%。该代谢物的血浆浓度约为西地那非的40%。N-去甲基代谢物进一步被代谢，其终末半衰期约为4小时。

排泄

西地那非的总体清除率为41L/小时，终末相半衰期为3 - 5小时。口服或静脉给药后西地那非主要以代谢物形式从粪便排泄(约为口服剂量的80%)，少量经尿液排泄(约为口服剂量的13%)。

特殊人群中的药代动力学

老年人

健康老年志愿者(65岁及以上)的西地那非清除率降低，导致西地那非及其活性N-去甲基代谢物的血浆浓度比健康年轻志愿者(18 - 45岁)高90%。因血浆蛋白结合率存在年龄差异，游离西地那非血浆浓度相应升高约40%。

肾功能不全

在轻度至中度肾功能受损(肌酐清除率=30-80mL/分钟)志愿受试者中，口服单剂量50mg西地那非后，其药代动力学未改变。N-去甲基代谢物的平均AUC 和C_{max}相较于无肾脏受损的同年龄组志愿者相比分别下降了126%和73%。但因受试者间差异较大，并无显著的统计学差异。在重度肾功能受损志愿受试者(肌酐清除率<30 mL/min)中，西地那非清除率下降，与无肾脏受损的同年龄组志愿者相比，AUC和C_{max}平均分别增加了100%和88%。此外，N-去甲基代谢物AUC 和C_{max}数值分别显著增加了200%和79%。

肝功能不全

在轻度至中度肝硬化(Child-Pugh分级A级和B级)志愿受试者中，西地那非清除率下降，与无肝脏受损的同年龄组志愿者相比，AUC和C_{max}分别增加了84%和47%。尚未在重度肝功能受损患者中研究西地那非的药代动力学。

【贮藏】 密闭保存。

【包装】 聚酰胺/铝/聚氯乙烯冷冲压成型固体药用复合硬片和药用铝箔。1片/板，1板/盒，2板/盒；4片/板，1板/盒。

【有效期】 24个月

【执行标准】 YBH14212023

【批准文号】 国药准字H20234296

【上市许可持有人】

名　称：青岛黄海制药有限责任公司
注册地址：青岛市崂山区科苑经四路17号
邮政编码：266101
电话号码：4007089177 0532-88704020
网　址：www.qdhuanghai.com

【生产企业】

企业名称：安徽泰恩康制药有限公司
生产地址：马鞍山市当涂工业园区
邮政编码：243100
电话号码：0555-6613278
传真号码：0555-6613188