Инструкция по применению
Эвалар Эффекс Силденафил таблетки 100 мг

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Эвалар
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Силденафил
Количество в упаковке: 1
Дозировка действующего вещества: 100 мг

Описание

Таблетки круглые, двояковыпуклые, покрытые пленочной оболочкой от бледно-оранжевого с розоватым опенком до бледно-коричневого с розоватым опенком цвета, на поперечном разрезе ядро от белого до почти белого цвета.

Действующее вещество

Силденафил

Состав

Силденафила цитрат Вспомогательные вещества: Целлюлоза микрокристаллическая, Кальция гидрофосфат,Крахмал прежелатинизированный кукурузный, Магния стеарат, Кроскармеллоза натрия, Кремния диоксид коллоидный Состав оболочки: Гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), Макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000), Титана диоксид, Полисорбат-80, Тальк, Краситель железа оксид красный, Краситель железа оксид желтый.

Форма выпуска

Таблетки

Способ применения и дозы

Внутрь. Рекомендуемая доза для большинства взрослых пациентов составляет 50 мг силденафила примерно за 1 час до сексуальной активности. С учетом эффективности и переносимости доза может быть увеличена до 100 мг. Максимальная рекомендуемая доза составляет 100 мг. Максимальная рекомендуемая кратность применения – 1 раз в сутки. Пожилые пациенты Корректировка дозы препарата ЭФФЕКС® Силденафил не требуется. Нарушения функции почек Для пациентов с легкой или средней степенью тяжести почечной недостаточности (КК 30-80 мл/мин) коррекции дозы не требуется. Совместное применение с другими лекарственными средствами Чтобы свести к минимуму риск развития постуральной гипотензии у пациентов, принимающих #-адрено-блокаторы, прием силденафила следует начинать только после достижения стабилизации гемодинамики у этих пациентов. Следует также рассмотреть целесообразность снижения начальной дозы силденафила.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к силденафилу или к любому другому компоненту препарата. Применение у пациентов, получающих постоянно или с перерывами донаторы оксида азота, органические нитраты или нитриты в любых формах, поскольку ЭФФЕКС® Силденафил усиливает гипотензивное действие нитратов. Безопасность и эффективность препарата ЭФФЕКС® Силденафил при совместном применении с другими средствами лечения нарушений эрекции не изучались, поэтому применение подобных комбинаций не рекомендуется. Совместное применение с ритонавиром. Нарушения функции печени. Хроническая почечная недостаточность тяжелой степени тяжести. Тяжелая сердечная недостаточность, нестабильная стенокардия, перенесенные в течение последних 6 месяцев инсульт или инфаркт миокарда, жизнеугрожающие аритмии, артериальная гипертензия (АД > 170 /100 мм рт. ст.) или гипотония (АД С осторожностью Анатомическая деформация полового члена (ангуляция, кавернозный фиброз или болезнь Пейрони). Заболевания, предрасполагающие к развитию приапизма (серповидноклеточная анемия, множественная миелома, лейкоз, тромбоцитемия). Заболевания, сопровождающиеся кровотечением. Обострение язвенной болезни желудка и 12-перстной кишки. Наследственный пигментный ретинит.

Побочные действия

Наиболее частыми побочными эффектами были головная боль и приливы. Обычно побочные эффекты препарата ЭФФЕКС® Силденафил слабо или умеренно выражены и носят преходящий характер. В исследованиях с применением фиксированной дозы показано, что частота некоторых нежелательных явлений повышается с увеличением

дозы. Классификация частоты развития побочных эффектов согласно рекомендациям Всемирной Организации Здравоохранения:Очень часто (⩾1/10), часто (от ⩾1/10 до Со стороны иммунной системы: нечасто – реакции повышенной чувствительности (в т.ч. кожная сыпь), аллергические реакции. Со стороны органа зрения: часто – затуманенное зрение, нарушение зрения, цианопсия, нечасто – боль в глазах, фотофобия, фотопсия, хроматопсия, покраснение глаз/инъекции склер, изменение яркости световосприятия, мидриаз, конъюнктивит, кровоизлияние в ткани глаза, катаракта, нарушение работы слезного аппарата, редко – отек век и прилегающих тканей, ощущение сухости в глазах, наличие радужных кругов в поле зрения вокруг источника света, повышенная утомляемость глаз, видение предметов в желтом цвете (ксантопсия), видение предметов в красном цвете (эритропсия), гиперемия конъюнктивы, раздражение слизистой оболочки глаз, неприятные ощущения в глазах, частота неизвестна – неартериитная передняя ишемическая невропатия зрительного нерва (НПИНЗН), окклюзия вен сетчатки, дефект полей зрения, диплопия*, временная потеря зрения или снижение остроты зрения, повышение внутриглазного давления, отек сетчатки, заболевания сосудов сетчатки, отслойка стекловидного тела /витреальная тракция. Со стороны органа слуха: нечасто – внезапное снижение или потеря слуха, шум в ушах, боль в ушах, звон в ушах. Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто– приливы, нечасто – тахикардия, ощущение сердцебиения, снижение артериального давления, повышение артериального давления, увеличение частоты сердечных сокращений, нестабильная стенокардия, атриовентрикулярная блокада, ишемия миокарда, тромбоз сосудов головного мозга, остановка сердца, сердечная недостаточность, отклонения в показаниях электрокардиограммы, кардиомиопатия, редко – фибрилляция предсердий. Со стороны крови и лимфатической системы: нечасто – анемия, лейкопения. Со стороны обмена веществ и питания: нечасто – ощущение жажды, отеки, подагра, некомпенсированный сахарный диабет, гипергликемия, периферические отеки, гиперурикемия, гипогликемия, гипернатриемия. Со стороны дыхательной системы: часто – заложенность носа, нечасто – носовое кровотечение, ринит, астма, диспноэ, ларингит, фарингит, синусит, бронхит, увеличение объема отделяемой мокроты, усиление кашля, редко – чувство стеснения в горле, сухость слизистой оболочки полости носа, отек слизистой оболочки носа. Со стороны желудочно-кишечноготракта: часто– тошнота, диспепсия, нечасто – гастроэзофагеаль-ная рефлюксная болезнь, рвота, боль в области живота, сухость слизистой оболочки полости рта, глоссит, гингивит, колит, дисфагия, гастрит, гастроэнтерит, эзофагит, стоматит, отклонение печеночных функциональных тестов от нормы, ректальное кровотечение, редко – гипестезия слизистой оболочки полости рта. Со стороны опорно-двигательного аппарата: часто – боль в спине, нечасто – миалгия, боль в конечностях, артрит, артроз, разрыв сухожилия, теносиновит, боль в костях, миастения, синовит. Со стороны мочеполовой системы: нечасто – цистит,

никтурия, увеличение молочных желез, недержание мочи, гематурия, нарушение эякуляции, отек гениталий, аноргазмия, гематоспермия, повреждение тканей полового члена, редко – длительная эрекция и/или приапизм. Со стороны центральной и периферической нерв-ной системы: очень часто – головная боль, часто – головокружение, нечасто – сонливость, мигрень, атаксия, гипертонус, невралгия, нейропатия, парестезия, тремор, вертиго, симптомы депрессии, бессонница, необычные сновидения, повышение рефлексов, гипестезия, редко – судороги*, повторные судороги*, обморок, нарушение мозгового кровообращения, транзиторная ишемическая атака. Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – кожная сыпь, крапивница, простой герпес, кожный зуд, повышенное потоотделение, изъязвление кожи, контактный дерматит, эксфолиативный дерматит, частота неизвестна – синдром Стивенса-Джонсо-на, токсический эпидермальный некролиз. Со стороны репродуктивной системы: редко – кровотечение из полового члена. Прочие: нечасто – ощущение жара, отек лица, реакция фоточувствительности, шок, астения, повышенная утомляемость, боль различной локализации, озноб, случайные падения, боль в области грудной клетки, случайные травмы, редко – раздражительность. * Побочные эффекты выявленные во время постмаркетинговых исследований. Сердечно-сосудистые осложнения В ходе постмаркетингового применения силденафила для лечения эректильной дисфункции сообщалось о таких нежелательных явлениях, как тяжелые сердечно-сосудистые осложнения (в т.ч. инфаркт миокарда, нестабильная стенокардия, внезапная сердечная смерть, желудочковая аритмия, геморрагический инсульт, транзиторная ишемическая атака, гипертензия и гипотензия), которые имели временную связь с применением силденафила. Большинство этих пациентов, но не все из них, имели факторы риска сердечно-сосудистых осложнений. Многие из указанных нежелательных явлений наблюдались вскоре после сексуальной активности, и некоторые из них отмечались после приема силденафила без последующей сексуальной активности. Не представляется возможным установить наличие прямой связи между отмечавшимися нежелательными явлениями и указанными или иными факторами. Зрительные нарушения В редких случаях во время пострегистрационного применения всех ингибиторов ФДЭ5, в том числе силденафила, сообщали о неартериитной передней ишемической невропатии зрительного нерва (НПИНЗН) – редком заболевании и причине снижения или потери зрения. У большинства из этих пациентов были факторы риска, в частности снижение отношения диаметров экскавации и диска зрительного нерва (застойный диск), возраст старше 50 лет, сахарный диабет, гипертензия, ишемическая болезнь сердца, гиперлипидемия и курение. В обсервационном ис-следовании оценивали, связано ли недавнее применение препаратов класса ингибиторов ФДЭ5 с острым началом НПИНЗН. Результаты указывают на приблизительно 2-кратное повышение риска НПИНЗН в пределах 5

периодов полувыведения после применения ингибитора ФДЭ5. Согласно опубь в течение 5 дней), умеренным ингибитором изоферликованным литературным данным, годичная частота возникновения НПИНЗН составляет 2,5-11,8 случаев на 100 000 мужчин в возрасте ⩾ 50 лет в общей популяции. Следует рекомендовать пациентам в случае внезапной потери зрения прекратить терапию силденафилом и немедленно проконсультироваться с врачом. Лица, у которых уже был случай НПИНЗН, имеют повышенный риск рецидива НПИНЗН. Поэтому врачу следует обсудить данный риск с такими пациентами, а также обсудить с ними потенциальный шанс неблагоприятного воздействия ингибиторов ФДЭ5. Ингибиторы ФДЭ5, в том числе силденафил, у таких пациентов следует применять с осторожностью и только в ситуациях, когда ожидаемая польза перевешивает риск.

Передозировка

При использовании препарата ЭФФЕКС® Силденафил в дозах, превышавших рекомендуемые, нежелательные явления были сходными с отмеченными выше, но обычно встречались чаще. Лечение симптоматическое. Гемодиализ не ускоряет выведение препарата, поскольку силденафил проч-но связывается с белками плазмы крови и не выводится почками.

Взаимодействие с другими препаратами

Влияние других лекарственных препаратов на фармакокинетику силденафила Метаболизм силденафила происходит в основном под действием изоферментов цитохрома CYP3A4 (основной путь) и CYP2C9, поэтому ингибиторы этих изоферментов могут уменьшить клиренс силденафила, а индукторы, соответственно, увеличить клиренс силденафила. Отмечено снижение клиренса силденафила при одновременном применении ингибиторов изофермента цитохрома CYP3A4 (кетоконазол, эритромицин, циметидин). Циметидин (800 мг), неспецифический ингибитор изофермента цитохрома CYP3A4, при совместном приеме с силденафилом (50 мг) вызывает повышение концентрации силденафила в плазме на 56 %. Однократный прием 100 мг силденафила совместно с эритромицином (по 500 мг /сутки 2 раза в денмента цитохрома CYP3A4, на фоне достижения постоянной концентрации эритромицина в крови, приводит к увеличению AUC силденафила на 182 %. При совместном приеме силденафила (однократно 100 мг) и саквинавира (1200 мг/день 3 раза в день), ингибитор ВИЧ-протеазы и изофермента цитохрома CYP3A4, на фоне достижения постоянной концентрации саквинавира в крови Cmax силденафила повышалась на 140 %, а AUC увеличилась на 210 %. Силденафил не оказывает влияния на фармакокинетику саквинавира. Более сильные ингибиторы изофермента цитохрома CYP3A4, такие как кетоконазол и итраконазол, могут

вызывать и более сильные изменения фармакокинетики силденафила. Одновременное применение силденафила (однократно 100 мг) и ритонавира (по 500 мг 2 раза в сутки), ингибитора ВИЧ-протеазы и сильного ингибитора цитохрома Р450, на фоне достижения постоянной концентрации ритонавира в крови приводит к увеличению Cmax силденафила на 300 % (в 4 раза), а AUC на 1000 % (в 11 раз). Через 24 часа концентрация силденафила в плазме крови составляет около 200 нг/мл (после однократного применения одного силденафила – 5 нг/мл). Если силденафил применяют в рекомендуемых дозах пациенты, получающие одновременно сильные ингибиторы изофермента цитохрома CYP3A4, то Cmax свободного силденафила не превышает 200 нМ, и препарат хорошо переносится. Однократный прием антацида (магния гидроксида/алюминия гидроксида) не влияет на биодоступность силденафила. В исследованиях с участием здоровых добровольцев при одновременном применении антагониста эндотелиновых рецепторов, бозентана (индуктор изофермента CYP3A4 (умеренный), CYP2C9 и, возможно, CYP2C19) в равновесной концентрации (125 мг два раза в сутки) и силденафила в равновесной концентрации (80 мг три раза в сутки) отмечалось снижение AUC и Cmax силденафила на 62,6 % и 52,4 %, соответственно. Силденафил увеличивал AUC и Cmax бозентана на 49,8 % и 42 %, соответственно. Предполагается, что одновременное применение силденафила с мощными индукторами изофермента CYP3A4, такими как рифампицин, может приводить к большому снижению концентрации силденафила в плазме крови. Ингибиторы изофермента цитохрома CYP2C9 (толбутамид, варфарин), изофермента цитохрома CYP2D6 (селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, трициклические антидепрессанты), тиазидные и тиазидоподобные диуретики, ингибиторы АПФ и антагонисты кальция, не оказывают влияния на фармакокинетику силденафила. Азитромицин (500 мг/сут в течение 3 дней) не оказывает влияние на AUC, Cmax, Tmax, константу скорости выведения и T½ силденафила или его основного циркулирующего метаболита. средства Силденафил является слабым ингибитором изоферментов цитохрома Р450 – 1А2, 2С9, 2С19, 2D6, 2Е1 и 3А4 (ИК50 > 150 мкмоль). При приеме силденафила в рекомендуемых дозах его Cmax составляет около 1 мкмоль, поэтому маловероятно, что силденафил может повлиять на клиренс субстратов этих изоферментов. Силденафил усиливает гипотензивное действие нитратов как при длительном применении последних, так и при их назначении по острым показаниям. В связи с этим, применение силденафила в сочетании с нитратами или донаторами оксида азота противопоказано. При одновременном приеме #-адреноблокатора доксазозина (4 мг и 8 мг) и силденафила (50 мг и 100 мг) у пациентов с доброкачественной гиперплазией предстательной железы со стабильной гемодинамикой среднее дополнительное снижение систолического/диастолического АД в положении лежа на спине составляло 9/5 мм рт. ст. и 8/4 мм рт. ст., соответственно, а в положении стоя – 11/4 мм рт. ст. и 4/5 мм рт. ст., соответственно.

Сообщается о редких случаях развития у таких пациентов симптоматической постуральной гипотензии, проявлявшейся в виде головокружений (без обморока). У отдельных чув-ствительных пациентов, получающих #-адрено-блокаторы, одновременное применение силденафила может привести к симптоматической гипотензии. Признаков значительного взаимодействия с толбутамидом (250 мг) или варфарином (40 мг), которые метаболизируются изоферментом цитохрома CYP2C9, не выявлено. Силденафил (100 мг) не оказывает влияния на фармакокинетику ингибиторов ВИЧ-протеазы, саквинавира и ритонавира, являющихся субстратами изофермента цитохрома CYP3A4, при их постоянном уровне в крови. Одновременное применение силденафила в равновесном состоянии (80 мг три раза в сутки) приводит к повышению AUC и Cmax бозентана (125 мг два раза в сутки) на 49,8 % и 42 %, соответственно. Силденафил (50 мг) не вызывает дополнительного увеличения времени кровотечения при приеме ацетилсалициловой кислоты (150 мг). Силденафил (50 мг) не усиливает гипотензивное действие алкоголя у здоровых добровольцев при максимальной концентрации алкоголя в крови в среднем 0,08 % (80 мг/дл). У пациентов с артериальной гипертонией признаков взаимодействия силденафила (100 мг) с амлодипином не выявлено. Среднее дополнительное снижение АД в положении лежа составляет 8 мм рт. ст. (систолического) и 7 мм рт. ст. (диастолического). Применение силденафила в сочетании с антигипертензивными средствами не приводит к возникновению дополнительных побочных эффектов.

Особые указания

Для диагностики нарушений эрекции, определения их возможных причин и выбора адекватного лечения необходимо собрать полный медицинский анамнез и провести тщательное физикальное обследование. Средства лечения эректильной дисфункции должны использоваться с осторожностью у пациентов с анатомической деформацией полового члена (ангуляция, кавернозный фиброз, болезнь Пейрони), или у пациентов с факторами риска развития приапизма (серповидноклеточная анемия, множественная миелома, лейкоз, тромбоцитемия). Во время постмаркетинговых исследований сообщалось о случаях развития длительной эрекции и приапизма. В случае сохранения эрекции в течение более 4 часов следует немедленно обратиться за медицинской помощью. Если терапия приапизма не была проведена немедленно, это может привести к повреждению тканей полового члена и необратимой утрате потенции. Препараты, предназначенные для лечения нарушений эрекции, не следует назначать мужчинам, для которых сексуальная активность нежелательна. Сексуальная активность представляет определенный риск при наличии заболеваний сердца, поэтому перед началом любой терапии по поводу нарушений эрекции врачу следует направить пациента на обследование состояния сердечно-сосудистой системы.

Сексуальная активность нежелательна у пациентов с сердечной недостаточностью, нестабильной стенокардией, перенесенными в последние 6 месяцев инсультом или инфарктом миокарда, жизнеугрожающими аритмиями, артериальной гипертензией (АД > 170/100 мм рт. ст.) или гипотонией (АД Сердечно-сосудистые осложнения В ходе постмаркетингового применения силде-нафила для лечения эректильной дисфункции сообщалось о таких нежелательных явлениях, как серьезные сердечно-сосудистые осложнения (в т.ч. инфаркт миокарда, нестабильная стенокардия, внегеморрагический инсульт, транзиторная ишемическая атака, гипертензия и гипотензия), которые имели временную связь с применением силденафила. Большинство этих пациентов, но не все из них, имели факторы риска сердечно-сосудистых осложнений. Многие из указанных нежелательных явлений наблюдались вскоре после сексуальной активности, и некоторые из них отмечались после приема силденафила без последующей сексуальной активности. Не представляется возможным установить наличие прямой связи между отмечавшимися нежелательными явлениями и указанными или иными факторами. Гипотензия Силденафил оказывает системное вазодилатирующее действие, приводящее к преходящему снижению АД, что не является клинически значимым явлением и не приводит к каким-либо последствиям у большинства пациентов. Тем не менее, до назначения силденафила врач должен тщательно оценить риск возможных нежелательных проявлений вазодилатирующего действия у пациентов с соответствующими заболеваниями, особенно на фоне сексуальной активности. Повышенная восприимчивость к вазодилататорам наблюдается у больных с обструкцией выходного тракта левого желудочка (стеноз аорты, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия), а также с редко встречающимся синдромом множественной системной атрофии, проявляющимся тяжелым нарушением регуляции АД со стороны вегетативной нервной системы. Поскольку совместное применение силденафила и #-адреноблокаторов может привести к симптоматической гипотензии у отдельных чувствительных пациентов, силденафил следует с осторожностью назначать больным, принимающим #-адрено-блокаторы. Чтобы свести к минимуму риск развития постуральной гипотензии у пациентов, принимающих #-адреноблокаторы, прием силденафила следует начинать только после достижения стабилизации показателей гемодинамики у этих пациентов. Следует также рассмотреть целесообразность снижения начальной дозы силденафила. Врач должен проинформировать пациентов о том, какие действия следует предпринять в случае появления симптомов постуральной гипотензии. Зрительные нарушения В редких случаях во время пострегистрационного применения всех ингибиторов ФДЭ5, в том числе силденафила, сообщали о неартериитной передней ишемической невропатии зрительного нерва (НПИНЗН) – редком заболевании и причине снижения или потери зрения. У большинства из этих пациентов были факторы риска, в частности снижение

отношения диаметров экскавации и диска зрительного нерва (застойный диск), возраст старше 50 лет, сахарный диабет, гипертензия, ишемическая болезнь сердца, гиперлипидемия и курение. В обсервационном исследовании оценивали, связано ли недавнее применение препаратов класса ингибиторов ФДЭ5 с острым началом НПИНЗН. Результаты указывают на приблизительно 2-кратное повышение риска НПИНЗН в пределах 5 периодов полувыведения после применения ингибитора ФДЭ5. Согласно опубликованным литературным данным, годичная частота возникновения НПИНЗН составляет 2,5 – 11,8 случаев на 100 000 мужчин в возрасте ⩾ 50 лет в общей популяции. Следует рекомендовать пациентам в случае внезапной потери зрения прекратить терапию силденафилом и немедленно проконсультироваться с врачом. Лица, у которых уже был случай НПИНЗН, имеют повышенный риск рецидива НПИНЗН. Поэтому врачу следует обсудить данный риск с такими пациентами, а также обсудить с ними потенциальный шанс неблагоприятного воздействия ингибиторов ФДЭ5. Ингибиторы ФДЭ5, в том числе силденафил, у таких пациентов следует применять с осторожностью и только в ситуациях, когда ожидаемая польза перевешивает риск. У небольшого числа пациентов с наследственным пигментным ретинитом имеются генетически детерминированные нарушения функции фосфодиэстераз сетчатки глаза. Сведения о безопасности применения силденафила у больных с пигментным ретинитом отсутствуют, поэтому препарат следует применять с осторожностью. Нарушение слуха В некоторых постмаркетинговых и клинических исследованиях сообщается о случаях внезапного ухудшения или потери слуха, связанных с применением всех ингибиторов ФДЭ5, включая силденафил. Большинство этих пациентов имели факторы риска внезапного ухудшения или потери слуха. Причинно-следственной связи между применением ингибиторов ФДЭ5 и внезапным ухудшением слуха или потерей слуха не установлено. В случае внезапного ухудшения слуха или потери слуха на фоне приема силденафила следует немедленно проконсультироваться с врачом. Кровотечения Силденафил усиливает антиагрегантный эффект нитропруссида натрия, донатора оксида азота, на тромбоциты человека in vitro. Данные о безопаснос-ти применения силденафила у пациентов со склонностью к кровоточивости или обострением язвенной болезни желудка и 12-перстной кишки отсутствуют, поэтому силденафил у этих пациентов следует применять с осторожностью. Частота носовых кровотечений у пациентов с легочной гипертензией, связанной с диффузными заболеваниями соединительной ткани, была выше (силденафил 12,9 %, плацебо 0 %), чем у пациентов с первичной легочной гипертензией (силденафил 3,0 %, плацебо 2,4 %). У пациентов, получавших силденафил в сочетании с антагонистом витамина К, частота носовых кровотечений была выше (8,8 %), чем у пациентов, не принимавших антагониста витамина К (1,7 %). Применение совместно с другими средствами лечения нарушений эрекции Безопасность и эффективность силденафила совместно с другими ингибиторами

ФДЭ5 или другими препаратами для лечения легочной гипертензии, содержащими силденафил (например, Ревацио®) или другими средствами лечения нарушений эрекции не изучались, поэтому применение подобных комбинаций не рекомендуется. Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами Поскольку при приеме силденафила возможно развитие головокружения, снижение АД, развитие хроматопсии, затуманенного зрения и т.п. побочных явлений, следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. Также следует внимательно относиться к индивидуальному действию препарата в указанных ситуациях, особенно в начале лечения и при изменении режима дозирования.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25С в защищенном от света месте. Хранить в недоступном для детей месте.