Инструкция по применению
Камастил таблетки 100 мг 4 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Индия
Производитель: Хетеро Лабс
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Силденафил
Количество в упаковке: 4
Дозировка действующего вещества: 100 мг



Описание

Двояковыпуклые таблетки ромбовидной формы, покрытые пленочной оболочкой голубого цвета, с гравировкой на одной стороне "I", на другой "58". На поперечном разрезе ядро таблетки белого или почти белого цвета.

Действующее вещество

Силденафил

Состав

В каждой таблетке содержится: Действующее вещество: силденафила цитрат 140,48 мг (в пересчете на силденафил 100,0 мг) Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая 296,00 мг, кальция гидрофосфат безводный 135,52 мг, кроскармеллоза натрия 36,00 мг, магния стеарат 12,00 мг, опадрай II голубой 31K80956 (лактоза моногидрат 40,00%, гипромеллоза HPMC 2910 (E464) 28,00%, титана диоксид (E171) 20,500%, триацетин 8,00%, краситель синий/индиго кармин (E132) 3,500%) 18,60 мг, опадрай прозрачный 02K19253 (гипромеллоза HPMC 2910 (E464) 90,00%, триацетин 10,00%) 3,19 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Фармакокинетика силденафила в рекомендуемом диапазоне доз носит линейный характер. Всасывание После приема внутрь силденафил быстро всасывается. Абсолютная биодоступность в среднем составляет около 40% (от 25% до 63%). In vitro силденафил в концентрации около 17 нг/мл (35 нМ) подавляет активность ФДЭ5 человека на 50%. После однократного приема силденафила в дозе 100 мг средняя максимальная концентрация свободного силденафила в плазме крови (Cmax) мужчин составляет около 18 нг/мл (38 нМ). Cmax при приеме силденафила внутрь натощак достигается в среднем в течение 60 мин (от 30 мин до 120 мин). При приеме в сочетании с жирной пищей скорость всасывания снижается: Cmax уменьшается в среднем на 29% а время достижения максимальной концентрации (Tmax) увеличивается на 60 мин однако степень абсорбции достоверно не изменяется (площадь под фармакокинетической кривой концентрация- время (AUC) снижается на 11%). Распределение Объем распределения силденафила в равновесном состоянии составляет в среднем 105 л. Связь силденафила и его основного циркулирующего N-деметильного метаболита с белками плазмы крови составляет около 96% и не зависит от общей концентрации препарата. Менее 00002% дозы силденафила (в среднем 188 нг) обнаружено в сперме через 90 мин после приема препарата. Метаболизм Силденафил метаболизируется главным образом в печени под действием изофермента цитохрома CYP3A4 (основной путь) и изофермента цитохрома CYP2C9 (минорный путь). Основной циркулирующий активный метаболит образующийся в результате N- деметилирования силденафила подвергается дальнейшему метаболизму. Селективность действия этого метаболита в отношении ФДЭ сопоставима с таковой силденафила а его активность в отношении ФДЭ5 in vitro составляет около 50 % активности силденафила. Концентрация метаболита в плазме крови здоровых добровольцев составляла около 40 % от концентрации силденафила. N-деметильный метаболит подвергается дальнейшему метаболизму, период его полувыведения (T1/2) составляет около 4 часов. Выведение Общий клиренс силденафила составляет 41 л/час а конечный T1/2 - 3-5 часов. После приема внутрь также как после внутривенного введения силденафил выводится в виде метаболитов в основном кишечником (около 80%) и в меньшей степени почками (около 13%). Фармакокинетика у особых групп пациентов Пожилые пациенты У здоровых пожилых пациентов (старше 65 лет) клиренс силденафила снижен а концентрация свободного силденафила в плазме крови примерно на 40% выше чем у молодых (18-45 лет). Возраст не оказывает клинически значимого влияния на частоту развития побочных эффектов. Нарушения функции почек При легкой (клиренс креатинина (КК) 50-80 мл /мин) и умеренной (КК 30-49 мл/мин) степени почечной недостаточности фармакокинетика силденафила после однократного приема внутрь в дозе 50 мг не изменяется. При тяжелой почечной недостаточности (КК (30 мл/мин) клиренс силденафила снижается что приводит к примерно двукратному увеличению значения

AUC (100%) и Cmax (88%) по сравнению с таковыми показателями при нормальной функции почек у пациентов той же возрастной группы. Нарушения функции печени У пациентов с циррозом печени (стадии А и В по классификации Чайлд-Пью) клиренс силденафила снижается что приводит к повышению значения AUC (84%) и Cmax (47%) по сравнению с таковыми показателями при нормальной функции печени у пациентов той же возрастной группы. Фармакокинетика силденафила у больных с тяжелыми нарушениями функции печени (стадия С по классификации Чайлд-Пью) не изучалась.

Показания

Лечение нарушений эрекции характеризующихся неспособностью к достижению или сохранению эрекции полового члена достаточной для удовлетворительного полового акта. Силденафил эффективен только при сексуальной стимуляции.

Способ применения и дозы

Внутрь. Рекомендуемая доза для большинства взрослых пациентов составляет 50 мг примерно за 1 час до сексуальной активности. С учетом эффективности и переносимости доза может быть увеличена до 100 мг или снижена до 25 мг. Максимальная рекомендуемая доза составляет 100 мг. Максимальная рекомендуемая кратность применения - один раз в сутки. Нарушения функции почек При легкой и среднетяжелой степени почечной недостаточности (КК 30-80 мл/мин) корректировка дозы не требуется при тяжелой почечной недостаточности (КК < 30 мл/мин) - дозу силденафила следует снизить до 25 мг. Нарушения функции печени Поскольку выведение силденафила нарушается у пациентов с повреждением печени (в частности при циррозе) дозу препарата Камастил следует снизить до 25 мг. Совместное применение с другими лекарственными средствами При совместном применении с ритонавиром максимальная разовая доза препарата Камастил не должна превышать 25 мг а кратность применения - 1 раз в 48 час (см. раздел "Взаимодействие с другими лекарственными средствами"). При совместном применении с ингибиторами изофермента цитохрома CYP3A4 (эритромицин саквинавир кетоконазол итраконазол) начальная доза препарата Камастил должна составлять 25 мг (см. раздел "Взаимодействие с другими лекарственными средствами"). Чтобы свести к минимуму риск развития постуральной гипотензии у пациентов принимающих #-адреноблокаторы прием препарата Камастил следует начинать только после достижения стабилизации гемодинамики у этих пациентов. Следует также рассмотреть целесообразность снижения начальной дозы силденафила (см. разделы "Особые указания" и "Взаимодействие с другими лекарственными средствами"). Пожилые пациенты Корректировка дозы препарата Камастил не требуется.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к силденафилу или к любому другому компоненту препарата, - одновременный прием донаторов оксида азота органических нитратов или нитритов в любых лекарственных формах других средств лечения нарушений эрекции ритонавира, - пациентам для которых сексуальная активность нежелательна (в т.ч. с тяжелыми сердечно-сосудистыми заболеваниями такими как нестабильная стенокардия тяжелая сердечная недостаточность), - артериальная гипотензия (артериальное давление менее 90/50 мм рт. ст.), - недавно перенесенное нарушение мозгового кровообращения или инфаркт миокарда (в течение последних шести месяцев), - наследственные дегенеративные заболевания сетчатки в том числе пигментный ретинит, - печеночная недостаточность тяжелой степени тяжести, - женский пол, - возраст до 18 лет.

Применение при беременности и кормлении грудью

По зарегистрированному показанию препарат не предназначен для применения у женщин.

Побочные действия

Классификация частоты развития побочных эффектов (ВОЗ): очень часто >1/10 часто от >1/100 до 1/1000 до 1/10000 до <1/1000 очень редко от <1/10000 включая отдельные сообщения. Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль, часто - головокружение, нечасто - сонливость гипестезия, редко - нарушение мозгового кровообращения транзиторная ишемическая атака инсульт обморок, частота неизвестна - судороги в т.ч. рецидивирующие. Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - "приливы", нечасто - повышение артериального давления ощущение сердцебиения тахикардия, редко - повышение или снижение артериального давления инфаркт миокарда фибрилляция предсердий, частота неизвестна - желудочковая аритмия нестабильная стенокардия внезапная смерть. Со стороны органов зрения: часто - нарушение зрения нарушение цветовосприятия, нечасто - поражение конъюнктивы нарушение слезотечения, частота неизвестна - передняя ишемическая оптическая нейропатия окклюзия сосудов сетчатки дефекты полей зрения. Со стороны органов слуха: нечасто - звон в ушах, редко - носовое кровотечение. Со стороны желудочно-кишечного тракта: часто - диспепсия, нечасто - рвота тошнота сухость слизистой оболочки полости рта. Аллергические реакции: нечасто - кожная сыпь, частота неизвестна - синдром Стивенса-Джонсона токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайела). Со стороны половых органов: нечасто - гематоспермия, редко - кровотечение из полового члена, частота неизвестна - приапизм пролонгированная эрекция. Со стороны опорно-двигательного аппарата: нечасто - миалгия. Прочие: редко - боль в груди усталость.

Передозировка

При однократном приеме препарата Камастил в дозе до 800 мг нежелательные явления были сопоставимы с таковыми при приеме препарата в более низких дозах но встречались чаще. Лечение симптоматическое. Гемодиализ не ускоряет клиренс силденафила так как последний активно связывается с белками плазмы 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 день в течение 5 дней) специфическим ингибитором изофермента 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) ингибитора ВИЧ-протеазы и изофермента цитохрома CYP3A4 на фоне достижения постоянной концентрации саквинавира в крови Cmax силденафила повышалась на 140% а AUC увеличивалась 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 P450 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 принимают 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. 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 влияния на AUC Cmax Tmax константу скорости выведения и T1/2 силденафила или его основного циркулирующего метаболита. При одновременном применении с бозентаном (индуктором изоферментов CYP3A4 CYP2C9) отмечалось снижение AUC и Cmax силденафила на 626% и 524% соответственно. Влияние силденафила на другие лекарственные средства Силденафил является слабым ингибитором изоферментов цитохрома P450 - 1A2 2C9 2C19 2D6 2E1 и 3A4 (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 (25 мг 50 мг и 100 мг) у пациентов с доброкачественной гиперплазией простаты со стабильной гемодинамикой среднее дополнительное снижение систолического/диастолического артериального давления в положении лежа на спине составляло 7/7 мм рт. ст. 9/5 мм рт. ст. и 8/4 мм рт. ст. соответственно а в положении стоя - 6/6 мм рт. ст. 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 чувствительных пациентов получающих #-адреноблокаторы 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. 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 008% (80 мг/дл). У больных 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. Силденафил увеличивал AUC и Cmax бозентана на 498% и 42% соответственно.

Особые указания

Для диагностики нарушений эрекции определения их возможных причин и выбора адекватного лечения необходимо собрать полный медицинский анамнез и провести тщательное физикальное обследование. 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 аритмиями артериальной гипертензией (артериальное давление > 170/100 мм рт. ст.) противопоказана у пациентов с нестабильной стенокардией перенесенным в последние 6 месяцев инфарктом миокарда или инсультом артериальной гипотензией (артериальное давление < 90/50 мм рт. ст.) (см. разделы "Противопоказания" "С осторожностью").

Препараты предназначенные для лечения нарушений эрекции не следует назначать мужчинам для которых сексуальная активность нежелательна. Препарат Камастил оказывает системное вазодилатирующее действие приводящее к преходящему снижению артериального давления что не является клинически значимым явлением и не приводит к каким-либо последствиям у большинства пациентов. Тем не менее до назначения препарата Камастил 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 артериального давления со стороны вегетативной нервной системы. Были отмечены редкие случаи развития передней ишемической оптической нейропатии неартериального генеза как причины ухудшения или потери зрения на фоне применения всех ингибиторов ФДЭ5 включая силденафил. Большинство этих пациентов имели факторы риска такие как экскавация (углубление) головки зрительного нерва возраст свыше 50 лет сахарный диабет артериальная гипертензия ишемическая болезнь сердца (ИБС) гиперлипидемия и курение. Причинно-следственной связи между приемом ингибиторов ФДЭ5 и развитием передней ишемической оптической нейропатии неартериального генеза не выявлено. Врач должен информировать пациента о повышении риска развития передней ишемической оптической нейропатии неартериального генеза если ранее это состояние у него уже отмечалось. Поскольку совместное применение силденафила и #-адреноблокаторов может привести к симптоматической гипотензии у отдельных чувствительных пациентов препарат Камастил следует с осторожностью назначать больным принимающим #-адреноблокаторы (см. раздел "Взаимодействие с другими лекарственными средствами"). Чтобы свести к минимуму риск развития гипотензии у пациентов принимающих #-адреноблокаторы прием препарата Камастил следует начинать только после достижения стабилизации гемодинамики у этих пациентов. Следует также рассмотреть целесообразность снижения начальной дозы препарата Камастил (см. раздел "Способ применения и дозы"). Врач должен проинформировать пациентов о том какие действия следует предпринять в случае появления симптомов гипотензии. Силденафил усиливает антиагрегационный эффект нитропруссида натрия (донатора оксида азота) на тромбоциты человека in vitro. Сведения о безопасности применения препарата Камастил у больных с внутренними кровотечениями или активной пептической язвой желудка отсутствуют поэтому его следует применять с осторожностью (см. раздел "С осторожностью"). 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 лейкемия) (см. раздел "С осторожностью"). Безопасность и эффективность препарата Камастил совместно с другими средствами лечения нарушений эрекции не изучались поэтому применение подобных комбинаций не рекомендуется (см. раздел "Противопоказания"). В некоторых постмаркетинговых и клинических исследованиях с использованием всех ингибиторов ФДЭ5 включая силденафил сообщалось о внезапном снижении или потере слуха у пациентов. Однако большинство этих больных имели факторы риска развития данной патологии и не было выявлено никакой корреляции между использованием ингибиторов ФДЭ5 и внезапным снижением или потерей слуха. В случае внезапного снижения или потери слуха следует прекратить терапию силденафилом и немедленно проконсультироваться с врачом. В случае сохранения эрекции более 4 часов следует обратиться за медицинской помощью. Если терапия приапизма не проведена своевременно это может привести к повреждению тканей полового члена и необратимой утрате потенции. Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.: Поскольку при приеме силденафила возможны снижение артериального давления нарушения зрения нарушение цветовосприятия развитие головокружения и иных побочных явлений следует внимательно относиться к индивидуальному действию препарата особенно в начале лечения и при изменении режима дозирования. Следует соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятиях потенциально опасными видами деятельности требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Срок хранения после открытия

3 года. Не использовать по истечении срока годности указанного на упаковке

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.