Инструкция по применению
Левитра ОДТ таб. диспергируемые 10мг №2

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки диспергерируемые
Страна: Германия
Производитель: Байер
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Варденафил
Количество в упаковке: 2
Дозировка действующего вещества: 10 мг
Срок годности: 36.0



Действующее вещество

Варденафил

Состав

1 таб.:варденафила гидрохлорида тригидрат (микронизированный) 11.852 мг,что соответствует содержанию рденафила 10 мг.Вспомогательные вещества: аспартам - 1.8 мг, ароматизатор мяты перечной (акации камедь, мальтодекстрин, ментол, масло листьев мяты перечной, масло листьев мяты полевой) - 2.7 мг, магния стеарат - 4.5 мг, фармабурст (Pharmaburst) (кросповидон, маннитол, кремния диоксид коллоидный, сорбитол) - 159.15 мг.

Форма выпуска

Таблетки диспергерируемые

Фармакокинетика

ВсасываниеСреднее время достижения Cmax после приема препарата натощак варьирует от 45 до 90 мин. При сравнении препарата Левитра ОДТ (10 мг), с таблетками, покрытыми оболочкой (10 мг), отмечалось увеличение среднего значения AUC варденафила с 21 до 29% и снижение Cmax на 8-19%. Прием пищи, содержащий большое количество жира, не оказывал никакого влияния на AUC и время достижения Cmax варденафила, однако при этом отмечалось снижение среднего значения Cmax варденафила на 35%. С учетом этих результатов препарат Левитра ОДТ в форме

таблеток, диспергируемых в полости рта, можно принимать независимо от приема пищи. Если таблетки, диспергируемые в полости рта, запивать водой, то AUC варденафила снижается на 29%, а медианное Tmax уменьшается на 60 мин, в то время как Cmax не изменяется. Поэтому препарат Левитра ОДТ в форме таблеток, диспергируемых в полости рта, следует принимать, не запивая водой. Изучение биоэквивалентности показало, что препарат Левитра ОДТ, в форме таблеток диспергируемых в полости рта (10 мг), не биоэквивалентен препарату Левитра ОДТ в форме таблеток, покрытых оболочкой (10 мг). Поэтому таблетки, диспергируемые в полости рта, не должны использоваться в качестве эквивалента таблеткам, покрытым оболочкой.РаспределениеСредний Vd варденафила в устойчивом состоянии фармакокинетических параметров составляет в среднем 208 л, что демонстрирует его хорошее распределение в тканях. Варденафил и его основной метаболит (M1) хорошо связываются с белками плазмы крови (до 95%), причем это свойство является обратимым и не зависит от общей концентрации препарата.Спустя 90 мин после приема варденафила не более 0.00012% полученной дозы может определяться в сперме здоровых пациентов.МетаболизмВарденафил метаболизируется преимущественно печеночными ферментами с участием изоферментов системы цитохрома P450 (CYP) - CYP3A4, а также CYP3A5 и CYP2C9. В крови содержится глюкуронид в форме конъюгата (глюкуроновая кислота), который является частью M1 метаболита. Концентрация остальной части M1 метаболита (неглюкуроновой) составляет 26% от концентрации активного вещества. Профиль селективности в отношении фосфодиэстеразы у M1 сходен с таковым варденафила; in vitro способность подавлять ФДЭ5 составляет 28% по сравнению с варденафилом, что соответствует 7% эффективности препарата.ВыведениеСредний T1/2 варденафила после приема таблеток, диспергируемых в полости рта, составляет 4-6 ч, а основного метаболита M1 (образуемого путем дезэтилирования пиперазиновой части молекулы) - от 3 до 5 ч. Общий клиренс варденафила составляет 56 л/ч. После приема внутрь варденафил в виде метаболитов выводится преимущественно ЖКТ (91-95% дозы), в меньшей степени - почками (2-6% дозы).Фармакокинетика у особых групп пациентовУ пациентов в возрасте 65 лет и старше при приеме таблеток, диспергируемых в полости рта, отмечалось увеличение AUC с 31 до 39% и Cmax с 16 до 21%, по сравнению с пациентами в возрасте 45 лет и младше. При приеме одной таблетки, диспергируемой в полости рта, в течение 10 дней пациентами в возрасте до 45 лет и в возрасте 65 лет и старше не отмечалось накопления варденафила в плазме.Не выявлено различий в эффективности или безопасности препарата у пожилых и более молодых пациентов.У пациентов с легкой (КК больше 50-80 мл/мин) и умеренной (КК больше 30-50 мл/мин) почечной недостаточностью фармакокинетические показатели варденафила сопоставимы с показателями здоровых мужчин. При тяжелой почечной недостаточности (КК меньше 30 мл/мин) среднее значение показателя AUC

повышается на 21%, а Cmax снижается на 23%. Достоверной корреляции между клиренсом креатинина и концентрацией варденафила в плазме (AUC и Cmax) не отмечается.У пациентов, находящихся на гемодиализе, фармакокинетика варденафила не изучалась.У пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции печени клиренс варденафила снижается пропорционально степени нарушения функции печени. При легкой степени печеночной недостаточности (класс А по шкале Чайлд-Пью) отмечается увеличение показателей AUC и Cmax в 1.2 раза (AUC - на 17%, Cmax - на 22%), а при умеренной (класс В по шкале Чайлд-Пью) - AUC в 2.6 (160%) и Cmax в 2.3 (130%) раза соответственно по сравнению со здоровыми субъектами.Безопасность применения таблеток, диспергируемых в полости рта, не изучалась у пациентов с умеренными нарушениями функции печени (класс В по шкале Чайлд-Пью), поэтому не рекомендуется применение у данной категории пациентов.У пациентов с тяжелой степенью печеночной недостаточности (класс С по шкале Чайлд-Пью) фармакокинетика варденафила не изучалась.

Показания

- эректильная дисфункция (неспособность достигать и сохранять эрекцию, необходимую для совершения полового акта).

Способ применения и дозы

Препарат Левитра ОДТ принимают внутрь, независимо от приема пищи.Таблетку принимают сразу же после ее извлечения из упаковки. Таблетку следует держать на языке до ее полного растворения и затем проглотить, не запивая жидкостью.В начале лечения рекомендуемая доза составляет 10 мг (приблизительно за 25-60 мин до сексуального контакта). Максимальная рекомендованная доза составляет 10 мг 1 раз /сут.Для обеспечения адекватной реакции на лечение необходима сексуальная стимуляция. Препарат Левитра ОДТ показал свою эффективность при приеме за 4-5 ч до полового акта.Коррекция дозы у пациентов пожилого возраста (старше 65 лет) не требуется.У пациентов с незначительным нарушением функции печени (класс А по шкале Чайлд-Пью) изменения режима дозирования не требуется. Применение препарата Левитра ОДТ не рекомендуется у пациентов с умеренными нарушениями функции печени (класс В по шкале Чайлд-Пью).Изменения режима дозирования не требуется у пациентов с легкими (КК больше 50-80 мл/мин), умеренными (КК больше 30-50 мл/мин) и тяжелыми (КК меньше 30 мл/мин) нарушениями функции почек.

Противопоказания

- одновременное применение с нитратами или препаратами, которые являются донаторами оксида азота;- одновременное применение с умеренно активными или мощными ингибиторами CYP3A4, такими как кетоконазол, итраконазол, ритонавир, индинавир, эритромицин и кларитромицин;- детский и подростковый возраст до 18 лет;- повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата.Безопасность препарата Левитра ОДТ не исследовалась и, пока соответствующие данные не получены, его применение не рекомендуется у пациентов со следующими состояниями:- тяжелые нарушения функции печени;- заболевания почек в терминальной стадии, требующие гемодиализа;- артериальная гипотензия (систолическое АД в покое менее 90 мм рт. ст.);- недавно перенесенный инсульт или инфаркт миокарда (в течение последних 6 месяцев);- нестабильная стенокардия;- наследственные дегенеративные заболевания сетчатки, например, пигментный ретинит.С осторожностью следует применять препарат у пациентов с анатомической деформацией полового члена (искривление, кавернозный фиброз, болезнь Пейрони), с заболеваниями, предрасполагающими к приапизму (серповидно-клеточная анемия, множественная миелома, лейкемия). Пациентам со склонностью к кровотечениям и с обострением язвенной болезни, препарат следует назначать только после оценки соотношения польза/риск.

Применение при беременности и кормлении грудью

Препарат не показан для применения у женщин, новорожденных и детей.

Побочные действия

При применении препарата Левитра ОДТ в рекомендуемых дозах сообщалось о следующих побочных реакциях (согласно терминологии, принятой ВОЗ).В зависимости от частоты возникновения были выделены очень частые (≥10%), частые (≥1% и меньше10%), нечастые (≥0.1% и меньше1%) и редкие (≥ 0.01% и меньше0.1%) побочные реакции.Со стороны иммунной системы: нечасто - аллергический отек, ангионевротический отек; редко - аллергическая реакция.Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль; часто - головокружение; нечасто - нарушение чувствительности, сонливость, нарушения сна; редко - обморок, амнезия, судороги.Со стороны органа зрения: нечасто - нарушения зрения, гиперемия конъюнктивы глазного яблока, нарушения цветовосприятия, боль в глазных яблоках и дискомфорт в глазах, фотофобия; редко - повышение внутриглазного давления, конъюнктивит.Со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: нечасто - звон в ушах, вертиго.Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - вазодилатация; нечасто - сердцебиение, тахикардия; редко - стенокардия, инфаркт миокарда, желудочковые

тахиаритмии, гипотензия.Со стороны дыхательной системы: часто - заложенность носа; нечасто - одышка, заложенность околоносовых пазух.Со стороны пищеварительной системы: часто - диспепсия; нечасто - тошнота, боли в животе, сухость во рту, диарея, гастроэзофагиальная рефлюксная болезнь, гастрит, рвота, повышение уровня трансаминаз.Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - эритема, сыпь.Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - боль в спине, повышение уровня КФК, повышенный мышечный тонус и судороги.Со стороны половой системы: нечасто - усиление эрекции; редко - приапизм.Прочие: нечасто - плохое самочувствие; редко - боль в груди.Сообщалось о случаях развития инфаркта миокарда, ассоциированных по времени с приемом варденафила и сексуальной активностью, но не установлено, связано ли это состояние непосредственно с применением варденафила, или с сексуальной активностью, или с сопутствующими заболеваниями, или с комбинацией этих факторов. Имеются редкие сообщения о случаях развития передней ишемической нейропатии зрительного нерва (ПИНЗН), приводящей к нарушению зрения (включая стойкую утрату зрения), связанных по времени с приемом ингибиторов ФДЭ5, в т.ч. и препарата Левитра ОДТ, у пациентов, многие из которых, имеют сопутствующие факторы риска развития этого состояния, такие как: анатомический дефект диска зрительного нерва, возраст старше 50 лет, сахарный диабет, гипертония, ИБС, гиперлипидемия и курение. Не установлено, связано ли развитие ПИНЗН непосредственно с применением ингибиторов ФДЭ5, или с имеющимися у пациента сопутствующими сосудистыми факторами риска и анатомическими дефектами, или с комбинацией этих факторов, или с другими причинами.Сообщается о случаях нарушения зрения, включая временную или стойкую утрату зрения, которые связаны во времени с приемом ингибиторов ФДЭ5, в т.ч. и препарата Левитра ОДТ. Не установлено, связаны ли эти случаи непосредственно с приемом ингибиторов ФДЭ5, или с сопутствующими сосудистыми факторами риска, или с другими причинами.Отмечены немногочисленные случаи внезапной глухоты или потери слуха при использовании препаратов из группы ингибиторов ФДЭ5, в т.ч. и препарата Левитра ОДТ. Не установлено, связаны ли эти случаи непосредственно с приемом препарата Левитра ОДТ, с сопутствующими факторами риска потери слуха, с комбинацией этих факторов или с другими причинами.

Передозировка

Оценка побочных эффектов проводилась при назначении варденафила в дозе до 120 мг/сут.При назначении варденафила в дозе до 80 мг 1 раз/сут и в дозе до 40 мг несколько раз в сутки не наблюдалось развития серьезных побочных реакций. При применении доз варденафила от 80 мг до 120 мг увеличивается риск развития побочных эффектов.При применении варденафила в дозе 40 мг 2 раза/сут отмечались выраженные боли в пояснице без признаков токсического действия на мышечную и нервную системы.В случаях передозировки следует проводить стандартную поддерживающую терапию. Поскольку варденафил в высокой степени связывается с белками плазмы, и лишь незначительное количество препарата выводится почками, эффективность гемодиализа маловероятна.

Взаимодействие с другими препаратами

Варденафил метаболизируется преимущественно с участием печеночных ферментов системы цитохрома P450, а именно изоформы 3A4, а также с некоторым участием изоформ 3A5 и 2C9. Ингибиторы этих ферментов могут снижать клиренс варденафила. Циметидин (400 мг 2 раза/сут): неспецифический ингибитор цитохрома P450 не оказывает влияния на величину показателей AUC и Cmax варденафила (20 мг) при их одновременном применении.Препарат Левитра ОДТ противопоказан при одновременном применении с умеренно активными или мощными ингибиторами CYP3A4, такими как кетоконазол, итраконазол, ритонавир, индинавир, эритромицин и кларитромицин. При сочетанном применении препарата Левитра ОДТ с кетоконазолом, итраконазолом, индинавиром и ритонавиром (потенциальные ингибиторы CYP3A4) можно ожидать значительное повышение концентрации варденафила в плазме.Нитраты, донаторы оксида азота: прием варденафила (10 мг) в период от 24 ч до 1 ч, предшествующий приему нитроглицерина (0.4 мг сублингвально), не вызывает усиления его гипотензивного эффекта при приеме у здоровых субъектов. В дозе 20 мг за 1-4 ч до приема нитратов (0.4 мг сублингвально) варденафил усиливает их гипотензивное действие, но, если варденафил назначается за 24 ч, то усиления гипотензивного действия нитратов не происходит при приеме у здоровых субъектов среднего возраста.Никорандил является активатором калиевых каналов и содержит в своем составе нитрогруппу. Наличие нитрогруппы в составе никорандила обуславливает высокую вероятность его взаимодействия с варденафилом.Однако не имеется достаточной информации о потенциальных гипотензивных эффектах варденафила при одновременном применении с нитратами. В связи с этим данная комбинация противопоказана.Варденафил (20 мг) не изменяет показатели AUC и Cmax глибенкламида (глибурида в дозе 3.5 мг) при их совместном применении. Также показано, что фармакокинетика варденафила не изменяется при

его одновременном применении с глибенкламидом.Фармакокинетические и фармакодинамические взаимодействия (влияние на протромбиновое время и факторы свертывания II, VII, X) не отмечаются при совместном применении варденафила (20 мг) с варфарином (25 мг). Одновременное применение с варфарином не изменяет фармакокинетику варденафила.Не отмечено значимого фармакокинетического взаимодействия между варденафилом (20 мг) и нифедипином (30 мг или 60 мг). Сочетанный прием варденафила и нифедипина не приводит к значимому фармакодинамическому взаимодействию: варденафил вызывает в сравнении с плацебо дополнительное снижение систолического и диастолического АД при измерении в положении лежа на спине в среднем на 5.9 мм рт.ст. и 5.2 мм рт.ст. соответственно.Поскольку известно, что альфа-адреноблокаторы вызывают снижение АД, особенно постуральную гипотензию и обморок, вопрос взаимодействия альфа-адреноблокаторов и варденафила при совместном применении тщательно изучался. Оценка АД и пульса в течение 10 ч после приема варденафила в дозировке 5 мг или 10 мг, назначенного через 4 ч после приема алфузозина, не выявила клинически значимого дополнительного снижения максимального среднего АД по сравнению с плацебо. У одного пациента произошло снижение систолического АД от исходного более чем на 30 мм рт.ст. в положении стоя после приема варденафила в дозе 5 мг. У другого пациента наблюдалось снижение систолического АД от исходного более чем на 30 мм рт.ст. в положении стоя после приема варденафила в дозе 10 мг. Случаев снижения систолического АД в положении стоя ниже 85 мм рт.ст. в этом случае выявлено не было. Сообщалось о наличии головокружения у двух пациентов после приема варденафила в дозе 5 мг, у одного пациента - приема 10 мг варденафила, и у одного - после приема плацебо. Так как для выявления максимальных потенциальных взаимодействий был выбран 4-часовой интервал между приемами доз варденафила и алфузозина, соблюдение интервала времени между приемом препаратов не требуется. Случаев обмороков в этом случае и при одновременном применении варденафила с тамсулозином или теразозином выявлено не было.Сочетанное назначение варденафила и альфа-адреноблокаторов допустимо только при наличии стабильных показателей АД на фоне приема альфа-адреноблокаторов, при этом варденафил нужно назначать с минимальной рекомендованной дозы, составляющей 5 мг. Однако препарат Левитра ОДТ в форме таблеток, диспергируемых в полости рта, не должен назначаться в качестве начальной дозы при одновременной терапии с альфа-адреноблокаторами. Не следует принимать варденафил в одно и то же время с альфа-адреноблокаторами, за исключением тамсулозина и алфузозина, прием которых может совпадать по времени с приемом препарата Левитра ОДТ. Между приемом варденафила и других альфа-адреноблокаторов следует соблюдать временной интервал. При одновременном назначении теразозина и варденафила необходимо соблюдать 6-часовой интервал между приемом препаратов.

Одновременное применение дигоксина (0.375 мг) и варденафила (20 мг) через день в течение более 14 дней не сопровождается их взаимодействием.Однократный прием антацида (магния гидроксид/алюминия гидроксид) не влияет на показатели AUC и Cmax варденафила.Биодоступность варденафила (20 мг) также не нарушается при его сочетании с блокатором гистаминовых H2-рецепторов ранитидином (150 мг 2 раза /сут).Варденафил (10 мг и 20 мг) не влияет на длительность кровотечения, когда применяется в качестве монотерапии и в комбинации с ацетилсалициловой кислотой в низкой дозе (2 таб. по 81 мг).Варденафил (20 мг) не потенцирует гипотензивный эффект этанола (0.5 г/кг массы тела), фармакокинетика варденафила не нарушается. Ацетилсалициловая кислота, ингибиторы АПФ, бета-адреноблокаторы, диуретики и противодиабетические препараты (препараты сульфонилмочевины и метформин), слабые ингибиторы CYP3A4 не влияют на фармакокинетику варденафила.

Особые указания

До назначения препаратов, применяемых для лечения эректильной дисфункции, врач должен оценить состояние сердечно-сосудистой системы, поскольку существует риск развития осложнений со стороны сердца во время сексуальной активности. Варденафил обладает сосудорасширяющими свойствами, что может сопровождаться незначительным или умеренным снижением АД. Пациенты с обструкцией путей оттока из левого желудочка, например, с аортальным стенозом, идиопатическим гипертрофическим субаортальным стенозом, могут быть чувствительными к действию вазодилататоров, включая ингибиторы ФДЭ5.У мужчин, которым не показана сексуальная активность вследствие сопутствующего сердечно-сосудистого заболевания, препараты для лечения эректильной дисфункции не должны применяться.При использовании препарата Левитра ОДТ в терапевтических (10 мг) или сверхтерапевтических (80 мг) дозах отмечается удлинение интервала QT. Одновременное применение варденафила с другими препаратами, оказывающими подобное влияние на интервал QT, приводило к суммации эффектов на продолжительность интервала QT в сравнении с приемом каждого из этих препаратов по отдельности. Это должно учитываться при одновременном назначении препарата Левитра ОДТ пациентам с удлинением интервала QT в анамнезе или пациентам, которые принимают препараты, удлиняющие интервал QT. В связи с этим назначения препарата Левитра ОДТ следует избегать у пациентов с врожденным удлинением интервала QT и у пациентов, принимающих антиаритмические препараты класса I A (хинидин, прокаинамид) или класса III (амиодарон, соталол).Безопасность и эффективность варденафила в комбинации с другими методами лечения эректильной дисфункции не изучалась, поэтому их совместное применение не рекомендуется. Безопасность применения таблеток, диспергируемых в полости рта (10 мг), не

изучалась у пациентов с умеренными нарушениями функции печени (класс В по шкале Чайлд-Пью), поэтому не рекомендуется применение у данной категории пациентов.На фоне приема препарата Левитра ОДТ и других ингибиторов ФДЭ5 были зарегистрированы случаи преходящей потери зрения и неартериитной ишемической нейропатии зрительного нерва. При наступлении внезапной потери зрения необходимо прекратить прием препарата Левитра ОДТ и срочно проконсультироваться с лечащим врачом.Сочетанная терапия альфа-адреноблокаторами и варденафилом может сопровождаться развитием артериальной гипотензии с соответствующей клинической картиной, поскольку эти препараты обладают вазодилатирующим эффектом. Сочетанное назначение варденафила и альфа-адреноблокаторов допустимо только при наличии стабильных показателей АД на фоне приема альфа-адреноблокаторов, при этом варденафил нужно назначать в минимальной рекомендованной дозе, составляющей 5 мг. Пациентам, получающим лечение альфа-адреноблокаторами, не следует применять в качестве начальной дозы препарат Левитра ОДТ в виде таблеток, диспергируемых в полости рта (10 мг). Не следует принимать варденафил в одно и тоже время с альфа-адреноблокаторами, за исключением тамсулозина или алфузозина, прием которых может совпадать по времени с приемом варденафила. Между приемом варденафила и других альфа-адреноблокаторов следует соблюдать временной интервал. В случае приема подобранной дозы варденафила терапию альфа-адреноблокаторами следует начинать с минимальной дозы. Постепенное увеличение дозы альфа-адреноблокаторов больным, получающим препараты из группы ингибиторов ФДЭ5, может вести к дальнейшему снижению АД.Таблетки, диспергируемые в полости рта, содержат 1.8 мг аспартама, источник фенилаланина, что следует учитывать при наличии у пациента фенилкетонурии.Таблетки, диспергируемые в полости рта, содержат 7.96 мг сорбитола. Пациенты с редкими наследственными заболеваниями непереносимости фруктозы не должны принимать данный препарат.Дополнительные данные по безопасностиНе установлено токсического (включая репродуктивную токсичность), генотоксического и канцерогенного действия варденафила.Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмамиПеред тем, как управлять транспортными средствами и механизмами, пациенты должны знать, как они реагируют на прием препарата Левитра ОДТ.

Условия хранения

Беречь от детей