Инструкция по применению
Виагра Таблетки покрытые пленочной оболочкой 100 мг 12 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Франция
Производитель: Пфайзер
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Силденафил
Количество в упаковке: 12
Дозировка действующего вещества: 100 мг





Действующее вещество

Силденафил

Состав

1 таб. силденафил (в форме цитрата) 100 мг целлюлоза микрокристаллическая, кальция гидрофосфат, кроскармеллоза натрия, магния стеарат. Opadry голубой OY-LS-20921 (гипромеллоза, лактоза, триацетин, титана диоксид (E171), алюминиевый лак на основе индигокармина (E132)) и Opadry прозрачный YS-2-19114-A (гипромеллоза, триацетин).

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Реализация физиологического механизма эрекции связана с высвобождением оксида азота (NO) в кавернозных телах во время сексуальной стимуляции. Это, в свою очередь, приводит к увеличению уровня цГМФ, последующему расслаблению гладкомышечной ткани кавернозных тел и увеличению притока крови. Силденафил не оказывает прямого расслабляющего действия на изолированное кавернозное тело человека, но усиливает эффект оксида азота (NO) посредством ингибирования ФДЭ-5, которая ответственна за распад цГМФ. Силденафил селективен в отношении ФДЭ-5 in vitro, его активность в отношении ФДЭ-5 превосходит активность в отношении других

известных изоферментов фосфодиэстеразы: ФДЭ-6 — в 10 раз; ФДЭ-1 — более чем в 80 раз; ФДЭ-2, ФДЭ-4, ФДЭ-7–ФДЭ-11 — более чем в 700 раз. Силденафил в 4000 раз более селективен в отношении ФДЭ-5 по сравнению с ФДЭ-3, что имеет важнейшее значение, поскольку ФДЭ-3 является одним из ключевых ферментов регуляции сократимости миокарда. Обязательным условием эффективности силденафила является сексуальная стимуляция. Клинические данные Кардиологические исследования Применение силденафила в дозах до 100 мг не приводило к клинически значимым изменениям ЭКГ у здоровых добровольцев. Максимальное снижение сАД в положении лежа после приема силденафила в дозе 100 мг составило 8,3 мм рт. ст., а дАД — 5,3 мм рт. ст. Более выраженный, но также преходящий эффект на АД отмечался у пациентов, принимавших нитраты (см. разделы «Противопоказания» и «Взаимодействие»). В исследовании гемодинамического эффекта силденафила в однократной дозе 100 мг у 14 пациентов с тяжелой ИБС (более чем у 70% пациентов был стеноз, по крайней мере одной коронарной артерии), сАД и дАД в состоянии покоя уменьшалось на 7 и 6% соответственно, а легочное систолическое давление снижалось на 9%. Силденафил не влиял на сердечный выброс и не нарушал кровоток в стенозированных коронарных артериях, а также приводил к увеличению (примерно на 13%) аденозининдуцированного коронарного потока как в стенозированных, так и в интактных коронарных артериях. В двойном слепом плацебо-контролируемом исследовании 144 пациента с эректильной дисфункцией и стабильной стенокардией, принимающих антиангинальные препараты (кроме нитратов) выполняли физические упражнения до того момента, когда выраженность симптомов стенокардии уменьшилась. Продолжительность выполнения упражнений была достоверно больше (19,9 с; 0,9–38,9 с) у пациентов, принимавших силденафил в однократной дозе 100 мг по сравнению с пациентами, получавшими плацебо. В рандомизированном двойном слепом плацебо-контролируемом исследовании изучали эффект переменой дозы силденафила (до 100 мг) у мужчин (n = 568) с эректильной дисфункцией и артериальной гипертензией, принимающих более двух антигипертензивных препаратов. Силденафил улучшил эрекцию у 71% мужчин по сравнению с 18% в группе плацебо. Частота неблагоприятных эффектов была сравнима с таковой в других группах пациентов, так же как у лиц, принимающих более трех антигипертензивных препаратов. Исследования зрительных нарушений У некоторых пациентов через 1 ч после приема силденафила в дозе 100 мг с помощью теста Фарнсуорта-Мунселя 100 выявлено легкое и преходящее нарушение способности различать оттенки цвета (синего/зеленого). Через 2 ч после приема препарата эти изменения отсутствовали. Считается, что нарушение цветового зрения вызывается ингибированием ФДЭ-6, которая участвует в процессе передачи света в сетчатке глаза. Силденафил не оказывал влияния на остроту зрения, восприятие контрастности,

электроретинограмму, внутриглазное давление или диаметр зрачка. В плацебо-контролируемом перекрестном исследовании пациентов с доказанной ранневозрастной макулярной дегенерацией (n = 9) силденафил в однократной дозе 100 мг переносился хорошо. Не было выявлено никаких клинически значимых изменений зрения, оцениваемых по специальным визуальным тестам (острота зрения, решетка Амслера, цветовое восприятие, моделирование прохождения цвета, периметр Хамфри и фотостресс). Эффективность Эффективность и безопасность силденафила оценивали в 21 рандомизированном двойном слепом плацебо-контролируемом исследовании, продолжительностью до 6 мес, у 3000 пациентов в возрасте от 19 до 87 лет с эректильной дисфункцией различной этиологии (органической, психогенной или смешанной). Эффективность препарата оценивали глобально с использованием дневника эрекций, международного индекса эректильной функции (валидированный опросник о состоянии сексуальный функции) и опроса партнера. Эффективность силденафила, определенная как способность достигать и поддерживать эрекцию, достаточную для удовлетворительного полового акта, была продемонстрирована во всех проведенных исследованиях и была подтверждена в долгосрочных исследованиях продолжительностью 1 год. В исследованиях с применением фиксированной дозы соотношение пациентов, сообщивших, что терапия улучшила их эрекцию, составляло 62% (доза силденафила — 25 мг), 74% (доза силденафила — 50 мг) и 82% (доза силденафила — 100 мг) по сравнению с 25% в группе плацебо. Анализ международного индекса эректильной функции показал, что дополнительно к улучшению эрекции лечение силденафилом также повышало качество оргазма, позволяло достичь удовлетворения от полового акта и общего удовлетворения. Согласно обобщенным данным, среди пациентов, сообщивших об улучшении эрекции при лечении силденафилом были 59% больных диабетом, 43% пациентов, перенесших радикальную простатэктомию, и 83% пациентов с повреждениями спинного мозга (против 16, 15 и 12 % в группе плацебо соответственно). 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 1,7 нг/мл (3,5 нМ) подавляет активность фосфодиэстеразы 5-го типа (ФДЭ-5) человека на 50%. После однократного приема силденафила в дозе 100 мг средняя Cmax свободного силденафила в плазме крови мужчин составляет около 18 нг/мл (38 нМ). Cmax при приеме силденафила внутрь натощак достигается в среднем в течение 60 мин (от 30 до 120 мин). При приеме в сочетании с жирной пищей скорость всасывания снижается: Cmax уменьшается в среднем на 29%, а Tmax увеличивается на 60 мин, однако степень абсорбции достоверно не изменяется (AUC снижается на 11%). Распределение. VSS силденафила

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 0,0002% 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 ФДЭ-5 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; T1/2 составляет около 4 ч. Выведение. Общий клиренс силденафила составляет 41 л/ч, а конечный T1 /2 — 3–5 ч. После приема внутрь, также как после в/в введения силденафил выводится в виде метаболитов в основном кишечником (около 80% пероральной дозы) и в меньшей степени — почками (около 13% пероральной дозы).

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, примерно за 1 ч до сексуальной активности. Рекомендуемая доза для большинства взрослых пациентов составляет 50 мг. 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 — 1 раз в сутки. Нарушения функции почек. При легкой и среднетяжелой степени почечной недостаточности (Cl креатинина 30–80 мл /мин) корректировка дозы не требуется, при тяжелой почечной недостаточности (Cl креатинина <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 Виагра® следует снизить до 25 мг.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к силденафилу или любому другому компоненту препарата; применение у пациентов, получающих постоянно или с перерывами донаторы оксида азота, органические нитраты или нитриты в любых формах, поскольку силденафил усиливает гипотензивное действие нитратов (см. раздел «Взаимодействие»); совместное применение с другими средствами для лечения нарушений эрекции (безопасность и эффективность препарата Виагра® при совместном применении не изучались, см. раздел «Особые указания»), поэтому применение подобных комбинаций не рекомендуется; не предназначен для применения по зарегистрированному показанию у детей до 18 лет; не предназначен для применения по зарегистрированному показанию у женщин.

Применение при беременности и кормлении грудью

По зарегистрированному показанию препарат не предназначен для применения у женщин.

Побочные действия

Нарушения общего состояния: реакции повышенной чувствительности (в т.ч. кожная сыпь). Изменения со стороны ЦНС и периферической нервной системы: судороги. Изменения со стороны ССС: тахикардия, снижение АД, обмороки, носовое кровотечение. Желудочно-кишечные нарушения: рвота. Изменения со стороны органа зрения: боль в глазах, покраснение глаз/инъекции склер. Нарушения со стороны репродуктивной системы: длительная эрекция и/или приапизм.

Передозировка

Симптомы: при однократном приеме препарата Виагра® 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, т.к. последний активно связывается с белками плазмы и не выводится почками.

Взаимодействие с другими препаратами

При совместном применении с ритонавиром максимальная разовая доза препарата Виагра® не должна превышать 25 мг, а кратность применения — 1 раз в 48 ч (см. раздел «Взаимодействие»). При совместном применении с ингибиторами изофермента цитохрома CYP3A4 (эритромицин, саквинавир, кетоконазол, итраконазол) начальная доза препарата Виагра® должна составлять 25 мг (см. раздел «Взаимодействие»). Чтобы свести к минимуму риск развития постуральной гипотензии у пациентов, принимающих α-адреноблокаторы, прием препарата Виагра® следует начинать только после достижения стабилизации гемодинамики у этих пациентов. Следует также рассмотреть целесообразность снижения начальной дозы силденафила (см. разделы «Особые указания» и «Взаимодействие»). Пожилые пациенты. Корректировка дозы препарата Виагра® не требуется.

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 ССС. Сексуальная активность нежелательна у пациентов с сердечной недостаточностью, нестабильной стенокардией, перенесенным в последние 6 мес инфарктом миокарда или инсультом, жизнеугрожающими аритмиями, артериальной гипертензией (АД >170/100 мм рт. ст.) или гипотензией (АД <90/50 мм рт. ст.) (см. раздел «Противопоказания», подраздел «С осторожностью»). В клинических исследованиях показано отсутствие различий в частоте развития инфаркта миокарда (1,1 на 100 человек в год) или частоте смертности от сердечно-сосудистых заболеваний (0,3 на 100 человек в год) у пациентов, получавших препарат Виагра®, по сравнению с пациентами, получавшими плацебо. Препараты, предназначенные для лечения нарушений эрекции, не следует назначать мужчинам, для которых сексуальная активность нежелательна. Препарат Виагра® 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 препарата Виагра® 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. Были отмечены редкие случаи развития передней ишемической оптической нейропатии неартериального генеза как причины ухудшения или потери зрения на фоне применения всех ингибиторов ФДЭ-5, включая силденафил. Большинство этих пациентов имели факторы риска, такие как экскавация (углубление) головки зрительного нерва, возраст свыше 50 лет, сахарный диабет, артериальная гипертензия, ИБС, гиперлипидемия и курение. Причинно-следственной связи между приемом ингибиторов ФДЭ-5 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 α-адреноблокаторов может привести к симптоматической гипотензии у отдельных чувствительных пациентов, препарат Виагра® следует с осторожностью назначать больным, принимающим α-адреноблокаторы (см. раздел «Взаимодействие»). Чтобы свести к минимуму риск развития постуральной гипотензии у пациентов, принимающих α-адреноблокаторы, прием препарата Виагра® следует начинать только после достижения стабилизации гемодинамики у этих пациентов. Следует также рассмотреть целесообразность снижения начальной дозы препарата Виагра® (см. раздел «Способ применения и дозы»). Врач должен проинформировать пациентов о том, какие действия следует предпринять в случае появления симптомов постуральной гипотензии. У небольшого числа пациентов с наследственным пигментным ретинитом имеются генетически детерминированные нарушения функций фосфодиэстераз сетчатки глаза. Сведения о безопасности применения препарата Виагра® у больных с пигментным ретинитом отсутствуют, поэтому силденафил следует применять с осторожностью (см. раздел « Противопоказания», подраздел «С осторожностью»). Силденафил усиливает антиагрегационный эффект нитропруссида натрия (донатора оксида азота) на тромбоциты человека in vitro. Сведения о безопасности применения препарата Виагра® у больных с внутренними кровотечениями или активной пептической язвой желудка отсутствуют, поэтому его следует применять с осторожностью (см. раздел «Противопоказания», подраздел «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 «Противопоказания», подраздел «С осторожностью»). Безопасность и эффективность применения препарата Виагра® совместно с другими средствами для лечения нарушений эрекции не изучалась, поэтому применение подобных комбинаций не рекомендуется (см. «Противопоказания»). В некоторых постмаркетинговых и клинических исследованиях с использованием всех ингибиторов ФДЭ-5, 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 ФДЭ-5 и внезапным снижением или потерей слуха. В случае внезапного снижения или потери слуха следует прекратить терапию силденафилом и немедленно проконсультироваться с врачом. Влияние на способность управлять автомобилем или выполнять работы, требующие повышенной скорости физических и психических реакций. На фоне приема силденафила какого-либо отрицательного влияния на способность управлять автомобилем или другими техническими средствами не наблюдалось. Однако поскольку при приеме силденафила возможно снижение АД, развитие хроматопсии, затуманенного зрения и т.п. побочных явлений, следует внимательно относиться к индивидуальному действию препарата в указанных ситуациях, особенно в начале лечения и при изменении режима дозирования.