Динамико



Код АТХ:

- G04BE03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Силденафил

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой голубого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
силденафила цитрат	35.12 мг,
что соответствует содержанию силденафила	25 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 102.88 мг, кроскармеллоза натрия - 5.25 мг, гипролоза - 4.5 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 0.75 мг, магния стеарат - 1.5 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II 31F58914 белый (гипромеллоза, лактозы моногидрат, титана диоксид (E171), макрогол 4000, натрия цитрат) - 5.955 мг, индигокармин (E132) - 0.045 мг.

1 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
4 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой голубого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
силденафила цитрат	70.24 мг,
что соответствует содержанию силденафила	50 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 205.76 мг, кроскармеллоза натрия - 10.5 мг, гипролоза - 9 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 1.5 мг, магния стеарат - 3 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II 31F58914 белый (гипромеллоза, лактозы моногидрат, титана диоксид (E171),

макрогол 4000, натрия цитрат) - 11.91 мг, индигокармин (E132) - 0.09 мг.

1 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
4 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой голубого цвета, овальные, двояковыпуклые, с риской с обеих сторон.

	1 таб.
силденафила цитрат	140.48 мг,
что соответствует содержанию силденафила	100 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 411.52 мг, кроскармеллоза натрия - 21 мг, гипролоза - 18 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 3 мг, магния стеарат - 6 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II 31F58914 белый (гипромеллоза, лактозы моногидрат, титана диоксид (E171), макрогол 4000, натрия цитрат) - 23.82 мг, индигокармин (E132) - 0.18 мг.

1 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
4 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Препарат для лечения эректильной дисфункции, ингибитор ФДЭ5. Восстанавливает в условиях сексуальной стимуляции нарушенную эректильную функцию путем увеличения кровотока в половом члене.

Физиологический механизм эрекции включает высвобождение оксида азота (NO) в пещеристом теле вследствие полового возбуждения. NO активирует фермент гуанилатциклазу, что приводит к повышению концентрации циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ). В свою очередь, цГМФ вызывает расслабление гладких мышц кровеносных сосудов и, соответственно, приток крови в пещеристое тело полового члена.

Силденафил представляет собой селективный ингибитор цГМФ-специфической ФДЭ5, которая вызывает распад цГМФ в пещеристом теле полового члена. Он не оказывает прямое расслабляющее действие на гладкие мышцы пещеристого тела, но усиливает расслабляющий эффект оксида азота на эту ткань и увеличивает кровоток в половом члене. При активации цепи NO-цГМФ, наблюдающейся при сексуальной стимуляции, угнетение ФДЭ5 приводит к увеличению цГМФ в пещеристом теле. Фармакологический эффект достигается только при наличии сексуальной стимуляции.

Активность силденафила в отношении ФДЭ5 превосходит активность в отношении других известных изоферментов фосфодиэстеразы: ФДЭ6 - в 10 раз; ФДЭ1 - более чем в 80 раз; ФДЭ2 - ФДЭ4, ФДЭ7-ФДЭ11 - более чем в 700 раз. Силденафил в 4000 раз более селективен в отношении ФДЭ5, по сравнению с ФДЭ3, что имеет большое значение, поскольку ФДЭ3 является одним из ключевых ферментов регуляции сократимости миокарда.

Силденафил обладает легким и кратковременным гипотензивным действием, в большинстве случаев не имеющим клинического проявления при приеме в рекомендованных дозах. Гипотензивное действие связано с вазодилатирующим эффектом силденафила из-за повышения содержания цГМФ в гладкомышечной оболочке сосудов.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь быстро всасывается. C_{max} в плазме крови при приеме натощак достигается в течение 0.5-2 ч, биодоступность составляет в среднем 41% (25-63%). При приеме с пищей C_{max} снижается на 20-40% и достигается через 1.5-3 ч.

Распределение

Кажущийся V_d в равновесном состоянии составляет 105 л. Связывание силденафила и его основного активного метаболита с белками плазмы крови составляет 96% от введенной дозы и не является дозозависимым.

Метаболизм

Силденафил метаболизируется, главным образом, под действием изоферментов CYP3A4 (основной путь) и CYP2C9 (дополнительный путь) микросомальных изоферментов печени. Основным циркулирующим активным метаболитом является N-деметилметаболит, активность которого в отношении фосфодиэстеразы составляет 50% активности силденафила, а его концентрация в плазме достигает 40% концентрации силденафила. N-деметилметаболит подвергается дальнейшему метаболизму с $T_{1/2}$ 4 ч.

Выведение

Общий клиренс силденафила равен 41 л/ч. $T_{1/2}$ силденафила составляет 3-5 ч. Неактивные метаболиты выводятся кишечником (80%) и почками (13%).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов старше 65 лет C_{max} силденафила и его активного метаболита увеличена приблизительно на 90% по сравнению с пациентами 18-45 лет из-за сниженного клиренса силденафила. Концентрация силденафила в плазме крови, не связанного с белками, составляет 40%.

У пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести (КК 30-80 мл/мин) фармакокинетика силденафила не изменяется при приеме 50 мг, а C_{max} и AUC для N-деметилметаболита увеличена на 73% и 126% соответственно. У пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин) C_{max} и AUC увеличены на 88% и 100% соответственно, C_{max} и AUC N-деметилметаболита увеличены на 79% и 200% соответственно.

У пациентов с циррозом печени (классы А и В по шкале Чайлд-Пью) C_{max} и AUC увеличены на 47% и 84% соответственно.

Показания к применению:

— лечение эректильной дисфункции, характеризующейся неспособностью к достижению или сохранению эрекции полового члена, достаточной для удовлетворительного полового акта.

Эффективен только при сексуальной стимуляции.

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— одновременный прием донаторов оксида азота или органических нитратов или нитратов в любых лекарственных формах;

— одновременный прием ритонавира;

— пациентам, для которых сексуальная активность нежелательна, в т.ч. с тяжелыми сердечно-сосудистыми заболеваниями, такими как нестабильная стенокардия, тяжелая сердечная недостаточность, угрожающие жизни аритмии, артериальная гипотензия (АД менее 90/50 мм рт.ст.), артериальная гипертензия (АД более 170/100 мм рт. ст.), недавно перенесенные нарушение мозгового кровообращения или инфаркт миокарда;

— пациентам с потерей зрения на один глаз вследствие передней ишемической оптической нейропатии неартериального генеза (независимо от того, произошло ли это вследствие приема ингибитора ФДЭ5 или нет);

— наследственные дегенеративные заболевания сетчатки, в т.ч. пигментный ретинит (меньшая часть таких пациентов имеет генетическое заболевание ФДЭ сетчатки);

— тяжелая печеночная недостаточность;

— женский пол;

— детский и подростковый возраст до 18 лет.

С *осторожностью* следует применять препарат при синдроме множественной системной атрофии, обструкции выходного тракта левого желудочка (в т.ч. аортальный стеноз, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия), анатомической деформации полового члена, приапизме, множественной миеломе, лейкозе, одновременно с приемом альфа-адреноблокаторов, при непереносимости лактозы, дефиците лактазы, глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Способ применения и дозы:

Препарат назначают внутрь, примерно за 1 ч до планируемой сексуальной активности, по 50 мг 1 раз/сут. С учетом эффективности и переносимости доза может быть увеличена до 100 мг или снижена до 25 мг.

Для **пациентов с почечной недостаточностью легкой или средней степени (КК 30-80 мл/мин)** коррекции дозы не требуется.

Для **пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин)** первая доза составляет 25 мг. При хорошей переносимости доза может быть увеличена до 50 или 100 мг.

Для **пациентов пожилого возраста** первая доза составляет 25 мг. При хорошей переносимости доза может быть увеличена до 50 или 100 мг.

Для **пациентов с легкой или компенсированной печеночной недостаточностью** первая доза составляет 25 мг. При хорошей переносимости доза может быть увеличена до 50 или 100 мг.

Для пациентов, принимающих альфа-адреноблокаторы, первая доза составляет 25 мг. При хорошей переносимости доза может быть увеличена до 50 или 100 мг.

Побочное действие:

Частота развития побочных эффектов классифицирована согласно рекомендациям ВОЗ: очень часто (≥10%), часто (≥1%, но <10%), нечасто (≥0.1%, но <1%), редко (≥0.01%, но <0.1%), очень редко (<0.01%), включая единичные случаи.

Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль; часто - головокружение; нечасто - сонливость, гипестезия; редко - инсульт, обморок; частота неизвестна - транзиторная ишемическая атака, судороги, в т.ч. рецидивирующие.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - приливы; нечасто - ощущение сердцебиения, тахикардия; редко - повышение или снижение АД, инфаркт миокарда, фибрилляция предсердий; частота неизвестна - желудочковая аритмия, нестабильная стенокардия, внезапная смерть.

Со стороны органа зрения: часто - нарушение зрения, нарушение цветовосприятия; нечасто - поражение конъюнктивы, нарушение слезотечения, усиленное восприятие света, нарушение четкости зрения, преходящая хроматопсия; редко - покраснение склер, боль в глазных яблоках; частота неизвестна - передняя ишемическая оптическая невропатия, окклюзия сосудов сетчатки, сужение полей зрения.

Со стороны органа слуха: нечасто - вертиго, шум в ушах; редко - глухота.

Со стороны органов дыхания: часто - заложенность носа; редко - носовое кровотечение.

Со стороны пищеварительной системы: часто - диспепсия; нечасто - рвота, тошнота, сухость слизистой оболочки полости рта.

Аллергические реакции: нечасто - кожная сыпь; частота неизвестна - синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Со стороны половой системы: частота неизвестна - приапизм, пролонгированная эрекция.

Прочие: редко - боль в груди, усталость.

Передозировка:

Симптомы: при однократном приеме препарата в дозе до 800 мг нежелательные реакции (головная боль, приливы, головокружение, диспепсия, заложенность носа, нарушение зрения) были выражены сильнее и встречались чаще, чем при приеме в обычных дозах; дозы до 200 мг увеличивают частоту, но не выраженность нежелательных реакций.

Лечение: проводят симптоматическую терапию. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

У женщин препарат не применяется.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Ингибиторы изоферментов CYP3A4 и CYP2C9 (кетоконазол, эритромицин, цимитидин) снижают метаболизм и увеличивают концентрацию силденафила в крови. В этом случае лечение силденафилом начинают с дозы 25 мг.

При одновременном применении с ритонавиром C_{max} силденафила повышается на 300%, AUC на 1000% и сохраняются на высоком уровне даже спустя сутки после приема силденафила.

Одновременное применение с саквинавиром С

C_{max} силденафила повышается на 140%, AUC на 210%.

Фармакокинетика ритонавира и саквинавира не изменяется при применении силденафила.

Силденафил усиливает антиагрегантный эффект натрия нитропруссида.

Никорандил из-за нитратного компонента при взаимодействии с силденафилом может привести к тяжелой артериальной гипотензии.

Одновременный прием силденафила и органических нитратов и других донаторов оксида азота может привести к летальному исходу из-за взаимного усиления эффектов.

Силденафил усиливает гипотензивные эффекты блокаторов медленных кальциевых каналов, бета-адреноблокаторов, ингибиторов АПФ.

При одновременном применении повышает эффективность гипогликемических средств.

Азитромицин не оказывает влияния на фармакокинетику силденафила.

При одновременном применении силденафила и альфа-адреноблокаторов, в т.ч. доксазозина, особенно в первые 4 ч после приема силденафила, может наблюдаться выраженное понижение АД и ортостатическая гипотензия.

Грейпфрутовый сок может умеренно повышать концентрацию силденафила в крови.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед применением силденафила следует провести тщательное обследование пациента с целью диагностики эректильной дисфункции и определения причин ее возникновения.

Необходимо оценить риск развития серьезных побочных реакций, обусловленных сексуальной активностью, у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями, а также сопутствующим приемом лекарственных препаратов.

Силденафил вызывает мягкое снижение АД. Особенно подвержены гипотензивному эффекту силденафила пациенты с обструкцией левого желудочка или с редким синдромом множественной атрофии. Перед применением силденафила у таких пациентов необходимо исключить риск неблагоприятного влияния низкого АД во время сексуальной активности. Большинство побочных реакций со стороны сердечно-сосудистой системы развиваются непосредственно после полового акта или спустя короткое время после него, в единичных случаях побочные реакции могут развиться до полового акта.

Не рекомендуется одновременное применение нескольких различных лекарственных средств для лечения эректильной дисфункции.

Силденафил следует с осторожностью применять у пациентов с анатомическими деформациями полового члена (ангуляция, кавернозный фиброз или болезнь Пейрони), а также пациентам с заболеваниями, предрасполагающими к приапизму (серповидно-клеточная анемия, миеломная болезнь, лейкоз).

При возникновении дефекта зрения следует немедленно обратиться к врачу.

В дозах более 200 мг не повышается эффективность препарата, однако увеличивается частота и выраженность дозозависимых побочных эффектов.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В случае развития побочных реакций со стороны нервной системы и органов чувств пациентам рекомендуется воздержаться от вождения автомобиля и управления механизмами, а также соблюдать осторожность при занятии видами деятельности, требующими концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Для **пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин)** первая доза составляет 25 мг. При хорошей переносимости доза может быть увеличена до 50 или 100 мг.

При нарушениях функции печени

Для **пациентов с легкой или компенсированной печеночной недостаточностью** первая доза составляет 25 мг. При хорошей переносимости доза может быть увеличена до 50 или 100 мг.

Противопоказано применение при **тяжелой печеночной недостаточности**.

Применение в пожилом возрасте

Для **пациентов пожилого возраста** первая доза составляет 25 мг. При хорошей переносимости доза может быть

увеличена до 50 или 100 мг.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Dinamiko