ЭФФЕКС Силденафил



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:

Форма выпуска, описание и состав

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

	1 таб.
силденафила цитрат	140.5 мг
что соответствует содержанию силденафила	100 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 252.74 мг, кальция гидрофосфат - 82.5 мг, крахмал прежелатинизированный - 55 мг, магния стеарат - 8.26 мг, кроскармеллоза натрия - 5.5 мг, кремния диоксид коллоидный - 5.5 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза - 9.42 мг, макрогол 4000 (полиэтиленгликоль 4000) - 4.7 мг, титана диоксид - 5.66 мг, краситель железа оксид красный - 0.04 мг, краситель железа оксид желтый - 0.18 мг.

15 шт. - упаковки контурные ячейковые (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный ингибитор циклогуанозинмонофосфат (цГМФ)-специфической ФДЭ5. ФДЭ5, ответственная за распад цГМФ, содержится не только в кавернозном теле полового члена, но и в сосудах легких.

Восстанавливает нарушенную эректильную функцию и обеспечивает естественный ответ на сексуальное возбуждение. Силденафил не оказывает прямого расслабляющего влияния на кавернозное тело, но активно усиливает расслабляющий эффект окиси азота на эту ткань. При сексуальном возбуждении локальное высвобождение NO под влиянием силденафила приводит к угнетению ФДЭ5 и повышению уровня цГМФ в кавернозном теле, в результате этого происходит расслабление гладких мышц и усиление кровотока в кавернозном теле.

Являясь ингибитором ФДЭ5, силденафил увеличивает содержание цГМФ в гладкомышечных клетках легочных сосудов и вызывает их расслабление. У пациентов с легочной гипертензией прием силденафила приводит к расширению сосудов легких и, в меньшей степени, других сосудов.

Силденафил селективен в отношении ФДЭ5 in vitro. Его активность в отношении ФДЭ5 превосходит активность в отношении других известных изоферментов ФДЭ: ФДЭ6, участвующей в передаче светового сигнала в сетчатой оболочке глаза - в 10 раз; ФДЭ1 - в 80 раз; ФДЭ2, ФДЭ4, ФДЭ7-ФДЭ11 - более чем в 700 раз. Активность силденафила в отношении ФДЭ5 более чем в 4000 раз превосходит его активность в отношении ФДЭ3, цАМФ-специфической ФДЭ, участвующей в сокращении сердца.

Силденафил может вызывать легкое и преходящее нарушение различения цвета (синего/зеленого). Предполагаемым механизмом нарушения цветного зрения считается угнетение ФДЭ6, которая участвует в процессе передачи света в сетчатке. Исследования in vitro показали, что влияние силденафила на ФДЭ6 в 10 раз уступает его активности в отношении ФДЭ5.

Фармакокинетика

После приема внутрь силденафил быстро всасывается. Абсолютная биодоступность в среднем составляет 40% (25-63%). После однократного приема внутрь в дозе 100 мг C_{max} составляет 18 нг/мл и достигается при приеме натощак в течение 30-120 мин. При приеме силденафила в сочетании с жирной пищей скорость всасывания снижается; T_{max} увеличивается на 60 мин, а C_{max} снижается в среднем на 29%. V_d силденафила в равновесном состоянии составляет в среднем 105 л. Силденафил и его основной циркулирующий N-десметильный метаболит примерно на 96% связываются с белками плазмы. Связывание с белками не зависит от общей концентрации силденафила. Менее 0.0002% дозы (в среднем 188 нг) обнаруживали в сперме через 90 мин после приема силденафила.

Силденафил метаболизируется, главным образом под действием микросомальных изоферментов печени CYP3A4 (основной путь) и CYP2C9.

Основной циркулирующий метаболит, который образуется в результате N-десметилирования силденафила, подвергается дальнейшему метаболизму. По селективности действия на ФДЭ метаболит сопоставим с силденафилом, а его активность в отношении ФДЭ5 in vitro составляет примерно 50% активности самого силденафила. Концентрация метаболита в плазме составляет примерно 40% от таковой силденафила. N-десметилметаболит подвергается дальнейшему метаболизму; его терминальный $T_{1/2}$ равен около 4 ч.

Общий клиренс силденафила из организма равен 41 л/ч, а $T_{1/2}$ в терминальную фазу – 3-5 ч. После приема внутрь силденафил выводится в виде метаболитов в основном с калом (примерно 80% дозы) и в меньшей степени - с мочой (примерно 13% дозы).

У пациентов пожилого возраста (65 лет и старше) клиренс силденафила снижен, а концентрация свободного активного вещества в плазме примерно на 40% превышает его концентрацию у молодых (18-45 лет) пациентов.

При почечной недостаточности легкой (КК 50-80 мл/мин) и средней (КК 30-49 мл/мин) степени тяжести фармакокинетические параметры силденафила после приема внутрь однократно (50 мг) не изменяются. При почечной недостаточности тяжелой степени (КК≤30 мл/мин) клиренс силденафила снижается, что приводит к примерно двукратному увеличению AUC (100%) и C_{max} (88%) по сравнению с таковыми показателями при нормальной функции почек у пациентов той же возрастной группы.

У пациентов с циррозом печени (класс А и В по шкале Чайлд-Пью) клиренс силденафила снижается, что приводит к повышению AUC (84%) и C_{max} (47%) по сравнению с таковыми показателями при нормальной функции печени у пациентов той же возрастной группы.

Показания к применению:

Лечение нарушений эрекции, характеризующихся неспособностью к достижению или сохранению эрекции полового члена, достаточной для удовлетворительного полового акта.

Легочная гипертензия.

Относится к болезням:

- Гипертензия
- Нарушения эрекции

Противопоказания:

Одновременный прием донаторов окиси азота или нитратов в любых формах, повышенная чувствительность к силденафилу.

Способ применения и дозы:

Лечение нарушений эрекции: принимают внутрь примерно за 1 ч до планируемой сексуальной активности. Разовая доза составляет 50 мг. С учетом эффективности и переносимости доза может быть увеличена до 100 мг или снижена до 25 мг. *Максимальная разовая доза* составляет 100 мг. Максимальная частота применения - 1 раз/сут. Для пожилых пациентов в возрасте старше 65 лет и при сопутствующих нарушениях функции почек или печени доза составляет 25 мг.

Легочная гипертензия: внутрь по 20 мг 3 раза/сут с интервалом около 6-8 ч независимо от приема пищи. *Максимальная суточная доза* составляет 60 мг. Пациентам с нарушением функции почек коррекция дозы не требуется, однако при плохой переносимости дозу снижают до 20 мг 2 раза/сут.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: возможны головная боль, приливы, головокружение, бессонница.

Со стороны пищеварительной системы: возможны диспепсия, астения, диарея, боли в животе, тошнота.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгии, миалгии, повышение мышечного тонуса.

Со стороны дыхательной системы: заложенность носа, фарингит, ринит, синусит, инфекции дыхательных путей, нарушение дыхания.

Со стороны органа зрения: изменение зрения (легкое и преходящее; главным образом изменение цвета объектов, а также усиленное восприятие света и нарушение четкости зрения), конъюнктивит.

Прочие: возможны гриппоподобный синдром, развитие инфекционных заболеваний, симптомы вазодилатации, боли в спине, сыпь, инфекции мочевыводящих путей, нарушения функции предстательной железы; в единичных случаях - приапизм.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении ингибиторов CYP3A4 (эритромицина, циметидина) снижается клиренс силденафила, повышается концентрация силденафила в плазме крови.

При одновременном применении индинавира, саквинавира, ритонавира повышается C_{max} в плазме крови и AUC силденафила, что обусловлено ингибированием изофермента CYP3A4 под влиянием индинавира, саквинавира, ритонавира.

Можно ожидать, что более сильные ингибиторы изофермента CYP3A4, такие как кетоконазол или итраконазол, будут повышать концентрацию силденафила в плазме крови

При одновременном применении с нитратами усиливается гипотензивное действие нитратов.

Описан случай развития симптомов рабдомиолиза после однократного приема дозы силденафила у пациента, получающего симвастатин.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом приема силденафила для лечения нарушений эрекции следует провести обследование сердечно-сосудистой системы.

С осторожностью следует применять у пациентов с анатомической деформацией полового члена (например, ангуляция, кавернозный фиброз или болезнь Пейрони) и людей с заболеваниями, которые предрасполагают к развитию приапизма (такими как серповидно-клеточная анемия, множественная миелома или лейкемия).

Не следует применять у пациентов, для которых сексуальная активность нежелательна.

С осторожностью применять у пациентов со склонностью к кровоточивости, при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, при наследственном пигментном ретините.

Силденафил не применяют у пациентов в возрасте до 18 лет.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Силденафил не оказывает влияния на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами.

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