Купид 36



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Тадалафил

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета миндалевидной формы, с гравировкой "20" на одной стороне.

	1 таб.
тадалафил	20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 249 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 66 мг, гипролоза - 3.5 мг, натрия лаурилсульфат - 1 мг, кроскармеллоза натрия - 7 мг, магния стеарат - 3.5 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II 32K520009 желтый - 8 мг (лактозы моногидрат - 36%, гипромеллоза - 26%, титана диоксид - 15.5%, железа оксид желтый - 8.5% , триацетин - 8%, тальк - 6%).

1 шт. - блистеры ПВХ/ПВДХ/Алюминий (1) - пачки картонные.
1 шт. - блистеры ПВХ/ПВДХ/Алюминий (2) - пачки картонные.
1 шт. - блистеры ПВХ/ПВДХ/Алюминий (4) - пачки картонные.
2 шт. - блистеры ПВХ/ПВДХ/Алюминий (1) - пачки картонные.
2 шт. - блистеры ПВХ/ПВДХ/Алюминий (2) - пачки картонные.
2 шт. - блистеры ПВХ/ПВДХ/Алюминий (4) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Средство для лечения нарушений эрекции, является обратимым селективным ингибитором специфической ФДЭ5 цГМФ. Когда сексуальное возбуждение вызывает местное высвобождение оксида азота, ингибирование ФДЭ5 тадалафилом приводит к повышению уровня цГМФ в кавернозном теле полового члена. Следствием этого является релаксация гладких мышц артерий и приток крови к тканям полового члена, что и вызывает эрекцию. Тадалафил неэффективен при отсутствии сексуального стимулирования.

Исследования in vitro показали, что тадалафил является селективным ингибитором ФДЭ5. ФДЭ5 - фермент, обнаруженный в гладких мышцах кавернозного тела, в гладких мышцах сосудов внутренних органов, в скелетных мышцах, тромбоцитах, почках, легких, мозжечке.

Действие тадалафила на ФДЭ5 является более активным, чем на другие фосфодиэстеразы. Тадалафил в 10 000 раз

активнее в отношении ФДЭ5, чем в отношении ФДЭ1, ФДЭ2, ФДЭ4, которые локализуются в сердце, головном мозге, кровеносных сосудах, печени и в других органах. Тадалафил в 10 000 раз активнее блокирует ФДЭ5, чем ФДЭ3 - фермент, который обнаруживается в сердце и кровеносных сосудах. Эта селективность в отношении ФДЭ5, по сравнению с ФДЭ3, имеет важное значение, поскольку ФДЭ3 является ферментом, принимающим участие в сокращении сердечной мышцы. Кроме того, тадалафил приблизительно в 700 раз активнее в отношении ФДЭ5, чем в отношении ФДЭ6, обнаруженной в сетчатке и являющейся ответственной за фотопередачу. Тадалафил также в 10 000 раз активнее в отношении ФДЭ5, по сравнению с его влиянием на ФДЭ7-ФДЭ10.

Действует в течение 36 ч. Эффект проявляется уже через 16 мин после приема внутрь при наличии сексуального возбуждения.

Тадалафил у здоровых лиц не вызывает достоверного изменения систолического и диастолического давления, по сравнению с плацебо в положении лежа (среднее максимальное снижение составляет 1.6/0.8 мм рт.ст. соответственно) и стоя (среднее максимальное снижение составляет 0.2/4.6 мм рт.ст. соответственно). Тадалафил не вызывает достоверного изменения ЧСС.

Тадалафил не вызывает изменений распознавания цвета (голубой/зеленый), что объясняется его низким сродством к ФДЭ6. Кроме того, не отмечается влияния тадалафила на остроту зрения, электроретинограмму, внутриглазное давление и размер зрачка.

Клинически значимого влияния на характеристики спермы у мужчин, принимавших тадалафил в суточных дозах в течение 6 мес, не выявлено.

Фармакокинетика

После приема внутрь тадалафил быстро всасывается. C_{max} достигается в среднем через 2 ч. Скорость и степень всасывания не зависят от приема пищи. Фармакокинетика тадалафила у здоровых лиц линейна в отношении времени и дозы. В диапазоне доз от 2.5 до 20 мг AUC увеличивается пропорционально дозе. C_{ss} в плазме достигаются в течение 5 дней при приеме препарата 1 раз/сут.

Фармакокинетика тадалафила у пациентов с нарушением функции эрекции аналогична фармакокинетике препарата у лиц без нарушения функции эрекции.

V_d составляет около 63 л, что указывает на то, что тадалафил распределяется в тканях организма. В терапевтических концентрациях 94% тадалафила связывается с белками плазмы. У здоровых лиц менее 0.0005% введенной дозы обнаружено в сперме.

Метаболизируется с участием изофермента CYP3A4. Основным циркулирующим метаболитом является метилкатехолглюкуронид, который в 13 000 раз менее активен в отношении ФДЭ5, чем тадалафил, поэтому маловероятно, что этот метаболит является клинически значимым.

У здоровых лиц средний клиренс тадалафила при приеме внутрь составляет 2.5 л/ч, а средний $T_{1/2}$ - 17.5 ч. Тадалафил выводится преимущественно в виде неактивных метаболитов, в основном с калом (около 61%) и в меньшей степени с мочой (около 36%).

У пациентов с почечной недостаточностью легкой (КК от 51 до 80 мл/мин) или средней степени тяжести (КК от 31 до 50 мл/мин) AUC больше, чем у здоровых лиц.

Показания к применению:

Нарушения эрекции.

Противопоказания:

Одновременный прием препаратов, содержащих любые органические нитраты; детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к тадалафилу.

Способ применения и дозы:

Мужчинам среднего возраста рекомендуется принимать в дозе 20 мг как минимум за 16 мин до предполагаемой сексуальной активности независимо от приема пищи. Пациенты могут осуществлять попытку полового акта в любое время в течение 36 ч после приема для того, чтобы установить оптимальное время ответа на прием тадалафила. Максимальная частота приема - 1 раз/сут.

Побочное действие:

Наиболее часто: головная боль, диспепсия.

Возможно: боль в спине, миалгия, заложенность носа, приливы крови к лицу.

Редко: отек век, боль в глазах, гиперемия конъюнктивы, головокружение.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат у женщин не применяется.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Тадалафил в основном метаболизируется с участием фермента CYP3A4. Селективный ингибитор CYP3A4 кетоконазол увеличивает AUC на 107%, а рифампицин снижает ее на 88%.

Несмотря на то, что специфические взаимодействия не изучались, можно предположить, что такие ингибиторы протеаз, как ритонавир и саквинавир, а также ингибиторы CYP3A4, такие как эритромицин и итраконазол, повышают активность тадалафила.

При одновременном приеме антацида (магния гидроксид/алюминия гидроксид) и тадалафила снижается скорость всасывания последнего без изменения его AUC.

Тадалафил усиливает гипотензивное действие нитратов. Это происходит в результате аддитивного действия нитратов и тадалафила на метаболизм оксида азота и цГМФ. Поэтому применение тадалафила у пациентов, получающих нитраты, противопоказано.

Особые указания и меры предосторожности:

С особой осторожностью и только в случае крайней необходимости возможно применение тадалафила у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК≤30 мл/мин) и тяжелой печеночной недостаточностью.

На фоне лечения тадалафилом у пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести (КК от 31 до 50 мл/мин) чаще отмечались боли в спине по сравнению с пациентами с почечной недостаточностью легкой степени тяжести (КК от 51 до 80 мл/мин) или здоровыми добровольцами. У пациентов с КК≤50 мл/мин тадалафил следует применять с осторожностью.

Поэтому лечение эректильной дисфункции, в т.ч. с применением тадалафила, не следует проводить у мужчин с такими заболеваниями сердца, при которых сексуальная активность не рекомендована.

Следует учитывать потенциальный риск развития осложнений при сексуальной активности у пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы: инфаркт миокарда в течение последних 90 дней; нестабильная стенокардия или стенокардия, возникающая во время полового акта; хроническая сердечная недостаточность (II функциональный класс и выше по классификации NYHA), развившаяся в течение последних 6 месяцев; неконтролируемые нарушения сердечного ритма; артериальная гипотензия (АД менее 90/50 мм рт.ст.) или неконтролируемая артериальная гипертензия; инсульт, перенесенный в течение последних 6 месяцев.

С осторожностью следует применять тадалафил у пациентов с предрасположенностью к приапизму (например, при серповидно-клеточной анемии, множественной миеломе или лейкемии) или у пациентов с анатомической деформацией полового члена (например, при ангуляции, кавернозном фиброзе или болезни Пейрони).

Пациент должен быть проинформирован о необходимости немедленного обращения к врачу в случае возникновения эрекции, продолжающейся 4 ч и более. Несвоевременное лечение приапизма приводит к повреждению тканей полового члена, в результате этого может наступить долговременная потеря потенции.

На фоне применения тадалафила о случаях приапизма не сообщалось.

Не рекомендуется применять тадалафила в комбинации с другими видами лечения эректильной дисфункции.

Источник: http://drugs.thead.ru/Kupid_36