

Состав

действующее вещество: udenafil;

1 таблетка, покрытая оболочкой, содержит уденафила 100 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, гидроксипропилцеллюлоза, кремния диоксид коллоидный, тальк, магния стеарат, гипромеллоза, титана диоксид (E 171), желтый закат FCF (E 110).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки, покрытые пленочной оболочкой бледно-оранжевого цвета, овальные, с тиснением 100 для дозирования 100 мг с одной стороны и Z и Y, разделенных чертой, с другой.

Фармакотерапевтическая группа

Средства для лечения эректильной дисфункции. Уденафил. Код АТХ G04B E11.

Фармакодинамика

Уденафил - селективный обратимый ингибитор циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) - специфической фосфодиэстеразы 5-го типа (ФДЭ-5).

Уденафил не оказывает прямого расслабляющего действия на изолированное кавернозное тело, но при сексуальной стимуляции усиливает расслабляющий эффект оксида азота посредством ингибирования ФДЭ-5, ответственной за распад цГМФ в кавернозном теле. Следствием этого является релаксация гладких мышц артерий и приток крови к тканям полового члена, что и вызывает эрекцию. Препарат эффективен при отсутствии сексуального возбуждения.

Уденафил является селективным ингибитором фермента ФДЭ-5. ФДЭ-5 присутствует в гладких мышцах кавернозного тела, в гладких мышцах сосудов внутренних органов, в скелетных мышцах, тромбоцитах, почках, легких и мозжечке. Уденафил в 10000 раз сильнее ингибитор относительно ФДЭ-5, чем относительно ФДЭ-1, ФДЭ-2, ФДЭ-3 и ФДЭ-4, которые локализируются в сердце, головном мозге, кровеносных сосудах, печени и других органах.

Кроме того, уденафил в 700 раз активнее в отношении ФДЭ-5, чем к ФДЭ-6, обнаруженной в сетчатке, ответственной за цветовосприятие. Уденафил не ингибируется ФДЭ-11, что объясняет отсутствие случаев миалгии, боли в пояснице и проявлений тестикулярной токсичности.

Оптимальная продолжительность действия препарата до 24 часов. Эффект проявляется уже через 30 минут после приема препарата при наличии сексуального возбуждения.

Уденафил у здоровых добровольцев не вызывает достоверного изменения систолического и диастолического давления в сравнении с плацебо в положении лежа и стоя (среднее максимальное снижение составляет 1,6/0,8 мм рт.ст. и 0,2/4,6 мм рт.ст. . соответственно). Уденафил не меняет распознавания цветов (голубой/зеленый), что объясняется его низким сродством с ФДЭ-6. Уденафил не влияет на остроту зрения, электроретинограмму, внутриглазное давление и размер зрачка.

Не выявлено клинически значимого влияния препарата на количество и концентрацию спермы, подвижность и морфологию сперматозоидов.

Фармакокинетика

Всасывание. После приема внутрь уденафил быстро всасывается. Время достижения максимальной концентрации в плазме крови (t_{max}) составляет 30-90 минут (в среднем - 60 минут). Период полувыведения ($t_{1/2}$) составляет 12 часов, высокое связывание уденафила с белками плазмы крови (93,9%) продлевает период его эффективности до 24 часов после приема всего одной дозы.

Прием пищи с высоким содержанием жира не влияет на всасывание уденафила. Сопутствующий прием 112 мл алкоголя (в пересчете на 40% этиловый спирт) с пероральным приемом уденафила в дозе 200 мг не влияет на фармакокинетический профиль уденафила.

Метаболизм. Уденафил в основном метаболизируется с участием фермента (CYP) 3A4 цитохрома P450.

Выведение. У здоровых добровольцев общий клиренс уденафила составляет 755 мл/мин. После приема внутрь уденафил выводится в виде метаболитов с калом.

Уденафил не накапливается в организме. При ежедневном приеме здоровыми добровольцами уденафила в дозе 100 мг в сутки в течение 10 дней не было выявлено существенных изменений его фармакокинетики.

Показания

Лечение нарушений эрекции, характеризующихся неспособностью достичь или сохранить эрекцию полового члена, необходимую для успешного полового акта.

Для эффективного действия Зидены нужно сексуальное возбуждение.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к компонентам препарата Зидена; регулярное или периодическое применение нитратов и других донаторов оксида азота неконтролируемая артериальная гипертензия (АД > 170/100 мм рт. ст.);
- артериальная гипотензия (артериальное давление < 90/50 мм рт. ст.);
- неконтролируемая аритмия;
- наследственные дегенеративные заболевания сетчатки (включая пигментный ретинит);
- тяжелая печеночная или почечная недостаточность;
- наличие врожденного синдрома удлинения интервала QT или увеличение интервала QT вследствие приема препаратов;
- нестабильная стенокардия или тяжелая сердечная недостаточность;
- инсульт, инфаркт миокарда или проведения аортокоронарного шунтирования в течение последних 6 месяцев;
- применение сильных ингибиторов цитохрома P450 (ингибитор протеазы ВИЧ индинавир или ритонавир);
- одновременный прием препарата Зидена с другими препаратами для лечения эректильной дисфункции.

Потеря зрения на один глаз вследствие неартериальной ишемической невропатии.

Зидена содержит лактозу, поэтому препарат не следует принимать пациентам с наследственными заболеваниями, как непереносимость галактозы, лактазная недостаточность или нарушение абсорбции глюкозы-галактозы.

Возраст до 18 лет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Ингибиторы изоферментов цитохрома P450 CYP 3A4 (кетоназол, итраконазол, ритонавир, индинавир, циметидин, эритромицин, сок грейпфрута) могут повышать плазменную концентрацию препарата Зидена.

Одновременное применение кетоконазола (в дозе 400 мг) и уденафила (в дозе 100 мг) повышает биодоступность и максимальная концентрация практически в два раза (212%) и в 0,8 раза (85%) соответственно.

Ингибиторы протеазы ВИЧ ритонавир и индинавир значительно повышают системную концентрацию препарата.

Дексаметазон, рифампицин и противосудорожные препараты (карбамазепин, фенитоин и фенобарбитал) ускоряют метаболизм уденафила, поэтому при одновременном применении ожидается снижение концентрации препарата.

Одновременное введение уденафила (30 мг/кг перорально) и нитроглицерина (2,5 мг/кг однократно внутривенно) в экспериментах на крысах не показало влияния на фармакокинетику уденафила, однако одновременное применение нитроглицерина и уденафила не рекомендуется из-за возможного снижения артериального давления путем воздействия уденафила на расширение сосудов.

Уденафил и препараты группы альфа-адреноблокаторов является сосудорасширяющими средствами, поэтому при совместном приеме их следует назначать в минимальных рекомендуемых дозах.

Пациенты с затруднением оттока крови из левого желудочка (аортальный стеноз) могут быть более чувствительными к действию вазодилататоров, включая ингибиторы ФДЭ.

При одновременном употреблении большого количества алкоголя и препарата Зидена, врач должен сообщить что возможно появление таких симптомов, как более частый пульс, снижение артериального давления, головокружение, головная боль и ортостатические явления.

Особенности применения

Для диагностики эректильной дисфункции и оценки потенциальных рисков необходимо провести обследование и тщательно изучить анамнез пациента. Применение препарата Зидена следует ограничить пациентам, которые на основе данных объективной диагностики требуют клинического лечения. Перед началом применения препарата Зидена необходимо тщательно обследовать состояние сердечно-сосудистой системы, поскольку сексуальная активность - это потенциальный риск для пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями. Поэтому лечение эректильной дисфункции, в том числе с применением уденафила, не следует проводить у мужчин с заболеваниями сердца, при которых сексуальная активность не рекомендована. Препарат Зидена нельзя назначать пациентам, которые в течение 6 месяцев перенесших инсульт,

кровоизлияние в мозг или инфаркт миокарда.

Препарат Зидена противопоказан пациентам, ранее получавших или в настоящее время получают любые формы нитратов или других донаторов оксида азота (нитроглицерин, амилнитрит, изосорбит динитрат и др.) Потому что Зидена может усилить их гипотензивное действие. Поэтому перед назначением препарата Зидена следует определить, принимает ли пациент нитраты или другие донаторы оксида азота. Также пациентов необходимо предупредить о запрете применения нитратов или других донаторов оксида азота во время и после лечения Зидена.

С осторожностью следует применять уденафил пациентам со склонностью к приапизма, а также пациентам с анатомической деформацией полового члена, при наличии имплантата полового члена.

В случае возникновения эрекции продолжительностью более 4 часов (независимо от наличия болевых ощущений) пациенты должны немедленно обратиться за медицинской помощью. При отсутствии своевременного лечения приапизм может привести к необратимому повреждению эректильной ткани и нарушением эректильной функции.

Не рекомендуется применять уденафил в комбинации с другими препаратами для лечения эректильной дисфункции.

С осторожностью следует применять уденафил пациентам с диабетической ретинопатией и с активной формой гастроэзофагеальной рефлюксной болезни или грыжи пищеводного отверстия диафрагмы.

При одновременном приеме уденафила и блокаторов кальциевых каналов, альфа-адрено-блокаторов или других гипотензивных средств возможно дополнительное снижение систолического и диастолического артериального давления.

Пациенты с обструкцией пути оттока левого желудочка (например, аортальный стеноз, идиопатический гипертрофическим субаортальным стенозом) статью могут быть особенно чувствительными к действию вазодилататоров.

В случае внезапной потери зрения, слуха или глухоты (что может сопровождаться шумом в ушах и головокружением) следует немедленно обратиться за медицинской помощью.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Перед тем как управлять транспортными средствами, пациенты должны знать, как они реагируют на прием Зидены. Следует учитывать возможность головокружения, ухудшения зрения.

Применение в период беременности или кормления грудью

Препарат не предназначен для применения женщинам.

Способ применения и дозы

Применяют взрослым мужчинам внутрь, независимо от приема пищи. Применяют внутрь одну таблетку 100 мг в день примерно за 30 минут - 12 часов до предполагаемой сексуальной активности. Дозу можно увеличить с осторожностью до 200 мг, после тщательной оценки всех нежелательных явлений, которые возникали после приема 100 мг препарата. Максимальная рекомендованная количество применений - 1 раз в сутки.

Для мужчин пожилого возраста (старше 65 лет) коррекции дозы не требуется.

Мужчинам с легкой формой почечной недостаточности коррекции дозы не требуется.

Пациентам с легкой формой печеночной недостаточности коррекции дозы не требуется (класс А по Чайлд-Пью).

Дети

Не применяют.

Передозировка

Во время исследований применения одной дозы препарата у здоровых добровольцев при применении 400 мг уденафила один раз в сутки не наблюдалось никаких серьезных побочных реакций. При повышении дозы возрастала частота появления нежелательных явлений (головной боли, покраснение лица), но большинство из них имели легкую степень тяжести и проходили без дополнительного лечения. В случае передозировки следует назначить общую симптоматическую терапию. Препарат Зидена имеет высокий показатель связывания с белками плазмы и не выводится с мочой, поэтому после проведения диализа почечный клиренс не повышается.

Побочные реакции

Побочные реакции, указанные в таблице, возникали во время клинических исследований при применении препарата Зидена 100 мг по требованию пациентов перед сексуальной активностью. В общем побочные реакции были преходящими и имели легкий или средней степени тяжести. К наиболее распространенным побочным реакциям относятся: головная боль и покраснение лица.

Класс систем и органов	Побочные реакции по частоте		
	[≥10 %]	[≥1%, <10 %]	[≥0,1 %, <1.0 %]
Общие нарушения		головная боль	боль в грудной клетке, боль в животе, усталость, приливы крови, дискомфорт в грудной клетке
Со стороны нервной системы			головокружение, ригидность затылочных мышц, парестезии
Со стороны сердечно-сосудистой системы	покраснение		
Со стороны органов зрения		покраснение глаз	затуманенное зрение, боль в глазах, хроматопсия
Со стороны дыхательной системы		заложенность носа	одышка, сухость слизистой оболочки носа
Со стороны желудочно-кишечного тракта		диспепсия	тошнота, зубная боль, запор, гастрит, дискомфорт в желудке

Со стороны кожи и подкожных тканей			отек лица или глаз, крапивница, зуд
Метаболические и эндокринные нарушения			расстройства выделительной системы, жажда
Со стороны опорно-двигательного аппарата			периартрит

Перечисленные далее побочные реакции не наблюдались во время до регистрационных исследований препарата, однако были зафиксированы во время дополнительных клинических исследований, поэтому их причинно-следственные связи нельзя исключить: тяжесть в голове, ощущение холода, сонливость, сильное сердцебиение, ортостатическая головокружение, вялость, онемение ушной раковины, дискомфорт глаз, сыпь, эритема, рвота, диарея, одышка при физических упражнениях, кашель, носовые кровотечения, усиления эрекции и гипотензия.

У пациентов, принимавших дозу препарата до 200 мг в сутки, наблюдали увеличение частоты и типов побочных реакций по сравнению с применением дозы 100 мг.

Во время пострегистрационных наблюдения редко отмечали временную появление передней неартериитной ишемической невропатии зрительного нерва (НАИНЗН), хотя при проведении клинических исследований Зидены не было данных об этом и причин снижения зрения, в связи с применением ингибиторов фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ-5), в том числе препарата Зидена. Большинство таких пациентов, но не все, имели сопутствующие анатомические или сосудистые факторы риска НАИНЗН, включая, помимо других: низкое соотношение диаметров экскавации и диска зрительного нерва (застойный диск), возраст 50 лет, сахарный диабет, артериальную гипертензию, ишемическую болезнь сердца, гиперлипидемией и курения.

Невозможно точно установить, связаны ли эти нежелательные явления непосредственно с применением ингибиторов ФДЭ-5, с сопутствующими сосудистыми факторами риска или анатомическими патологиями пациента или с комбинацией этих факторов или другими причинами.

Во время пострегистрационных наблюдений у пациентов, принимавших ингибиторы ФДЭ-5, включая препарат Зидена, не зафиксировано случаев внезапного снижения или потери слуха. При этом сообщалось, что иногда состояние здоровья и другие факторы могут влиять на появление нежелательных явлений со стороны органов слуха. Часто информация о дальнейшем медицинском наблюдении ограничено. Невозможно точно установить, связаны ли эти нежелательные явления непосредственно с применением препарата Зидена, с сопутствующими факторами риска потери слуха или с комбинацией этих факторов или другими причинами.

Результаты постмаркетингового исследования уденафила 100. Во время пострегистрационных исследования для повторной экспертизы в Корее, продолжалось 6 лет, частота побочных реакций без учета причинно-следственной связи составила 2,20%; при этом частота нежелательных явлений, где нельзя исключить связь с применением препарата Зидена, составляла 2,03%.

Зафиксированы побочные реакции включали: приливы крови (1,04%), головная боль (0,76%), головокружение (0,11%), заложенность носа (0,11%), диспепсия, покраснение глаз (0,06%), нарушения зрения, гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь, усиленное сердцебиение (0,03%). Среди всех явлений гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь была непредсказуемой побочной реакцией.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С, для защиты от воздействия влаги и света хранить в оригинальной упаковке. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 1 таблетки, покрытые пленочной оболочкой, в блистере и в пачке из картона.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Донг-А СТ Ко., Лтд.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

2Ф Секция Б, 3Ф, 4ф Секция Б, 200-23, Пексокгонден 1-ро, Собук-гу, Чхонан-си, Чхунчхон-Намдо, Республика Корея.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).