Состав

действующее вещество: sildenafil;

1 таблетка, покрытая оболочкой, содержит силденафила цитрата в пересчете на силденафил 100 мг;

вспомогательные вещества: лактоза моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая повидон 29-32; натрия кроскармеллоза; магния стеарат Opadry Blue 03F20404 (гипромеллоза, титана диоксид (Е 171), макрогол 6000, индигокармина алюминиевый лак).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства:

100 мг: голубые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, овальной формы, с надписью «SL100» с одной стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, применяемые при эректильной дисфункции. Силденафил. Код АТХ G04B E03.

Фармакодинамика

Механизм действия. Силденафил - лекарственное средство для перорального применения, предназначенный для лечения эректильной дисфункции. При сексуальном возбуждении препарат восстанавливает пониженную эректильную функцию путем усиления притока крови к пенису.

Физиологический механизм, что приводит к эрекцию, включая высвобождение оксида азота (NO) в кавернозных телах во время сексуального возбуждения. Освободившееся NO активирует фермент гуанилатциклаза, что стимулирует повышение уровня циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ), что, в свою очередь, вызывает расслабление гладкой мускулатуры кавернозных тел, способствуя притоку крови.

Силденафил является мощным и селективным ингибитором цГМФ-специфической фосфодиэстеразы 5 (ФДЭ-5) в кавернозных телах, где ФДЭ-5 отвечает за распад цГМФ. Влияние силденафила на эрекцию имеет

периферический характер. Силденафил не оказывает непосредственного релаксирующей действия на изолированные кавернозные тела человека, но мощно усиливает расслабляющее действие NO на эту ткань. При активации метаболического пути NO/цГМФ, что происходит при сексуальной стимуляции, ингибирование сильденафилом ФДЭ5 приводит к повышению уровня цГМФ в кавернозных телах. Таким образом, для того, чтобы силденафил вызвал нужен фармакологический эффект, необходимо сексуальное возбуждение.

Влияние на фармакодинамику. Исследования *in vitro* показали, что силденафил является селективным к ФДЭ-5, что активно участвует в процессе эрекции. Влияние силденафила на ФДЭ-5 мощнее, чем на другие известные фосфодиэстеразы. Этот эффект в 10 раз мощнее, чем эффект воздействия на ФДЭ6, участвующий в процессах фотопревращения в сетчатке. При применении максимальных рекомендованных доз селективность силденафила в ФДЭ-5 в 80 раз превышает его селективность к ФДЕ1, в 700 раз выше, чем в ФДЕ2, ФДЭ-3, ФДЕ4, ФДЕ7, ФДЕ8, ФДЕ9, ФДЕ10 и ФДЕ11. В частности, селективность силденафила в ФДЭ-5 в 4000 раз превышает его селективность к ФДЭ-3 - цАМФ-специфической изоформы ФДЭ, участвующий в регуляции сердечной сократимости.

Фармакокинетика

Абсорбция. Силденафил быстро абсорбируется. Максимальная плазменная концентрация (max) достигается в течение 30-120 минут (с медианой 60 минут) после его перорального применения натощак. Средняя биодоступность после перорального применения составляет 41% (с диапазоном значений от 25 до 63%). В рекомендованном диапазоне доз (от 25 до 100 мг) площадь под фармакокинетической кривой «концентрация - время» (AUC) и максимальная концентрация силденафила после его перорального применения повышаются пропорционально дозе.

При применении силденафила во время еды степень абсорбции снижается со средним удлинением времени достижения максимальной концентрации (Tmax) до 60 минут и средним снижением Cmax на 29%.

Распределение. Средний равновесный объем распределения (Vd) составляет 105 литров, что свидетельствует о распределении препарата в тканях организма. После однократного приема внутрь силденафила в дозе 100 мг средняя максимальная общая плазменная концентрация силденафила составляет примерно 440 нг/мл (коэффициент вариации составляет 40%). Поскольку связывание силденафила и его главного N-десметил-метаболита с белками плазмы достигает 96%, средняя Cmax свободного силденафила достигает 18

нг/мл (38 нмоль). Степень связывания с белками плазмы не зависит от общих концентраций силденафила.

У здоровых добровольцев, получавших силденафил однократно в дозе 100 мг, через 90 минут в эякуляте определялось меньше 0,0002% (в среднем 188 нг) дозы.

Метаболизм. Метаболизм силденафила осуществляется главным образом с участием микросомальных изоферментов печени CYP3A4 (основной путь) и CYP2C9 (второстепенный путь). Главный циркулирующий метаболит образуется путем N-деметилирования силденафила. Селективность метаболита относительно ФДЭ-5 сравнима с селективностью силденафила, а активность метаболита относительно ФДЭ-5 составляет примерно 50% активности исходного вещества. Плазменная концентрация этого метаболита составляет примерно 40% концентрации силденафила в плазме крови. N-деметилированного метаболит подвергается дальнейшему метаболизму, а период его полувыведения составляет примерно 4 часа.

Выведение. Общий клиренс силденафила составляет 41 л/час, вызывая период его полувыведения продолжительностью 3-5 часов. Как после приема, так и после применения экскреция силденафила в виде метаболитов осуществляется главным образом с калом (примерно 80% введенной внутрь дозы) и в меньшей степени с мочой (примерно 13% введенной пероральной дозы).

Фармакокинетика в особых групп пациентов.

Пациенты пожилого возраста. У здоровых добровольцев пожилого возраста (старше 65 лет) отмечалось снижение клиренса силденафила, что приводило к повышению плазменных концентраций силденафила и его активного N-деметилированного метаболита примерно на 90% по сравнению с соответствующими концентрациями у здоровых добровольцев молодого возраста (18-45 лет). В связи с возрастными различиями в связывании с белками плазмы крови соответствующее повышение плазменной концентрации свободного силденафила составляло примерно 40%.

Почечная недостаточность. У добровольцев с нарушением функции почек легкой и средней степени (клиренс креатинина 30-80 мл/мин) фармакокинетика силденафила оставалась неизменной после его однократного приема внутрь в дозе 50 мг. Средние AUC и Cmax N-деметилированного метаболита повышались максимум на 126% и 73% соответственно по сравнению с этими показателями у добровольцев такого же возраста без нарушений функции почек. Однако из-за высокой индивидуальную вариабельность эти различия не были статистически значимыми. У добровольцев с тяжелыми нарушениями функции почек (клиренс

креатинина ниже 30 мл/мин) клиренс силденафила снижался, что приводило к средним повышений AUC и Cmax на 100% и 88% соответственно по сравнению с добровольцами такого же возраста без нарушений функции почек. Кроме того, значение AUC и Cmax N-деметилированного метаболита значимо повышались на 200% и 79% соответственно.

Печеночная недостаточность. У добровольцев с циррозом печени легкой и средней степени тяжести (классы А и В по классификации Чайлд-Пью) клиренс силденафила снижался, что приводило к повышению AUC (84%) и Cmax (47%) по сравнению с соответствующими показателями у добровольцев такого же возраста без нарушений функции печени. Фармакокинетика силденафила у пациентов с нарушениями функции печени тяжелой степени не изучалось.

Показания

Лекарственное средство Эротекс для мужчин рекомендуется применять мужчинам с эректильной дисфункцией, которая определяется как неспособность достичь или поддержать эрекцию полового члена, необходимую для успешного полового акта.

Для эффективного действия препарата Эротекс для мужчин нужно сексуальное возбуждение.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к активному веществу или к любому из вспомогательных веществ препарата;
- одновременное применение с донорами оксида азота (такими как амилнитрит) или нитратами в любой форме, поскольку известно, что силденафил влияет на пути метаболизма оксида азота (NO)/циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) и потенцирует гипотензивное действие нитратов;
- одновременное применение ингибиторов ФДЭ-5 (в том числе силденафила) со стимуляторами гуанилатциклазы, такими как риоцигуат, поскольку это может привести к симптоматической гипотензии (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»);
- состояния, при которых не рекомендуется сексуальная активность (например, тяжелые сердечно-сосудистые расстройства, такие как нестабильная стенокардия или сердечная недостаточность тяжелой степени);

- потеря зрения на один глаз вследствие неартериальной передней ишемической невропатии зрительного нерва независимо от того, связана эта патология с предыдущим применением ингибиторов ФДЭ-5 или нет;
- наличие таких заболеваний, как нарушение функции печени тяжелой степени, артериальная гипотензия (артериальное давление ниже 90/50 мм рт. ст.), недавно перенесенный инсульт или инфаркт миокарда и известные наследственные дегенеративные заболевания сетчатки, такие как пигментный ретинит (небольшое количество таких пациентов имеет генетические расстройства ФДЭ сетчатки), поскольку безопасность силденафила не исследовались в таких подгруппах пациентов.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Влияние других лекарственных средств на силденафил.

Исследования in vitro. Метаболизм силденафила происходит преимущественно с участием изоформы 3А4 (основной путь) и изоформы 2С9 (второстепенный путь) цитохрома Р450 (CYP). Поэтому ингибиторы этих изоферментов могут снижать клиренс силденафила, а индукторы этих изоферментов могут повышать клиренс силденафила.

Исследования in vivo. Популяционный фармакокинетический анализ данных клинических исследований продемонстрировал снижение клиренса силденафила при одновременном применении с ингибиторами CYP3A4 (такими как кетоконазол, эритромицин, циметидин). Хотя при одновременном применении силденафила и ингибиторов CYP3A4 рост частоты побочных явлений не наблюдалось, следует рассмотреть возможность применения начальной дозы силденафила 25 мг.

Одновременное применение ингибитора протеазы ВИЧ, очень мощного ингибитора Р450, в состоянии равновесной концентрации (500 мг 1 раз в сутки) и силденафила (разовая доза 100 мг) приводило к повышению Cmax силденафила на 300% (в 4 раза) и повышению плазменной AUC силденафила на 1000% (в 11 раз). Через 24 часа плазменный уровень силденафила все еще составлял примерно 200 нг/мл по сравнению с уровнем примерно 5 нг/мл, характерным для применения силденафила отдельно, что согласуется со значительным влиянием ритонавира на широкий спектр субстратов Р450. Силденафил не влияет на фармакокинетику ритонавира. Учитывая эти фармакокинетические данные одновременное применение силденафила и ритонавира не рекомендуется (см. Раздел «Особенности применения»); в любом случае максимальная доза силденафила при каких обстоятельствах не должна превышать 25 мг в течение

48 часов.

Одновременное применение ингибиторов протеазы ВИЧ саквинавира, ингибитора CYP3A4, в дозе, обеспечивает равновесную концентрацию (1200 мг 3 раза в сутки) и силденафила (100 мг однократно) приводило к повышению Cmax силденафила на 140% и увеличение AUC силденафила на 210%. Не выявлено влияния силденафила на фармакокинетику саквинавира (см. Раздел «Способ применения и дозы»). Предполагается, что более мощные ингибиторы CYP3A4, такие как кетоконазол и итраконазол, будут иметь более выраженное влияние.

При применении силденафила (100 мг однократно) и эритромицина, умеренного ингибитора CYP3A4, в равновесном состоянии (500 мг 2 раза в сутки в течение 5 дней) наблюдалось повышение AUC силденафила на 182%. У здоровых добровольцев мужского пола не наблюдалось влияния азитромицина (500 мг в течение 3 суток) на AUC, Cmax, Tmax, константу скорости элиминации и последующий период полувыведения силденафила или его основного циркулирующего метаболита. Циметидин (ингибитор цитохрома P450 и неспецифический ингибитор CYP3A4) в дозе 800 мг при одновременном применении с силденафилом в дозе 50 мг у здоровых добровольцев приводил к повышению плазменной концентрации силденафила на 56%.

Грейпфрутовый сок является слабым ингибитором CYP3A4 в стенке кишечника и может вызвать умеренное повышение уровня силденафила в плазме крови.

Однократное применение антацидов (магния гидроксида/алюминия гидроксида) не влияло на биодоступность силденафила.

Хотя исследований специфического взаимодействия со всеми лекарственными средствами не проводилось (по данным популяционного фармакокинетического анализа), фармакокинетика силденафила не менялась при одновременном применении с лекарственными средствами, принадлежащими к группе ингибиторов CYP2C9 (толбутамид, варфарин, фенитоин), группы ингибиторов CYP2D6 (таких как селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, трициклические антидепрессанты), группы тиазидных и тиазидоподобных диуретиков, петлевых и калийсберегающих диуретиков, ингибиторов АПФ, антагонистов кальция, антагонистов β-адренорецепторов или индукторов метаболизма CYP450 (таких как рифампицин, барбитураты).

В процессе исследования с участием здоровых добровольцев-мужчин одновременное применение антагониста эндотелина босентан (умеренный индуктор CYP3A4, CYP2C9 и, возможно, CYP2C19) в равновесном состоянии (125 мг 2 раза в сутки) и силденафила в равновесном состоянии (80 мг 3 раза в сутки) приводило к снижению AUC и Cmax силденафила на 62,6% и 55,4%

соответственно. Поэтому одновременное применение таких мощных индукторов CYP3A4, как рифампицин, может приводить к более выраженному снижению концентрации силденафила в плазме крови.

Никорандил представляет собой гибрид активатора кальциевых каналов и нитрата. Нитратный компонент предопределяет возможность его серьезного взаимодействия с сильденафилом.

Влияние силденафила на другие лекарственные средства.

Исследования in vitro. Силденафил - слабый ингибитор изоформ 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 3A4 цитохрома P450 (ИК50> 150 мкмоль). Поскольку пиковые плазменные концентрации силденафила равны примерно 1 мкмоль, влияние препарата на клиренс субстратов этих изоферментов маловероятен.

Отсутствуют данные о взаимодействии силденафила и таких неспецифических ингибиторов фосфодиэстеразы, как теофиллин и дипиридамол.

Исследования in vivo. Поскольку известно, что силденафил влияет на метаболизм NO/цГМФ, было установлено, что силденафил потенцирует гипотензивное действие нитратов, поэтому его одновременное применение с донорами оксида азота или нитратами в любой форме противопоказано (см. «Противопоказания»).

Риоцигуат. Доклинические исследования показали аддитивный системный эффект снижения артериального давления при одновременном применении ингибиторов ФДЭ-5 с риоцигуатом. Клинические исследования показали, что риоцигуат усиливает гипотензивное действие ингибиторов ФДЭ-5. У пациентов, участвовавших в исследовании, не наблюдалось клинического эффекта при одновременном применении ингибиторов ФДЭ-5 с риоцигуатом. Противопоказано одновременное применение риоцигуата с ингибиторами ФДЭ-5, в том числе с сильденафилом (см. Раздел «Противопоказания»).

Одновременное применение силденафила и блокаторов α-адренорецепторов может привести к развитию симптоматической гипотензии у некоторых предрасположенных пациентов. Такая реакция часто возникала в течение 4 часов после применения силденафила (см. Разделы «Особенности применения» и «Способ применения и дозы»). В процессе 3 исследований специфического взаимодействия блокаторов α-адренорецепторов доксазозина (4 мг и 8 мг) и силденафила (25 мг, 50 мг и 100 мг) применялись одновременно пациентам с доброкачественной гиперплазией предстательной железы, стабилизация состояния которых была достигнута при применении доксазозина. В этих популяциях наблюдалось среднее дополнительное снижение артериального

давления в положении лежа на 7/7 мм рт. ст., 9/5 мм рт. ст. и 8/4 мм рт. ст. и среднее снижение артериального давления в положении стоя на 6/6 мм рт. ст., 11/4 мм рт. ст., 4/5 мм рт. ст. соответственно. При одновременном применении силденафила и доксазозина у пациентов, стабилизация состояния которых была достигнута при применении доксазозина, иногда сообщалось о развитии симптоматической ортостатической гипотензии. В этих сообщениях говорилось о случаях головокружение и предобморочное состояние, но без синкопе.

Не наблюдалось никаких значимых взаимодействий при одновременном применении силденафила (50 мг) и толбутамиду (250 мг) или варфарина (40 мг), которые метаболизируются CYP2C9.

Силденафил (50 мг) не приводил бы к увеличению времени кровотечения, вызванного применением ацетилсалициловой кислоты (150 мг).

Силденафил (50 мг) не потенциировал гипотензивное действие алкоголя у здоровых добровольцев при среднем максимальном уровне этанола в крови 80 мг/дл.

У пациентов, получавших силденафил, не наблюдалось никаких различий профиля побочных эффектов по сравнению с плацебо при одновременном применении таких классов гипотензивных лекарственных средств, как диуретики, блокаторы β-адренорецепторов, ингибиторы АПФ, антагонисты ангиотензина II, антигипертензивные лекарственные средства (сосудорасширяющие и центрального действия), блокаторы адренергических нейронов, блокаторы кальциевых каналов и блокаторы α-адренорецепторов. В специальном исследовании взаимодействия при одновременном применении силденафила (100 мг) и амлодипина пациентам с артериальной гипертензией наблюдалось дополнительное снижение систолического артериального давления в положении лежа на 8 мм рт. ст. Снижение диастолического артериального давления составило 7 мм рт. ст. По величине эти дополнительные снижение артериального давления были сопоставимы с теми, что наблюдались при применении только силденафила у здоровых добровольцев (см. Раздел «Фармакологические свойства»).

Силденафил в дозе 100 мг не влиял на фармакокинетические показатели ингибиторов протеазы ВИЧ, саквинавира и ритонавира, которые являются субстратами CYP3A4.

У здоровых добровольцев мужского пола применения силденафила в равновесном состоянии (80 мг 3 раза в сутки) приводило к повышению AUC и Cmax босентан (125 мг 2 раза в день) на 49,8% и 42% соответственно.

Особенности применения

До начала терапии следует собрать медицинский анамнез пациента и провести физикальное обследование для диагностики эректильной дисфункции и определения ее возможных причин.

Факторы риска сердечно-сосудистых заболеваний. Поскольку сексуальная активность сопровождается определенным риском со стороны сердца, до начала любого лечения эректильной дисфункции врач должен оценить состояние сердечно-сосудистой системы пациента. Силденафил оказывает сосудорасширяющее действие, проявляется незначительным и кратковременным снижением артериального давления (см. Раздел «Фармакологические»). До назначения силденафила врач должен тщательно взвесить, может ли такой эффект неблагоприятно влиять на пациентов с определенными основными заболеваниями, особенно в сочетании с сексуальной активностью. К пациентам с повышенной чувствительностью к вазодилататоров относятся пациенты с обструкцией выводного тракта левого желудочка (например, стеноз аорты, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия) и пациенты с редким синдромом мультисистемной атрофии, одним из проявлений которой является тяжелое нарушение регуляции артериального давления со стороны вегетативной нервной системы.

Силденафил потенцирует гипотензивное действие нитратов (см. Раздел «Противопоказания»).

В постмаркетинговый период сообщалось о тяжелых побочных реакциях со стороны сердечно-сосудистой системы, включая инфаркт миокарда, нестабильной стенокардией, внезапную сердечную смерть, желудочковая аритмия, цереброваскулярные кровоизлияния, транзиторную ишемическую атаку, артериальной гипертензией и артериальной гипотензии, которые по времени совпадали с применением силденафила. У большинства пациентов, но не у всех, существовали факторы риска сердечно-сосудистых заболеваний. Много таких побочных реакций наблюдалось во время или сразу после полового акта и только несколько случилось вскоре после применения силденафила без сексуальной активности. Поэтому невозможно определить, связано развитие таких побочных реакций непосредственно с факторами риска, или их развитие обусловлено другими факторами.

Приапизм. Средства для лечения эректильной дисфункции, в том числе и силденафил, следует назначать с осторожностью пациентам с анатомической деформацией пениса (ангуляция, кавернозный фиброз или болезнь Пейрони) или пациентам с состояниями, которые вызывают развитие приапизма (серповидно-

клеточная анемия, множественная миелома или лейкемия).

После выхода силденафила на рынок сообщалось о случаях удлиненной эрекции и приапизма. Если эрекция длится более чем 4 часа, пациентам следует немедленно обратиться за медицинской помощью. При отсутствии немедленного лечения приапизм может привести к повреждению тканей пениса и к стойкой потере потенции.

Одновременное применение с другими ингибиторами ФДЭ-5 или другими препаратами для лечения эректильной дисфункции. Безопасность и эффективность одновременного применения силденафила с другими ингибиторами ФДЭ-5 или другими препаратами для лечения гипертензии легочной артерии, содержащие силденафил, или с другими препаратами для лечения эректильной дисфункции изучались. Поэтому применение таких комбинаций не рекомендуется.

Влияние на зрение. Спонтанные сообщения про возникновение дефектов зрения поступали ассоциировано с применением силденафила и других ингибиторов ФДЭ-5 (см. Раздел «Побочные реакции»). О случаях неартериальной передней ишемической невропатии зрительного нерва, является редким состоянием, поступали спонтанные сообщения и сообщалось в надзорном исследовании ассоциировано с применением силденафила и других ингибиторов ФДЭ-5 (см. Раздел «Побочные реакции»). Пациентов следует предупредить, что в случае внезапного нарушения зрения применения препарата ЕРГОС следует прекратить и немедленно обратиться к врачу (см. Раздел «Противопоказания»).

Одновременное применение с ритонавиром. Одновременное применение силденафила и ритонавира не рекомендуется (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Одновременное применение с блокаторами α-адренорецепторов. Пациентам, принимающим блокаторы α-адренорецепторов, применять силденафил следует с осторожностью, поскольку такая комбинация может привести к симптоматической гипотензии у некоторых предрасположенных пациентов. Симптоматическая гипотензия обычно возникает в течение 4 часов после применения силденафила. С целью минимизации возможного развития постуральной гипотензии у пациентов, принимающих блокаторы α-адренорецепторов, их состояние нужно стабилизировать с помощью блокаторов α-адренорецепторов до начала применения силденафила. Также следует рассмотреть возможность применения начальной дозы 25 мг (см. Раздел «Способ применения и дозы»). Кроме того, следует проинформировать пациентов, как действовать в случае появления симптомов ортостатической гипотензии.

Влияние на кровотечения. Исследования тромбоцитов человека показали, что in vitro силденафил потенцирует антиагрегационным эффекты натрия нитропруссида. Нет никакой информации относительно безопасности применения силденафила пациентам с нарушениями свертывания крови или острой язвенной болезнью. Таким образом, применение силденафила пациентами этой группы возможно только после тщательной оценки соотношения пользы и риска.

После приема 100 мг здоровыми добровольцами не наблюдалось влияния на морфологию или подвижность сперматозоидов (см. Раздел «Фармакологические»).

Потеря слуха. Врачам следует посоветовать пациентам прекратить применение препарата ЕРГОС и немедленно обратиться за медицинской помощью в случае внезапного снижения или потери слуха. Об этих явлениях, которые также могут сопровождаться звоном в ушах и головокружением, сообщалось с ассоциацией во времени с применением ингибиторов ФДЭ-5, включая ЕРГОС. Определить, эти явления напрямую связаны с применением ингибиторов ФДЭ-5 или с другими факторами невозможно.

Одновременное применение с гипотензивными препаратами. Силденафил оказывает системную сосудорасширяющее действие и может в дальнейшем снижать артериальное давление у пациентов, применяющих гипотензивные лекарственные средства. В отдельном исследовании лекарственного взаимодействия одновременное применение амлодипина (5 мг или 10 мг) и силденафила (100 мг) перорально наблюдалось среднее дополнительное снижение систолического давления на 8 мм рт. ст., диастолического - на 7 мм рт. ст.

Заболевания, передающиеся половым путем. Применение препарата ЕРГОС не защищает от заболеваний, передающихся половым путем. Следует рассмотреть возможность информирования пациентов о необходимых мер для защиты от заболеваний, передающихся половым путем, включая вирус иммунодефицита человека.

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

Эротекс для мужчин может иметь незначительное влияние на управление автотранспортом или другими механизмами. Поскольку в процессе клинических исследований применения силденафила сообщалось о случаях головокружения и нарушении со стороны органов зрения, перед тем как садиться за руль

транспортного средства или другими механизмами, пациентам необходимо выяснить, какова их индивидуальная реакция на применение препарата Эротекс для мужчин.

Применение в период беременности или кормления грудью

Эротекс для мужчин не предназначен для применения женщинами.

Способ применения и дозы

Препарат применяют перорально.

Взрослые. Рекомендуемая доза составляет 50 мг, принимаемая в случае необходимости примерно за один час до полового акта. На основе эффективности и переносимости дозу можно увеличить до 100 мг или снизить до 25 мг *. Максимальная рекомендованная доза составляет 100 мг. Максимальная рекомендованная частота приема - 1 раз в сутки. Если Эротекс для мужчин принимается с пищей, начало действия препарата может быть отложен по сравнению с приемом натощак.

Пациенты пожилого возраста. Для пациентов пожилого возраста (возраст ≥ 65 лет) коррекции дозы не требуется.

Пациенты с почечной недостаточностью. Пациентам с почечной недостаточностью легкой и средней степени тяжести (клиренс креатинина 30-80 мл / мин) рекомендуемая доза такая же, как указано выше в разделе «Взрослые».

Поскольку у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (клиренс креатинина <30 мл / мин) клиренс силденафила снижен, следует рассмотреть возможность применения дозы 25 мг *. В зависимости от эффективности и переносимости препарата при необходимости дозу можно увеличить постепенно до 50 мг и до 100 мг.

Пациенты с печеночной недостаточностью. Поскольку клиренс силденафила снижается у пациентов с печеночной недостаточностью (например, у пациентов с циррозом печени), следует рассмотреть возможность применения дозы 25 мг *. На основании данных эффективности и переносимости дозу можно постепенно увеличить до 50 мг до 100 мг в случае необходимости.

Применение пациентам, которые принимают другие лекарственные средства. За исключением ритонавира, для которого сопутствующее введение с сильденафилом не рекомендуется (см. Разделы «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий» и «Особенности

применения»), для пациентов, которые проходят сопутствующее лечение ингибиторами CYP3A4, следует рассмотреть начальную дозу 25 мг *.

Для того, чтобы свести к минимуму возможность развития постуральной гипотензии у пациентов, которых лечат α-блокаторами, состояние пациентов необходимо стабилизировать с помощью α-блокаторов до начала лечения сильденафилом. Кроме того, начальную терапию сильденафилом следует рассматривать в дозе 25 мг * (см. Разделы «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий» и «Особенности применения»).

* Применять в соответствующей дозировке.

Дети

Эротекс для мужчин не применяют детям (в возрасте до 18 лет).

Передозировка

В процессе исследований с участием добровольцев при применении разовой дозы силденафила до 800 мг побочные реакции были подобны тем, которые наблюдались при применении силденафила в более низких дозах, но встречались чаще и были более тяжелыми. Применение силденафила в дозе 200 мг не приводило к повышению эффективности, но вызывало рост количества случаев развития побочных реакций (головной боли, приливов крови, головокружение, диспепсии, заложенности носа, нарушений со стороны органов зрения).

В случае передозировки при необходимости прибегают к обычным поддерживающих мероприятий. Ускорение клиренса силденафила при гемодиализе маловероятно вследствие высокой степени связывания препарата с белками плазмы крови и отсутствия элиминации силденафила с мочой.

Побочные реакции

Чаще всего сообщалось о таких побочных реакциях, как головная боль, приливы крови, диспепсия, заложенность носа, боль в спине, головокружение, тошнота, приливы жара, нарушения зрения, цианопсия и помутнение зрения.

Побочные реакции приведены ниже в соответствии с классификацией «Система-орган-класс» и частоты: очень часто (≥ 1/10), часто (≥ 1/100 - <1/10), нечасто (≥ 1000 - <1/100) и редко (≥ 1/10 000 - <1/1000). В пределах каждой частотной группы побочные реакции приведены в порядке уменьшения их серьезности.

Инфекции и инвазии: нечасто - ринит.

Со стороны иммунной системы: нечасто - гиперчувствительность.

Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль; часто - головокружение нечасто - сонливость, гипестезия; редко - инсульт, транзиторная ишемическая атака, судороги*, рецидивы судорог*, синкопе.

Со стороны органа зрения: часто - нарушение восприятия цвета**, расстройства зрения, помутнение зрения; нечасто - нарушение слезоотделения***, боль в глазах, фотофобия, фотопсия, гиперемия глаз, яркость зрения, конъюнктивит редко - неартериальна передняя ишемическая нейропатия зрительного нерва* окклюзия сосудов сетчатки* ретинальный кровоизлияние, артериосклеротична ретинопатия, нарушения со стороны сетчатки, глаукома, дефекты поля зрения, диплопия, снижение остроты зрения, миопия, астенопия, плавающие помутнения стекловидного тела, нарушения со стороны радужной оболочки, мидриаз, появление светящихся кругов вокруг источника света (гало) в поле зрения, отек глаз, припухлость глаз, нарушения со стороны глаз, гиперемия конъюнктивы, раздражение глаз, аномальные ощущения в глазах, отек век, обесцвечивание склеры.

Со стороны органов слуха: нечасто - вертиго, звон в ушах редко - глухота.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - приливы крови к лицу, приливы жара; нечасто - тахикардия, усиленное сердцебиение, артериальная гипотензия/гипертензия редко - внезапная сердечная смерть*, инфаркт миокарда, желудочковая аритмия*, фибрилляция предсердий, нестабильная стенокардия.

Со стороны дыхательной системы: часто - заложенность носа, нечасто - носовое кровотечение, заложенность придаточных пазух носа; редко - ощущение сжатия в горле, отек слизистой оболочки носа, сухость в носу.

Со стороны пищеварительного тракта: часто - тошнота, диспепсия нечасто - гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь, рвота, боль в верхней части живота, сухость во рту редко - гипестезия ротовой полости.

Со стороны кожи и подкожной ткани: нечасто - сыпь, редко - синдром Стивенса-Джонсона*, токсический эпидермальный некролиз*.

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - миалгия, боль в конечностях.

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - гематурия.

Со стороны репродуктивной системы: редко - кровотечение из полового члена, приапизм* гематоспермия, продолжительная эрекция.

Общие нарушения: нечасто - боль в груди, повышенная утомляемость, ощущение жара; редко - раздражение.

Лабораторные показатели: нечасто - повышенная частота сердечных сокращений.

* Сообщалось лишь во время исследования.

** Нарушение восприятия цвета: хлоропсия, хроматопсия, цианопсия, еритропсия, ксантопсия.

*** Нарушение слезотечение: сухость в глазах, нарушение слезоотделения и повышение слезотечение.

Нижеприведенные явления наблюдались в <2% пациентов в процессе исследований, причинной взаимосвязи не определен. Сообщение включали явления, которые имели вероятный связь с применением силденафила. Явления, которые не были указаны, были легкими и сообщения были очень неточными, чтобы иметь значение.

Общие нарушения: отек лица, фотосенсибилизация, шок, астения, боль, внезапное падение, боль в животе, внезапное повреждение.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: стенокардия, AV-блокада, мигрень, постуральная гипотензия, ишемия миокарда, тромбоз сосудов головного мозга, внезапная остановка сердца, отклонения показателей ЭКГ, кардиомиопатия.

Со стороны пищеварительного тракта: глоссит, колит, дисфагия, гастрит, гастроэнтерит, эзофагит, стоматит, нарушение результатов печеночных проб, ректальное кровотечение, гингивит.

Со стороны системы крови и лимфатической системы: анемия, лейкопения.

Со стороны метаболизма и питания: жажда, отек, подагра, нестабильный диабет, гипергликемия, периферические отеки, гиперурикемия, гипогликемия, гипернатриемия.

Со стороны костно-мышечной системы: артрит, артроз, разрыв сухожилия, теносиновит, боль в костях, миастения, синовит.

Со стороны нервной системы: атаксия, невралгия, нейропатия, парестезии, тремор, вертиго, депрессия, бессонница, аномальные сновидения, снижение

рефлексов.

Со стороны дыхательной системы: астма, одышка, ларингит, фарингит, синусит, бронхит, усиленное слюноотделение, усиление кашля.

Со стороны кожи: крапивница, герпес, зуд, повышенная потливость, язвы кожи, контактный дерматит, эксфолиативный дерматит.

Со стороны органов чувств: внезапное снижение или потеря слуха, боль в ушах, кровоизлияние в глаз, катаракта, сухость в глазах.

Со стороны мочевыделительной системы: цистит, никтурия, повышенная частота мочеиспусканий, увеличение молочных желез, недержание мочи, нарушение эякуляции, отек половых органов, аноргазмия.

Побочные реакции, о которых поступали сообщения от популяции неизвестной численности. Эти явления были отмечены как за их серьезность, частоту сообщения, отсутствие четкого альтернативного связи, так и через комбинацию этих факторов.

Сердечно-сосудистые и цереброваскулярные явления. Сообщалось о тяжелых сердечно-сосудистые, цереброваскулярные и сосудистые явления, включая цереброваскулярной кровотечение, субарахноидальное и внутрицеребральном кровотечение и легочное кровотечение, которые были связаны во времени с применением силденафила. У большинства пациентов, но не у всех, имелись факторы сердечно-сосудистого риска. Сообщалось, что многие из этих явлений возникли во время или сразу после сексуальной активности и несколько явлений возникли сразу после применения силденафила без сексуальной активности. Другие явления возникли в течение следующих часов или дней после применения силденафила и сексуальной активности. Невозможно установить, эти явления связаны с применением силденафила, с сексуальной активностью, с имеющимися факторами риска или с комбинацией этих факторов, или с другими факторами.

Кровеносная и лимфатическая системы: вазооклюзивний кризисов.

В небольшом заблаговременно приостановленном исследовании применения силденафила пациентам с легочной артериальной гипертензией, вторичной по серповидноклеточной анемии, при применении силденафила о развитии вазооклюзивних кризов, требующие госпитализации, сообщалось чаще, чем при применении плацебо. Клиническое значение этой информации для пациентов, принимающих препарат Эросил с целью лечения эректильной дисфункции, неизвестно.

Специфические ощущения.

Слух. Сообщалось о случаях внезапного снижения или потери слуха, связанные по времени с применением силденафила. В некоторых случаях сообщали о наличии медицинских состояний и других факторов, которые могли сыграть роль в развитии побочных реакций со стороны слуха. Во многих случаях информация по дальнейшему медицинскому наблюдению отсутствует. Определить, эти явления напрямую связаны с применением силденафила, с имеющимися факторами риска потери слуха, с комбинацией этих факторов или другими факторами, невозможно.

Зрение. Временная потеря зрения, покраснение глаз, жжение в глазах, повышение внутриглазного давления, отек сетчатки, сосудистые заболевания сетчатки или кровотечение, отслойка стекловидного тела.

Сообщалось о случаях неартериальнои передней ишемической невропатии зрительного нерва, что является причиной снижения зрения, включая постоянную потерю зрения, которые были связаны во времени с применением ингибиторов ФДЭ-5, включая силденафил. У многих пациентов, но не у всех, имелись анатомические или сосудистые факторы риска развития неартериальнои передней ишемической невропатии зрительного нерва, включая (но не ограничиваясь) следующие: низкое соотношение диаметра экскавации и диска зрительного нерва (застойный диск зрительного нерва), возраст более 50 лет, артериальная гипертензия, заболевания коронарных артерий, гиперлипидемия и курение. Невозможно определить, эти явления напрямую связаны с применением ингибиторов ФДЭ-5, или с имеющимися анатомическими или сосудистыми факторами риска, или с комбинацией этих всех факторов, или с другими факторами.

Отчет о подозреваемых побочных реакциях.

Отчет о подозреваемых побочных реакциях после регистрации лекарственного средства имеет важное значение. Это позволяет проводить непрерывный мониторинг соотношения пользы и рисков, связанных с применением этого препарата. Врачам следует отчитываться о любых подозреваемых побочных реакциях в соответствии с требованиями законодательства.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 30 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 4 таблетки, вкриті плівковою оболонкою, у блістері; по 1 блістеру у картонній пачці.

Категория отпуска

За рецептом.

Производитель

Актавис Лтд./Actavis Ltd.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

BLB 015, Булебел Індастріал Естейт, м. Зейтун, ZTN 3000, Мальта/ BLB 015, Bulebel Industrial Estate, Zejtun ZTN 3000, Malta.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.