

# Инструкция к препарату «Виагра»

## Форма выпуска

Таблетки.

## Упаковка

от 4 шт. до 10 шт.

## Фармакологическое действие

Силденафил является мощным селективным ингибитором цГМФ-специфической фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5).

Реализация физиологического механизма эрекции связана с высвобождением оксида азота (NO) в кавернозном теле во время сексуальной стимуляции. Это, в свою очередь, приводит к увеличению уровня цГМФ, последующему расслаблению гладкомышечной ткани кавернозного тела и увеличению притока крови.

Силденафил не оказывает прямого расслабляющего действия на изолированное кавернозное тело у человека, но усиливает эффект NO посредством ингибирования ФДЭ5, которая ответственна за распад цГМФ.

Силденафил селективен в отношении ФДЭ5 *in vitro*, его активность 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 важнейшее значение, поскольку ФДЭ3 является одним из ключевых ферментов регуляции сократимости миокарда.

Обязательным условием эффективности силденафила является сексуальная стимуляция.

## Показания

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

Силденафил эффективен только при наличии сексуальной стимуляции.

## Противопоказания

- Повышенная чувствительность к силденафилу или к любому компоненту препарата;
- применение у пациентов, получающих постоянно или с перерывами донаторы оксида азота, органические нитраты или нитраты в любых формах, поскольку силденафил усиливает гипотензивное действие нитратов;
- не рекомендуется применять препарат совместно с другими средствами для лечения нарушений эрекции (безопасность и эффективность комбинированной терапии не изучена);
- препарат не предназначен для применения у детей и подростков в возрасте 18 лет;
- препарат не предназначен для применения у женщин.
- С осторожностью: при анатомической деформации полового члена, при ангуляции, кавернозном фиброзе, болезни Пейрони, при заболеваниях, предрасполагающих к развитию приапизма, серповидно-клеточная анемия, множественная миелома, лейкоз, тромбоцитопения, при заболеваниях, сопровождающихся кровотечением, при обострении язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, при наследственном пигментном ретините, при сердечной недостаточности, при нестабильной стенокардии, при перенесенном в последние 6 мес инфаркте миокарда, при инсульте, при тяжелых, угрожающих жизни аритмиях, при артериальной гипертензии (АД более 170/100 мм рт.ст.), при гипотензии (АД менее 90/50 мм рт.ст.).

## Особые указания

Для диагностики нарушений эрекции, определения их возможных причин и выбора адекватного лечения необходимо собрать полный медицинский анамнез и провести тщательное физикальное обследование.

Сексуальная активность представляет определенный риск при заболеваниях сердца; в связи с этим перед началом любой терапии по поводу нарушений эрекции врач может посчитать нужным обследование сердечно-сосудистой системы. Сексуальная активность является нежелательной у пациентов с сердечной недостаточностью, нестабильной стенокардией, перенесенным в последние 6 месяцев инфарктом миокарда или инсультами, угрожающими жизни аритмиями, артериальной гипертензией (АД > 170/100 мм рт.ст.) или гипотензией (АД

Препараты, предназначенные для лечения нарушений эрекции, не следует назначать мужчинам, для которых сексуальная активность нежелательна.

Виагра оказывает системное вазодилатирующее действие, которое приводит к преходящему снижению АД. Этот эффект не является клинически значимым и не приводит к каким-либо последствиям у большинства пациентов. Однако до назначения препарата Виагра врач должен тщательно взвесить риск нежелательных проявлений вазодилатирующего действия у пациентов с определенными сопутствующими заболеваниями, особенно на фоне сексуальной активности. Повышенная восприимчивость к вазодилататорам наблюдается у пациентов с обструкцией выходного тракта левого желудочка (например, аортальный стеноз, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия), а также с редко встречающимся синдромом множественной системной атрофии, проявляющимся тяжелым нарушением регуляции АД со стороны вегетативной нервной системы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

На фоне приема препарата Виагра какого-либо отрицательного влияния на способность управлять автомобилем или другими техническими

средствами не наблюдалось. Однако поскольку при приеме препарата возможно снижение АД, развитие хроматопсии, затуманенного зрения, следует внимательно относиться к индивидуальному действию препарата в указанных ситуациях, особенно в начале лечения и при изменении режима дозирования.

## Состав

1 таблетка содержит:

Активное вещество: силденафил (в форме цитрата) от 25 мг (в зависимости от купленной дозировки)

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кальция гидрофосфат, кроскармеллоза натрия, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: Opadry голубой OY-LS-20921 (гипромеллоза, лактоза, триацетин, титана диоксид (E171), алюминиевый лак на основе индигокармина (E132)) и Opadry прозрачный YS-2-19114-A (гипромеллоза, триацетин).

## Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь. Если в названии препарата присутствует приставка «Софт», то принимают сублингвально (лингвально).

Для большинства пациентов рекомендуемая доза составляет 50 мг примерно за 1 ч до сексуальной активности. С учетом эффективности и переносимости доза может быть увеличена до 100 мг или снижена до 25 мг.

Максимальная рекомендуемая доза составляет 100 мг. Максимальная рекомендуемая кратность применения – 1 раз/сут.

При почечной недостаточности легкой и средней степени тяжести

При почечной недостаточности легкой и средней степени тяжести ( КК 30-80 мл/мин) коррекции дозы не требуется.

При почечной недостаточности тяжелой степени (КК

При нарушениях функции печени

При нарушениях функции печени дозу препарата можно снизить до 25 мг.

При совместном применении с ритонавиром

При совместном применении с ритонавиром максимальная разовая доза препарата Виагра должна составлять 25 мг, кратность применения - 1 раз в 48 ч.

При совместном применении с ингибиторами изофермента CYP3A4

При совместном применении с ингибиторами изофермента CYP3A4 (эритромицин, саквинавир, кетоконазол, итраконазол) начальная доза препарата Виагра должна составлять 25 мг.

У пациентов, принимающих альфа-адреноблокаторы

Чтобы свести к минимуму риск развития постуральной гипотензии у пациентов, принимающих альфа-адреноблокаторы, начинать принимать силденафил следует только после того, как будет достигнута стабилизация гемодинамики у этих пациентов. Следует рассмотреть целесообразность снижения начальной дозы препарата Виагра.

## Побочные действия

Побочные эффекты обычно преходящие и легкие или умеренно выраженные.

Частота нежелательных явлений повышается с увеличением дозы.

Нервная система: головокружение - силденафил (%) - 2,9, плацебо (%) - 1,0. Наиболее часто (>1/10) - головная боль - силденафил (%) - 10,8, плацебо (%) - 2,8.

Сердечно-сосудистая система: увеличение частоты сердечных сокращений - силденафил (%) - 1,0, плацебо (%) - 0,2. Часто (>1/100 и < 1/10) - вазодилатация (приливы крови к лицу) - силденафил (%) - 10,9, плацебо (%) - 1,4.

Орган зрения: изменения зрения (затуманенное зрение, изменение чувствительности к свету) - силденафил (%) - 2,5, плацебо (%) - 0,4.  
Хроматопсия (легкая и преходящая, главным образом изменение восприятия оттенков цвета) - силденафил (%) - 1,1, плацебо (%) - 0,03.

Дыхательная система: ринит (заложенность носа) - силденафил (%) - 2,1, плацебо (%) - 0,3.

Пищеварительная система: диспепсия - силденафил (%) - 3,0, плацебо (%) - 0,4.

При применении препарата в дозах, превышавших рекомендуемые, побочные эффекты были сходными с отмеченными выше, но обычно встречались чаще.

Аллергические реакции: реакции повышенной чувствительности (в т.ч. кожная сыпь).

Со стороны ЦНС: судороги.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, снижение АД, Обморок носовое кровотечение.

Со стороны пищеварительной системы: рвота.

Со стороны органа зрения: боль в глазах, покраснение глаз/инъекции склер.

Со стороны половой системы: длительная эрекция и/или приапизм.

## Лекарственное взаимодействие

Влияние других лекарственных средств на метаболизм силденафила

Метаболизм силденафила происходит, в основном, в печени под действием изоферментов CYP3A4 (основной путь) и CYP2C9, поэтому ингибиторы этих изоферментов могут снижать клиренс силденафила, а индукторы, соответственно, увеличивать клиренс силденафила.

При одновременном применении ингибиторов СYP3A4 (таких как кетоконазол, эритромицин, циметидин ) отмечено снижение клиренса силденафила.

Циметидин (800 мг), являющийся неспецифическим ингибитором СYP3A4, при одновременном приеме с силденафилом (50 мг) вызывает повышение концентрации силденафила в плазме на 56%.

Однократный прием силденафила в дозе 100 мг одновременно с эритромицином, специфическим ингибитором СYP3A4 (при приеме эритромицина 2 раза/сут по 500 мг в течение 5 дней), на фоне

достижения постоянного уровня эритромицина в крови приводит к увеличению AUC силденафила на 182%.

При одновременном применении силденафила (однократно в дозе 100 мг) и саквинавира, являющегося как ингибитором ВИЧ-протеазы, так и ингибитором СYP3A4 (при приеме саквинавира 3 раза/сут в дозе 1200 мг), на фоне достижения постоянного уровня саквинавира в крови,  $C_{max}$  силденафила в крови повышалась на 140%, а AUC увеличивалась на 210%. Силденафил не оказывал влияния на фармакокинетические параметры саквинавира.

Более сильные ингибиторы изофермента СYP3A4, такие как кетоконазол или итраконазол, могут вызывать более выраженные изменения фармакокинетики силденафила.

Одновременное применение силденафила (однократно в дозе 100 мг) и ритонавира, являющегося ингибитором ВИЧ-протеазы и сильным ингибитором изоферментов системы цитохрома P450 (при приеме ритонавира по 500 мг 2 раза/сут), на фоне достижения постоянного уровня ритонавира в крови,  $C_{max}$  силденафила увеличивалась на 300% (в 4 раза), а AUC на 1000% (в 11 раз). Через 24 ч концентрация силденафила в плазме крови приблизительно составляла 200 нг/мл (при однократном применении одного силденафила - 5 нг/мл).

Если силденафил принимают в рекомендуемых дозах пациенты, получающие одновременно сильные ингибиторы СYP3A4, то  $C_{max}$  свободного силденафила не превышает 200 нМ, и препарат хорошо переносится.

Однократный прием антацида ( магния гидроксида /алюминия гидроксида) не влияет на биодоступность силденафила.

Ингибиторы CYP2C9 (такие как толбутамид, варфарин ), CYP2D6 (такие как селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, трициклические антидепрессанты), тиазиды и тиазидоподобные диуретики, ингибиторы АПФ и антагонисты кальция не оказывают влияния на фармакокинетические параметры силденафила.

Одновременный прием азитромицина (500 мг/сут в течение 3 дней) не оказывает влияния на AUC, C max , T max , константу скорости выведения и T 1/2 силденафила или его основного циркулирующего метаболита.

Влияние силденафила на другие лекарственные средства

Силденафил является слабым ингибитором изоферментов системы цитохрома P450 - 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 3A4 (ИК 50 >150 мкмоль). Маловероятно, что силденафил может повлиять на клиренс субстратов этих изоферментов.

Силденафил усиливает гипотензивное действие нитратов как при длительном применении, так и при применении по острым показаниям. В связи с этим применение силденафила в сочетании с нитратами или донаторами оксида азота противопоказано.

При одновременном приеме альфа-адреноблокатора доксазозина (4 мг и 8 мг) и силденафила (25 мг, 50 мг и 100 мг) у пациентов с доброкачественной гиперплазией предстательной железы со стабильной гемодинамикой среднее дополнительное снижение систолического/диастолического АД в положении лежа на спине составляло 7/7 мм рт.ст., 9/5 мм рт.ст. и 8/4 мм рт.ст. соответственно, а в положении стоя - 6/6 мм рт.ст., 11/4 мм рт.ст. и 4/5 мм рт.ст. соответственно. Сообщается о редких случаях развития у таких пациентов симптоматической постуральной гипотензии, проявлявшейся в виде Головокружение (без Обморок ). У отдельных чувствительных пациентов, получающих альфа-адреноблокаторы, одновременное применение силденафила может привести к симптоматической гипотензии.



Признаков значимого взаимодействия силденафила с толбутамидом (250 мг) или варфарином (40 мг), которые метаболизируются CYP2C9, не выявлено.

Силденафил в дозе 100 мг не оказывает влияния на фармакокинетические параметры ингибиторов ВИЧ-протеазы при их постоянной концентрации в крови, таких как саквинавир и ритонавир, одновременно являющихся субстратами CYP3A4.

Силденафил (50 мг) не вызывает дополнительного увеличения времени кровотечения при приеме ацетилсалициловой кислоты (150 мг).

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

У пациентов с артериальной гипертензией признаков взаимодействия силденафила (100 мг) с амлодипином не выявлено. Среднее дополнительное снижение АД в положении лежа составляет: систолического – на 8 мм рт.ст., диастолического – на 7 мм рт.ст.

Применение силденафила в сочетании с антигипертензивными средствами не приводит к возникновению дополнительных побочных эффектов.

## Передозировка

Симптомы: при однократном приеме препарата в дозе до 800 мг нежелательные явления были сопоставимы с таковыми при приеме силденафила в более низких дозах, но встречались чаще.

Лечение: при необходимости проводят симптоматическую терапию. Гемодиализ не ускоряет клиренс силденафила, т.к. последний активно связывается с белками плазмы и не выводится с мочой.

## Условия хранения

Хранить в сухом месте при температуре не выше 30°C.

## Срок годности

5 лет.