

СИЛОМЕН

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название: Силомен.

Международное непатентованное название: Силденафил.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав: каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой содержит:

Силденафила цитрат экв. силденафилу 100 мг.

Вспомогательные вещества q.s.

Цвет: красный оксид железа NF и диоксид титана ВР.

Фармакотерапевтическая группа: Препарат для лечения эректильной дисфункции. Ингибитор ФДЭ-5.

Код АТХ: G04BE03.

Фармакологическое действие:

Фармакодинамика:

Силденафил является мощным и селективным ингибитором цГМФ-специфической фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5), которая ответственна за распад цГМФ в кавернозном теле. 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.

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.

Исследования in vitro свидетельствуют о том, что активность силденафила в отношении ФДЭ5 в 10-10000 раз превосходит его активность в отношении других изоформ фосфодиэстеразы (ФДЭ 1, 2, 3, 4 и 6). В частности активность силденафила в отношении ФДЭ5 в 4000 раз превосходит его активность в отношении ФДЭ3 - цАМФ-специфической фосфодиэстеразы, участвующей в сокращении сердца.

Фармакокинетика:

Всасывание - после приема внутрь быстро всасывается. Стах в плазме крови при приеме натоцак достигается в течение 0.5-2 ч, биодоступность составляет в среднем 41% (25-63%). При приеме с пищей Стах снижается на 20-40% и достигается через 1.5-3 ч.

Распределение - кажущийся Vd в равновесном состоянии составляет 105 л. Связывание силденафила и его основного активного метаболита с белками плазмы крови составляет 96% от введенной дозы и не является дозозависимым.

Метаболизм - силденафил метаболизируется, главным образом, под действием изоферментов CYP3A4 (основной путь) и CYP2C9 (дополнительный путь) микросомальных изоферментов печени. Основным циркулирующим активным метаболитом является N-деметилметаболит, активность которого в отношении фосфодиэстеразы составляет 50% активности силденафила, а его концентрация в плазме достигает 40% концентрации силденафила. N-деметилметаболит подвергается дальнейшему метаболизму с T1/2 4 ч.

Выведение - общий клиренс силденафила равен 41 л/ч. T1/2 силденафила составляет 3-5 ч. Неактивные метаболиты выводятся кишечником (80%) и почками (13%).

Фармакокинетика в особых клинических случаях:

У пациентов старше 65 лет Стах силденафила и его активного метаболита увеличена приблизительно на 90% по сравнению с пациентами 18-45 лет из-за сниженного клиренса силденафила. Концентрация силденафила в плазме крови, не связанного с белками, составляет 40%.

У пациентов с умеренной почечной недостаточностью (КК 30-80 мл/мин) фармакокинетика силденафила не изменяется при приеме 50 мг, а Стах и АUC для N-деметилметаболита увеличена на 73% и 126% соответственно. У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК менее 30 мл/мин) Стах и АUC увеличены на 88% и 100% соответственно, Стах и АUC N-деметилметаболита увеличены на 79% и 200% соответственно.

У пациентов с циррозом печени (классы А и В по шкале Чайлд-Пью) Стах и АUC увеличены на 47% и 84% соответственно.

Показания к применению:

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

Эффективен только при сексуальной стимуляции.

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к силденафилу;
- пациентам, для которых сексуальная активность нежелательна, в т.ч. с тяжелыми сердечно-сосудистыми заболеваниями, такими как нестабильная стенокардия, тяжелая сердечная недостаточность, угрожающие жизни аритмии, артериальная гипотензия (АД менее 90/50 мм рт.ст.), артериальная гипертензия (АД более 170/100 мм рт. ст.), недавно перенесенные нарушение мозгового кровообращения или инфаркт миокарда;
- пациентам с потерей зрения на один глаз вследствие передней ишемической оптической нейропатии неартериального генеза (независимо от того, произошло ли это вследствие приема ингибитора ФДЭ5 или нет);
- наследственные дегенеративные заболевания сетчатки, в том числе пигментный ретинит (меньшая часть таких пациентов имеет генетическое заболевание ФДЭ сетчатки);
- тяжелая печеночная недостаточность;
- женский пол;
- возраст до 18 лет.

С *осторожностью* следует применять препарат при синдроме множественной системной атрофии, обструкции выходного тракта левого желудочка (в т.ч. аортальный стеноз, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия), анатомической деформации полового члена, приапизме, множественной миеломе, лейкозе, одновременно с приемом альфа-адреноблокаторов, при непереносимости лактозы, дефиците лактазы, глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Способ применения и дозы:

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 в сутки.

Для пожилых пациентов в возрасте старше 65 лет и при сопутствующих нарушениях функции почек или печени доза составляет 25 мг.

Побочные действия:

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

Передозировка:

Симптомы: при однократном приеме до 800 мг силденафила было отмечено усиление выраженности побочных эффектов.

Лечение: симптоматическое. Диализ неэффективен из-за высокой степени связывания силденафила и его метаболита с белками плазмы крови.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Однократный прием антацидов (магния гидроксид/алюминия гидроксид) одновременно с силденафилом не влияет на его биодоступность. Усиливает гипотензивное действие нитратов (одновременный прием противопоказан) и антиагрегационный эффект натрия нитропруссида. При одновременном приеме с ацетилсалициловой кислотой (150 мг) не увеличивает время кровотечения. Ингибиторы CYP3A4 (циметидин, кетоконазол, итраконазол, эритромицин и др.) повышают концентрацию силденафила в плазме (в частности, циметидин в дозе 800 мг — на 56%, при приеме силденафила в дозе 50 мг) и уменьшают его выведение. При однократном приеме 100 мг силденафила на фоне равновесной концентрации эритромицина (прием по 500 мг дважды в сутки в течение 5 дней) АUC силденафила возрастает на 182%, на фоне равновесной концентрации саквинавира (1200 мг 3 раза в сутки) C_{max} силденафила повышается на 140%, АUC — на 210%. Однократный прием 100 мг силденафила на фоне равновесной концентрации ритонавира — мощного ингибитора цитохрома P450 (400 мг 2 раза в сутки), приводит к 4-кратному (на 300%) повышению C_{max} и 11-кратному (на 1000%) повышению АUC силденафила. Силденафил не оказывает влияния на фармакокинетику ритонавира и саквинавира. Ингибиторы CYP2C9 (толбутамид, варфарин), CYP2D6 (селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, трициклические антидепрессанты), тиазиды и тиазидоподобные диуретики, петлевые и калийсберегающие диуретики, ингибиторы АПФ, антагонисты кальция, бета-адреноблокаторы и индукторы цитохрома P450 (рифампицин, барбитураты) не оказывают влияния на фармакокинетику силденафила. Предполагается, что при одновременном приеме силденафила с индукторами CYP3A4 (рифампицин и др.), его плазменная концентрация будет уменьшаться. АUC активного метаболита силденафила увеличивается на 62% при приеме петлевых и калийсберегающих диуретиков и на 102% — при приеме неспецифических бета-адреноблокаторов (клиническое значение этих эффектов не определено). Не выявлено признаков взаимодействия с амлодипином (5 и 10 мг): среднее дополнительное понижение АД в положении лежа (сАД на 8 мм рт.ст., дАД на 7 мм рт.ст.) сопоставимо с таковым при приеме одного силденафила здоровыми добровольцами. Не усиливает гипотензивное действие алкоголя у здоровых добровольцев при концентрации алкоголя в крови до 80 мг/дл.

Особые указания:

Перед началом приема для диагностики нарушений эрекции, определения возможных ее причин и выбора адекватных методов лечения необходимо собрать полный анамнез и провести тщательное урологическое и общеклиническое обследование, особенно у больных с сопутствующими сердечно-сосудистыми заболеваниями, для которых повышенная сексуальная активность нежелательна (например, при тяжелых формах ИБС и артериальной гипертензии). У пациентов старше 65 лет, с печеночной и тяжелой почечной недостаточностью (Сl креатинина менее 30 мл/мин), а также при одновременном применении ингибиторов цитохрома P450 3A4 (эритромицин, кетоконазол, итраконазол, саквинавир и др.), начальная доза составляет 25 мг. При одновременном приеме ритонавира максимальная разовая доза не должна превышать 25 мг в течение 48 ч.

Имеются сообщения о редких случаях эрекции, продолжающейся свыше 4 ч, и приапизме, требующих немедленного медицинского вмешательства во избежание повреждения тканей полового члена и необратимой импотенции.

Безопасность препарата Силомен при одновременном приеме с другими средствами для лечения эректильной дисфункции не изучалась, одновременный прием не рекомендуется.

Влияние на способность вождения автомобиля и управление движущимися механизмами.

Возможны головокружение и нарушения зрения, пациенты должны соблюдать осторожность при вождении автомобиля и управлении движущимися механизмами.

Форма выпуска:

4 таблетки покрытые пленочной оболочкой в каждом блистере. Один блистер в картонной упаковке вместе с инструкцией по применению.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С и в местах, недоступных для детей.

Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

Без рецепта.