

[Инструкция Эректил таблетки по 50 мг №12 \(12x1\)](#)

ВНИМАНИЕ! Вся информация взята из открытых источников и предоставляется исключительно в ознакомительных целях.

Эректил таблетки по 50 мг №12 (12x1)



Действующее вещество: Силденафил

Лекарственная форма: Таблетки

Фармакотерапевтическая группа: Средства, применяемые при нарушении эрекции. Силденафил.

Состав

действующее вещество: sildenafil;

1 таблетка содержит силденафила цитрата в пересчете на силденафил – 50 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, натрия кроскармеллоза, алюминия гидроксид (тонкий порошок, гидрагилит), повидон, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

Лекарственная форма

Таблетки.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, применяемые при эректильной дисфункции. Силденафил. Код АТС G04В E03.

Показания

Лечение нарушений эрекции, которые определяются как неспособность достичь и поддержать эрекцию полового члена, необходимую для успешного полового акта.

Для эффективного действия Эректилу необходимо сексуальное возбуждение.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к активному веществу или к любому из вспомогательных веществ препарата.
- Одновременное применение с донорами оксида азота (такими как амилнитрат) или нитратами в любой форме противопоказано, поскольку известно, что силденафил влияет на пути метаболизма оксида азота/циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) и потенцирует гипотензивный эффект нитратов.
- Лекарственные средства для лечения эректильной дисфункции, включая силденафил, противопоказаны мужчинам, которым не рекомендована половая активность (например пациенты с тяжелыми сердечно-сосудистыми расстройствами, такими как нестабильная стенокардия и сердечная недостаточность тяжелой степени).
- Пациентам с потерей зрения на один глаз вследствие неартериальной передней ишемической нейропатии зрительного нерва, независимо от того, связана ли эта патология с предыдущим применением ингибиторов ФДЕ5.
- Пациентам со следующими заболеваниями: 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 фосфодиэстераз сетчатки), поскольку безопасность силденафила исследовалась в таких подгрупп пациентов.

Способ применения и дозы

Препарат применяют перорально.

Рекомендуемая доза препарата Эректил составляет 50 мг и применяется при необходимости примерно за час до полового акта. В зависимости от эффективности и переносимости препарата дозу можно увеличить до 100 мг или снизить до 25 мг. Максимальная рекомендуемая доза составляет 100 мг.

Максимальная рекомендованная частота применения препарата составляет 1 раз в сутки. При применении препарата Эректил во время приема пищи действие препарата может наступать позднее, чем при его применении натощак.

Пациенты пожилого возраста.

Необходимость в коррекции дозы у пациентов пожилого возраста отсутствует.

Пациенты с почечной недостаточностью.

Пациентам с почечной недостаточностью легкой и умеренной степени тяжести (клиренс креатинина от 30 до 80 мл/мин) рекомендованная обычная доза препарата.

Поскольку у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (клиренс креатинина

ниже 30 мл/мин) клиренс силденафила снижен, рекомендуемая доза препарата составляет 25 мг. В зависимости от эффективности и переносимости препарата дозу можно увеличить до 50 мг и 100 мг.

Пациенты с печеночной недостаточностью.

Поскольку у пациентов с печеночной недостаточностью (например, циррозом) клиренс силденафила снижен, рекомендуемая доза препарата составляет 25 мг. В зависимости от эффективности и переносимости препарата дозу можно увеличить до 50 мг и 100 мг.

Пациенты, которые применяют другие лекарственные средства.

Рекомендуемая начальная доза препарата пациентам, которые применяют ингибиторы СУРЗА4, за исключением ритонавира, составляет 25 мг. При одновременном приеме с ритонавиром максимальная разовая доза силденафила не должна превышать 25 мг в течение 48 часов.

С целью минимизации риска развития ортостатической гипотензии состояние пациентов, которые применяют блокаторы альфа-адренорецепторов, должно быть стабилизировано до начала применения силденафила. Также рекомендуемая доза силденафила составляет 25 мг.

Препарат Эректил не предназначен для применения женщинами.

Побочные реакции

На основе данных по безопасности частыми побочными реакциями были: головная боль, приливы крови, диспепсия, расстройства зрения, заложенность носа, головокружение и нарушение восприятия цвета.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности.

Со стороны нервной системы: головная боль; головокружение; сонливость, гипестезия; синкопе, инсульт, обморок (эпилептический приступ, рецидив эпилептического приступа); транзиторная ишемическая атака, судороги, рецидивы судорог.

Со стороны органов зрения: расстройства зрения (затуманивание зрения, повышенная чувствительность к свету), нарушение восприятия цвета (ахроматопсия: умеренной степени, транзиторная, главным образом цветное зрение); расстройства со стороны конъюнктивы, расстройства слезотечение, другие расстройства со стороны органов зрения: боль в глазах, покраснение глаз; неартериальная передняя ишемическая нейропатия зрительного нерва, окклюзия сосудов сетчатки, дефекты поля зрения.

Со стороны органов слуха и вестибулярного аппарата: головокружение, шум или звон в ушах; внезапная глухота*.

Со стороны сосудов: приливы крови к лицу; артериальная гипертензия, артериальная гипотензия.

Со стороны сердца: усиленное сердцебиение, ощущение сердцебиения, тахикардия; инфаркт миокарда, фибрилляция предсердий; желудочковая аритмия, нестабильная стенокардия, внезапная остановка сердца (сердечная смерть).

Со стороны респираторной системы, грудной клетки и средостения: заложенность носа

(ринит); носовое кровотечение.

Со стороны пищеварительного тракта: диспепсия; тошнота, рвота, сухость во рту.

Со стороны кожи и ее придатков: высыпания на коже; синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны м' мышечной, соединительной ткани и костей: миалгия.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: приапизм, удлинение эрекции.

Общие расстройства и реакции в месте введения: боль в груди, повышенная утомляемость.

Обследования: повышенная частота сердечных сокращений.

* - Расстройства со стороны органов слуха и вестибулярного аппарата: внезапная глухота. В рамках клинических исследований и постмаркетингового опыта при применении всех ингибиторов ФДЕ5, включая силденафил, сообщалось о небольшом количестве случаев внезапного снижения или потери слуха.

Передозировка

При применении разовой дозы силденафила до 800 мг побочные реакции были подобны тем, что 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, головокружения, диспепсии, заложенности носа, нарушений со стороны органов зрения).

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

Применение в период беременности или кормления грудью

Препарат Эректил не предназначен для применения женщинами.

В ходе исследований репродуктивной токсичности на животных при пероральном применении силденафила соответствующих побочных эффектов не наблюдалось.

Дети

Применение препарата противопоказано детям.

Особенности применения

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

Поскольку сексуальная активность сопровождается определенным риском со стороны сердца,

до начала любого лечения эректильной дисфункции врач должен оценить состояние сердечно-сосудистой системы пациента. Силденафил обладает сосудорасширяющим эффектом, что проявляется легким и кратковременным снижением артериального давления. До назначения силденафила врач должен тщательно взвесить, может ли такой эффект оказывать неблагоприятное влияние на пациентов с определенными основными заболеваниями, особенно в комбинации с сексуальной активностью. К пациентам с повышенной чувствительностью к вазодилататоров относятся пациенты с обструкцией выводного тракта левого желудочка (например, стеноз аорты, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия) или пациенты с редким синдромом мультисистемной атрофии, одним из проявлений которой является тяжелое нарушение артериального давления со стороны вегетативной нервной системы.

Эректил потенцирует гипотензивный эффект нитратов.

В постмаркетинговом периоде сообщалось о тяжелых побочных реакциях со стороны сердечно-сосудистой системы, включая инфаркт миокарда, нестабильную стенокардию, внезапную сердечную смерть, желудочковую аритмию, цереброваскулярные кровоизлияния, транзиторную ишемическую атаку, артериальную гипертензию и артериальную гипотензию, 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 лишь 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.

Средства для лечения эректильной дисфункции, в том числе и силденафил, следует назначать с осторожностью пациентам с анатомическими деформациями пениса (такими как ангуляция, кавернозный фиброз или болезнь Пейрони) или пациентам с состояниями, способствующими развитию приапизма (такими как серповидно-клеточная анемия, множественная миелома или лейкомия).

Безопасность и эффективность одновременного применения силденафила с другими методами лечения эректильной дисфункции не изучались. Поэтому применение таких комбинаций не рекомендуется.

Сообщалось о расстройствах зрения и случаи неартериальной передней ишемической нейропатии зрительного нерва, связанных с применением силденафила и других ингибиторов ФДЕ5. Пациентов следует предупредить, что в случае внезапного нарушения зрения применение препарата Эректил следует прекратить и немедленно обратиться к врачу.

Одновременное применение силденафила и ритонавира не рекомендуется.

Пациентам, которые применяют блокаторы альфа-адренорецепторов, применять силденафил следует с осторожностью, поскольку такая комбинация может привести к симптоматической гипотензии у некоторых предрасположенных к этому пациентов. Симптоматическая гипотензия обычно возникает в течение 4 часов после применения силденафила. С целью минимизации риска развития ортостатической гипотензии терапию силденафилом можно начинать только у гемодинамически стабильных пациентов, которые применяют блокаторы альфа-адренорецепторов. Рекомендуемая начальная доза таким пациентам составляет 25 мг силденафила. Кроме того, следует проинформировать пациентов о том, как действовать в случае появления симптомов ортостатической гипотензии.

Исследования тромбоцитов человека продемонстрировали, что *in vitro* силденафил потенцирует

антиагрегационные эффекты натрия нитропруссиды. Нет никакой информации относительно безопасности применения силденафила пациентам с нарушениями свертывания крови или острой пептической язвой. Таким образом, применение силденафила пациентами этой группы возможно лишь после тщательной оценки соотношения пользы и риска.

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

Исследований влияния препарата на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами не проводилось.

Поскольку в клинических исследованиях применения силденафила сообщалось о случаях головокружения и нарушениях со стороны органов зрения, перед тем, как садиться за руль транспортного средства или работать с механизмами, пациентам необходимо выяснить, какова их индивидуальная реакция на применение препарата Эректил.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Влияние других лекарственных средств на силденафил.

Метаболизм силденафила происходит преимущественно при участии изоформы 3A4 (основной путь) и изоформы 2C9 (второстепенный путь) цитохрома P450 (CYP). Поэтому ингибиторы этих изоферментов способны снижать клиренс силденафила.

Проведенные исследования продемонстрировали 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, рекомендуемая начальная доза силденафила составляет 25 мг.

Одновременное применение ингибитора ВИЧ-протеазы ритонавира, очень мощного ингибитора P450, в состоянии равновесной концентрации (500 мг 1 раз в сутки) и силденафила (разовая доза 100 мг) приводило к повышению C_{max} силденафила на 300 % (в 4 раза) и повышению плазменной AUC силденафила на 1000 % (в 11 раз). Через 24 часа плазменные уровни силденафила все еще составляли примерно 200 нг/мл по сравнению с уровнем примерно 5 нг/мл, характерным для применения силденафила отдельно, что соответствует значительному влиянию ритонавира на широкий спектр субстратов P450. Силденафил не влияет на фармакокинетику ритонавира. Учитывая эти фармакокинетические данные, одновременное применение силденафила и ритонавира не рекомендуется; в любом случае максимальная доза силденафила ни при каких обстоятельствах не должна превышать 25 мг в течение 48 часов.

Одновременное применение ингибитора ВИЧ-протеазы саквинавира, ингибитора CYP3A4, в дозе, обеспечивающей равновесную концентрацию (1200 мг трижды в сутки), и силденафила (100 мг разово) приводило к повышению C_{max} силденафила на 140 % и увеличению системной экспозиции (AUC) силденафила на 210 %. Не выявлено влияния силденафила на фармакокинетику саквинавира. Предполагается, что более мощные ингибиторы CYP3A4, такие как кетоконазол и итраконазол, будут иметь более выраженное влияние.

При применении силденафила (100 мг разово) и эритромицина, специфического ингибитора CYP3A4, в равновесном состоянии (500 мг дважды в сутки в течение 5 дней) наблюдалось повышение системной экспозиции силденафила на 182 % (AUC). У здоровых добровольцев

мужского пола не наблюдалось влияния азитромицина (500 мг в сутки в течение 3 суток) на AUC, C_{max} , T_{max} , константу скорости элиминации и последующий период полувыведения силденафила или его главного 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 плазменных концентраций силденафила на 56 %.

Грейпфрутовый сок является слабым ингибитором CYP3A4 в стенке кишечника и может вызвать умеренное повышение плазменных уровней силденафила.

Однократное применение антацидных средств (магния гидроксида/алюминия гидроксида) не влияет на биодоступность силденафила.

Хотя исследований специфического взаимодействия со всеми лекарственными средствами не проводилось, по данным популяционного фармакокинетического анализа, фармакокинетика силденафила не менялась при его 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 ангиотензинпревращающего фермента, антагонистов кальция, антагонистов бета-адренорецепторов или индукторов метаболизма CYP450 (такие как рифампицин, барбитураты).

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

Влияние азитромицина (500 мг в сутки в течение 3 суток) на скорость выведения и период полужизни силденафила или его основных метаболитов не доказан.

Влияние силденафила на другие лекарственные средства.

Было доказано, что силденафил – слабый ингибитор изоформ 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 3A4 ($IC_{50} > 150$ мкмоль) цитохрома P450. Поскольку максимальные плазменные концентрации силденафила равны примерно 1 мкмоль, влияние силденафила на клиренс субстратов этих изоферментов маловероятно.

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

Поскольку известно, что силденафил влияет на метаболизм оксида азота/циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ), было установлено, что этот препарат потенцирует гипотензивное действие нитратов, поэтому его одновременное применение с донорами оксида азота или с нитратами в любой форме противопоказано.

У некоторых, предрасположенных к этому пациентов, одновременное применение силденафила и блокаторов альфа-адренорецепторов может привести к развитию симптоматической гипотензии, что чаще всего возникало в течение 4 часов после применения силденафила. При одновременном применении силденафила и доксазозину у пациентов, стабилизация состояния которых была достигнута при применении доксазозину, иногда сообщалось о развитии симптоматической ортостатической гипотензии. В этих сообщениях речь шла о случаях головокружения и предобморочном состоянии, но без синкопе.

Не наблюдалось никаких значимых взаимодействий при одновременном применении

силденафила (50 мг) и толбутамида (250 мг) или варфарина (40 мг), которые метаболизируются CYP2C9.

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

Силденафил (50 мг) не потенцировал гипотензивное действие алкоголя при средних максимальных уровнях этанола крови 80 мг/дл.

У пациентов, которые применяли силденафил, не наблюдалось никаких различий профиля побочных эффектов по сравнению с плацебо при одновременном применении таких классов гипотензивных лекарственных средств, как диуретики, блокаторы бета-адренорецепторов, ингибиторы АПФ, антагонисты ангиотензина II, антигипертензивные лекарственные средства (сосудорасширяющие и центрального действия), блокаторы адренергических нейронов, блокаторы кальциевых каналов и блокаторы альфа-адренорецепторов.

Не отмечено взаимодействия силденафила (100 мг) и амлодипина у пациентов с артериальной гипертензией.

Анализ безопасности показал, что нет разницы в профиле побочных реакций у пациентов, которые применяют этот препарат вместе с антигипертензивными препаратами.

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

Фармакологические свойства

Фармакодинамика. Силденафил является препаратом для перорального применения, предназначенный для лечения эректильной дисфункции. При половой стимуляции препарат восстанавливает сниженную эректильную функцию путем усиления притока крови к пенису.

Физиологический механизм, что приводит к эрекции включает высвобождение оксида азота (NO) в кавернозных телах во время сексуального возбуждения. Высвобожденный оксид азота активирует фермент гуанилатциклазу, который стимулирует повышение уровня циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) который, в свою очередь, вызывает расслабление гладкой мускулатуры кавернозных тел, способствуя притоку крови.

Силденафил является мощным и селективным ингибитором цГМФ-специфической фосфодиэстеразы 5 (ФДЕ5) в кавернозных телах, где ФДЕ5 отвечает за распад цГМФ. Эффекты силденафила на эрекцию носят периферический характер. Силденафил не оказывает непосредственно релаксирующей действия на изолированные кавернозные тела человека, но мощно усиливает расслабляющее действие NO на данную ткань. При активации метаболического пути NO/цГМФ, что происходит при половой стимуляции, ингибирование силденафилом ФДЕ5 приводит к повышению уровня цГМФ в кавернозных телах. Таким образом, для того, чтобы силденафил вызвал необходимый фармакологический эффект, необходимо сексуальное возбуждение.

Исследования *in vitro* показали селективность влияния силденафила на ФДЕ5, что принимает активное участие в процессе эрекции. Эффект силденафила на ФДЕ5 мощнее, чем на другие известные фосфодиэстеразы. Этот эффект в 10 раз мощнее, чем эффект на ФДЕ6, что участвует в процессах преобразования, связанные, в сетчатке. При применении максимальных рекомендованных доз селективность силденафила к ФДЕ5 в 80 раз превышает его

селективность к ФДЕ1, в 700 раз выше, чем к ФДЕ2, ФДЕ3, ФДЕ4, ФДЕ7, ФДЕ8, ФДЕ9, ФДЕ10 и ФДЕ11. В частности, селективность силденафила к ФДЕ5 в 4000 раз превышает его селективность к ФДЕ3 – цГМФ-специфической изоформы фосфодиэстеразы, участвующей в регуляции сердечной сократимости.

Силденафил вызывает легкое и кратковременное снижение артериального давления, что в большинстве случаев не имеет клинических проявлений.

Однократное пероральное применение силденафила в дозах до 100 мг у здоровых добровольцев не вызвало никаких клинически значимых изменений на электрокардиограмме.

В исследовании гемодинамических эффектов однократного перорального применения силденафила в дозе 100 мг у пациентов с тяжелой ишемической болезнью сердца (ИБС) (со стенозом менее одной коронарной артерии более 70 %) среднее систолическое и диастолическое артериальное давление в состоянии покоя снизилось на 7 % и 6 % соответственно относительно исходного уровня. Средний легочный систолическое давление снизилось на 9 %. Силденафил не приводил к изменению показателей сердечного выброса и не уменьшал кровоток по стенозованным коронарным артериям.

Никаких клинически значимых различий не было продемонстрировано для времени до возникновения лимитирующей стенокардии при применении силденафила по сравнению с плацебо в вдвойне-слепых, плацебо-контролируемых клинических исследованиях с использованием теста с физической нагрузкой у пациентов с эректильной дисфункцией и хронической стабильной стенокардией, которые постоянно применяли антиангинальные лекарственные средства (за исключением нитратов).

Легкие и временные нарушения способности различать цвета (голубой/зеленый) были обнаружены у некоторых пациентов при проведении 100-видтинкового теста Фарнворта-Манселла через 1 час после применения силденафила в дозе 100 мг. Эти эффекты полностью исчезали через 2 часа после применения препарата. Возможный механизм этого изменения в распознавании цветов связан с ингибированием ФДЕ6, что участвует в фотоперетворительном каскаде реакций в сетчатке. Силденафил не влияет на остроту зрения или контрастную чувствительность.

Однократное пероральное применение силденафила в дозе 100 мг здоровыми добровольцами не влияло на подвижность или морфологию сперматозоидов.

Безопасность и эффективность силденафила подтверждены данными долгосрочных исследований.

Фармакокинетика.

Абсорбция. Силденафил быстро абсорбируется. Максимальные плазменные концентрации препарата достигаются в течение 30-120 мин (с медианой 60 минут) после его перорального применения натощак. Средняя абсолютная биодоступность после перорального применения составляет 41 % (с диапазоном значений от 25 до 63 %). В рекомендованном диапазоне доз (от 25 до 100 мг) показатели AUC и C_{\max} силденафила после его перорального применения повышаются пропорционально дозе.

При применении силденафила во время приема пищи степень абсорбции снижается со средним удлинением T_{\max} до 60 минут и средним снижением C_{\max} на 29 %.

Распределение. Средний равновесный объем распределения (V_d) составляет 105 литров, что

свидетельствует о распределении препарата в тканях организма. После однократного перорального применения 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-деметилметаболиту с белками плазмы достигает 96 %, средняя максимальная плазменная концентрация свободного силденафила достигает 18 нг/мл (38 нмоль). Степень связывания с белками плазмы не зависит от общих концентраций силденафила.

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

Метаболизм. Метаболизм силденафила осуществляется главным образом при участии микросомальных изоферментов печени CYP3A4 (главный путь) и CYP2C9 (второстепенный путь). Главный циркулирующий метаболит образуется путем N-деметилирования силденафила. Селективность метаболита по отношению к ФДЕ5 сопоставима с селективностью силденафила, а активность метаболита по отношению к ФДЕ5 составляет примерно 50 % от активности исходного вещества. Плазменные концентрации этого метаболита составляют примерно 40 % от концентрации силденафила в плазме крови. N-деметильований метаболит подвергается дальнейшему метаболизму, а период его полувыведения составляет приблизительно 4 часа.

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

Фармакокинетика у пациентов особых групп.

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-деметильованого метаболита приблизительно на 90 % по сравнению с соответствующими концентрациями у здоровых добровольцев младшего возраста (18-45 лет). В связи с возрастными отличиями в связывании с белками плазмы крови, соответствующее повышение плазменной концентрации свободного силденафила составляло примерно 40 %.

Пациенты с недостаточностью функции почек. У добровольцев с нарушениями функции почек легкой и умеренной степени тяжести (клиренс креатинина от 30 до 80 мл/мин), фармакокинетика силденафила оставалась неизменной после его однократного перорального применения в дозе 50 мг. Средние AUC и C_{max} N-деметильованого метаболита повышались на 126 % и 73 % соответственно по сравнению с такими показателями у добровольцев аналогичного возраста без нарушений функции почек. Однако из-за высокой межиндивидуальной вариабельности 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 повышениям AUC и C_{max} на 100 % и 88 % соответственно по сравнению с добровольцами аналогичного возраста без нарушений функции почек. Кроме того, значения AUC и C_{max} N-деметильованого метаболита значимо повышались на 79 % и 200 % соответственно.

Пациенты с недостаточностью функции печени. У добровольцев с циррозом печени легкой и умеренной степени тяжести (классов А и В по классификации Чайлд-Пью) клиренс

силденафила снижался, что приводило к повышению AUC (84 %) и C_{max} (47 %) по сравнению с добровольцами аналогичного возраста без нарушений функций печени. Фармакокинетика силденафила у пациентов с нарушениями функций печени тяжелой степени не изучалась.

Основные физико-химические свойства

таблетки белого с серым оттенком цвета, круглой формы, верхняя и нижняя поверхности которых выпуклые; на одну с поверхностей нанесена риска для деления.

Срок годности

2,5 года.

Не применять препарат после окончания срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 1 таблетке или по 6 таблеток в блистере; по 1 блистеру в пачке.

По 12 таблеток в блистере, по 1 или 2 блистера в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ООО «Стиролбиофарм».

Местонахождение

84610, Украина, Донецкая обл., г. Горловка, ул. Горловской дивизии, 97.

Внимание! Текст описания препарата "Эректил таблетки по 50 мг №12 (12x1)" предоставлен для общей информации и ознакомления и является упрощённым вариантом официальной аннотации к лекарству. Перед приобретением и использованием препарата обязательно обратитесь к врачу и получите профессиональные рекомендации. Данный текст размещён на портале сугубо для ознакомительных целей и не может служить основанием для самолечения. Только врач может выносить решение о назначении того или иного лекарства, определять дозу и график приёма.