

Инструкция для препаратов Виагра, Виагра PRO, Виагра Soft

Фармакологическое действие:

Виагра является пероральным препаратом, предназначенным для лечения нарушений эрекции. Он восстанавливает нарушенную эректильную функцию и обеспечивает естественный ответ на сексуальное возбуждение. Физиологический механизм эрекции полового члена предполагает высвобождение окиси азота (N0) в кавернозном теле при сексуальной стимуляции. Окись азота активирует фермент гуанилатциклазу, что приводит к повышению уровня циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ), расслаблению гладких мышц кавернозного тела и усилению кровотока в половом члене. Силденафил – мощный и селективный ингибитор цГМФ-специфической фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5), которая ответственна за распад цГМФ в кавернозном теле. Виагра оказывает периферическое действие на эрекцию. Силденафил не оказывает прямого расслабляющего влияния на кавернозное тело, но активно усиливает расслабляющий эффект N0 на эту ткань. При активации пути MO/цГМФ, наблюдающейся при сексуальном возбуждении, угнетение ФДЭ5 под влиянием силденафила приводит к увеличению уровней цГМФ в кавернозном теле. В связи с этим для проявления благоприятного фармакологического эффекта Виагры необходима сексуальная стимуляция.

Фармакокинетические свойства:

Всасывание

Виагра быстро всасывается. Концентрация препарата в плазме после приема его внутрь натощак достигает пика в течение 30-120 мин (в среднем 60 мин). Абсолютная биодоступность при приеме внутрь в среднем составляет 41% (25-63%). Фармакокинетика Виагры при приеме внутрь в рекомендуемом диапазоне доз (25-100 мг) является линейной. При приеме Виагры в сочетании с жирной пищей скорость всасывания снижается.

Распределение

Объем распределения (Vss) силденафила в равновесном состоянии составляет в среднем 105 л, что указывает на его распределение в тканях. Силденафил и его основной циркулирующий М-десметилловый метаболит примерно на 96% связываются с белками плазмы. Связывание с белками не зависит от общей концентрации препарата. У здоровых добровольцев, получавших Виагру (однократно по 100 мг), менее 0,0002% (в среднем 188 нг) дозы обнаруживали в сперме через 90 мин после приема.

Метаболизм

Силденафил метаболизируется главным образом под действием CYP3A4 (основной путь) и CYP2C9 (дополнительный путь) микросомальных изоферментов печени. Основной циркулирующий метаболит образуется в результате М-десметилирования силденафила. По селективности действия на ФДЭ метаболит сопоставим с силденафилом, а его активность в отношении ФДЭ5 составляет примерно 50% активности самого препарата. Концентрации метаболита в плазме составляют примерно 40% от таковых силденафила. М-десметилметаболит подвергается дальнейшему метаболизму; конечный период его полувыведения равен около 4 часов.

Выведение

Общий клиренс силденафила из организма равен 41 л/ч, а конечный период полувыведения – 3-5 ч. После приема внутрь или внутривенного введения силденафил выводится в виде метаболитов в основном с калом (примерно 80% введенной дозы) и в меньшей степени с мочой (примерно 13% введенной дозы).

Показания к применению:

Виагру применяют для лечения нарушений эрекции физиологической и психологической природы, а также с целью повышения качества полового акта.

Способ применения:

Таблетки данного препарата принимают внутрь, примерно за один час до планируемого полового акта. Таблетки, покрытые оболочкой – Виагра и Виагра Pro, рекомендуется принимать целиком, запивая достаточным количеством питьевой воды или чая. Таблетки, предназначенные для сублингвального употребления – Виагра Soft, рассасывают под языком.

Оптимальная разовая доза для взрослых составляет 100 мг один раз в сутки. Учитывая индивидуальную переносимость и эффективность препарата, доза может быть уменьшена до 50 мг или увеличена до 150 мг. Для лиц пожилого возраста не нужно изменять стандартную дозировку.

Противопоказания:

Препарат противопоказан лицам с гиперчувствительностью к компонентам препарата и с анатомическими деформациями полового члена (болезнь Пейрони, кавернозный фиброз, ангуляция). Также не следует применять данный препарат при следующих нарушениях: — повышенная склонность к кровотечениям; — обострение язвенной болезни желудочно-кишечного тракта; — нарушения работы печени, особенно тяжелая почечная недостаточность или цирроз; — заболевания, развивающие приапизм, в том числе лейкопения, миеломная болезнь и серповидно-клеточная анемия; — тяжелая форма гипотензии или артериальной гипертензии; различные заболевания сердца, в том числе нестабильная стенокардия, аритмия в опасной форме и сердечная недостаточность. Если пациент пережил инсульт или инфаркт миокарда, то в последующие шесть месяцев препарат применять не следует. Также Виагра не назначается детям. Категорически запрещено одновременное использование данного препарата с нитратами и донаторами оксида азота. Мужчинам, которым противопоказана сексуальная активность, не следует назначать Виагру.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Прием эритромицина, циметидина и кетоконазола характерен снижением клиренса и последующем повышении содержания силденафила в плазме крови пациента. Виагра совместно с натрия нитропруссидом усиливает его антиагрегантный эффект. Также при сочетании с нитратами препарат усиливает их гипотензивный эффект. Это может привести даже к летальному исходу. Также опасен для жизни одновременный прием препарата с гипогликемическими пероральными лекарственными средствами, БМКК и бета-адреноблокаторами.

Влияние других препаратов на Виагру

Метаболизм силденафила происходит главным образом под влиянием изоформ 3A4 (основной путь) и 2C9 (менее значимый путь) цитохрома P450. Следовательно, ингибиторы этих изоферментов могут уменьшить клиренс силденафила.

Циметидин (800 мг), являющийся неспецифическим ингибитором CYP3A4, при одновременном приеме с Виагрой вызывал повышение концентрации силденафила плазмы на 56% у здоровых добровольцев. Популяционный фармакокинетический анализ результатов клинического исследования продемонстрировал снижение клиренса силденафила при одновременном применении ингибиторов CYP3A4 (таких как кетоконазол, эритромицин, циметидин). Однако частота нежелательных явлений у этих пациентов не увеличилась.

Однократный прием антацида (магния гидроокиси/алюминия гидроокиси) не влиял на биодоступность Виагры. По данным популяционного фармакокинетического анализа, ингибиторы CYP2C9 (такие как толбутамид, варфарин), CYP2D6 (такие как селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, трициклические антидепрессанты), тиазиды и тиазидоподобные диуретики, петлевые и калийсберегающие диуретики, ингибиторы АПФ, антагонисты кальция, бета-адреноблокаторы и индукторы метаболизма CYP450 (такие как рифампицин, барбитураты) не оказывали влияния на фармакокинетику силденафила.

Влияние Виагры на другие препараты

Силденафил является слабым ингибитором изоферментов цитохрома P450 – 1A2, 2C9, 2C19, 206, 2E1 и 3A4 (ИК, >150 мкмоль). При применении силденафила в рекомендуемых дозах максимальная концентрация его в плазме составляет около 1 мкмоль, поэтому мало вероятно, что препарат Виагра способен повлиять на клиренс субстратов этих изоферментов.

Признаков существенного взаимодействия с толбутамидом (250 мг) или варфарином (40 мг), которые метаболизируются CYP2C9, не выявлено. Препарат Виагра (50 мг) не вызывал дополнительного увеличения времени кровотечения при приеме аспирина (150 мг). Препарат Виагра (50 мг) не усиливал гипотензивное действие алкоголя у здоровых добровольцев при максимальном уровне алкоголя в крови в среднем 80 мг/дл. У больных с артериальной гипертонией признаков взаимодействия Виагры (100 мг) с амлодипином не выявлено. Среднее дополнительное снижение артериального давления в положении лежа (систолического – на 8 мм рт. ст., диастолического – на 7 мм рт. ст.) было сопоставимо с таковым при приеме одной Виагры у здоровых добровольцев (см. Фармакодинамические свойства). Анализ информации о безопасности продемонстрировал отсутствие различий в характере побочных эффектов у больных, получавших Виагру в сочетании с антигипертензивными средствами и без них. Препарат Виагра усиливал гипотензивное действие нитратов в острой пробе и при длительном применении последних. В связи с этим, применение Виагры в сочетании с нитратами или донаторами окиси азота противопоказано.