

Сиалис®

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, миндалевидной формы, с обозначением "С 20" на одной стороне.

Владелец регистрационного удостоверения

ELI LILLY VOSTOK (Швейцария)

Регистрационный номер

П N014761/01

Латинское название

Cialis®

Действующее вещество

тадалафил (tadalafil)

АТХ

G04BE08 Тадалафил

Фармакологическая группа

Эректильной дисфункции средство лечения - ФДЭ5 ингибитор

Нозологическая классификация (МКБ-10)

F52.2 Недостаточность генитальной реакции (импотенция психогенная)

N48.4 Импотенция органического происхождения

Состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, миндалевидной формы, с обозначением "С 20" на одной стороне.

1 таб.

тадалафил

20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 245.195 мг, гипролоза (гидроксипропилцеллюлоза) - 8.05 мг, кроскармеллоза натрия - 22.4 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 52.5 мг, магния стеарат - 0.875 мг, натрия лаурилсульфат - 0.98 мг.

Состав пленочной оболочки: смесь красителя опадрай II желтый (лактозы моногидрат, гипромеллоза, титана диоксид, триацетин, краситель железа оксид желтый) - 14 мг.

1 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.2 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.2 шт. - блистеры (2)

- пачки картонные.2 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Описание лекарственной формы

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, миндалевидной формы, с обозначением "С 20" на одной стороне.

Фармакологические свойства

Средство для лечения нарушений эрекции, является обратимым селективным ингибитором специфической ФДЭ5 цГМФ. Когда сексуальное возбуждение вызывает местное высвобождение оксида азота, ингибирование ФДЭ5 тадалафилом приводит к повышению уровня цГМФ в кавернозном теле полового члена. Следствием этого является релаксация гладких мышц артерий и приток крови к тканям полового члена, что и вызывает эрекцию. Тадалафил неэффективен при отсутствии сексуального стимулирования.

Исследования *in vitro* показали, что тадалафил является селективным ингибитором ФДЭ5. ФДЭ5 - фермент, обнаруженный в гладких мышцах кавернозного тела, в гладких мышцах сосудов внутренних органов, в скелетных мышцах, тромбоцитах, почках, легких, мозжечке.

Действие тадалафила на ФДЭ5 является более активным, чем на другие фосфодиэстеразы. Тадалафил в 10 000 раз активнее в отношении ФДЭ5, чем в отношении ФДЭ1, ФДЭ2, ФДЭ4, которые локализируются в сердце, головном мозге, кровеносных сосудах, печени и в других органах. Тадалафил в 10 000 раз активнее блокирует ФДЭ5, чем ФДЭ3 - фермент, который обнаруживается в сердце и кровеносных сосудах. Эта селективность в отношении ФДЭ5, по сравнению с ФДЭ3, имеет важное значение, поскольку ФДЭ3 является ферментом, принимающим участие в сокращении сердечной мышцы. Кроме того, тадалафил приблизительно в 700 раз активнее в отношении ФДЭ5, чем в отношении ФДЭ6, обнаруженной в сетчатке и являющейся ответственной за фотопередачу. Тадалафил также в 10 000 раз активнее в отношении ФДЭ5, по сравнению с его влиянием на ФДЭ7-ФДЭ10.

Действует в течение 36 ч. Эффект проявляется уже через 16 мин после приема внутрь при наличии сексуального возбуждения.

Тадалафил у здоровых лиц не вызывает достоверного изменения систолического и диастолического давления, по сравнению с плацебо в положении лежа (среднее максимальное снижение составляет 1.6/0.8 мм рт.ст. соответственно) и стоя (среднее максимальное снижение составляет 0.2/4.6 мм рт.ст. соответственно). Тадалафил не вызывает достоверного изменения ЧСС.

Тадалафил не вызывает изменений распознавания цвета (голубой/зеленый), что объясняется его низким сродством к ФДЭ6. Кроме того, не отмечается влияния тадалафила на остроту зрения, электроретинограмму, внутриглазное давление и размер зрачка.

Клинически значимого влияния на характеристики спермы у мужчин, принимавших тадалафил в суточных дозах в течение 6 мес, не выявлено.

После приема внутрь тадалафил быстро всасывается. Стах достигается в среднем через 2 ч. Скорость и степень всасывания не зависят от приема пищи. Фармакокинетика тадалафила у здоровых лиц линейна в отношении времени и дозы. В диапазоне доз от 2.5 до 20 мг АUC увеличивается пропорционально дозе. C_{ss} в плазме достигаются в течение 5 дней при приеме препарата 1 раз/сут.

Фармакокинетика тадалафила у пациентов с нарушением функции эрекции аналогична фармакокинетике препарата у лиц без нарушения функции эрекции.

V_d составляет около 63 л, что указывает на то, что тадалафил распределяется в тканях организма. В терапевтических концентрациях 94% тадалафила связывается с белками плазмы. У здоровых лиц менее 0.0005% введенной дозы обнаружено в сперме.

Метаболизируется с участием изофермента CYP3A4. Основным циркулирующим метаболитом является метилкатехолглюкуронид, который в 13 000 раз менее активен в отношении ФДЭ5, чем тадалафил, поэтому маловероятно, что этот метаболит является клинически значимым.

У здоровых лиц средний клиренс тадалафила при приеме внутрь составляет 2.5 л/ч, а средний T_{1/2} - 17.5 ч. Тадалафил выводится преимущественно в виде неактивных метаболитов, в основном с калом (около 61%) и в меньшей степени с мочой (около 36%).

У пациентов с почечной недостаточностью легкой (КК от 51 до 80 мл/мин) или средней степени тяжести (КК от 31 до 50 мл/мин) АUC больше, чем у здоровых лиц.

Показания

Нарушения эрекции.

Противопоказания

Одновременный прием препаратов, содержащих любые органические нитраты; детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к тадалафилу.

Способ применения и дозы

Мужчинам среднего возраста рекомендуется принимать в дозе 20 мг как минимум за 16 мин до предполагаемой сексуальной активности независимо от приема пищи. Пациенты могут осуществлять попытку полового акта в любое время в течение 36 ч после приема для того, чтобы установить оптимальное время ответа на прием тадалафила. Максимальная частота приема - 1 раз/сут.

Побочные действия

Наиболее часто: головная боль, диспепсия.

Возможно: боль в спине, миалгия, заложенность носа, приливы крови к лицу.

Редко: отек век, боль в глазах, гиперемия конъюнктивы, головокружение.

Особые указания

С особой осторожностью и только в случае крайней необходимости возможно применение тадалафила у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени ($КК \leq 30$ мл/мин) и тяжелой печеночной недостаточностью.

На фоне лечения тадалафилем у пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести ($КК$ от 31 до 50 мл/мин) чаще отмечались боли в спине по сравнению с пациентами с почечной недостаточностью легкой степени тяжести ($КК$ от 51 до 80 мл/мин) или здоровыми добровольцами. У пациентов с $КК \leq 50$ мл/мин тадалафил следует применять с осторожностью.

Поэтому лечение эректильной дисфункции, в т.ч. с применением тадалафила, не следует проводить у мужчин с такими заболеваниями сердца, при которых сексуальная активность не рекомендована.

Следует учитывать потенциальный риск развития осложнений при сексуальной активности у пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы: инфаркт миокарда в течение последних 90 дней; нестабильная стенокардия или стенокардия, возникающая во время полового акта; хроническая сердечная недостаточность (II функциональный класс и выше по классификации NYHA), развившаяся в течение последних 6 месяцев; неконтролируемые нарушения сердечного ритма; артериальная гипотензия (АД менее 90/50 мм рт.ст.) или неконтролируемая артериальная гипертензия; инсульт, перенесенный в течение последних 6 месяцев.

С осторожностью следует применять тадалафил у пациентов с предрасположенностью к приапизму (например, при серповидно-клеточной анемии, множественной миеломе или лейкемии) или у пациентов с анатомической деформацией полового члена (например, при ангуляции, кавернозном фиброзе или болезни Пейрони).

Пациент должен быть проинформирован о необходимости немедленного обращения к врачу в случае возникновения эрекции, продолжающейся 4 ч и более. Несвоевременное лечение приапизма приводит к повреждению тканей полового члена, в результате этого может наступить долговременная потеря потенции.

На фоне применения тадалафила о случаях приапизма не сообщалось.

Не рекомендуется применять тадалафил в комбинации с другими видами лечения эректильной дисфункции.

Форма выпуска

таб., покр. пленочной оболочкой, 20 мг: 1, 2, 4 или 8 шт.

Производитель

LILLY DEL CARIBE (Пуэрто-Рико)

Условия выпуска из аптек

Отпускается по рецепту.