

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ПОТЕНЦІАЛЕ
(POTENTIALE)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: силденафіл; {1-[[3-(6,7-дигідро-1-метил-7-оксо-3-пропіл-1H-піразоло[4,3-α]піримідин-5-іл)4-етоксифеніл]сульфоніл-4-метил-піперазину цитрат};

основні фізико-хімічні властивості: таблетки з дозуванням 50 мг, вкриті оболонкою, блакитного кольору; таблетки з дозуванням 100 мг, вкриті оболонкою, синього кольору, з двоопуклою поверхнею. На поперечному розрізі видно два шари;

склад: 1 таблетка містить силденафілу – 50 мг або 100 мг (у вигляді силденафілу цитрату);

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, кроскармелоза натрію (натрію карбоксиметилцелюлоза), гіпромелоза, магнію стеарат, аеросил, титану діоксид, тальк, пропіленгліколь, макрогол 6000 (поліетиленгліколь 6000), індигокармін.

Форма випуску. Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що застосовуються при еректильній дисфункції. Силденафіл. Код АТС G04B E03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Препарат належить до групи засобів, що стимулюють центральну нервову систему (переважно на рівні спинного мозку), оскільки є дані про його ефективність при порушеннях потенції, пов'язаних з ураженнями спинного мозку, а також при нейрогенних порушеннях потенції. Однак основне значення надається здатності силденафілу вибірково інгібувати активність ферменту фосфодіестерази типу V, що здійснює інактивацію циклічного гуанозинмонофосфату (ц-ГМФ), який бере участь у розслабленні мускулатури кавернозного тіла і покращує кровопостачання статевого члена. Силденафіл не чинить пряму розслаблюючу дію на судини кавернозного тіла, але посилює судинорозширювальний ефект вивільненого при сексуальній стимуляції оксиду азоту (NO).

Фармакокінетика. При прийомі внутрішньо силденафіл швидко всмоктується. Максимальна концентрація в плазмі крові досягається в середньому через 60 хв.

Показання для застосування. Потенціале призначається для лікування порушень ерекції, що визначаються як нездатність досягти та підтримати ерекцію статевого члена, необхідну для успішного статевого акту.

Спосіб застосування та дози. Таблетки призначені для перорального прийому.

Застосування у дорослих. Рекомендована доза дорослим (чоловікам старше 18 років) становить 50 мг, дозу приймають за необхідності, приблизно за годину до сексуальних дій. Враховуючи ефективність і переносимість, дозу можна збільшити до 100 мг або зменшити до 25 мг. Максимальна рекомендована доза становить 100 мг. Максимальна рекомендована частота застосування - один раз на добу. Активність Потенціале може виявлятися через більший строк при прийомі з їжею, порівняно з прийомом натщесерце.

Застосування у пацієнтів з порушенням функції нирок. Пацієнтам з нирковою недостатністю легкого та середнього ступеня тяжкості (кліренс креатиніну становить 30 - 80 мл/хв) режим дозування не змінюється. Оскільки у пацієнтів з тяжкою нирковою недостатністю (кліренс креатиніну < 30 мл/хв) кліренс силденафілу знижений, застосування препарату потрібно починати з дози 25 мг.

Застосування у пацієнтів з порушенням функції печінки. Оскільки у пацієнтів з печінковою недостатністю кліренс силденафілу знижений, наприклад, при цирозі, застосування препарату потрібно починати з дози 25 мг.

Потенціал не показано для застосування в осіб, молодше 18 років.

Застосування у пацієнтів літнього віку. Для пацієнтів літнього віку зміна дози не потрібна.

Для того, щоб препарат почав діяти, необхідне сексуальне збудження.

Побічна дія. За наявними даними, препарат звичайно добре переноситься. Можливі побічні ефекти: головний біль, запаморочення, диспепсія, діарея, припливи крові, закладеність носа, розширення периферичних судин, порушення зору (включаючи порушення сприйняття кольорів, підвищена яскравість світла та затуманення зору); при застосуванні препарату у дозах, що перевищували рекомендовані, небажані явища були подібними до відзначених вище, однак реєструвалися частіше. Відзначені міалгія та випадки пріапізму, артралгія, люмбалгія, безсоння, схильність до інфекцій сечовивідних шляхів, тривала ерекція (більше 4 годин).

Протипоказання. Препарат протипоказаний у разі індивідуальної непереносимості (підвищеної реакції та виражених побічних ефектів). Не слід застосовувати його пацієнтам, які користуються донаторами NO (нітратами, молсидоміном), та особам, молодшим 18 років.

Передозування. Доза, що перевищує 100 мг, не покращує ефективність препарату, але вона може збільшити кількість та тяжкість побічних ефектів. Терапія симптоматична. Діаліз неефективний.

Особливості застосування. Для діагностики порушень ерекції, визначення їх можливих причин та вибору адекватного лікування необхідно зібрати повний медичний анамнез і провести ретельне фізичне обстеження пацієнта. Сексуальна активність становить певний ризик за наявності захворювань серцево-судинної системи. Через це перед початком лікування з приводу порушень ерекції необхідне кардіологічне обстеження хворого. Після широкого впровадження препарату в практику надійшли повідомлення про серйозні порушення з боку серцево-судинної системи, які включали стенокардію, інфаркт міокарда, раптову коронарну смерть, шлуночкові аритмії, геморагічний інсульт, минущу ішемію, артеріальну гіпер- або гіпотензію. Вказані випадки переважно розвивалися під час або відразу після сексуальної активності. У більшості пацієнтів спостерігалися фактори ризику розвитку захворювань серцево-судинної системи.

Препарати, призначені для лікування порушень ерекції, з обережністю застосовують у хворих з анатомічною деформацією статевого члена, наприклад при ангуляції, кавернозному фіброзі (хвороба Пейроні) та в осіб із захворюваннями, що сприяють розвитку пріапізму (серпоподібно-клітинна анемія, множинна міелома або лейкоз).

Відомості про застосування препарату при пептичній виразці та геморагічному діатезі відсутні, із-за чого препарат хворим з такою патологією призначають з обережністю.

У невеликої кількості хворих зі спадковим пігментним ретинітом відзначені спадкові порушення фосфодіестераз сітківки. Відомості про застосування препарату у хворих з пігментним ретинітом відсутні, тому препарат у них слід застосовувати з обережністю.

Препарати, призначені для лікування порушень ерекції, не слід призначати чоловікам, для яких сексуальна активність небажана (тяжкі захворювання серцево-судинної системи).

З обережністю слід застосовувати препарат при артеріальній гіпотензії, захворюваннях нирок та печінки.

Особам похилого віку першу дозу препарату лікар повинен підібрати індивідуально.

Оскільки препарат може бути причиною запаморочення та порушень зору, необхідно дотримуватися обережності при керуванні автомобілем або роботі з механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Не рекомендується застосування препарату разом з іншими засобами для лікування розладів ерекції.

Одночасне призначення силденафілу та ритонавіру, високо специфічного інгібітора Р450, не рекомендується. Одночасний прийом інгібітора протеаз ВІЛ ритонавіру на стадії рівноважної концентрації (500 мг 2 рази на добу) з силденафілом (100 мг одноразово) призводить до 300% підвищення (у 4 рази) максимальної концентрації силденафілу в плазмі крові та 1000% (у 11 разів)

збільшення AUC силденафілу.

Циметидин у дозі 800 мг, що є неспецифічним інгібітором CYP3A4, при одночасному прийомі з препаратом спричиняв підвищення концентрації силденафілу в плазмі крові на 56% у здорових добровольців. Популяційний фармакокінетичний аналіз результатів клінічного дослідження продемонстрував зниження кліренсу силденафілу при одночасному застосуванні інгібіторів CYP3A4 (таких, як кетоконазол, еритроміцин, циметидин).

Одноразовий прийом антациду (магнію/алюмінію гідроксиду) не впливав на біодоступність препарату.

За даними популяційного фармакокінетичного аналізу інгібітори CYP2C9 (толбутамід, варфарин), CYP2D6 (селективні інгібітори зворотного нейронального захоплення серотоніну, трициклічні антидепресанти), тіазиди й тіазидоподібні діуретики, петльові та калійзберігаючі діуретики, інгібітори АПФ, антагоністи кальцію, блокатори α -адренорецепторів та індуктори метаболізму CYP450 (рифампіцин, барбітурати) не впливали на фармакокінетику силденафілу. Препарат є слабким інгібітором ізоферментів цитохрому P-450-1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 та 3A4 (IC₅₀ > 150 мкмоль). При застосуванні силденафілу у рекомендованих дозах максимальна концентрація його у плазмі крові становить майже 1 мкмоль, тому є малоімовірним, що силденафіл здатний впливати на кліренс субстратів цих ізоферментів.

Ознак істотної взаємодії з толбутамідом у дозі 250 мг або варфарином у дозі 40 мг, які метаболізуються CYP2C9, не виявлено.

Препарат (50 мг) не посилював гіпотензивної дії алкоголю у здорових добровольців при максимальному рівні алкоголю в крові в середньому 80 мг/дл. У хворих на артеріальну гіпертензію ознак взаємодії препарату (100 мг) з амлодипіном не виявлено. Середнє додаткове зниження АТ у положенні лежачи (систоличного - на 8 мм рт.ст., діастолічного - на 7 мм рт.ст.) було подібним до такого при прийомі однієї таблетки препарату у здорових добровольців. Дані про безпеку застосування свідчать про відсутність відмінностей у характері побічних ефектів у хворих, які одержували препарат разом з антигіпертензивними препаратами і без них.

Потенціал підвищує гіпотензивний ефект нітратів. Застосування його з нітратами та донаторами NO протипоказане.

Умови та термін зберігання. У сухому, захищеному від світла місці при температурі не вище 30 °С. Термін придатності - 3 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 2 таблетки в блістері. 1 або 2 блістери в пачці із картону.

Виробник. ЗАТ «Технолог».

Адреса. 20300, м. Умань, Черкаської обл., вул. Залізняка, 3.