

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ВЕКТА
(VECTA)

Склад:

діюча речовина: 1 таблетка містить силденафілу цитрату еквівалентно силденафілу 50 мг або 100 мг;

допоміжні речовини: крохмаль кукурудзяний, целюлоза мікрокристалічна, повідон, натрію метилпарабен (Е 219), натрію пропілпарабен (Е 217), магнію стеарат, тальк очищений, кремнію діоксид колоїдний безводний, натрію крохмальгліколят (тип А), гідроксипропілметилцелюлоза, титану діоксид (Е 171), поліетиленгліколь 6000, пунцовий 4R (Е 124).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що застосовуються при порушеннях ерекції.

Код АТС G04В E03.

Клінічні характеристики.

Показання. Лікування порушень ерекції, що визначаються як нездатність досягти та підтримати ерекцію статевого члена, необхідну для успішного статевого акту.

Протипоказання. Індивідуальна підвищена чутливість до компонентів препарату; одночасне застосування будь-яких донаторів NO або нітратів; дитячий вік (до 18 років).

Спосіб застосування та дози. Препарат призначають дорослим по 50 мг (1 таблетка) за 1 годину до початку статевого акту.

З урахуванням ефективності та переносимості дозу можна підвищувати до 100 мг.

Максимальна рекомендована доза становить 100 мг, 1 раз на добу.

Застосування пацієнтами з порушеннями 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 пацієнтами з порушеннями функції печінки. Оскільки у пацієнтів з печінковою недостатністю кліренс силденафілу знижений, наприклад при цирозі, застосування препарату потрібно починати з дози 25 мг (застосовуються препарати силденафілу з можливістю такого дозування).

Застосування пацієнтами літнього віку. Для пацієнтів літнього віку зміна дозування не потрібна.

Для того, щоб Векта почала діяти, необхідне сексуальне збудження.

Побічні реакції.

- *З боку нервової системи:* головний біль, запаморочення, тахікардія, гіпотензія, синкопе, носові кровотечі;
- *З боку серцево-судинної системи:* почервоніння шкіри, відчуття серцебиття;
- *З боку шлунково-кишкового тракту:* диспепсія, блювання;
- *З боку органа зору:* біль в очах, почервоніння очей, затуманення зору, підвищена чутливість до світла, хроматопсія;
- *З боку дихальної системи:* риніт (закладеність носа);
- *З боку імунної системи:* реакції гіперчутливості (включаючи шкірні висипання);
- *З боку репродуктивної системи:* пролонгована ерекція та/або пріапізм.

Передозування. У дослідженнях на здорових добровольцях при одноразовому прийомі препарату в

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

дозах до 800 мг негативні явища були подібними до таких, як при прийомі препарату у нижчих дозах, але зустрічалися частіше.

У разі передозування проводять симптоматичне лікування. Застосування діалізу не збільшує кліренс силденафілу, оскільки останній активно зв'язується з білками плазми і не виводиться із сечею.

Застосування в період вагітності або годування груддю. Засіб не призначений для застосування жінками.

Діти. Векта не показана для застосування особами, віком до 18 років.

Особливості застосування. Для діагностики порушень ерекції, визначення їх можливих причин і 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. Тому 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, минаючу ішемію, артеріальну гіпер- або гіпотензію. Зазначені випадки розвивалися переважно під час або відразу після сексуальної активності. У більшості пацієнтів (але не у всіх) спостерігалися чинники ризику розвитку захворювань серцево-судинної системи.

Препарати, призначені для лікування порушень ерекції, з обережністю призначають хворим з анатомічною деформацією статевого члена, наприклад при ангуляції, кавернозному фіброзі (хвороба Пейроні), та особам із захворюваннями, що сприяють розвитку пріапізму (серпоподібноклітинна анемія, множинна міелома або лейкоз).

Силденафіл має судинорозширювальний ефект, результатом якого є незначне та тимчасове зниження артеріального тиску. Завдяки цим властивостям Векта посилює гіпотензивну дію нітратів.

До пацієнтів з підвищеною чутливістю до вазодилітаторів належать хворі з лівошлуночковою обструкцією (стенозом аорти, обструктивною гіпертрофічною кардіоміопатією) та з винятковим синдромом системної атрофії, яка виявляється ушкодженням автономного контролю артеріального тиску.

Векта не впливає на серцевий викид і не зменшує потік крові через стенозовані коронарні артерії, а зменшення систолічного та діастолічного тиску крові відбувається, в середньому, в межах 6 – 9 %. Прийом Векти не зменшує тривалість виконання фізичних вправ у пацієнтів з еректильною дисфункцією і стабільною стенокардією, які регулярно приймають антиангінальні препарати (окрім нітратів).

Відомості щодо застосування препарату при пептичній виразці, геморагічному діатезі та пігментному ретиніті відсутні, тому хворим з такою патологією силденафіл призначають з особливою обережністю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. Оскільки під час клінічних випробувань Векти спостерігалися запаморочення та порушення зору, не слід керувати транспортом і працювати з потенційно небезпечними механізмами до з'ясування індивідуальної реакції на препарат.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Безпека та ефективність застосування препарату у комбінації з іншими засобами, призначеними для лікування порушень ерекції, не вивчалися, тому подібні комбінації застосовувати не рекомендується.

Одночасне призначення силденафілу та ритонавіру, високоспецифічного інгібітору цитохрому P₄₅₀, не рекомендується.

Зниження кліренсу силденафілу спостерігалося при одночасному застосуванні інгібіторів CYP3A4 (таких як кетоконазол, еритроміцин, циметидин), проте частота побічних ефектів у таких пацієнтів не зросла.

Грейпфрутовий сік, який є слабким інгібітором CYP 3A4, впливає на метаболізм у стінці кишечника та може призвести до невеликого підвищення рівня силденафілу в плазмі.

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

Інгібітори CYP2C9 (толбутимід, 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 виявляли впливу на фармакокінетику силденафілу.

Клінічних ознак істотної взаємодії з толбутамідом (250 мг) або варфарином (40 мг), які метаболізуються CYP2C9, не виявлено.

Силденафіл не підсилював 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.

Одноразовий прийом Векти і α -блокаторів може спричинити симптоматичну гіпотензію у деяких пацієнтів.

Дані про безпеку застосування свідчать про відсутність відмінностей у характері побічних ефектів у хворих, які одержували препарат разом з антигіпертензивними засобами та без них.

Завдяки відомим ефектам на шляху обміну оксиду азоту/цГМФ силденафіл підсилює гіпотензивний ефект нітратів. Отже, застосування силденафілу у поєднанні з нітратами або донорами оксиду азоту в будь-яких формах протипоказане.

Силденафіл підсилює антиагрегантні властивості нітропрусиду натрію.

Силденафіл (50 мг) не призводить до збільшення тривалості кровотечі, спричиненої ацетилсаліциловою кислотою (150 мг).

Безпека і ефективність комбінації силденафілу з іншими засобами, призначеними для лікування порушень ерекції, не вивчались. Отже, призначення таких комбінацій не рекомендується.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Векта відновлює порушену здатність ерекціювати та забезпечує природну відповідь на сексуальне збудження. Фізіологічний механізм ерекції статевого члена полягає у вивільненні оксиду азоту (NO) у кавернозному тілі при сексуальній стимуляції. Оксид азоту активує фермент гуанілатциклазу, що підвищує рівень цГМФ, розслаблює гладкі м'язи кавернозного тіла і посилює кровотік у статево члені.

Силденафіл є потужним і селективним інгібітором цГМФ-специфічної фосфодіестерази типу 5 (ФДЕ 5), яка забезпечує розпад цГМФ у кавернозному тілі. Силденафіл має периферичну еректильну властивість. Силденафіл не чинить прямої розслаблюючої дії на ізольоване кавернозне тіло, однак посилює релаксуючу дію NO у тканині кавернозного тіла. При активації шляху NO/цГМФ, що спостерігається при сексуальному збудженні, пригнічення ФДЕ 5 під впливом силденафілу призводить до підвищення рівня цГМФ у кавернозному тілі. Через це для досягнення сприятливого фармакологічного ефекту препарату необхідна адекватна сексуальна стимуляція.

При одноразовому прийомі внутрішньо в дозах до 100 мг у здорових добровольців препарат не спричиняв клінічно значущих змін ЕКГ. Максимальне зниження систолічного артеріального тиску (АТ), у положенні лежачи при застосуванні препарату внутрішньо в дозі 100 мг становило в середньому 8,4 мм рт.ст. Відповідне зниження діастолічного АТ у положенні лежачи становило 5,5 мм рт.ст. Зниження АТ пояснюється вазодилатуючим ефектом силденафілу, можливо, за рахунок підвищення рівня цГМФ у гладких м'язах судин.

Фармакокінетика. Препарат швидко всмоктується після прийому внутрішньо. Концентрація препарату в плазмі крові після перорального прийому натще досягає максимального значення протягом 30-120 хв (у середньому 60 хв). Абсолютна біодоступність при прийомі внутрішньо в рекомендованих дозах є лінійною. При прийомі силденафілу разом з жирною їжею швидкість всмоктування знижується, період досягнення максимальної концентрації зростає на 60 хв, а

максимальна концентрація у плазмі крові знижується, в середньому на 29 %. Об'єм розподілу силденафілу в рівноважному стані становить, у середньому, 105 л/кг. Силденафіл та його основний циркулюючий М-десметиловий метаболіт приблизно на 96 % зв'язуються з білками плазми крові. Зв'язування з білками не залежить від концентрації препарату. У здорових добровольців, які одержували препарат одноразово по 100 мг, менше 0,0002 % (у середньому 188 мг) дози виявляли у спермі через 90 хв після прийому. Одноразовий прийом препарату внутрішньо у дозі 100 мг не супроводжувався зміною рухливості або морфології сперматозоїдів.

Силденафіл метаболізується переважно під впливом CYP3A4 (основний шлях) і CYP2C9 (неосновний шлях) мікосомальних ізоферментів печінки. Основний циркулюючий метаболіт утворюється внаслідок N-десметилування силденафілу. За селективністю дії на ФДЕ метаболіт можна зіставити із силденафілом, а його активність щодо ФДЕ 5 становить приблизно 50 % активності самого препарату. Концентрація метаболіту у плазмі крові становить приблизно 40 % від такої у силденафілі. N-десметилметаболіт піддається подальшому метаболізму; термінальний період його напіввиведення – приблизно 4 години. Загальний кліренс силденафілу з організму дорівнює 41 л/год, а термінальний період напіввиведення – 3-5 годин. Після прийому внутрішньо силденафіл виводиться у вигляді метаболітів переважно з калом (майже 80 % введеної дози) і меншою мірою – із сечею (приблизно 13 % введеної дози).

У здорових добровольців віком 65 років і старше кліренс силденафілу знижений, а концентрація вільної лікарської речовини в плазмі крові приблизно на 40 % перевищує рівень його у здорових добровольців молодшого віку (18-45 років). Проте аналіз даних щодо безпеки застосування показав, що вік не впливає на частоту негативних побічних ефектів.

У осіб з легкою та помірною нирковою недостатністю (кліренс креатиніну 30-80 мл/хв) фармакокінетика силденафілу після одноразового прийому внутрішньо не змінювалась. У хворих з тяжкою нирковою недостатністю (кліренс креатиніну <30 мл/хв) кліренс силденафілу знижувався, що призводило до збільшення AUC (100 %) та максимальної концентрації (88 %) у плазмі крові порівняно з такими у здорових добровольців.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: рожеві круглі двоопуклі таблетки, вкриті оболонкою, з написом VESTA50 з одного боку на таблетках по 50 мг та написом VESTA100 з одного боку на таблетках по 100 мг.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати у захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. 1 або 4 таблетки у блістері; 1 блістер у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ЮНІМАКС ЛАБОРАТОРИС.

Місцезнаходження. Плот № 7, Сектор 24, Фарідабад-121005, Харіана, Індія.

Власник реєстраційного посвідчення. АМЕРІКЕН НОРТОН КОРПОРЕЙШН.