

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения
Зидена®

Регистрационный номер: ЛСР-006071/08

Торговое название препарата: Зидена®

Международное непатентованное или группировочное название: уденафил

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав на одну таблетку:

1 таблетка содержит:

активное вещество:

уденафил - 100 мг

вспомогательные вещества:

лактоза – 87,5 мг, крахмал кукурузный - 20,0 мг, кремния диоксид коллоидный – 12,5 мг, L-гидроксипропилцеллюлоза – 12,5 мг, гидроксипропилцеллюлоза-LF – 7,5 мг, тальк – 7,5 мг, стеарат магния – 2,5 мг;

оболочка: гидроксипропилметилцеллюлоза – 6,9 мг, тальк – 0,022 мг, оксид железа красный – 0,0106 мг, оксид железа желтый – 0,0266 мг, титана диоксид - 1,0408 мг.

Описание:

таблетки, покрытые оболочкой светло-розового цвета с бежеватым оттенком, овальные с выдавленным символом 100 на одной стороне и символами в виде букв Z и Y, разделенных риской, на другой стороне. На изломе белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

средство для лечения эректильной дисфункции. Ингибитор фосфодиэстеразы-5 типа.

Код АТХ: G04BE

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Уденафил – селективный обратимый ингибитор циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) - специфической фосфодиэстеразы 5-го типа (ФДЭ-5).

Уденафил не оказывает прямого расслабляющего действия на изолированное кавернозное тело, но при сексуальной стимуляции усиливает расслабляющий эффект оксида азота посредством ингибирования ФДЭ-5, ответственной за распад цГМФ в кавернозном теле. Следствием этого является релаксация гладких мышц артерий и приток крови к тканям полового члена, что и вызывает эрекцию. Препарат не оказывает эффекта в отсутствие сексуального стимулирования.

Исследования *in vitro* показали, что уденафил является селективным ингибитором фермента ФДЭ-5. ФДЭ-5 присутствует в гладких мышцах кавернозного тела, в гладких мышцах сосудов внутренних органов, в скелетных мышцах, тромбоцитах, почках, легких и мозжечке. Уденафил является в 10 000 раз более мощным ингибитором в отношении ФДЭ-5, чем в отношении ФДЭ-1, ФДЭ-2, ФДЭ-3 и ФДЭ-4, которые локализируются в сердце, головном мозге, кровеносных сосудах, печени и других органах.

Кроме того, уденафил в 700 раз активнее в отношении ФДЭ-5, чем в отношении ФДЭ-6, обнаруженной в сетчатке и ответственной за цветовосприятие. Уденафил не ингибирует ФДЭ-11, что обуславливает отсутствие случаев миалгии, болей в пояснице и проявлений тестикулярной токсичности.

Уденафил улучшает эрекцию и возможность проведения успешного полового акта. Действие препарата имеет оптимальную продолжительность до 24 часов. Эффект проявляется уже через 30 минут после приема препарата при наличии сексуального возбуждения.

Уденафил у здоровых лиц не вызывает достоверного изменения систолического и диастолического давления в сравнении с плацебо в положении лежа и стоя (среднее максимальное снижение составляет 1,6/0,8 мм рт.ст. и 0,2/4,6 мм рт.ст., соответственно). Уденафил не вызывает изменений распознавания цветов (голубой/зеленый), что объясняется его низким сродством с ФДЭ-6. Уденафил не влияет на остроту зрения, электроретинограмму, внутриглазное давление и размер зрачка.

При исследовании уденафила у мужчин не выявлено клинически значимого влияния препарата на количество и концентрацию спермы, подвижность и морфологию сперматозоидов.

Фармакокинетика

Всасывание:

После приема внутрь уденафил быстро всасывается. Время достижения максимальной концентрации в плазме крови (t_{max}) составляет 30-90 минут (в среднем – 60 минут). Период полувыведения ($t_{1/2}$) составляет 12 часов, высокое связывание уденафила с белками плазмы крови (93,9%) продлевает период его эффективности до 24 часов после приема всего одной дозы.

Прием пищи с высоким содержанием жира не оказывает влияния на всасываемость уденафила.

Прием алкоголя в количества 112 мл алкоголя (в пересчете на 40% этиловый спирт) в сочетании с пероральным приемом уденафила в дозе 200 мг не влияет на фармакокинетический профиль уденафила.

Метаболизм:

Уденафил в основном метаболизируется с участием изофермента (CYP)3A4 цитохрома P450.

Выведение:

У здоровых людей общий клиренс уденафила составляет 755 мл/мин. После приема внутрь уденафил выводится в виде метаболитов с калом.

Уденафил не накапливается в организме. При ежедневном приеме здоровыми добровольцами уденафила в дозе 100 мг и 200 мг в сутки в течение 10 дней не было выявлено существенных изменений его фармакокинетики.

Показания к применению

Лечение нарушений эрекции, характеризующихся неспособностью к достижению или сохранению эрекции полового члена, достаточной для удовлетворительного полового акта.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата;
- одновременный прием нитратов и других «донаторов» оксида азота.

С осторожностью

С осторожностью следует принимать уденафил пациентам с неконтролируемой артериальной гипертензией (артериальное давление > 170/100 мм рт. ст.), гипотонией (артериальное давление < 90/50 мм рт. ст.); пациентам с наследственными дегенеративными заболеваниями сетчатки (включая пигментный ретинит, пролиферативную диабетическую ретинопатию); пациентам, перенесшим в течение последних 6 месяцев инсульт, инфаркт миокарда или аортокоронарное шунтирование; пациентам с тяжелой печеночной или по-

чечной недостаточностью; при наличии врожденного синдрома удлинения интервала QT или при увеличении интервала QT вследствие приема препаратов.

Следует учитывать потенциальный риск развития осложнений при сексуальной активности у пациентов с такими заболеваниями сердечно-сосудистой системы, как нестабильная стенокардия или стенокардия, возникающая во время полового акта; хроническая сердечная недостаточность (II-IV функционального класса по классификации NYHA (New York Heart Association, Нью-йоркская Ассоциация Сердца), развившаяся в течение последних 6 месяцев; неконтролируемые нарушения сердечного ритма.

С осторожностью следует применять уденафил у пациентов с предрасположенностью к приапизму, а также у пациентов с анатомической деформацией полового члена, при наличии импланта полового члена.

При одновременном приеме уденафила и блокаторов кальциевых каналов, альфа-адреноблокаторов или других гипотензивных средств может отмечаться дополнительное снижение систолического и диастолического артериального давления на 7-8 мм ртутного столба.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

По зарегистрированному показанию препарат не предназначен для применения у женщин.

Применение в педиатрии

Уденафил не предназначен для применения у детей и подростков в возрасте до 18 лет.

Способ применения и дозы

Препарат принимается внутрь, независимо от приема пищи.

Рекомендованная доза препарата составляет 100 мг, принимают за 30 минут до предполагаемой сексуальной активности.

Доза может быть увеличена до 200 мг, с учетом индивидуальной эффективности и переносимости препарата. Максимальная рекомендованная кратность применения – один раз в сутки.

Побочное действие

В приведенной таблице перечислены побочные эффекты, наблюдавшиеся в ходе клинических исследований уденафила, в зависимости от частоты их возникновения.

Органы и системы органов	Побочные явления		
	очень часто ≥10%	часто 1 %-10 %	иногда 0,1 %-1%
Сердечно-сосудистая система	Приливы крови к лицу		
Центральная нервная система			Головокружение, ригидность мышц шеи, парестезии.
Органы зрения		Покраснение глаз	Затуманенное зрение, боль в глазах, повышенное слезотечение
Кожа			Отек век, отек лица, крапивница
Пищеварительная система		Диспепсия, дискомфорт в области живота	Тошнота, зубная боль, запор, гастрит
Эндокринная система			Жажда

Дыхательная система		Заложенность носа	Одышка, сухость в носу
Опорно-двигательная система			Периартрит
Организм в целом		Головная боль, дискомфорт в груди, ощущение жара	Боль в груди, боль в животе, усталость

В процессе постмаркетинговых наблюдений при применении уденафила были также описаны другие нежелательные явления: сильное сердцебиение, носовое кровотечение, шум в ушах, диарея, аллергические реакции (кожная сыпь, эритема), длительная эрекция, чувство общего дискомфорта, ощущение холода или жара, постуральное головокружение, кашель.

Передозировка

При однократном приеме препарата в дозе 400 мг нежелательные явления были сопоставимы с наблюдавшимися при приеме уденафила в более низких дозах, но встречались чаще.

Лечение: симптоматическое. Диализ не ускоряет выведение уденафила.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Ингибиторы изоферментов цитохрома P450 CYP3A4 (кетоназол, итраконазол, ритонавир, индинавир, циметидин, эритромицин, сок грейпфрута) могут усилить действие уденафила.

Кетоназол (в дозе 400 мг) повышает биодоступность и C_{max} уденафила (в дозе 100 мг) практически в два раза (212%) и в 0,8 раза (85%), соответственно.

Ритонавир и индинавир значительно усиливают действие уденафила.

Дексаметазон, рифампин и антиконвульсивные препараты (карбамазепин, фенитоин и фенобарбитал) могут ускорить метаболизм уденафила, поэтому совместное введение с вышеуказанными препаратами ослабляет действие уденафила.

Совместное введение уденафила (30 мг/кг, перорально) и нитроглицерина (2,5 мг/кг однократно внутривенно) не показало какого-либо влияния на фармакокинетику уденафила в экспериментальных исследованиях, однако одновременное использование нитроглицерина и уденафила не рекомендуется из-за возможного снижения артериального давления.

Уденафил и препараты из группы альфа-блокаторов являются сосудорасширяющими средствами, поэтому при совместном приеме должны назначаться в минимальных дозах.

Особые указания

Сексуальная активность имеет потенциальный риск для пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями, поэтому лечение эректильной дисфункции, в том числе с использованием уденафила, не следует проводить у мужчин с заболеваниями сердца, при которых сексуальная активность не рекомендована.

Пациенты с затруднением оттока крови из левого желудочка (аортальный стеноз) могут быть более чувствительными к действию вазодилататоров, включая ингибиторы ФДЭ.

Несмотря на отсутствие в ходе клинических исследований случаев пролонгированной эрекции (более 4 часов) и приапизма (болезненная эрекция, продолжительностью более 6 часов), такие явления свойственны для данного класса препаратов. В случае возникновения эрекции продолжительностью более 4 часов (независимо от наличия болевых ощущений) пациенты должны немедленно обратиться за медицинской помощью. При отсутствии своевременного лечения приапизм может привести к необратимому повреждению эректильной ткани и эректильной функции.

В связи с отсутствием клинических данных об использовании уденафила у пациентов старше 71 года данной категории пациентов не рекомендуется прием данного препарата. Не рекомендуется использовать уденафил в комбинации с другими видами лечения эректильной дисфункции.

Воздействие на способность водить автомобиль и работать с техникой

Перед тем, как управлять техникой и транспортными средствами, пациенты должны знать, как они реагируют на прием Зидены®.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 100 мг.

По 1, 2 или 4 таблетки в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1 контурную ячейковую упаковку по 1, 2 или 4 таблетки, или 2 контурные ячейковые упаковки по 1, 2 или 4 таблетки, или 4 контурные ячейковые упаковки по 2 таблетки, или 5 контурных ячейковых упаковок по 2 таблетки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не применять после истечения срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Предприятие-производитель:

Донг-А СТ Ко., Лтд.

Республика Корея, г. Чхонан.

Предприятие-упаковщик:

ОАО «Валента Фармацевтика»,
141101, Россия, Московская область,
г. Щелково, ул. Фабричная, д. 2.

Тел. (495) 933-48-62, факс (495) 933-48-63

Претензии от покупателей принимает предприятие-упаковщик:

ОАО «Валента Фармацевтика»,
141101, Россия, Московская область,
г. Щелково, ул. Фабричная, д. 2.

Тел. (495) 933-48-62, факс (495) 933-48-63

Заявитель:

Заместитель Генерального директора-
Директор по науке и развитию
ОАО «Валента Фармацевтика»



А.Н. Щавлинский