

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

КАМАГРА

- Торговое название

Камагра

- Международное непатентованное название

Силденафил

- Лекарственная форма

Желе пероральное со вкусом ананаса и апельсина по 50 мг и 100 мг

- Состав

5 г препарата содержат активные вещества – силденафила цитрат 70,240/140,480 мг (эквивалентно силденафилу 50 мг\100 мг),

вспомогательные вещества: сахароза, натрияметилпарагидроксибензоат, натрия пропилапарагидроксибензоат, калия ацесульфам, натрия хлорид, пропилен- гликоль, сорбит жидкий (70 %), натрия кармеллоза, кислота лимонная безводная, кислоты лимонной моногидрат, желтый «солнечный закат» FCF (E110), ароматизатор апельсиновый 15215 или ароматизатор ананасовый RSV (IFF), хинолиновый желтый WS(E104), вода очищенная.

- Описание

Гомогенное желе оранжевого цвета (со вкусом апельсина) или желтого цвета (со вкусом ананаса), со сладким вкусом и приятным запахом.

Фармакотерапевтическая группа

Препараты для лечения нарушений эрекции.

Код АТХ G04BE03

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

Камагра быстро всасывается. Максимальные концентрации в плазме наблюдаются в пределах от 30 до 120 минут (в среднем 60 минут) после приема натощак. При одновременном приеме силденафила с жирной пищей, степень всасывания значительно снижается, в среднем с задержкой по показателю T_{max} на 60 минут и средним сокращением по показателю C_{max} на 29%. Средний объем распределения в установившемся состоянии (V_{ss}) для силденафила составляет 105 л, что указывает на распределение в тканях. Силденафил имеет основной циркулирующий метаболит N-

десметил метаболит примерно на 96% связываются с белками плазмы. Связывание с белками плазмы зависит от общей концентрации препарата.

Препарат преимущественно выводится печеночными микросомальными изоферментами CYP3A4 (основной метаболический путь) и CYP2C9 (второстепенный метаболический путь). Преобразуется в активный метаболит путем N-десметилирования и затем далее метаболизируется. Этот метаболит обладает аналогичной селективностью в отношении ФДЭ и *in vitro* активностью в отношении ФДЭ5 ~ 50% исходного лекарственного вещества.

Силденафил выводится в виде метаболитов преимущественно с фекалиями (~80%) и в меньшей степени с мочой (~13%).

Фармакодинамика

Камагра содержит в составе цитратную соль силденафила, селективного ингибитора циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ) – специфической фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5). Физиологический механизм эрекции полового члена включает высвобождение оксида азота (ОА) в пещеристом теле полового члена во время сексуального возбуждения. Затем окись азота активирует фермент гуанилатциклазу, что приводит к увеличению уровней циклического гуанозин монофосфата (цГМФ), оказывая расслабление гладкой мышцы в пещеристом теле и обеспечивая приток крови. Препарат не обладает прямым релаксационным действием на пещеристое тело у человека, но усиливает действие оксида азота (ОА) путем ингибирования фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5), которая отвечает за расщепление цГМФ в пещеристом теле. Когда при сексуальном возбуждении происходит местное высвобождение ОА, ингибирование ФДЭ5 препаратом вызывает увеличение уровня цГМФ в пещеристом теле полового члена, приводя к расслаблению гладкой мышцы и притоку крови к пещеристому телу. Камагра в рекомендуемых дозах не вызывает эрекции в отсутствие сексуального возбуждения.

Показания к применению

- лечение эректильной дисфункции у мужчин

Способ применения и дозы:

Один пакетик предназначен только для однократного применения - открыть пакетик и использовать все содержимое.

Применять строго под наблюдением врача.

Для большинства пациентов рекомендуемая доза составляет 50 мг, принимается по мере необходимости и приблизительно за 1 час до половой активности. Однако, дозу можно принять в интервале между 4 и 0,5 часами до половой активности. Максимальную рекомендуемую дозу 100 мг, следует принимать только один раз в сутки.

Следующие факторы связаны с увеличением уровня силденафила в плазме: возраст > 65 лет (увеличение на 40 % показателя AUC), печеночная недостаточность (например, цирроз

– на 80 %), тяжелая почечная недостаточность(клиренс креатинина < 30 мл/мин – на 100 %), и одновременный прием сильнодействующих ингибиторов цитохрома P450 3A4(эритромицин, кетоконазол, итраконазол –на 200%). Поскольку высокий уровень концентрации в плазме может одновременно повысить эффективность и частоту побочных действий, у таких пациентов начальная доза должна составлять 25 мг, и такие пациенты должны находиться под медицинским контролем. Данной категории пациентов не назначают препарат в дозировке 100 мг.

- Побочные действия

Очень часто

- головная боль, мигрень

Часто

- головокружение

- нарушения зрения(умеренные и кратковременные, преимущественно

Выражающиеся нарушением цветовосприятия, а также повышенной чувствительностью к свету или «затуманенным» зрением)

- «прилив» крови к лицу

- заложенность носа, гриппоподобный синдром

- диспепсия

Нечасто

- миopia, конъюнктивит, светобоязнь, боль в глазах, кровоизлияния в глаза, катаракта

- шум в ушах, боли в ушах

- одышка, кашель, ларингит, фарингит, синусит, бронхит, астмабронхиальная

- сердцебиение, тахикардия, синкопе, пониженное артериальное давление,

Постуральная артериальная гипотензия, периферические отеки, ишемия миокарда, тромбоз сосудов головного мозга, задержка очередного

сердечного сокращения, сердечная недостаточность, отклонения от нормы

на электрокардиограмме, предсердно-желудочковая блокада, стенокардия,

кардиомиопатии

- сухость во рту, жажда, рвота, стоматит, гингивит, глоссит, дисфагия, эзофагит, гастрит, гастроэнтерит, колит, ректальное кровотечение
- боль в груди, общая слабость
- боль в пояснице
- подагра
- артралгии, миалгии, разрыв сухожилия, тендовагинит, миастения, синовит, артрит, артроз
- атаксия, невралгия, невропатии, парестезии, дрожание, депрессия, сонливость, бессонница, нарушение сна, снижение рефлексов, гипестезия
- крапивница, простой герпес, кожная сыпь, зуд, повышенное потоотделение, язвы на коже, контактный дерматит
- цистит, никтурия, учащенное мочеиспускание, недержание мочи
- набухание молочных желез, нарушение эякуляции, отек половых органов и аноргазмия
- анемия, лейкопения
- гипергликемия, гипогликемия, гиперурикемия, гипернатриемия

Редко

- цереброваскулярные нарушения, обморок
- глухота
- инфаркт миокарда, фибрилляция предсердий
- артериальная гипертензия
- носовое кровотечение

Противопоказания

- повышенная чувствительность к какому-либо компоненту препарата
- одновременный прием препаратов, являющихся донаторами миоксида азота,

Органических нитратов или нитритов в любых формах

- сердечная недостаточность
- нестабильная стенокардия, перенесенные в последние месяцы инфаркт миокарда, инсульт или жизнеугрожающие аритмии
- артериальная гипертензия (артериальное давление (АД) >170/100 мм рт ст) или Артериальная гипотония (АД < 90/50 мм рт ст)
- установленные врожденные дегенеративные заболевания сетчатки (пигментный ретинит, врожденный дефект ретинальных фосфодиэстераз)
- детский и подростковый возраст до 18 лет
- не предназначен для применения у женщин

Лекарственные взаимодействия

Влияние других лекарственных препаратов на Камагру

Метаболизм силденафила преимущественно обуславливается цитохромом P450 (CYP), изоформами 3A4 (основной метаболический путь) и 2C9 (второстепенный метаболический путь). Следовательно, ингибиторы данных изоферментов могут повлиять на клиренс силденафила.

Циметидин (800 мг), неспецифичный ингибитор CYP вызывает увеличение на 56 % концентрации препарата в плазме при одновременном приеме с силденафилом (50 мг) у здоровых добровольцев.

Более сильные ингибиторы CYP3A4, такие как кетоконазол, итраконазол или мибефрадил, как полагают, могут оказать более сильное влияние. Данные клинических исследований показали снижение клиренса силденафила у пациентов при одновременном приеме с ингибиторами CYP3A4. Следует ожидать, что одновременный прием индукторов CYP3A4, таких как рифампицин, может снизить уровень концентрации силденафила в плазме.

Однократный прием антацида (гидроксид магния/гидроокись алюминия) не оказывает влияния на биодоступность силденафила.

Фармакокинетические данные пациентов в клинических исследованиях не показали влияния ингибиторов CYP2C9 (таких как бутаид, варфарин), ингибиторов CYP2D6 (таких как селективные ингибиторы повторного высвобождения серотонина, трициклические антидепрессанты), тиазида и родственных диуретиков, ингибиторов ACE и блокаторов кальциевого канала на фармакокинетику силденафила. Показатель AUC активного метаболита – N-десметилсилденафил, увеличивается на 62% под влиянием петлевых диуретиков и калийсберегающих диуретиков, и на 102 % при приеме с неспецифичными

бета-блокаторами. Такие влияния на метаболит, как полагают, не будут иметь клинических последствий.

Влияние препарата на другие лекарственные препараты

В исследованиях *in vitro*: препарат является слабым ингибитором цитохрома P450 изоформ 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 3A4 (IC₅₀ > 150 нМ). При максимальных концентрациях препарата в плазме, составляющих примерно 1 мМ после приема в рекомендованных дозах, маловероятно, что препарат повлияет на клиренс субстратов этих изоферментов.

В исследованиях *in vivo*: никаких значимых взаимодействий не выявлено при одновременном приеме с толбутамидом (250 мг) или варфарином (40 мг), которые оба метаболизируются посредством CYP2C9.

Камагра (50 мг) не оказывает влияние на увеличение времени кровотечения, вызываемого аспирином (150 мг).

Камагра (50 мг) не усиливает гипотензивное действие алкоголя у здоровых добровольцев при средних максимальных уровнях алкоголя в крови 0.08 %.

Когда препарат (100 мг) принимают одновременно с амлодипином у гипертоников, то дополнительное снижение артериального давления в положении лежа (в среднем, систолическое на 8 ммHg; диастолическое - на 7 ммHg) имеет аналогичную магнитуду, наблюдаемую при приеме только одного препарата у здоровых добровольцев.

Анализ данных по безопасности не показал различий в частоте проявления побочных действий у пациентов, принимающих только Камагру, и у пациентов, принимающих препарат с гипотензивными средствами.

Особые указания

Необходимо изучить историю болезни и провести физическое обследование, чтобы диагностировать эректильную дисфункцию, выявить потенциальные основные причины и назначить соответствующее лечение. В некоторой степени существует риск со стороны сердечно-сосудистой системы, связанный с половой активностью; следовательно, врачу необходимо оценить состояние сердечно-сосудистой системы пациентов до назначения каких-либо препаратов для лечения эректильной дисфункции.

Препараты для лечения эректильной дисфункции следует назначать с осторожностью пациентам с анатомической деформацией члена (угловое искривление, кавернозный фиброз или фибропластическая индурация полового члена (болезнь Пейрони), или пациентам с сопутствующими заболеваниями, которые могут вызывать приапизм (такие как серповидно-клеточная анемия, множественная миелома или лейкомия).

Безопасность и эффективность препарата в комбинации с другими препаратами для лечения эректильной дисфункции не изучены. Следовательно, применять препарат в комбинации с такими препаратами не рекомендуется.

Камагра желе не оказывает влияния на время кровотечения как при приеме препарата отдельно, так и вместе с аспирином. Человеческие тромбоциты показали, что препарат усиливает антиагрегантное действие нитроцианида натрия (донора окиси азота). Данных о безопасности приема препарата у пациентов с нарушениями кровотечения или активной формой пептической язвы не представлено. Следовательно, препарата следует назначать с осторожностью таким пациентам.

У некоторых пациентов с наследственной пигментной дегенерацией сетчатки наблюдаются генетические нарушения фосфодиэстеразы сетчатки. Данных о безопасности приема Камагры у пациентов с пигментной дегенерацией сетчатки не имеется. Следовательно, препарат следует назначать с осторожностью таким пациентам.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами

Учитывая побочные действия лекарственного средства, следует соблюдать осторожность при управлении автотранспортом или другими потенциальноопасными механизмами.

Передозировка

При приеме высоких доз препарата может наблюдаться усиление побочных действий, наблюдаемых при приеме рекомендованных доз. В случае передозировки назначают общее симптоматическое и поддерживающее лечение.

Форма выпуска и упаковка

По 5 г препарата помещают в алюминиевый саше -пакетик.

По 1 саше-пакетику вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках вкладывают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 0С, защищать от света.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения

3 года

Не применять по истечении срока годности!

Условия отпуска

По рецепту

Производитель

«Аджанта Фарма Лимитед»

Аджанта Хаус, 98, Кандивли Кооператив Эстейт Лимитед,

Чаркоп, Кандивли (В), Мумбай 400067

Индия

Владелец регистрационного удостоверения

Аджанта Фарма Лимитед, Индия