

УТВЕРЖДЕНА
Приказом председателя
Комитета фармации
Министерства здравоохранения
Республики Казахстан
от «27» 12 2018г.
№N018984

Инструкция
по медицинскому применению лекарственного средства
Эректо-Фаст 10

Торговое название

Эректо-Фаст 10

Международное непатентованное название

Тадалафил

Лекарственная форма

Плётки, диспергируемые в полости рта, 10 мг

Состав

Одна плётка содержит:

активное вещество – тадалафил 10 мг,

вспомогательные вещества: гипромеллоза (5 cps), гипромеллоза (15 cps), пропиленгликоль, глицерин, полисорбат 80, сукралоза, мятное масло (дементализированное мятное масло), железа(III) оксид желтый (E172).

Описание

Плётки прямоугольной формы, светло-жёлтого цвета, непрозрачные, нелипкие, длиной 15 ± 1.00 мм, шириной 25 ± 0.25 мм.

Фармакотерапевтическая группа

Мочеполовая система и половые гормоны. Урологические препараты. Препараты, применяемые при эректильной дисфункции. Тадалафил.
Код АТХ G04BE08

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

Всасывание

Тадалафил легко всасывается после перорального введения, а средняя максимальная концентрация в плазме (C_{max}) достигается в срединное время. Абсолютная биодоступность тадалафила после применения не была определена. Скорость и степень всасывания тадалафила не зависят от пищи, таким образом, тадалафил плётки можно принимать независимо от

приема пищи. Время приёма (утром или вечером) не имело клинически значимого эффекта на скорость и степень всасывания.

Распределение

Средний объем распределения составляет около 63 литров, что указывает на то, что тадалафил распределяется в ткани. При терапевтических концентрациях 94% тадалафила в плазме связывается с белками. Связывание с белками не изменяется с нарушением функции почек. У здоровых лиц менее 0,0005% введенной дозы обнаружено в сперме.

Метаболизм

Тадалафил преимущественно метаболизируется с участием цитохрома P450 (CYP) 3A4. Основным циркулирующим метаболитом является метилкатехолглюкоронид. Он в 13000 раз менее активен в отношении ФДЭ5, чем тадалафил. Следовательно, этот метаболит вряд ли является клинически значимым.

Выведение

У здоровых лиц средний клиренс тадалафила 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%).

Фармакодинамика

Тадалафил является эффективным, обратимым селективным ингибитором специфической фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5) циклического гуанозин монофосфата (цГМФ). Когда сексуальное возбуждение вызывает местное высвобождение оксида азота, ингибирование ФДЭ5 тадалафилом ведет к повышению уровней 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 не оказывает эффекта в отсутствии сексуального стимулирования.

Показания к применению

- лечение эректильной дисфункции у взрослых пациентов мужского пола. Для проявления эффекта тадалафила необходима сексуальная стимуляция. Эректо-Фаст не предназначен для применения лицами женского пола.

Способ применения и дозы

Взрослые мужчины

Эректильная дисфункция у мужчин среднего возраста: Обычно рекомендуемая доза составляет 10 мг, принятая до предполагаемой сексуальной активности независимо от приема пищи. Тем пациентам, у которых тадалафил в дозе 10 мг не дает адекватного эффекта, можно принять дозу 20 мг, по крайней мере, за 30 минут до сексуальной активности.

Максимальная частота приема составляет один раз в сутки.

Тадалафил 10 мг предназначен для использования непосредственно перед предполагаемой сексуальной активностью и не рекомендуется для непрерывного использования.

Особые группы пациентов

Пожилые мужчины: корректировка дозы не требуется.

Мужчины с почечной недостаточностью: корректировка дозы не требуется пациентам с легкой или умеренной почечной недостаточностью. Для пациентов с тяжелой почечной недостаточностью максимальная рекомендуемая доза составляет 10 мг.

Мужчины с диабетом: корректировка дозы не требуется.

Дети: Эректо-Фаст не применяется для лечения эректильной дисфункции у детей.

Способ применения

Для перорального применения.

- 1) Открыть пакетик только в указанном месте, медленно отрывая его. Не разрезать пакетик.
- 2) Аккуратно вытащить пленку из пакетика, не повредив ее.
- 3) Перед использованием проверить на наличие повреждений пленки. Следует использовать только неповрежденные пленки.
- 4) Пленку кладут на язык сухими руками в пустой рот пациента.
- 5) Пленка должна раствориться на языке без воды в течение нескольких секунд (в слюне, которую впоследствии следует проглотить).

Побочные действия

Наиболее часто при приеме тадалафила для лечения эректильной дисфункции или доброкачественной гиперплазии простаты развивались следующие побочные действия: головная боль, диспепсия, боли в спине, миалгия. При этом частота развития этих побочных действий увеличивалась пропорционально дозе тадалафила. Данные побочные действия были временными, и чаще всего легкими или умеренными. Большинство случаев развития головной боли при приеме тадалафила 1 раз в сутки отмечались в первые 10 или 30 дней с начала лечения тадалафилом.

Условное обозначение частоты побочных реакций: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100 - < 1/10$), нечасто ($\geq 1/1,000 - < 1/100$), редко ($\geq 1/10,000 - < 1/1,000$), очень редко ($< 1/10,000$) и неизвестно (невозможно определить частоту по имеющимся данным).

Часто: головные боли, покраснение, заложенность носа, диспепсия, боли в спине, миалгия, боли в конечностях.

Нечасто: реакции повышенной чувствительности, головокружение, затуманивание зрения, боли в глазах, звон в ушах, тахикардия, усиление сердцебиения, гипотензия, гипертензия, одышка, носовое кровотечение, боли в животе, рвота, тошнота, гастроэзофагеальный рефлюкс, высыпания, гематурия, длительная эрекция, боли в груди, периферические отеки, слабость.

Редко: крапивница, инсульт, синкопе, преходящая ишемическая атака, мигрень, судороги, преходящая амнезия, дефект поля зрения, отечность век, гиперемия конъюнктивы, передняя неартериитная ишемическая нейропатия зрительного нерва (NAION), окклюзия сосудов сетчатки,

внезапная потеря слуха, инфаркт миокарда, нестабильная стенокардия, желудочковая аритмия, крапивница, синдром Стивенса-Джонсона, эксфолиативный дерматит, гипергидроз, приапизм, кровотечение из пениса, гематоспермия, отечность лица, внезапная сердечная смерть.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к компонентам препарата
- прием препаратов, содержащих любые органические нитраты
- мужчинам с сердечными заболеваниями, которым сексуальная активность не рекомендована. Врачи должны учитывать потенциальный сердечный риск сексуальной активности пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы в анамнезе

Использование тадалафила противопоказано при следующих сердечно-сосудистых заболеваниях:

- инфаркт миокарда в течение последних 90 дней
- нестабильная стенокардия или стенокардия, возникающая во время полового акта
- сердечная недостаточность последние 6 месяцев
- неконтролируемая аритмия, гипотензия (<90/50 мм рт. ст.) или неконтролируемая гипертензия
- инсульт в течение последних 6 месяцев
- потеря зрения вследствие неартериальной передней ишемической оптической нейропатии зрительного нерва, независимо от того, был ли этот эпизод связан с предыдущим воздействием ингибитора фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5)
- лицам с наследственной непереносимостью фруктозы, мальабсорбцией глюкозы-галактозы, дефицитом фермента сукразы-изомальтазы

Лекарственные взаимодействия

Воздействие других веществ на тадалафил

Ингибиторы цитохрома P450: кетоконазол (400 мг в день) увеличивал активность тадалафила (20 мг) в 4 раза и *Stax* на 22%.

Ритонавир, ингибитор протеазы (200 мг 2 раза в сутки), который является ингибитором CYP3A4, CYP2C9, CYP2C19 и CYP2D6, увеличивал действие тадалафила (20 мг) в 2 раза без изменения *Stax*. Другие ингибиторы протеазы, такие как саквинавир и другие ингибиторы CYP3A4, такие как эритромицин, кларитромицин, итраконазол и сок грейпфрута, следует принимать с осторожностью, так как они увеличивают концентрацию тадалафила в плазме.

Стимуляторы цитохрома P450: стимулятор CYP3A4, рифампицин, уменьшает площадь под кривой "концентрация-время" тадалафила на 88% по сравнению с значениями "концентрация-время" только для тадалафила. Ожидается, что это уменьшение воздействия может снизить эффективность тадалафила; Другие стимуляторы CYP3A4, такие как фенобарбитал, фенитоин и карбамазепин, также могут снижать концентрации тадалафила в плазме.

Влияние тадалафила на другие лекарственные средства

Нитраты: в опубликованных исследованиях отмечается, что тадалафил увеличивает гипотензивное действие нитратов. Поэтому применение тадалафила пациентам, которые используют любую форму органических нитратов, противопоказано. Таким образом, пациентам, которым предписана любая доза тадалафила и введение нитрата считается жизненно-важным, по крайней мере, должно пройти 48 часов после последней дозы тадалафила до введения нитрата. В таких условиях нитраты следует вводить только под медицинским наблюдением с соответствующим мониторингом гемодинамики.

Антигипертензивные средства: совместное введение доксазозина (4 и 8 мг в сутки) и тадалафила (20 мг в виде разовой дозы) значительно повышает эффект действия данного альфа-блокатора, этот эффект может длиться не менее двенадцати часов и может быть симптоматичным, включая обморок. Поэтому эта комбинация не рекомендуется.

Этинилэстрадиол и тербуталин: тадалафил вызывает увеличение пероральной биодоступности этинилэстрадиола; аналогичное увеличение можно ожидать при пероральном введении тербуталина, хотя клинические последствия неясны.

Алкоголь: концентрация алкоголя (средняя максимальная концентрация в крови 0,08%) не влияла на совместное введение с тадалафилем. Тадалафил в дозе 20 мг не увеличивал среднее гипотензивное действие, вызванное алкоголем (0,7 г/кг или приблизительно 180 мл 40% спирта у мужчины весом 80 кг), но, у некоторых субъектов наблюдались поостуральное головокружение и ортостатическая гипотензия.

Метаболизм лекарственных средств с участием цитохрома P450: тадалафил не оказывает клинически значимого действия на клиренс лекарств, метаболизм которых протекает с участием изофермента цитохром CYP450. Тадалафил не ингибирует и не индуцирует изоферменты CYP3A4, CYP1A2, CYP2D6, CYP2E1 и CYP2C9 и CYP 2C19. *Субстраты CYP2C9 (например, R-варфарин):* тадалафил не оказывал клинического действия на AUC S-варфарина или R-варфарина. Также тадалафил не оказывал действия на изменение протромбинового времени, индуцируемое варфарином.

Аспирин: тадалафил не усиливал увеличение времени кровотечения, вызванного приемом ацетилсалициловой кислоты.

Особые указания

Перед началом лечения тадалафилем:

- Перед назначением лечения необходимо ознакомиться с медицинским анамнезом пациента и провести физическое обследование диагностики эректильной дисфункции или доброкачественной гиперплазии простаты, а также выявления потенциальных исходных причин.
- Перед началом любых препаратов для лечения эректильной дисфункции необходимо изучить состояние сердечно-сосудистой системы пациента, так как определенная степень риска для сердечно-сосудистой системы

связана с сексуальной активностью. Тадалафил обладает сосудорасширяющими свойствами, приводящими к легкому и преходящему снижению артериального давления, и как таковой потенцирует гипотензивное действие нитратов.

- Оценка эректильной дисфункции должна включать определение потенциальных исходных причин и идентификацию подходящего лечения, после проведенного физического обследования. Неизвестно, эффективен тадалафил для пациентов, подвергшихся операции на тазовых органах или нанервосберегающей простатэктомии.

Сердечно-сосудистая система:

- Сообщалось о развитии тяжелых сердечно-сосудистых заболеваний, связанных с приемом тадалафила, таких как инфаркт миокарда, внезапная сердечная смерть, нестабильная стенокардия, желудочковая аритмия, инсульт, преходящая ишемическая атака, боли в груди, усиление сердцебиения и тахикардия.

- У пациентов, принимающих альфа-1 блокаторы, совместный прием тадалафила может привести к развитию симптоматической гипотензии. Не рекомендуется совместный прием тадалафила и доксазозина.

Снижение зрения и внезапная потеря слуха

- Сообщалось о развитии дефектов зрения и случаях развития передней неартериитной ишемической невропатии зрительного нерва (NAION), вызванных приемом тадалафила и других ингибиторов PDE5. Пациенты должны знать, что в случае внезапного снижения зрения и снижения, или внезапной потери слуха необходимо прекратить прием тадалафила и немедленно обратиться к врачу.

Печеночная недостаточность

- Необходимо соблюдать осторожность при назначении тадалафила пациентам с тяжелой печеночной недостаточностью. Если же необходимо назначение тадалафила, врач должен тщательно оценить соотношение «польза/риск» в каждом индивидуальном случае.

Приапизм и анатомическая деформация полового члена

- Пациенты, испытывающие длительную эрекцию, длящуюся в течение 4 часов и более, должны обязательно обратиться за медицинской помощью. Без своевременного лечения возможно повреждение тканей полового члена и стойкая потеря потенции. Тадалафил следует принимать с осторожностью пациентам с анатомической деформацией полового члена (такой, как искривление, кавернозный фиброз, или болезнь Пейрони (фибропластическая индурация полового члена), а также пациентам с состояниями, предрасполагающими к приапизму (такие как серповидно-клеточная анемия, множественная миелома или лейкемия).

Применение совместно с ингибиторами СYP3A4

С осторожностью следует назначать тадалафил пациентам, принимающим ингибиторы СYP3A4 (ритонавир, саквинавир, кетоконазол, итраконазол, и эритромицин), так как при этом наблюдалось повышенное действие тадалафила (AUC, площадь под кривой «концентрация - время»).

Тадалафил и другие препараты для лечения эректильной дисфункции

Безопасность и эффективность комбинаций тадалафила с другими ингибиторами PDE5 или другими препаратами для лечения эректильной дисфункции не изучена. Пациентов следует информировать о том, что нельзя комбинировать данные препараты.

Передозировка

При однократном назначении здоровым добровольцам в дозе 500 мг и пациентам с эректильной дисфункцией многократно, до 100 мг, нежелательные эффекты были такими же, как и при применении препарата в более низких дозах.

Лечение: проведение стандартной симптоматической терапии. Гемодиализ неэффективен для выведения тадалафила.

Форма выпуска и упаковка

По 1 пленке в пакетики из тройной ламинированной алюминиевой фольги. По 4 пакетики вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения

2 года

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

Zim Laboratories Limited

B-21/22, MIDC Area, Kalmeshwar-441 501, Dist. Nagpur, Maharashtra, Индия

Держатель регистрационного удостоверения

VISTALABSDMCC

Unit No: 3O-01-3048, Jewellery&Gemplex3PlotNo:DMCC-PH2-J&GPlexs, Jewellery&Gemplex, Дубай, Объединенные Арабские Эмираты

Наименование, адрес и контактные данные (телефон, факс, электронная почта) организации на территории Республики Казахстан, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств от потребителей и ответственной за пострегистрационное наблюдение за безопасностью лекарственных средств:

ТОО «Метабол Казахстан», M01M09A1, г.Караганда, ул.Ермекова 110/2
тел.+7(212)43-38-11, факс +7(212)43-38-15

адрес электронной почты: metabolcompany@mail.ru

Қазақстан Республикасы
Денсаулық сақтау министрлігі
Фармация комитеті төрағасының
2018 жылғы “27” 12
№N018984 бұйрығымен
БЕКІТІЛГЕН

**Дәрілік затты медициналық қолдану
жөніндегі нұсқаулық
Эректо-Фаст 10**

Саудалық атауы
Эректо-Фаст 10

Халықаралық патенттелмеген атауы
Тадалафил

Дәрілік түрі
Ауыз қуысында ұсақталатын үлбір, 10 мг

Құрамы

Бір үлбірдің құрамында:

белсенді зат – 10 мг тадалафил,

қосымша заттар: гипромеллоза (5 cps), гипромеллоза (15 cps), пропиленгликоль, глицерин, полисорбат 80, сукралоза, жалбыз майы (дементолданған жалбыз майы), темірдің(III) сары тотығы (E172).

Сипаттамасы

Ақшыл-сары түсті, мөлдір емес, жабыспайтын, ұзындығы 15 ± 1.00 мм, ені 25 ± 0.25 мм тік бұрышты үлбір.

Фармакотерапиялық тобы

Несеп-жыныс жүйесі және жыныс гормондары. Урологиялық препараттар. Эректильді дисфункция кезінде қолданылатын препараттар. Тадалафил. АТХ коды G04BE08

Фармакологиялық қасиеттері

Фармакокинетикасы

Сіңуі

Тадалафил пероральді түрде енгізуден кейін жеңіл сіңеді, ал плазмада орташа ең жоғары концентрацияға (C_{max}) әрі-сәріден соң жетеді. Қолданудан кейінгі тадалафилдің абсолюттік биожетімділігі анықталған жоқ. Тадалафилдің сіңу жылдамдығы және дәрежесі тамаққа байланысты емес, сондықтан үлбірді тамақ ішуге қарамай-ақ қабылдай беруге болады. Қабылдау уақытының (таңертең немесе кешке) сіңу жылдамдығына және дәрежесіне клиникалық тұрғыдан маңызды әсері болған жоқ.

Таралуы

Орташа таралу көлемі 63 литрге жуықты құрайды, бұл тадалафилдің тіндерге таралатындығын көрсетеді. Емдік концентрацияларда плазмадағы тадалафилдің 94%-ы ақуыздармен байланысады. Ақуыздармен байланысуы бүйрек функциясының бұзылуымен өзгермейді. Дені сау адамдарда енгізілген дозаның 0,0005%-дан азы спермадан табылған.

Метаболизмі

Тадалафил көбінесе P450 (CYP) 3A4 цитохромының қатысуымен метаболизденеді. Айналымдағы негізгі метаболиті метилкатехолглюкоронид болып табылады. Ол тадалафилге қарағанда, ФДЭ5 қатысты 13000 есе азырақ белсенді. Демек, бұл метаболиттің клиникалық тұрғыдан маңызды болуы екіталай.

Шығарылуы

Дені сау адамдарда тадалафилдің орташа клиренсі сағатына 2,5 л құрайды, ал орташа T_{1/2} — 17,5 сағат. Тадалафил көбінесе белсенді емес метаболиттер түрінде, негізінен, нәжіспен (61%-ға жуығы) және, аз дәрежеде несеппен (36%-ға жуығы) шығарылады.

Фармакодинамикасы

Тадалафил циклдік гуанозин монофосфатының (цГМФ) спецификалық фосфодиэстеразасының 5 типінің (ФДЭ5) тиімді, қайтымды селективті тежегіші болып табылады. Сексуальді қозу азот тотығының жергілікті босап шығуын туындатқан кезде ФДЭ5-тің тадалафилмен тежелуі жыныс мүшесінің кавернозды денесінде цГМФ деңгейінің жоғарылауына әкеледі. Осының салдары артериялардың тегіс бұлшықеттерінің релаксациясы және жыныс мүшесінің тіндеріне қан ағынының келуі болып табылады, бұл эрекцияны туындатады. Тадалафил сексуальді стимуляциялау жоқ кезде әсер етпейді.

Қолданылуы

- ересек еркек пациенттерде эректильді дисфункцияны емдеу үшін.

Тадалафилдің әсері білінуі үшін сексуальді стимуляция қажет.

Эректо-Фаст әйел адамдардың қолдануына арналмаған.

Қолдану тәсілі және дозалары

Ересек еркектер

Орта жастағы еркектердегі эректильді дисфункция: әдетте тамақтануға қарамай, болжамды сексуальді белсенділікке дейін қабылданатын 10 мг құрайды. Тадалафилдің 10 мг дозасы адекватты әсер бермейтін

пациенттердің сексуальді белсенділіктен, ең кемінде, 30 минут бұрын 20 мг доза қабылдауына болады.

Қабылдаудың ең жоғары жиілігі тәулігіне бір ретті құрайды.

Тадалафил 20 мг болжамды сексуальді белсенділіктің тура алдында пайдалануға арналған және үзіліссіз пайдалану үшін ұсынылмайды.

Пациенттердің ерекше топтары

Егде жастағы еркектер: дозаны түзету қажет емес.

Бүйрек функциясының жеткіліксіздігі бар еркектер: дозаны түзету бүйрек функциясының жеңіл немесе орташа жеткіліксіздігі бар пациенттер үшін қажет емес. Бүйрек функциясының ауыр жеткіліксіздігі бар пациенттер үшін ұсынылатын ең жоғары доза 10 мг құрайды.

Диабеті бар еркектер: дозаны түзету қажет емес.

Балалар: Эректо-Фаст балаларда эректильді дисфункцияны емдеу үшін қолданылмайды.

Қолдану тәсілі

Пероральді түрде қолдануға арналған.

1) Пакетті көрсетілген жерінен ғана, баяу жыртып отырып, ашады. Пакетті кесуге болмайды.

2) Пакеттен үлбірді, оны бүлдіріп алмай, ақырын шығарып алады.

3) Пайдаланар алдында үлбірдің бүлінбегенін тексеру керек. Тек бүлінбеген үлбірді ғана пайдаланған жөн.

4) Үлбірді пациенттің бос тұрған аузына құрғақ қолмен салады.

5) Үлбір тілде сусыз бірнеше секунд ішінде (сілекейде, ақырында ол жұтылады) еруі тиіс.

Жағымсыз әсерлері

Эректильді дисфункцияны немесе простатаның қатерсіз гиперплазиясын емдеу үшін тадалафилді қабылдағанда келесі жағымсыз әсерлер өте жиі дамыды: бас ауыру, диспепсия, арқаның ауыруы, миалгия. Мұндайда осы жағымсыз әсерлердің даму жиілігі тадалафилдің дозасына пропорционалды түрде артты. Осы жағымсыз әсерлер уақытша және көбіне жеңіл немесе орташа болды. Тадалафилді тәулігіне 1 рет қабылдағанда тадалафилмен емдеуді бастаудың алғашқы 10 немесе 30 күн ішінде бас ауырудың көптеп даму жағдайлары білінді.

Жағымсыз реакциялар жиілігінің шартты белгілері: өте жиі ($\geq 1/10$), жиі ($\geq 1/100 - < 1/10$), жиі емес ($\geq 1/1,000 - < 1/100$), сирек ($\geq 1/10,000 - < 1/1,000$), өте сирек ($< 1/10,000$) және белгісіз (қолда бар деректермен жиілігін анықтау мүмкін емес).

Жиі: бас ауыру, қызару, мұрынның бітелуі, диспепсия, арқаның ауыруы, миалгия, аяқ-қолдың ауыруы.

Жиі емес: жоғары сезімталдық реакциялары, бас айналу, көрудің көмескіленуі, көздің ауыруы, құлақтың шуылдауы, тахикардия, жүрек қағуының күшеюі, гипотензия, гипертензия, ентигу, мұрыннан қан кету, іштің ауыруы, құсу, жүректің айнуы, гастроэзофагеальді рефлюкс, бөртпелер, гематурия, ұзаққа созылатын эрекция, кеуденің ауыруы, шеткері ісінулер, әлсіздік.

Сирек: есекжем, инсульт, синкопе, өткінші ишемиялық шабуыл, бас сақинасы, құрысулар, өткінші амнезия, көру аумағының кемістігі, қабақтың ісінуі, конъюнктива гиперемиясы, көру жүйкесінің алдыңғы артерииттік емес ишемиялық нейропатиясы (NAION), торқабық қантамырларының окклюзиясы, естуден кенет айырылу, миокард инфарктісі, тұрақсыз стенокардия, қарыншалық аритмия, есекжем, Стивенс-Джонсон синдромы, эксфолиативті дерматит, гипергидроз, приапизм, пенистен қан кету, гематоспермия, беттің ісінушілігі, жүректен кенет болатын өлім.

Қолдануға болмайтын жағдайлар

- препарат компоненттеріне жоғары сезімталдық
- құрамында кез келген органикалық нитраттар бар препараттарды қабылдау
- сексуальді белсенділік ұсынылмаған, жүрек аурулары бар еркектерге. Дәрігерлер анамнезінде жүрек-қантамыр жүйесінің аурулары бар пациенттерде сексуальді белсенділіктің жүрекке потенциалды қаупін ескеруі тиіс.

Келесі жүрек-қантамыр ауруларында тадалафилді пайдалануға болмайды:

- соңғы 90 күн ішіндегі миокард инфарктісінде
- тұрақсыз стенокардияда немесе жыныстық қатынас кезінде туындайтын стенокардияда
- соңғы 6 ай ішіндегі жүрек функциясының жеткіліксіздігінде
- бақыланбайтын аритмия, гипотензия (<90/50 мм с. б.) немесе бақыланбайтын гипертензияда
- соңғы 6 ай ішіндегі инсультте
- көру жүйкесінің артериялық емес ишемиялық оптикалық нейропатиясы салдарынан көз көрмей қалғанда, осы көріністің мұның алдындағы 5 типті фосфодиэстераза (ФДЭ5) тежегіштерінің әсер етуімен байланысты және байланысты еместігіне қарамайды
- тұқым қуалайтын фруктоза жақпаушылығы, глюкоза-галактоза мальабсорбциясы, сукраза-изомальтаза ферментінің тапшылығы бар адамдарға

Дәрілермен өзара әрекеттесуі

Басқа заттардың тадалафилге әсері

P450 цитохромының тежегіштері: кетоконазол (күніне 400 мг) тадалафилдің (20 мг) белсенділігін 4 есе және C_{\max} 22%-ға арттырды. СYP3A4, СYP2C9, СYP2C19 және СYP2D6 тежегіші болып табылатын ритонавир, протеаза тежегіші (тәулігіне 2 рет 200 мг) 2 реттік тадалафилдің (20 мг) әсерін, C_{\max} өзгертпей-ақ, арттырды. Протеазаның саквинавир сияқты басқа тежегіштерін және эритромицин, кларитромицин, итраконазол және грейпфрут шырыны сияқты СYP3A4 басқа тежегіштерін сақтықпен қабылдаған жөн, өйткені олар плазмадағы тадалафилдің концентрациясын арттырады.

P450 цитохромының стимуляторлары: СҮР3А4 стимуляторы рифампицин тадалафилдің "концентрация-уақыт" қисығы астындағы ауданын, тек тадалафилдің өзінің "концентрация-уақыт" мәндерімен салыстырғанда, 88%-ға азайтады. Әсер етуінің осы азаюы тадалафилдің тиімділігін төмендетуі мүмкін деп күтіледі; СҮР3А4-тің, фенобарбитал, фенитоин және карбамазепин сияқты басқа стимуляторлары да плазмадағы тадалафилдің концентрациясын төмендетуі мүмкін.

Тадалафилдің басқа дәрілік заттарға ықпалы

Нитраттар: жарияланған зерттеулерде нитраттардың гипотензиялық әсерін тадалафилдің арттыратыны байқалады. Сондықтан органикалық нитраттардың кез келген түрін пайдаланатын пациенттерге тадалафилді пайдалануға болмайды. Осылайша, пациенттерге жазып берілген тадалафилдің кез келген дозасы және нитратты енгізу өмірлік маңызды деп саналады, нитратты енгізгенге дейін тадалафилдің соңғы дозасынан кейін, ең жоқ дегенде, 48 сағат өтуі тиіс. Мұндай жағдайларда нитраттарды гемодинамикаға тиісті мониторинг жасай отырып, медициналық бақылаумен ғана енгізген жөн.

Гипертензияға қарсы дәрілер: доксазозинді (тәулігіне 4 және 8 мг) және тадалафилді (бір реттік доза түрінде 20 мг) бірге енгізу осы альфа-блокатордың әсерін едәуір арттырады, бұл әсер кем дегенде он екі сағатқа созылуы және, естен тануды қоса, симптомдық болуы мүмкін. Сондықтан осы біріктірілім ұсынылмайды.

Этинилэстрадиол және тербуталин: тадалафил этинилэстрадиолдың пероральді биожетімділігін арттырады; клиникалық салдарлары айқын болмаса да, тербуталинді пероральді түрде енгізгенде осыған ұқсас жоғарылауды күтуге болады.

Алкоголь: алкогольдің концентрациясы (қандағы орташа ең жоғары концентрация 0,08%) тадалафилмен бірге енгізуге ықпалын тигізген жоқ. Тадалафилдің 20 мг дозасы алкоголь (салмағы 80 кг еркектерде 0.7 г/кг немесе шамамен 180 мл 40% спирт) әсерінен туындаған орташа гипотензиялық әсерді арттырған жоқ, бірақ кейбір субъектілерде постуральді бас айналу және ортостатикалық гипотензия байқалды.

P450 цитохромының қатысуымен болатын дәрілік заттардың метаболизмі: тадалафил метаболизмі СҮР450 цитохромы изоферментінің қатысуымен өтетін дәрілердің клиренсіне клиникалық тұрғыдан маңызды әсерін тигізбейді. Тадалафил СҮР3А4, СҮР1А2, СҮР2D6, СҮР2E1 және СҮР2C9 мен СҮР 2C19 изоферменттерін тежемейді және индукцияламайды.

СҮР2C9 субстраттары (мысалы, R-варфарин): тадалафил S-варфариннің немесе R-варфариннің АUC мәніне клиникалық әсерін тигізген жоқ. Сондай-ақ тадалафил варфаринмен индукцияланатын протромбин уақытының өзгеруіне әсерін тигізген жоқ.

Аспирин: тадалафил ацетилсалицил қышқылын қабылдаудан туындаған қан кету уақытының артуын күшейткен жоқ.

Айрықша нұсқаулар

Тадалафилмен емдеуді бастар алдында:

- Емдеуді тағайындар алдында пациенттің медициналық анамнезімен танысып шығу және эректильді дисфункцияның немесе простатаның катерсіз гиперплазиясының диагностикасына физикалық тексеру жүргізу, сондай-ақ потенциалды бастапқы себептерін анықтау қажет.
- Эректильді дисфункцияны емдеу үшін кез келген препаратты қолдануды бастар алдында пациенттің жүрек-қантамыр жүйесінің жағдайын тексеріп білуі қажет, өйткені жүрек-қантамыр жүйесі үшін белгілі қауіп дәрежесі сексуальді белсенділікпен байланысты. Тадалафилдің артериялық қысымды жеңіл және өткінші төмендетуге әкелетін қантамырларды кеңейткіш қасиеттері, нитраттардың гипотензиялық әсерін де осылай потенциалдайтын қасиеттері бар.
- Эректильді дисфункцияға баға беру потенциалды бастапқы себептерін анықтауды және физикалық тексерулер жүргізгеннен кейін жарамды емді идентификациялауды қамтуы тиіс. Жамбас ағзаларына немесе жүйкені сақтайтын простатэктомияға операция жасалған пациенттер үшін тадалафилдің тиімді екендігі-еместігі белгісіз.

Жүрек-қантамыр жүйесі:

- Тадалафилді қабылдаумен байланысты жүрек-қантамырлардың, миокард инфарктісі, жүректен кенет өлу, тұрақсыз стенокардия, қарыншалық аритмия, инсульт, өткінші ишемиялық шабуыл, кеуденің ауыруы, жүректің күшті қағуы және тахикардия сияқты ауыр сырқаттарының дамығаны жөнінде мәлімделді.
- Альфа-1 блокаторларды қабылдап жүрген пациенттерде тадалафилді бірге қабылдау симптомдық гипотензияның дамуына әкелуі мүмкін. Тадалафилді және доксазозинді бірге қабылдау ұсынылмайды.

Көрудің нашарлауы және естуден кенет айырылу

- Тадалафилді және PDE5 басқа тежегіштерін қабылдау әсерінен көру кемістіктерінің дамуы және көру жүйкесінің алдыңғы артериитті емес ишемиялық невропатиясының (NAION) даму жағдайлары жөнінде мәлімделді. Пациенттер көрудің кенеттен нашарлауы естудің нашарлауы немесе естуден кенеттен айырылу болған жағдайда тадалафил қабылдауды дереу тоқтату және дәрігерге шұғыл қаралу қажет екендігін білуі қажет.

Бауыр функциясының жеткіліксіздігі

- Тадалафилді бауыр функциясының ауыр жеткіліксіздігі бар пациенттерге тағайындағанда сақтық таныту қажет. Егер тадалафилді тағайындау қажет болса, дәрігер әрбір жекелеген жағдайларда «пайда/қауіпі» арақатынасына мұқият баға беруі тиіс.

Приапизм және жыныс мүшесінің анатомиялық деформациясы

- 4 сағат және одан көбірекке созылатын ұзақ эрекцияны басынан өткізіп жүрген пациенттер міндетті түрде медициналық жәрдемге жүгінуі тиіс. Дер кезінде емделмеу жыныс мүшесі тіндерін зақымдап алуы және потенциясынан тұрақты түрде айырылуы мүмкін. Тадалафилді жыныс мүшесінің анатомиялық деформациясы (майысу, кавернозды фиброз сияқты, немесе Пейрони ауруы (жыныс мүшесінің фибропластикалық индурациясы) бар паациенттер, сондай-ақ приапизмге (орақ-жасушалы

анемия, көптеген миелома немесе лейкемия сияқты) бейім жағдайдағы пациенттер сақтықпен қабылдағандары жөн.

СҮРЗА4 тежегіштерімен бірге қолдану

СҮРЗА4 тежегіштерін (ритонавир, саквинавир, кетоконазол, итраконазол және эритромицин) қабылдап жүрген пациенттерге тадалафилді сақтықпен тағайындаған жөн, өйткені мұндайда тадалафилдің әсерінің (AUC, «концентрация - уақыт» қисығы астындағы аудан) жоғарылағаны байқалды.

Тадалафил және эректильді дисфункцияны емдеуге арналған басқа да препараттар

Тадалафилді PDE5 басқа тежегіштерімен немесе эректильді дисфункцияны емдеуге арналған басқа да препараттармен біріктірудің қауіпсіздігі және тиімділігі зерттелген жоқ. Пациенттерді осы препараттарды біріктіруге болмайтындығынан хабардар ету керек.

Артық дозалануы

Дені сау ерікті адамдарға бір реттік 500 мг дозада және эректильді дисфункциясы бар пациенттерге көп реттік 100 мг-ге дейінгі дозада тағайындағанда жағымсыз әсерлер препаратты өте төмен дозаларда қолданған кездегідей болды.

Емі: стандартты симптомдық ем жүргізу. Гемодиализ тадалафилді шығару үшін тиімді емес.

Шығарылу түрі және қаптамасы

Ламинацияланған үш қабат алюминий фольгадан жасалған пакетте 1 үлбірден.

4 пакет медициналық қолдану жөнінде мемлекеттік және орыс тілдеріндегі нұсқаулықпен бірге картон қорапшаға салынған.

Сақтау шарттары

Құрғақ, жарықтан қорғалған жерде, 25°C-ден аспайтын температурада сақтау керек.

Балалардың қолы жетпейтін жерде сақтау керек!

Сақтау мерзімі

2 жыл

Жарамдылық мерзімі өткеннен кейін қолдануға болмайды.

Дәріханалардан босатылу шарттары

Рецепт арқылы

Өндіруші

Zim Laboratories Limited

B-21/22, MIDC Area, Kalmeshwar-441 501, Dist. Nagpur, Maharashtra, Үндістан

Тіркеу куәлігінің ұстаушысы

VISTA LABS DMCC

Unit No: 3O-01-3048, Jewellery & Gemplex 3 Plot No: DMCC-PH2-J&GPlexs, Jewellery & Gemplex, Дубай, Біріккен Араб Әмірліктері

Тұтынушылардан дәрілік заттың сапасы жөніндегі шағымдарды (ұсыныстарды) Қазақстан Республикасы аумағында қабылдайтын және тіркеуден кейін дәрілік заттың қауіпсіздігін бақылауға жауапты ұйымның атауы, мекенжайы және байланыс жасау деректері (телефон, факс, электронды пошта):

«Метабол Қазақстан» ЖШС, M01M09A1, Қарағанды қ., Ермеков к-сі 110/2
тел.+7(212)43-38-11, факс +7(212)43-38-15

электронды пошта: metabolcompany@mail.ru

УТВЕРЖДЕНА
Приказом председателя
Комитета фармации
Министерства здравоохранения
Республики Казахстан
от «27» 12 2018 г.
№N018986

**Инструкция
по медицинскому применению лекарственного средства
Эректо-Фаст 20**

Торговое название

Эректо-Фаст 20

Международное непатентованное название

Тадалафил

Лекарственная форма

Плѐнки диспергируемые в полости рта, 20 мг

Состав

Одна пленка содержит:

активное вещество – тадалафил 20 мг;

вспомогательные вещества: гипромеллоза (5 cps), гипромеллоза (15 cps), пропиленгликоль, глицерин, полисорбат 80, сукралоза, мятное масло (дементолизированное мятное масло), железа(III) оксид желтый (E172).

Описание

Плѐнки прямоугольной формы, светло-жѐлтого цвета, непрозрачные, нелипкие, длиной 30 ± 1.00 мм, шириной 25 ± 0.25 мм.

Фармакотерапевтическая группа

Мочеполовая система и половые гормоны. Урологические препараты. Препараты, применяемые при эректильной дисфункции. Тадалафил.
Код АТХ G04BE08

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

Всасывание

Тадалафил легко всасывается после перорального введения, а средняя максимальная концентрация в плазме (C_{max}) достигается в срединное время. Абсолютная биодоступность тадалафила после применения не была определена. Скорость и степень всасывания тадалафила не зависят от пищи, таким образом, тадалафил пленки можно принимать независимо от

приема пищи. Время приёма (утром или вечером) не имело клинически значимого эффекта на скорость и степень всасывания.

Распределение

Средний объём распределения составляет около 63 литров, что указывает на то, что тадалафил распределяется в ткани. При терапевтических концентрациях 94% тадалафила в плазме связывается с белками. Связывание с белками не изменяется с нарушением функции почек. У здоровых лиц менее 0,0005% введенной дозы обнаружено в сперме.

Метаболизм

Тадалафил преимущественно метаболизируется с участием цитохрома P450 (CYP) 3A4. Основным циркулирующим метаболитом является метилкатехолглюкоронид. Он в 13000 раз менее активен в отношении ФДЭ5, чем тадалафил. Следовательно, этот метаболит вряд ли является клинически значимым.

Выведение

У здоровых лиц средний клиренс тадалафила 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%).

Фармакодинамика

Тадалафил является эффективным, обратимым селективным ингибитором специфической фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5) циклического гуанозин монофосфата (цГМФ). Когда сексуальное возбуждение вызывает местное высвобождение оксида азота, ингибирование ФДЭ5 тадалафилом ведет к повышению уровней 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 не оказывает эффекта в отсутствии сексуального стимулирования.

Показания к применению

- лечение эректильной дисфункции у взрослых пациентов мужского пола. Для проявления эффекта тадалафила необходима сексуальная стимуляция. Эректо-Фаст не предназначен для применения лицами женского пола.

Способ применения и дозы

Взрослые мужчины

Эректильная дисфункция у мужчин среднего возраста: Обычно рекомендуемая доза составляет 10 мг, принятая до предполагаемой сексуальной активности независимо от приема пищи. Тем пациентам, у которых тадалафил в дозе 10 мг не дает адекватного эффекта, можно принять дозу 20 мг, по крайней мере, за 30 минут до сексуальной активности.

Максимальная частота приёма составляет один раз в сутки.

Тадалафил 20 мг предназначен для использования непосредственно перед предполагаемой сексуальной активностью и не рекомендуется для непрерывного использования.

Особые группы пациентов

Пожилые мужчины: корректировка дозы не требуется.

Мужчины с почечной недостаточностью: корректировка дозы не требуется пациентам с легкой или умеренной почечной недостаточностью. Для пациентов с тяжелой почечной недостаточностью максимальная рекомендуемая доза составляет 10 мг.

Мужчины с диабетом: корректировка дозы не требуется.

Дети: Эректо-Фаст не применяется для лечения эректильной дисфункции у детей.

Способ применения

Для перорального применения.

- 1) Открыть пакетик только в указанном месте, медленно отрывая его. Не разрезать пакетик.
- 2) Аккуратно вытащить пленку из пакетика, не повредив ее.
- 3) Перед использованием проверить на наличие повреждений пленки. Следует использовать только неповрежденные пленки.
- 4) Пленку кладут на язык сухими руками в пустой рот пациента.
- 5) Пленка должна раствориться на языке без воды в течение нескольких секунд (в слюне, которую впоследствии следует проглотить).

Побочные действия

Наиболее часто при приеме тадалафила для лечения эректильной дисфункции или доброкачественной гиперплазии простаты развивались следующие побочные действия: головная боль, диспепсия, боли в спине, миалгия. При этом частота развития этих побочных действий увеличивалась пропорционально дозе тадалафила. Данные побочные действия были временными, и чаще всего легкими или умеренными. Большинство случаев развития головной боли при приеме тадалафила 1 раз в сутки отмечались в первые 10 или 30 дней с начала лечения тадалафилом.

Условное обозначение частоты побочных реакций: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100 - < 1/10$), нечасто ($\geq 1/1,000 - < 1/100$), редко ($\geq 1/10,000 - < 1/1,000$), очень редко ($< 1/10,000$) и неизвестно (невозможно определить частоту по имеющимся данным).

Часто: головные боли, покраснение, заложенность носа, диспепсия, боли в спине, миалгия, боли в конечностях.

Нечасто: реакции повышенной чувствительности, головокружение, затуманивание зрения, боли в глазах, звон в ушах, тахикардия, усиление сердцебиения, гипотензия, гипертензия, одышка, носовое кровотечение, боли в животе, рвота, тошнота, гастроэзофагеальный рефлюкс, высыпания, гематурия, длительная эрекция, боли в груди, периферические отеки, слабость.

Редко: крапивница, инсульт, синкопе, преходящая ишемическая атака, мигрень, судороги, преходящая амнезия, дефект поля зрения, отечность век, гиперемия конъюнктивы, передняя неартериитная ишемическая нейропатия зрительного нерва (NAION), окклюзия сосудов сетчатки,

внезапная потеря слуха, инфаркт миокарда, нестабильная стенокардия, желудочковая аритмия, крапивница, синдром Стивенса-Джонсона, эксфолиативный дерматит, гипергидроз, приапизм, кровотечение из пениса, гематоспермия, отёчность лица, внезапная сердечная смерть.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к компонентам препарата
- прием препаратов, содержащих любые органические нитраты
- мужчинам с сердечными заболеваниями, которым сексуальная активность не рекомендована. Врачи должны учитывать потенциальный сердечный риск сексуальной активности пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы в анамнезе

Использование тадалафила противопоказано при следующих сердечно-сосудистых заболеваниях:

- инфаркт миокарда в течение последних 90 дней
- нестабильная стенокардия или стенокардия, возникающая во время полового акта
- сердечная недостаточность последние 6 месяцев
- неконтролируемая аритмия, гипотензия (<90/50 мм рт. ст.) или неконтролируемая гипертензия
- инсульт в течение последних 6 месяцев
- потеря зрения вследствие неартериальной передней ишемической оптической нейропатии зрительного нерва, независимо от того, был ли этот эпизод связан с предыдущим воздействием ингибитора фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5)
- лицам с наследственной непереносимостью фруктозы, мальабсорбцией глюкозы-галактозы, дефицитом фермента сукразы-изомальтазы

Лекарственные взаимодействия

Воздействие других веществ на тадалафил

Ингибиторы цитохрома P450: кетоконазол (400 мг в день) увеличивал активность тадалафила (20 мг) в 4 раза и C_{\max} на 22%.

Ритонавир, ингибитор протеазы (200 мг 2 раза в сутки), который является ингибитором CYP3A4, CYP2C9, CYP2C19 и CYP2D6, увеличивал действие тадалафила (20 мг) в 2 раза без изменения C_{\max} . Другие ингибиторы протеазы, такие как саквинавир и другие ингибиторы CYP3A4, такие как эритромицин, кларитромицин, итраконазол и сок грейпфрута, следует принимать с осторожностью, так как они увеличивают концентрацию тадалафила в плазме.

Стимуляторы цитохрома P450: стимулятор CYP3A4, рифампицин, уменьшает площадь под кривой "концентрация-время" тадалафила на 88% по сравнению с значениями "концентрация-время" только для тадалафила. Ожидается, что это уменьшение воздействия может снизить эффективность тадалафила; Другие стимуляторы CYP3A4, такие как фенобарбитал, фенитоин и карбамазепин, также могут снижать концентрации тадалафила в плазме.

Влияние тадалафила на другие лекарственные средства

Нитраты: в опубликованных исследованиях отмечается, что тадалафил увеличивает гипотензивное действие нитратов. Поэтому применение тадалафила пациентам, которые используют любую форму органических нитратов, противопоказано. Таким образом, пациентам, которым предписана любая доза тадалафила и введение нитрата считается жизненно-важным, по крайней мере, должно пройти 48 часов после последней дозы тадалафила до введения нитрата. В таких условиях нитраты следует вводить только под медицинским наблюдением с соответствующим мониторингом гемодинамики.

Антигипертензивные средства: совместное введение доксазозина (4 и 8 мг в сутки) и тадалафила (20 мг в виде разовой дозы) значительно повышает эффект действия данного альфа-блокатора, этот эффект может длиться не менее двенадцати часов и может быть симптоматичным, включая обморок. Поэтому эта комбинация не рекомендуется.

Этинилэстрадиол и тербуталин: тадалафил вызывает увеличение пероральной биодоступности этинилэстрадиола; аналогичное увеличение можно ожидать при пероральном введении тербуталина, хотя клинические последствия неясны.

Алкоголь: концентрация алкоголя (средняя максимальная концентрация в крови 0,08%) не влияла на совместное введение с тадалафилом. Тадалафил в дозе 20 мг не увеличивал среднее гипотензивное действие, вызванное алкоголем (0.7 г/кг или приблизительно 180 мл 40% спирта у мужчины весом 80 кг), но, у некоторых субъектов наблюдались поостуральное головокружение и ортостатическая гипотензия.

Метаболизм лекарственных средств с участием цитохрома P450: тадалафил не оказывает клинически значимого действия на клиренс лекарств, метаболизм которых протекает с участием изофермента цитохром CYP450. Тадалафил не ингибирует и не индуцирует изоферменты CYP3A4, CYP1A2, CYP2D6, CYP2E1 и CYP2C9 и CYP 2C19. **Субстраты CYP2C9 (например, R-варфарин):** тадалафил не оказывал клинического действия на AUC S-варфарина или R-варфарина. Также тадалафил не оказывал действия на изменение протромбинового времени, индуцируемое варфарином.

Аспирин: тадалафил не усиливал увеличение времени кровотечения, вызванного приемом ацетилсалициловой кислоты.

Особые указания

Перед началом лечения тадалафилом:

- Перед назначением лечения необходимо ознакомиться с медицинским анамнезом пациента и провести физическое обследование диагностики эректильной дисфункции или доброкачественной гиперплазии простаты, а также выявления потенциальных исходных причин.
- Перед началом любых препаратов для лечения эректильной дисфункции необходимо изучить состояние сердечно-сосудистой системы пациента, так как определенная степень риска для сердечно-сосудистой системы

связана с сексуальной активностью. Тадалафил обладает сосудорасширяющими свойствами, приводящими к легкому и преходящему снижению артериального давления, и как таковой потенцирует гипотензивное действие нитратов.

- Оценка эректильной дисфункции должна включать определение потенциальных исходных причин и идентификацию подходящего лечения, после проведенного физического обследования. Неизвестно, эффективен тадалафил для пациентов, подвергшихся операции на тазовых органах или нанервосберегающей простатэктомии.

Сердечно-сосудистая система:

- Сообщалось о развитии тяжелых сердечно-сосудистых заболеваний, связанных с приемом тадалафила, таких как инфаркт миокарда, внезапная сердечная смерть, нестабильная стенокардия, желудочковая аритмия, инсульт, преходящая ишемическая атака, боли в груди, усиление сердцебиения и тахикардия.

- У пациентов, принимающих альфа-1 блокаторы, совместный прием тадалафила может привести к развитию симптоматической гипотензии. Не рекомендуется совместный прием тадалафила и доксазозина.

Снижение зрения и внезапная потеря слуха

- Сообщалось о развитии дефектов зрения и случаях развития передней неартериитной ишемической невропатии зрительного нерва (NAION), вызванных приемом тадалафила и других ингибиторов PDE5. Пациенты должны знать, что в случае внезапного снижения зрения и снижения, или внезапной потери слуха необходимо прекратить прием тадалафила и немедленно обратиться к врачу.

Печеночная недостаточность

- Необходимо соблюдать осторожность при назначении тадалафила пациентам с тяжелой печеночной недостаточностью. Если же необходимо назначение тадалафила, врач должен тщательно оценить соотношение «польза/риск» в каждом индивидуальном случае.

Приапизм и анатомическая деформация полового члена

- Пациенты, испытывающие длительную эрекцию, длящуюся в течение 4 часов и более, должны обязательно обратиться за медицинской помощью. Без своевременного лечения возможно повреждение тканей полового члена и стойкая потеря потенции. Тадалафил следует принимать с осторожностью пациентам с анатомической деформацией полового члена (такой, как искривление, кавернозный фиброз, или болезнь Пейрони (фибропластическая индукция полового члена), а также пациентам с состояниями, предрасполагающими к приапизму (такие как серповидно-клеточная анемия, множественная миелома или лейкемия).

Применение совместно с ингибиторами СYP3A4

С осторожностью следует назначать тадалафил пациентам, принимающим ингибиторы СYP3A4 (ритонавир, саквинавир, кетоконазол, итраконазол, и эритромицин), так как при этом наблюдалось повышенное действие тадалафила (AUC, площадь под кривой «концентрация - время»).

Тадалафил и другие препараты для лечения эректильной дисфункции

Безопасность и эффективность комбинаций тадалафила с другими ингибиторами PDE5 или другими препаратами для лечения эректильной дисфункции не изучена. Пациентов следует информировать о том, что нельзя комбинировать данные препараты.

Передозировка

При однократном назначении здоровым добровольцам в дозе 500 мг и пациентам с эректильной дисфункцией многократно, до 100 мг, нежелательные эффекты были такими же, как и при применении препарата в более низких дозах.

Лечение: проведение стандартной симптоматической терапии. Гемодиализ неэффективен для выведения тадалафила.

Форма выпуска и упаковка

По 1 пленке в пакетики из тройной ламинированной алюминиевой фольги. По 4 пакетики вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения

2 года

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

Zim Laboratories Limited

B-21/22, MIDC Area, Kalmeshwar-441 501, Dist. Nagpur, Maharashtra, Индия

Держатель регистрационного удостоверения

VISTALABSDMCC

Unit No: 3O-01-3048, Jewellery&GempLex3PlotNo:DMCC-PH2-J&GPlexs, Jewellery&GempLex, Дубай, Объединенные Арабские Эмираты

Наименование, адрес и контактные данные (телефон, факс, электронная почта) организации на территории Республики Казахстан, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств от потребителей и ответственной за пострегистрационное наблюдение за безопасностью лекарственных средств:

ТОО «Метабол Казахстан», M01M09A1, г.Караганда, ул.Ермекова 110/2
тел.+7(212)43-38-11, факс +7(212)43-38-15

адрес электронной почты: metabolcompany@mail.ru

Қазақстан Республикасы
Денсаулық сақтау министрлігі
Фармация комитеті төрағасының
2018 жылғы “27” 12
№N018986 бұйрығымен
БЕКІТІЛГЕН

**Дәрілік затты медициналық қолдану
жөніндегі нұсқаулық
Эректо-Фаст 20**

Саудалық атауы
Эректо-Фаст 20

Халықаралық патенттелмеген атауы
Тадалафил

Дәрілік түрі
Ауыз қуысында ұсақталатын үлбір, 20 мг

Құрамы
Бір үлбірдің құрамында:
белсенді зат – 20 мг тадалафил;
қосымша заттар: гипромеллоза (5 cps), гипромеллоза (15 cps),
пропиленгликоль, глицерин, полисорбат 80, сукралоза, жалбыз майы
(дементолданған жалбыз майы), темірдің(III) сары тотығы (E172).

Сипаттамасы
Ақшыл-сары түсті, мөлдір емес, жабыспайтын, ұзындығы 30 ± 1.00 мм, ені
 25 ± 0.25 мм тік бұрышты үлбір.

Фармакотерапиялық тобы
Несеп-жыныс жүйесі және жыныс гормондары. Урологиялық препараттар.
Эректильді дисфункция кезінде қолданылатын препараттар. Тадалафил.
АТХ коды G04BE08

Фармакологиялық қасиеттері

Фармакокинетикасы

Сіңуі

Тадалафил пероральді түрде енгізуден кейін жеңіл сіңеді, ал плазмада орташа ең жоғары концентрацияға (C_{max}) әрі-сәріден соң жетеді. Қолданудан кейінгі тадалафилдің абсолюттік биожетімділігі анықталған жоқ. Тадалафилдің сіңу жылдамдығы және дәрежесі тамаққа байланысты емес, сондықтан үлбірді тамақ ішуге қарамай-ақ қабылдай беруге болады. Қабылдау уақытының (таңертең немесе кешке) сіңу жылдамдығына және дәрежесіне клиникалық тұрғыдан маңызды әсері болған жоқ.

Таралуы

Орташа таралу көлемі 63 литрге жуықты құрайды, бұл тадалафилдің тіндерге таралатындығын көрсетеді. Емдік концентрацияларда плазмадағы тадалафилдің 94%-ы ақуыздармен байланысады. Ақуыздармен байланысуы бүйрек функциясының бұзылуымен өзгермейді. Дені сау адамдарда енгізілген дозаның 0,0005%-дан азы спермадан табылған.

Метаболизмі

Тадалафил көбінесе P450 (CYP) 3A4 цитохромының қатысуымен метаболизденеді. Айналымдағы негізгі метаболиті метилкатехолглюкоронид болып табылады. Ол тадалафилге қарағанда, ФДЭ5 қатысты 13000 есе азырақ белсенді. Демек, бұл метаболиттің клиникалық тұрғыдан маңызды болуы екіталай.

Шығарылуы

Дені сау адамдарда тадалафилдің орташа клиренсі сағатына 2,5 л құрайды, ал орташа T_{1/2} — 17,5 сағат. Тадалафил көбінесе белсенді емес метаболиттер түрінде, негізінен, нәжіспен (61%-ға жуығы) және, аз дәрежеде несеппен (36%-ға жуығы) шығарылады.

Фармакодинамикасы

Тадалафил циклдік гуанозин монофосфатының (цГМФ) спецификалық фосфодиэстеразасының 5 типінің (ФДЭ5) тиімді, қайтымды селективті тежегіші болып табылады. Сексуальді қозу азот тотығының жергілікті босап шығуын туындатқан кезде ФДЭ5-тің тадалафилмен тежелуі жыныс мүшесінің кавернозды денесінде цГМФ деңгейінің жоғарылауына әкеледі. Осының салдары артериялардың тегіс бұлшықеттерінің релаксациясы және жыныс мүшесінің тіндеріне қан ағынының келуі болып табылады, бұл эрекцияны туындатады. Тадалафил сексуальді стимуляциялау жоқ кезде әсер етпейді.

Қолданылуы

- ересек еркек пациенттерде эректильді дисфункцияны емдеу үшін. Тадалафилдің әсері білінуі үшін сексуальді стимуляция қажет. Эректо-Фаст әйел адамдардың қолдануына арналмаған.

Қолдану тәсілі және дозалары

Ересек еркектер

Орта жастағы еркектердегі эректильді дисфункция: әдетте тамақтануға қарамай, болжамды сексуальді белсенділікке дейін қабылданатын 10 мг құрайды. Тадалафилдің 10 мг дозасы адекватты әсер бермейтін пациенттердің сексуальді белсенділіктен, ең кемінде, 30 минут бұрын 20 мг доза қабылдауына болады.

Қабылдаудың ең жоғары жиілігі тәулігіне бір ретті құрайды.

Тадалафил 20 мг болжамды сексуальді белсенділіктің тура алдында пайдалануға арналған және үзіліссіз пайдалану үшін ұсынылмайды.

Пациенттердің ерекше топтары

Егде жастағы еркектер: дозаны түзету қажет емес.

Бүйрек функциясының жеткіліксіздігі бар еркектер: дозаны түзету бүйрек функциясының жеңіл немесе орташа жеткіліксіздігі бар пациенттер үшін қажет емес. Бүйрек функциясының ауыр жеткіліксіздігі бар пациенттер үшін ұсынылатын ең жоғары доза 10 мг құрайды.

Диабеті бар еркектер: дозаны түзету қажет емес.

Балалар: Эректо-Фаст балаларда эректильді дисфункцияны емдеу үшін қолданылмайды.

Қолдану тәсілі

Пероральді түрде қолдануға арналған.

- 1) Пакетті көрсетілген жерінен ғана, баяу жыртып отырып, ашады. Пакетті кесуге болмайды.
- 2) Пакеттен үлбірді, оны бүлдіріп алмай, ақырын шығарып алады.
- 3) Пайдаланар алдында үлбірдің бүлінбегенін тексеру керек. Тек бүлінбеген үлбірді ғана пайдаланған жөн.
- 4) Үлбірді пациенттің бос тұрған аузына құрғақ қолмен салады.
- 5) Үлбір тілде сусыз бірнеше секунд ішінде (сілекейде, ақырында ол жұтылады) еруі тиіс.

Жағымсыз әсерлері

Эректильді дисфункцияны немесе простатаның қатерсіз гиперплазиясын емдеу үшін тадалафилді қабылдағанда келесі жағымсыз әсерлер өте жиі дамыды: бас ауыру, диспепсия, арқаның ауыруы, миалгия. Мұндайда осы жағымсыз әсерлердің даму жиілігі тадалафилдің дозасына пропорционалды түрде артты. Осы жағымсыз әсерлер уақытша және көбіне жеңіл немесе орташа болды. Тадалафилді тәулігіне 1 рет қабылдағанда тадалафилмен емдеуді бастаудың алғашқы 10 немесе 30 күн ішінде бас ауырудың көптеп даму жағдайлары білінді.

Жағымсыз реакциялар жиілігінің шартты белгілері: өте жиі ($\geq 1/10$), жиі ($\geq 1/100 - < 1/10$), жиі емес ($\geq 1/1,000 - < 1/100$), сирек ($\geq 1/10,000 - < 1/1,000$), өте сирек ($< 1/10,000$) және белгісіз (қолда бар деректермен жиілігін анықтау мүмкін емес).

Жиі: бас ауыру, қызару, мұрынның бітелуі, диспепсия, арқаның ауыруы, миалгия, аяқ-қолдың ауыруы.

Жиі емес: жоғары сезімталдық реакциялары, бас айналу, көрудің көмескіленуі, көздің ауыруы, құлақтың шуылдауы, тахикардия, жүрек қағуының күшеюі, гипотензия, гипертензия, ентигу, мұрыннан қан кету,

іштің ауыруы, құсу, жүректің айнуы, гастроэзофагеальді рефлюкс, бөртпелер, гематурия, ұзаққа созылатын эрекция, кеуденің ауыруы, шеткері ісінулер, әлсіздік.

Сирек: есекжем, инсульт, синкопе, өткінші ишемиялық шабуыл, бас сақинасы, құрысулар, өткінші амнезия, көру аумағының кемістігі, қабақтың ісінуі, конъюнктива гиперемиясы, көру жүйкесінің алдыңғы артерииттік емес ишемиялық нейропатиясы (NAION), торқабық қантамырларының окклюзиясы, естуден кенет айырылу, миокард инфарктісі, тұрақсыз стенокардия, қарыншалық аритмия, есекжем, Стивенс-Джонсон синдромы, эксфолиативті дерматит, гипергидроз, приапизм, пенистен қан кету, гематоспермия, беттің ісінушілігі, жүректен кенет болатын өлім.

Қолдануға болмайтын жағдайлар

- препарат компоненттеріне жоғары сезімталдық
- құрамында кез келген органикалық нитраттар бар препараттарды қабылдау
- сексуальді белсенділік ұсынылмаған, жүрек аурулары бар еркектерге. Дәрігерлер анамнезінде жүрек-қантамыр жүйесінің аурулары бар пациенттерде сексуальді белсенділіктің жүрекке потенциалды қаупін ескеруі тиіс.

Келесі жүрек-қантамыр ауруларында тадалафилді пайдалануға болмайды:

- соңғы 90 күн ішіндегі миокард инфарктісінде
- тұрақсыз стенокардияда немесе жыныстық қатынас кезінде туындайтын стенокардияда
- соңғы 6 ай ішіндегі жүрек функциясының жеткіліксіздігінде
- бақыланбайтын аритмия, гипотензия (<90/50 мм с. б.) немесе бақыланбайтын гипертензияда
- соңғы 6 ай ішіндегі инсультте
- көру жүйкесінің артериялық емес ишемиялық оптикалық нейропатиясы салдарынан көз көрмей қалғанда, осы көріністің мұның алдындағы 5 типті фосфодиэстераза (ФДЭ5) тежегіштерінің әсер етуімен байланысты және байланысты еместігіне қарамайды
- тұқым қуалайтын фруктоза жақпаушылығы, глюкоза-галактоза мальабсорбциясы, сукраза-изомальтаза ферментінің тапшылығы бар адамдарға

Дәрілермен өзара әрекеттесуі

Басқа заттардың тадалафилге әсері

P450 цитохромының тежегіштері: кетоконазол (күніне 400 мг) тадалафилдің (20 мг) белсенділігін 4 есе және C_{\max} 22%-ға арттырды.

CYP3A4, CYP2C9, CYP2C19 және CYP2D6 тежегіші болып табылатын ритонавир, протеаза тежегіші (тәулігіне 2 рет 200 мг) 2 реттік тадалафилдің (20 мг) әсерін, C_{\max} өзгертпей-ақ, арттырды. Протеазаның саквинавир сияқты басқа тежегіштерін және эритромицин, кларитромицин,

итраконазол және грейпфрут шырыны сияқты СҮР3А4 басқа тежегіштерін сақтықпен қабылдаған жөн, өйткені олар плазмадағы тадалафилдің концентрациясын арттырады.

Р450 цитохромының стимуляторлары: СҮР3А4 стимуляторы рифампицин тадалафилдің "концентрация-уақыт" қисығы астындағы ауданын, тек тадалафилдің өзінің "концентрация-уақыт" мәндерімен салыстырғанда, 88%-ға азайтады. Әсер етуінің осы азаюы тадалафилдің тиімділігін төмендетуі мүмкін деп күтіледі; СҮР3А4-тің, фенобарбитал, фенитоин және карбамазепин сияқты басқа стимуляторлары да плазмадағы тадалафилдің концентрациясын төмендетуі мүмкін.

Тадалафилдің басқа дәрілік заттарға ықпалы

Нитраттар: жарияланған зерттеулерде нитраттардың гипотензиялық әсерін тадалафилдің арттыратыны байқалады. Сондықтан органикалық нитраттардың кез келген түрін пайдаланатын пациенттерге тадалафилді пайдалануға болмайды. Осылайша, пациенттерге жазып берілген тадалафилдің кез келген дозасы және нитратты енгізу өмірлік маңызды деп саналады, нитратты енгізгенге дейін тадалафилдің соңғы дозасынан кейін, ең жоқ дегенде, 48 сағат өтуі тиіс. Мұндай жағдайларда нитраттарды гемодинамикаға тиісті мониторинг жасай отырып, медициналық бақылаумен ғана енгізген жөн.

Гипертензияға қарсы дәрілер: доксазозинді (тәулігіне 4 және 8 мг) және тадалафилді (бір реттік доза түрінде 20 мг) бірге енгізу осы альфа-блокатордың әсерін едәуір арттырады, бұл әсер кем дегенде он екі сағатқа созылуы және, естен тануды қоса, симптомдық болуы мүмкін. Сондықтан осы біріктірілім ұсынылмайды.

Этинилэстрадиол және тербуталин: тадалафил этинилэстрадиолдың пероральді биожетімділігін арттырады; клиникалық салдарлары айқын болмаса да, тербуталинді пероральді түрде енгізгенде осыған ұқсас жоғарылауды күтуге болады.

Алкоголь: алкогольдің концентрациясы (қандағы орташа ең жоғары концентрация 0,08%) тадалафилмен бірге енгізуге ықпалын тигізген жоқ. Тадалафилдің 20 мг дозасы алкоголь (салмағы 80 кг еркектерде 0.7 г/кг немесе шамамен 180 мл 40% спирт) әсерінен туындаған орташа гипотензиялық әсерді арттырған жоқ, бірақ кейбір субъектілерде постуральді бас айналу және ортостатикалық гипотензия байқалды.

Р450 цитохромының қатысуымен болатын дәрілік заттардың метаболизмі: тадалафил метаболизмі СҮР450 цитохромы изоферментінің қатысуымен өтетін дәрілердің клиренсіне клиникалық тұрғыдан маңызды әсерін тигізбейді. Тадалафил СҮР3А4, СҮР1А2, СҮР2D6, СҮР2E1 және СҮР2C9 мен СҮР 2C19 изоферменттерін тежемейді және индукцияламайды.

СҮР2C9 субстраттары (мысалы, R-варфарин): тадалафил S-варфариннің немесе R-варфариннің АUC мәніне клиникалық әсерін тигізген жоқ. Сондай-ақ тадалафил варфаринмен индукцияланатын протромбин уақытының өзгеруіне әсерін тигізген жоқ.

Аспирин: тадалафил ацетилсалицил қышқылын қабылдаудан туындаған кан кету уақытының артуын күшейткен жоқ.

Айрықша нұсқаулар

Тадалафилмен емдеуді бастар алдында:

- Емдеуді тағайындар алдында пациенттің медициналық анамнезімен танысып шығу және эректильді дисфункцияның немесе простатаның қатерсіз гиперплазиясының диагностикасына физикалық тексеру жүргізу, сондай-ақ потенциалды бастапқы себептерін анықтау қажет.
- Эректильді дисфункцияны емдеу үшін кез келген препаратты қолдануды бастар алдында пациенттің жүрек-қантамыр жүйесінің жағдайын тексеріп білуі қажет, өйткені жүрек-қантамыр жүйесі үшін белгілі қауіп дәрежесі сексуальді белсенділікпен байланысты. Тадалафилдің артериялық қысымды жеңіл және өткінші төмендетуге әкелетін қантамырларды кеңейткіш қасиеттері, нитраттардың гипотензиялық әсерін де осылай потенциалдайтын қасиеттері бар.
- Эректильді дисфункцияға баға беру потенциалды бастапқы себептерін анықтауды және физикалық тексерулер жүргізгеннен кейін жарамды емді идентификациялауды қамтуы тиіс. Жамбас ағзаларына немесе жүйкені сақтайтын простатэктомияға операция жасалған пациенттер үшін тадалафилдің тиімді екендігі-еместігі белгісіз.

Жүрек-қантамыр жүйесі:

- Тадалафилді қабылдаумен байланысты жүрек-қантамырлардың, миокард инфарктісі, жүректен кенет өлу, тұрақсыз стенокардия, қарыншалық аритмия, инсульт, өткінші ишемиялық шабуыл, кеуденің ауыруы, жүректің күшті қағуы және тахикардия сияқты ауыр сырқаттарының дамығаны жөнінде мәлімделді.
- Альфа-1 блокаторларды қабылдап жүрген пациенттерде тадалафилді бірге қабылдау симптомдық гипотензияның дамуына әкелуі мүмкін. Тадалафилді және доксазозинді бірге қабылдау ұсынылмайды.

Көрудің нашарлауы және естуден кенет айырылу

- Тадалафилді және PDE5 басқа тежегіштерін қабылдау әсерінен көру кемістіктерінің дамуы және көру жүйкесінің алдыңғы артериитті емес ишемиялық невропатиясының (NAION) даму жағдайлары жөнінде мәлімделді. Пациенттер көрудің кенеттен нашарлауы естудің нашарлауы немесе естуден кенеттен айырылу болған жағдайда тадалафил қабылдауды дереу тоқтату және дәрігерге шұғыл қаралу қажет екендігін білуі қажет.

Бауыр функциясының жеткіліксіздігі

- Тадалафилді бауыр функциясының ауыр жеткіліксіздігі бар пациенттерге тағайындағанда сақтық таныту қажет. Егер тадалафилді тағайындау қажет болса, дәрігер әрбір жекелеген жағдайларда «пайда/қауіп» арақатынасына мұқият баға беруі тиіс.

Приапизм және жыныс мүшесінің анатомиялық деформациясы

- 4 сағат және одан көбірекке созылатын ұзақ эрекцияны басынан өткізіп жүрген пациенттер міндетті түрде медициналық жәрдемге жүгінуі тиіс. Дер кезінде емделмеу жыныс мүшесі тіндерін зақымдап алуы және

потенциясынан тұрақты түрде айырылуы мүмкін. Тадалафилді жыныс мүшесінің анатомиялық деформациясы (майысу, кавернозды фиброз сияқты, немесе Пейрони ауруы (жыныс мүшесінің фибропластикалық индурациясы) бар паациенттер, сондай-ақ приапизмге (орақ-жасушалы анемия, көптеген миелома немесе лейкемия сияқты) бейім жағдайдағы пациенттер сақтықпен қабылдағандары жөн.

СҮРЗА4 тежегіштерімен бірге қолдану

СҮРЗА4 тежегіштерін (ритонавир, саквинавир, кетоконазол, итраконазол және эритромицин) қабылдап жүрген пациенттерге тадалафилді сақтықпен тағайындаған жөн, өйткені мұндайда тадалафилдің әсерінің (AUC, «концентрация - уақыт» қисығы астындағы аудан) жоғарылағаны байқалды.

Тадалафил және эректильді дисфункцияны емдеуге арналған басқа да препараттар

Тадалафилді PDE5 басқа тежегіштерімен немесе эректильді дисфункцияны емдеуге арналған басқа да препараттармен біріктірудің қауіпсіздігі және тиімділігі зерттелген жоқ. Пациенттерді осы препараттарды біріктіруге болмайтындығынан хабардар ету керек.

Артық дозалануы

Дені сау ерікті адамдарға бір реттік 500 мг дозада және эректильді дисфункциясы бар пациенттерге көп реттік 100 мг-ге дейінгі дозада тағайындағанда жағымсыз әсерлер препаратты өте төмен дозаларда қолданған кездегідей болды.

Емі: стандартты симптомдық ем жүргізу. Гемодиализ тадалафилді шығару үшін тиімді емес.

Шығарылу түрі және қаптамасы

Ламинацияланған үш қабат алюминий фольгадан жасалған пакетте 1 үлбірден.

4 пакет медициналық қолдану жөнінде мемлекеттік және орыс тілдеріндегі нұсқаулықпен бірге картон қорапшаға салынған.

Сақтау шарттары

Құрғақ, жарықтан қорғалған жерде, 25°C-ден аспайтын температурада сақтау керек.

Балалардың қолы жетпейтін жерде сақтау керек!

Сақтау мерзімі

2 жыл

Жарамдылық мерзімі өткеннен кейін қолдануға болмайды.

Дәріханалардан босатылу шарттары

Рецепт арқылы

Өндіруші

Zim Laboratories Limited

B-21/22, MIDC Area, Kalmeshwar-441 501, Dist. Nagpur, Maharashtra,
Үндістан

Тіркеу куәлігінің ұстаушысы

VISTA LABS DMCC

Unit No: 3O-01-3048, Jewellery & Gemplex 3 Plot No: DMCC-PH2-
J&GPlexs, Jewellery & Gemplex, Дубай, Біріккен Араб Әмірліктері

Тұтынушылардан дәрілік заттың сапасы жөніндегі шағымдарды (ұсыныстарды) Қазақстан Республикасы аумағында қабылдайтын және тіркеуден кейін дәрілік заттың қауіпсіздігін бақылауға жауапты ұйымның атауы, мекенжайы және байланыс жасау деректері (телефон, факс, электронды пошта):

«Метабол Қазақстан» ЖШС, M01M09A1, Қарағанды қ., Ермеков к-сі 110/2
тел.+7(212)43-38-11, факс +7(212)43-38-15

электронды пошта: metabolcompany@mail.ru