



ИНСТРУКЦИЯ
(информация для пациента)
по медицинскому применению препарата
В-КАР

Наименование лекарственного средства

В-кар, V-care.

Международное непатентованное название

Силденафил.

Лекарственная форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав:

В-кар 50 мг

Каждая таблетка содержит:

действующее вещество - силденафил (в форме цитрата) 50 мг;

вспомогательные вещества: микрокристаллическая целлюлоза рН 101, магния стеарат, кроскармеллоза натрия, кремния диоксид коллоидный, опадрай II синий: *лактозы моногидрат, гипромеллоза, титана диоксид, полиэтиленгликоль/макрогол, FD&C синий №2/ алюминиевый лак на основе индигокармина E132, FD&C синий №2/ алюминиевый лак на основе синего блестящего E133, железа оксид черный E125.*

В-кар 100 мг

Каждая таблетка содержит:

действующее вещество - силденафил (в форме цитрата) 100 мг;

вспомогательные вещества: микрокристаллическая целлюлоза рН 101, магния стеарат, кроскармеллоза натрия, кремния диоксид коллоидный, опадрай II синий: *лактозы моногидрат, гипромеллоза, титана диоксид, полиэтиленгликоль/макрогол, FD&C синий №2/ алюминиевый лак на основе индигокармина E132, FD&C синий №2/ алюминиевый лак на основе синего блестящего E133, железа оксид черный E125.*

Описание

В-кар 50 мг

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, треугольной формы, голубого цвета

В-кар 100 мг

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, в форме ромба, голубого цвета

Фармакотерапевтическая группа

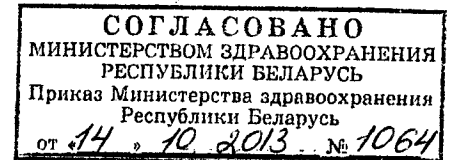
Средства, применяемые при эректильной дисфункции.

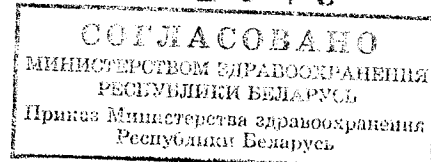
Код АТХ: G04BE03

Фармакологические свойства

При сексуальном возбуждении происходит ингибирование фосфодиэстеразы типа 5 силденафилом, повышается уровень цГМФ, что приводит к расслаблению гладких мышц и повышению кровотока в половом члене.

Применение силденафила неэффективно при отсутствии сексуальной активности.





Механизм действия

Активный ингредиент В-кара Силденафил цитрат является селективным ингибитором цГМФ-специфической фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ-5). Физиологический механизм эрекции предполагает высвобождение оксида азота (NO) в кавернозном теле при сексуальной активности. Оксид азота активирует фермент гуанилатциклазу, что приводит к повышению уровня циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ), расслаблению гладких мышц кавернозного тела и усилению кровотока в половом члене. Силденафил усиливает эффект оксида азота на эту ткань, так как он ингибирует фосфодиэстеразу типа 5 (ФДЭ-5), которая обеспечивает распад цГМФ в кавернозном теле.

Фармакокинетика

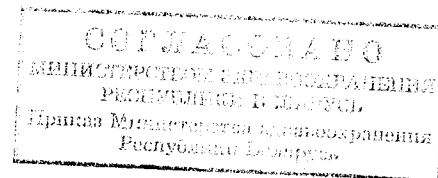
В-кар быстро всасывается при пероральном приеме, абсолютная биодоступность составляет 40%. Его фармакокинетика дозозависима в интервале рекомендуемых доз. Он элиминируется преимущественно печеночным метаболизмом (системой цитохрома P4503A4), превращаясь в активный метаболит; активное вещество и метаболит имеют одинаковый период полувыведения ($T_{1/2}$) 4 часа. Пик концентрации в плазме достигается через 30-120 минут при пероральном приеме натошак. Средний объем распределения при равновесном состоянии (V_d) составляет 105 л, что свидетельствует о распределении по всем тканям организма. Силденафил и его активный N-дисметилметаболит связываются с белками плазмы на 96% независимо от принятой пероральной дозы.

N-дисметилметаболит подвергается дальнейшему метаболизму. N-дисметилметаболит селективен в отношении ФДЭ-5, *in vitro* он демонстрирует активность к ФДЭ-5, составляющую 50% активности силденафила, *in vivo* активность метаболита составляет 20% от активности силденафила. Силденафил экскретируется, в основном, в виде метаболитов с калом (80% от пероральной дозы), и незначительно с мочой (13% от пероральной дозы). Подобная фармакокинетика наблюдается у добровольцев и у пациентов.

Гериатрия: у здоровых пожилых добровольцев (65 лет и старше) наблюдается сниженный клиренс силденафила: свободная концентрация в плазме на 40% превышает концентрацию в плазме у молодых добровольцев (18-45 лет).

Почечная недостаточность: при легкой (клиренс креатинина = 50-80 мл/мин.) и умеренной (клиренс креатинина = 30-49 мл/мин.) почечной недостаточности фармакокинетика разовой пероральной дозы не изменяется. При тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина = <30 мл/мин.), клиренс силденафила снижен по сравнению с клиренсом у пожилых людей без почечной недостаточности (значения AUC и C_{max} удваиваются).

Печеночная недостаточность: у больных с циррозом печени клиренс силденафила снижен, это выражается в повышении значений AUC (84%) и C_{max} (47%) по сравнению с данными у пожилых добровольцев без поражения печени. Рекомендованная начальная доза для таких пациентов составляет 25 мг. Фармакокинетика силденафила у пациентов с тяжелой



печеночной недостаточностью не изучалась.

Показания к применению

Нарушение эрекции, характеризующееся неспособностью к достижению, или сохранению эрекции полового члена, достаточной для проведения удовлетворительного полового акта.

Препарат эффективен только при наличии сексуальной стимуляции.

Способ применения и режим дозирования

Таблетки препарата В-кар принимают внутрь.

Применение у взрослых

Рекомендуемую дозу 50 мг принимают при необходимости примерно за один час до планируемой сексуальной активности. Но в отдельных случаях возможно применение В-кара от 4 часов до 0,5 часа перед сексуальной активностью. С учетом эффективности и переносимости доза может быть увеличена до 100 мг или снижена до 25 мг. Максимальная рекомендуемая доза составляет 100 мг. Максимальная рекомендуемая частота применения – один раз в день.

Применение у пожилых людей и больных с легким и умеренным нарушением функции почек (КК 30 – 80мл/мин)

Рекомендуемая схема применения та же, что и у взрослых.

Применение у больных с тяжелым нарушением функции почек (КК <30 мл/мин) и нарушением функции печени.

Дозу препарата следует снизить до 25 мг/сут.

Применение у больных, принимающих препараты, влияющие на безопасность силденафила

Рассматривается целесообразность назначения препарата в дозе 25 мг/сут в каждом отдельном случае.

Препарат не предназначен для применения у пациентов в возрасте до 18 лет.

Побочные эффекты

Частота развития побочных эффектов определена как: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ до $<1/10$), нечасто ($\geq 1/1\ 000$ до $<1/100$), редко ($\geq 1/10\ 000$ до $<1/1\ 000$), очень редко ($> 1/10\ 000$) и неизвестно (невозможно оценить на основании существующих данных).

Со стороны иммунной системы: редко – реакции гиперчувствительности.

Со стороны нервной системы: очень часто – головная боль; часто – головокружение; нечасто – сонливость, гипестезия; редко – нарушение мозгового кровообращения, обморок; неизвестно – транзиторная ишемическая атака, судороги, провоцирование судорожного припадка.

Со стороны органа зрения: часто – нарушение зрения, нарушение восприятия цвета; нечасто – повреждения конъюнктивы, заболевания глаз, нарушение функции слезных желез, другие расстройства со стороны глаз; неизвестно – передняя ишемическая оптическая невропатия не связанная с артериитом, окклюзия сосудов сетчатки, дефекты полей зрения.

Со стороны органа слуха и вестибулярного аппарата: нечасто – головокружение, шум в ушах; редко – снижение слуха.

Со стороны сердца: нечасто – сердцебиение, тахикардия; редко – инфаркт миокарда, фибрилляция предсердий; неизвестно – желудочковые нарушения ритма сердца, нестабильная стенокардия, внезапная сердечная смерть.

Со стороны сосудов: часто – ощущение «приливов»; редко – гипертензия, гипотензия.

Со стороны дыхательной системы и органов грудной клетки: часто – заложенность носа; редко – носовое кровотечение.

Со стороны пищеварительной системы: часто – диспепсия; нечасто – тошнота, рвота, сухость во рту.

Со стороны кожи и мягких тканей: нечасто – сыпь; неизвестно – синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролизис.

Со стороны мышечной системы и соединительной ткани: нечасто – миалгия.

Со стороны почек и мочевыделительной системы: нечасто – гематурия.

Со стороны репродуктивной системы: нечасто – гематоспермия, кровоизлияния в половой член; неизвестно – приапизм, длительная эрекция.

Прочие побочные реакции: нечасто – боль в грудной клетке, усталость.

Со стороны исследований: нечасто – повышение частоты сердечных сокращений.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к любому компоненту препарата.
- препарат противопоказан к применению у больных, получающих постоянно или с перерывами донаторы оксида азота, органические нитраты или нитраты в любых формах, т.к. силденафил усиливает гипотензивное действие нитратов.
- Средства для лечения эректильной дисфункции, в том числе силденафил, не должны использоваться у мужчин, которым не рекомендуется сексуальная активность (например, пациенты с тяжелыми заболеваниями сердечно-сосудистой системы, такими как нестабильная стенокардия или тяжелая сердечная недостаточность).
- Силденафил противопоказан больным с потерей зрения на один глаз, связанной с передней ишемической оптической невритом не связанной с артериитом, независимо от того, был ли этот эпизод связан с предыдущими приемом ингибитора ФДЭ-5 (см. раздел «Меры предосторожности»).
- Безопасность силденафила не изучалась в следующих подгруппах пациентов и поэтому его использование противопоказано: тяжелая печеночная недостаточность, артериальная гипотензия (артериальное давление <90/50 мм рт. ст.), недавно перенесенный инсульт или инфаркт миокарда, установленный диагноз наследственного дегенеративного заболевания сетчатки, например пигментный ретинит (у части этих пациентов наблюдаются генетические нарушения фосфодиэстеразы сетчатки).

С осторожностью

Препарат следует применять при:

- анатомической деформация полового члена (в том числе ангуляции, кавернозном фиброзе или болезни Пейрони);
- заболеваниях, предрасполагающих к развитию приапизма (таких как серповидно-клеточная анемия, множественная миелома, лейкоз, тромбоцитемия);
- заболеваниях, сопровождающихся кровотечением, обострении язвенной болезни, сердечной недостаточности;
- перенесенной в последние 6 месяцев жизнеугрожающей аритмии, артериальной гипертензии (артериальное давление (АД) > 170/100 мм рт. ст.).

Меры предосторожности

Для диагностики нарушений эрекции, определения возможных их причин и выбора адекватного лечения необходимо собрать полный медицинский анамнез и провести тщательное физикальное обследование.

Сексуальная активность представляет определенный риск при заболеваниях сердца; в связи с этим перед началом любой терапии по поводу нарушений эрекции врач может посчитать нужным обследование сердечно-сосудистой системы. Сексуальная активность является нежелательной у пациентов с сердечной недостаточностью, нестабильной стенокардией, перенесенным в последние 6 месяцев инфарктом миокарда или инсультами, жизнеугрожающими аритмиями, артериальной гипертензией (АД > 170/100 мм рт.ст.) или гипотензией (АД < 90/50 мм рт.ст.).

Силденафил оказывает системное вазодилатирующее действие, которое приводит к преходящему снижению АД. Этот эффект имеет небольшое значение или вообще не приводит к каким-либо последствиям у большинства пациентов. Однако до назначения силденафила врач должен тщательно взвесить риск нежелательных проявлений вазодилатирующего действия у пациентов с определенными сопутствующими заболеваниями, особенно на фоне сексуальной активности. Повышенная восприимчивость к вазодилататорам наблюдается у больных с обструкцией выходного тракта левого желудочка (например, аортальный стеноз, гипертрофическая кардиомиопатия), а также редко встречающимся синдромом множественной системной атрофии, проявляющимся тяжелым нарушением регуляции АД со стороны вегетативной нервной системы.

Поскольку совместное применение силденафила и альфа-адреноблокаторов может привести к симптоматической гипотензии у отдельных чувствительных пациентов, силденафил следует назначать с осторожностью пациентам, принимающим альфа-адреноблокаторы. Врач должен проинформировать пациентов о том, какие действия следует предпринять в случае появления симптомов постуральной гипотензии.

Силденафил усиливает антиагрегантный эффект натрия нитропрусида (донатора оксида азота) на тромбоциты человека *in vitro*.

В постмаркетинговых сообщениях регистрировались серьезные сердечно-сосудистые события, включая инфаркт миокарда, нестабильную

стенокардию, внезапную сердечную смерть, желудочковые аритмии, цереброваскулярные кровотечения, транзиторные ишемические атаки, гипертонию и гипотонию, имеющие временную связь с приемом силденафила. У большинства, но не у всех, из этих пациентов были сердечно-сосудистые факторы риска. Многие события происходили во время или сразу после полового акта; в нескольких сообщениях сердечно-сосудистые события происходили вскоре после употребления силденафила без сексуальной активности. Невозможно определить, являются ли эти события непосредственно связанными с приемом силденафила или другими факторами.

Имеются сообщения о пролонгированной эрекции свыше 4 часов и приапизме (болезненные эрекции длительностью свыше 6 часов); В случае, когда эрекция длится свыше 4 часов, пациенту следует обратиться за медицинской помощью. Если не оказывается неотложная помощь может произойти повреждение ткани пениса, в результате чего наступает перманентная утрата потенции.

Безопасность и эффективность силденафила в комбинации с другими средствами, предназначенными для лечения нарушений эрекции, не изучались. В связи с этим применение подобных комбинаций не рекомендуется.

Следует соблюдать осторожность при назначении силденафила пациентам, принимающих ингибитор протеаз ритонавир, может произойти 11-кратное повышение значения AUC силденафила. Данные о пациентах с высоким сывороточным уровнем силденафила ограничены. Это выражается в снижении артериального давления, обмороке, пролонгированной эрекции - случаи описаны у здоровых добровольцев, получавших 200-800 мг силденафила. Пациентам, принимающим ритонавир, рекомендуется снизить дозу силденафила для избежания побочных эффектов.

Влияние на зрение. Зарегистрированы случаи возникновения дефектов зрения и случаи передней ишемической оптической невропатии не связанных с артериитом, связанные с приемом силденафила и других ингибиторы ФДЭ-5. При возникновении внезапных визуальных дефектов, пациент должен прекратить прием силденафила и обратиться немедленно к врачу (см. раздел «Противопоказания»).

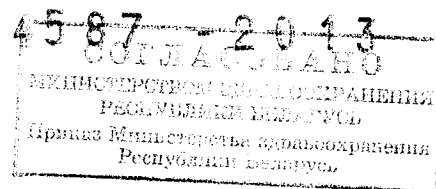
Пленочное покрытие таблетки содержит лактозу. Силденафил не следует назначать мужчинам с редкими наследственными заболеваниями непереносимости галактозы, дефицитом лактазы или синдромом мальабсорбции глюкозы-галактозы.

Применение при беременности и лактации:

В-кар не предназначен для применения у женщин.

Фертильность

Однократный прием препарата В-кар внутрь в дозе 100 мг у здоровых добровольцев не сопровождался изменением подвижности или морфологии



сперматозоидов.

Передозировка

В исследованиях у здоровых добровольцев прием разовой дозы 800 мг силденафила вызывал те же побочные эффекты, что и более низкие дозы хотя уровень числа случаев возрастал.

В случае передозировки рекомендуется поддерживающая терапия.

Почечный диализ не повышает клиренс силденафила из-за его прочной связи с белками плазмы, силденафил не выводится почками.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и пищевыми продуктами

При одновременном применении ингибиторов CYP3A4 (таких как кетоконазол, эритромицин, циметидин) отмечено снижение клиренса силденафила.

Циметидин (800 мг), являющийся неспецифическим ингибитором CYP3A4, при одновременном приеме с силденафилом (50 мг) вызывает повышение концентрации силденафила в плазме на 56%.

Однократный прием силденафила в дозе 100 мг одновременно с эритромицином, специфическим ингибитором CYP3A4 (при приеме эритромицина 2 раза/сут по 500 мг в течение 5 дней), на фоне достижения постоянного уровня эритромицина в крови, приводит к увеличению AUC силденафила на 182%.

При одновременном применении силденафила (однократно в дозе 100 мг) и саквинавира, являющегося как ингибитором ВИЧ-протеазы, так и ингибитором CYP3A4 (при приеме саквинавира 3 раза/сут в дозе 1200 мг), на фоне достижения постоянного уровня саквинавира в крови, максимальная концентрация силденафила в крови повышалась на 140%, а AUC увеличивалась на 210%. Силденафил не оказывал влияния на фармакокинетические параметры саквинавира.

Более сильные ингибиторы изофермента CYP3A4, такие как кетоконазол или итраконазол, могут вызывать более выраженные изменения фармакокинетики силденафила.

Одновременное применение силденафила (однократно в дозе 100 мг) и ритонавира, являющегося ингибитором ВИЧ-протеазы и сильным ингибитором цитохрома P₄₅₀ (при приеме ритонавира по 500 мг 2 раза/сут), на фоне достижения постоянного уровня ритонавира в крови, C_{max} силденафила увеличивалась на 300% (4-кратно), а AUC на 1000% (11-кратно). Через 24 ч уровень силденафила в плазме крови приблизительно составлял 200 нг/мл (сравнительная концентрация при однократном применении одного силденафила через 24 ч составила 5 нг/мл). Это согласуется с действием ритонавира на целый ряд препаратов, являющихся субстратами цитохрома P₄₅₀.

Однократный прием антацида (магния гидроксида/алюминия гидроксида) не влияет на биодоступность силденафила.

Ингибиторы CYP2C9 (такие как толбутамид, варфарин), CYP2D6 (такие как селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, трициклические антидепрессанты), тиазиды и тиазидоподобные диуретики, ингибиторы АПФ и антагонисты кальция не оказывают влияния на фармакокинетические параметры силденафила.

Одновременный прием азитромицина (500 мг/сут в течение 3 дней) не оказывает влияния на AUC, C_{max}, T_{max}, константу скорости выведения и T_{1/2} силденафила или его основного циркулирующего метаболита.

Силденафил является слабым ингибитором изоферментов цитохрома P₄₅₀ - 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 3A4 (ИК₅₀150 мкмоль). Маловероятно, что силденафил может повлиять на клиренс субстратов этих изоферментов.

Силденафил усиливает гипотензивное действие нитратов как при длительном применении, так и при применении по острым показаниям. В связи с этим применение силденафила в сочетании с нитратами или донаторами оксида азота противопоказано.

Никорандил является гибридом активаторов калиевых каналов и нитратов. В связи с наличием нитратного компонента возможно развитие серьезного взаимодействия с силденафилом.

При одновременном приеме альфа-адреноблокатора доксазозина (4 мг и 8 мг) и силденафила (25 мг, 50 мг и 100 мг) у пациентов с доброкачественной гиперплазией предстательной железы со стабильной гемодинамикой среднее дополнительное снижение систолического/диастолического АД в положении лежа на спине составляло 7/7 мм рт.ст., 9/5 мм рт.ст. и 8/4 мм рт.ст., соответственно, а в положении стоя - 6/6 мм рт.ст., 11/4 мм рт.ст. и 4/5 мм рт.ст., соответственно. Сообщается о редких случаях развития у таких пациентов симптоматической постуральной гипотензии, проявлявшейся в виде головокружений (без обморока). У отдельных чувствительных пациентов, получающих альфа-адреноблокаторы, одновременное применение силденафила может привести к симптоматической гипотензии.

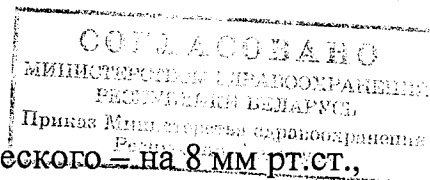
Признаков существенного взаимодействия силденафила с толбутамидом (250 мг) или варфарином (40 мг), которые метаболизируются CYP2C9, не выявлено.

Силденафил в дозе 100 мг не оказывал влияния на фармакокинетические параметры ингибиторов ВИЧ-протеазы при их постоянном уровне в крови, таких как саквинавир и ритонавир, одновременно являющихся субстратами CYP3A4.

Силденафил (50 мг) не вызывал дополнительного увеличения времени кровотечения при приеме ацетилсалициловой кислоты (150 мг).

Силденафил (50 мг) не усиливал гипотензивное действие этанола у здоровых добровольцев при максимальном уровне этанола в крови в среднем 80 мг/мл.

У больных с артериальной гипертензией признаков взаимодействия силденафила (100 мг) с амлодипином не выявлено. Среднее дополнительное



снижение АД в положении лежа составляет: систолического – на 8 мм рт.ст., диастолического – на 7 мм рт.ст.

Отсутствует различие характера побочных эффектов у больных, получавших силденафил в сочетании с антигипертензивными средствами и без них.

Отсутствуют данные о взаимодействии силденафила и неспецифические ингибиторов фосфодиэстеразы, таких как теофиллин или дипиридамол.

Грейпфрутовый сок, являющийся слабым ингибитором CYP3A4 метаболизма в стенке кишечника, может привести к умеренному увеличению силденафила в плазме крови.

Влияние на возможность управления транспортными средствами и работы с опасными приспособлениями и механизмами

В-кар не оказывает влияния на возможность управления транспортными средствами и работу с опасными приспособлениями и механизмами.

Но так как при приеме препарата возможно снижение артериального давления, развитие хроматопсии, затуманенного зрения, следует внимательно относиться к индивидуальному действию препарата в указанных ситуациях, особенно в начале лечения и при изменении режима дозирования.

Условия хранения

Хранить в защищенном от влаги и света месте при температуре не выше +25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Отпуск из аптек

Отпускают из аптек по рецепту.

Упаковка

Таблетки 50 мг № 2 и № 4 (в картонной пачке).

Таблетки 100 мг № 2, № 4, № 20 (в картонной пачке).

Фирма-производитель, страна

Фармакар ПЛС, Палестина для Фармакар Инт. Ко./Германо-Палестинское Совместное предприятие

Палестина, Иерусалим, п/о, а/я 51621.

Представительство компании «Фармакар ПЛС» в Республике Беларусь: г.Минск, 220020 а/я 7.

e-mail: pharmacare@pharmacare.by

Сайт: www.pharmacare.by