

ЛЕВИТРА, инструкция для потребителей.

Одобрено
Фармакологическим государственным
комитетом Минздрава России
17 февраля 2003 г.

ЛИСТОК-ВКЛАДЫШ (Информация для потребителей)

Левитра (LEVITRA) (Варденафил)

- В инструкции содержится резюме основной информации о препарате ЛЕВИТРА в таблетках по 5 мг, 10 мг и 20 мг.
- Пожалуйста, внимательно прочитайте эту инструкцию перед началом приема препарата.
- Сохраните инструкцию. Возможно, вы захотите прочитать ее еще раз.
- Если вам будет что-то непонятно или у вас возникнут дополнительные вопросы, то обратитесь к врачу или фармацевту.

Этот препарат предназначен для вас. Не передавайте его другим людям.

Левитра — препарат для лечения эректильной дисфункции, ингибитор фосфодиэстеразы 5 типа. Применяется для лечения эректильной дисфункции (неспособность достичь и сохранить эрекцию, необходимую для совершения полового акта).

Латинское название: ЛЕВИТРА / LEVITRA.

Состав и форма выпуска: *Левитра* таблетки, покрытые оболочкой, по 1, 2, 3, 4, 6, 8, 9 или 12 шт. в упаковке.

1 таблетка *Левитра* содержит варденафил 5, 10 или 20 мг (5.926, 11.852 или 23.705 мг варденафила гидрохлорида тригидрата, соответственно).

Активное-действующее вещество: Варденафил / Vardenafil.

Свойства / Действие:

Левитра - препарат для лечения эректильной дисфункции, ингибитор фосфодиэстеразы 5 типа (ФДЭ5).

Эрекция полового члена представляет собой гемодинамический процесс, в основе которого лежит расслабление гладких мышц пещеристых тел и расположенных в нем артериол. Во время сексуальной стимуляции из нервных окончаний пещеристых тел выделяется оксид азота (NO), активирующий фермент гуанилатциклазу, что приводит к повышению содержания в пещеристых телах циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ). В результате происходит расслабление гладких мышц пещеристых тел, что способствует увеличению притока крови в половой член.

Левитра (варденафил) блокирует ФДЭ5, под воздействием которой происходит расщепление цГМФ, в результате этого действие эндогенного NO в пещеристых телах

во время сексуальной стимуляции усиливается, что обуславливает способность Левитры усиливать естественную реакцию на сексуальную стимуляцию.

Фармакокинетика:

После приема внутрь Левитра быстро всасывается и начинает действовать через 15 минут (у большинства мужчин через 25 минут), продолжительность действия составляет 4—5 часов.

Стах достигается, как правило, в среднем через 60 мин (от 30 до 120 мин). Абсолютная биодоступность составляет около 15%. При приеме Левитры (варденафила) одновременно с пищей, содержащей большое количество жира, скорость всасывания уменьшается: время достижения Стах в плазме (Тмах) увеличивается до 60 мин, Стах в среднем снижается на 20% без существенного изменения АUC. При приеме Левитры с обычной пищей, содержащей не более 30% жиров, фармакокинетические параметры варденафила (Стах, Тмах, АUC) не изменяются.

Варденафил и его основной метаболит в высокой степени связываются с белками плазмы крови (до 95%), причем это свойство является обратимым и не зависит от общей концентрации препарата. Через 90 мин после приема варденафила внутрь в сперме здоровых мужчин обнаруживается не более 0.00012% полученной дозы.

Варденафил метаболизируется преимущественно в печени при участии изоферментов системы цитохрома P450 - CYP3A4, а также CYP3A5 и CYP2C9.

Средний T1/2 варденафила составляет 4-5 ч, а основного метаболита - около 4 ч. Общий клиренс варденафила составляет 56 л/ч, конечный T1/2 - около 4-5 ч. После приема внутрь варденафил в виде метаболитов выводится преимущественно через кишечник - 91-95% дозы, в меньшей степени почками - 2-6% дозы.

У здоровых мужчин пожилого возраста (65 лет и старше) по сравнению с более молодыми (45 лет и моложе) не отмечено значительного снижения печеночного клиренса варденафила. У мужчин пожилого возраста АUC увеличивается в среднем на 52%. В клинических исследованиях Левитры не наблюдалось различий эффективности и безопасности между пожилыми и молодыми индивидуумами.

У пациентов с незначительными (КК >55-80 мл/мин), умеренными (КК >30-50 мл/мин) и тяжелыми (КК <30 мл/мин) нарушениями функции почек фармакокинетические параметры варденафила были сопоставимы с показателями у здоровых испытуемых. Не отмечено достоверной корреляции между КК и концентрацией варденафила в плазме (АUC и Стах).

У пациентов, находящихся на гемодиализе, фармакокинетика варденафила не изучена. У пациентов с незначительными и умеренными нарушениями функции печени клиренс варденафила снижается пропорционально степени нарушения функции печени. По сравнению со здоровыми мужчинами, у пациентов с незначительными нарушениями функции печени, возможно увеличение АUC и Стах в 1.2 раза, а при умеренных нарушениях функции печени - в 2.6 раза.

У пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени фармакокинетика варденафила не изучена.

Показания:

Эректильная дисфункция (неспособность достичь и сохранить эрекцию, необходимую для совершения полового акта).

Способ применения и дозы:

Внутри. Левитру можно принимать независимо от приема пищи. Левитра действует только при достаточном уровне сексуальной стимуляции.

Препарат Левитра в рекомендованной дозе 10 мг необходимо принимать за 25—60 минут до полового акта. Продолжительность действия Левитры составляет 4—5 часов. При отсутствии положительного эффекта дозу Левитры повышают до 20 мг (сахарный диабет, простатэктомия).

У пациентов, принимающих другие препараты, или при состояниях, сопровождающихся сниженным метаболизмом варденафила, доза Левитры должна составлять 2,5–5 мг.

Доза 5 мг рекомендуется пожилым пациентам (старше 65 лет). В дальнейшем в зависимости от эффективности и переносимости Левитры доза может быть увеличена до 10 мг.

У пациентов с умеренными нарушениями функции печени отмечается снижение клиренса варденафила, поэтому начальная доза Левитры должна составлять 5 мг/сут. У пациентов с незначительными нарушениями функции печени изменения режима дозирования Левитры не требуется.

У пациентов с незначительными, умеренными и тяжелыми нарушениями функции почек изменения режима дозирования Левитры не требуется.

Не следует принимать Левитру более одного раза в сутки. Максимальная рекомендованная доза составляет 20 мг 1 раз в сутки.

Передозировка:

Известно о случаях приема Левитры в дозе 80 мг в сутки, которые не сопровождались развитием серьезных побочных реакций. Однако, в то же время при применении в дозе 40 мг два раза в сутки наблюдаются выраженные боли в пояснице без признаков токсического действия на мышечную и нервную системы.

Лечение: проведение симптоматической и поддерживающей терапии. Поскольку варденафил в высокой степени связывается с белками плазмы и лишь незначительное количество Левитры выводится почками, эффективность гемодиализа маловероятна.

Противопоказания:

Препарат Левитра не рекомендован к применению у пациентов:

- которым противопоказана сексуальная активность в связи с заболеваниями сердечно-сосудистой системы;
- перенесших в течение последних 6 месяцев инфаркт миокарда или инсульт;
- с очень низким уровнем артериального давления (систолическое давление в покое ниже 90 мм рт. ст.);
- с неконтролируемым повышением артериального давления;
- с нестабильной стенокардией;
- с врожденным удлинением интервала QT;
- с аортальным стенозом и идиопатическим гипертрофическим субаортальным стенозом;
- с тяжелой степенью печеночной недостаточности;
- с терминальной стадией почечной недостаточности, требующей проведения диализа;
- с наследственными дегенеративными заболеваниями сетчатки (например, с пигментной ретинопатией);

- с анатомической деформацией полового члена (искривление, кавернозный фиброз, болезнь Пейрони);
- с заболеваниями, предрасполагающими к приапизму (серповидно-клеточная анемия, множественная миелома, лейкемия);
- со склонностью к кровотечениям и с обострением язвенной болезни;
- с гиперчувствительностью к любому компоненту препарата Левитра;
- одновременно применяющих нитраты (нитроглицерин, изосорбида динитрат, изосорбида моонитрат) или препараты, которые являются донаторами оксида азота;
- одновременно применяющих ингибиторы протеаз ВИЧ, такие как индинавир или ритонавир.
- Левитра не показана женщинам и детям до 16 лет.

Применение при беременности и лактации:

Левитра не предназначен для применения у женщин.

Побочное действие:

Левитра в целом переносится хорошо, побочные эффекты, как правило, незначительно или умеренно выражены и имеют преходящий характер.

При проведении клинических испытаний препарата Левитра отмечаемыми побочными реакциями были:

- головная боль, головокружение, нарушения зрения, сонливость, повышение мышечного тонуса;
- диспепсия, тошнота, изменение функциональных "печеночных" тестов, повышение уровня ГГТП;
- "приливы" крови к лицу, артериальная гипертония, синкопальные состояния, ишемия миокарда, носовое кровотечение;
- ринит, диспноэ;
- анафилактические реакции (включая отек гортани), фотосенсибилизация;
- повышение уровня креатинкиназы, миалгия, боли в пояснице;
- глаукома;
- приапизм.

Особые указания и меры предосторожности:

В связи с тем, что сексуальная активность связана с определенной степенью кардинального риска, перед назначением Левитры по поводу эректильной дисфункции необходимо оценить состояние сердечно-сосудистой системы пациента.

Левитра (варденафил) не предназначен для применения у детей.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами:

Перед назначением Левитры пациентам, которые управляют транспортными средствами и работают с механизмами, необходимо выяснить их индивидуальную реакцию на Левитру.

Лекарственное взаимодействие:

Варденафил метаболизируется преимущественно в печени при участии изоферментов системы цитохрома P450, в частности - CYP3A4, а также с некоторым участием изоферментов CYP3A5 и CYP2C9.

Некоторые лекарственные средства могут влиять на метаболизм Левитры, в связи с этим пациенты должны консультироваться с врачом в случае назначения им нового лекарственного средства. Например, для пациентов, принимающих циметидин, кетоконазол, итраконазол, индинавир или ритонавир, максимально допустимая доза

Левитры составляет 5 мг. Доза кетоконазола и итраконазола при этом не должна превышать 200 мг. При одновременном применении с ингибитором СYP3A4 эритромицином не рекомендуется превышать максимальную дозу Левитры 10 мг/сут.

Следует избегать сочетанного приема препарата Левитра с нитратами (например, нитроглицерин, нитропруссид натрия) или блокаторами альфа-адренорецепторов (препаратами для лечения доброкачественной гиперплазии предстательной железы и/или снижения артериального давления), так как совместное применение с указанными препаратами может привести к резкому снижению артериального давления и коллапсу.

Поскольку ингибиторы ФДЭ оказывают влияние на систему оксид азота/цГМФ, ингибиторы ФДЭ5 могут усиливать гипотензивное действие нитратов. Левитру следует применять не ранее, чем через 6 часов после приема альфа-адреноблокаторов, и его доза не должна превышать 5 мг. Однако, при сочетании с альфа-блокатором тамсулозином, прием препаратов по времени может совпадать.

При одновременном применении Левитры с глибенкламидом, нифедипином, варфарином и дигоксином не отмечено значимых изменений фармакокинетики. При одновременном применении Левитры с варфарином не наблюдалось изменения протромбинового времени и факторов свертывания.

При одновременном применении Левитры с ацетилсалициловой кислотой, антацидами, ингибиторами АПФ (эналаприл, каптоприл), бета-адреноблокаторами (пропранолол, атенолол, метопролол и др.), диуретиками, гипогликемическими препаратами (производными сульфонилмочевины и метформином), а также с блокаторами гистаминовых H₂-рецепторов ранитидином и циметидином фармакокинетика варденафила не изменялась.

В исследованиях у человека при одновременном применении Левитры (варденафила) с ацетилсалициловой кислотой не наблюдалось изменения времени кровотечения. В исследованиях на человеческих тромбоцитах *in vitro* показано, что монотерапия варденафилом не подавляет агрегацию тромбоцитов, вызванную различными агонистами тромбоцитов.

Поскольку безопасность и эффективность комбинаций Левитры с другими средствами для лечения эректильной функции (силденафил, тадалафил) не исследовалась, применение таких комбинаций не рекомендуется.

Условия хранения: Хранить в сухом месте при температуре не выше 30°C.

Срок годности: 3 года.

Условия отпуска из аптеки: По рецепту врача.

