**ИНСТРУКЦИЯ ПО ПРИМЕНЕНИЮ**

**СИЛУШКА®**

**SILUSHKA®**

**Торговое название препарата:** Силушка®

**Действующее вещество (МНН):** дапоксетин

**Лекарственная форма:** таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

**Состав:**

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

*активное вещество:*дапоксетина гидрохлорид эквивалентно дапоксетину - 30 мг/60 мг

*вспомогательные вещества:*лактозы моногидрат, микрокристаллическая целлюлоза PH 102, гидроксипропилметилцеллюлоза, очищенная вода, стеарат магния, кроскармеллоза натрия, опадрай серый 03K575000.

**Описание:**

***Силушка® таблетки 30 мг*** – круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой серого цвета, ровные с обеих сторон.

***Силушка® таблетки 60 мг*** – круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой серого цвета, ровные с обеих сторон.

**Фармакотерапевтическая группа:** препараты для лечения урологических заболеваний.

**Код АТХ:** G04BX14.

**Фармакологические свойства**

Дапоксетин - мощный селективный ингибитор обратного захвата серотонина (СИОЗС) при IC50=1,12 нм, в то время как его основные метаболиты, дезметилдапоксетин   
(IC50<1.0 нм) и дидезметилдапоксетин (IC50 = 2,0 нм) эквивалентны или менее мощны (дапоксетин-N-оксид (IC50 = 282 нм)).

Механизм действия дапоксетина, применяемого при преждевременной эякуляции, связан с торможением нейронов обратного захвата серотонина и последующим потенцированием действия нейромедиатора пре-и постсинаптических рецепторов.

***Фармакокинетика***

*Всасывание:*Дапоксетин быстро всасывается и его максимальная плазменная концентрация (Cmax)достигается примерно через 1-2 часа после приема таблеток. Абсолютная биодоступность составляет 42% (диапазон 15-76%), увеличение дозы пропорционально экспозиции (AUC и Cmax) и наблюдается в пределах сильных доз между 30 и 60 мг. После введения нескольких доз, как для дапоксетина, так и активного метаболита десметилдапоксетина (DED), AUC увеличивается примерно на 50% по сравнению созначениями AUC при введении однократной дозы.

*Распространение:* Более 99% дапоксетина и при этом 98,5% - активного метаболита дезметилдапоксетина (DED) ин витро связываются c белками сыворотки крови человека. В устойчивом состоянии дапоксетин имеет средний объем распределения равный 162 л.

*Метаболизм:*Исследования ин витро показывают, что дапоксетин интенсивно метаболизируется в печени и почках ферментами CYP2D6, CYP3A4 и флавинмонооксигеназой 1 (ФMO1). После перорального приема 14С-дапоксетина, дапоксетин интенсивно метаболизируется до образования нескольких метаболитов, в основном следующими биотрансформационными путями как: N-окисление, N-деметилирование, нафтил гидроксилирование, глюкуронидация и сульфатирование. Существуют свидетельства пресистемного метаболизма после перорального приема.

*Элиминация:* Метаболиты дапоксетина в основном выводятся с мочой в виде конъюгатов. Неизменененное активное вещество в моче обнаружено не было. После перорального приема дапоксетин имеет начальный (диспозиция) период полураспада около 1,5 часа, с уровнем в плазме менее чем 5% пиковых концентраций через 24 часа после введения дозы, и терминальный период полураспада около 19 часов. Терминальный период полураспада дезметилдапоксетина составляет примерно 19 часов.

**Показания к применению**

Дапоксетин предназначен для лечения преждевременной эякуляции (ПЭ) у взрослых мужчин в возрасте от 18 до 64 лет.

Дапоксетин следует принимать только пациентам, отвечающим следующим критериям:

* При среднем времени интравагинальной задержки эякуляции (intravaginal ejaculation latency time, или IELT) менее чем две минуты;
* Постоянная или периодическая эякуляция при минимальной сексуальной стимуляции до, во время или вскоре после пенетрации и до пожелания пациента;
* С преждевременной эякуляцией, связанной с трудностями в личной жизни и с проблемами во взаимоотношениях;
* Плохой контроль за эякуляцией;
* При наличии преждевременной эякуляции в большинстве случаев попыток полового акта за предшествующие 6 месяцев.

**Способ применения и дозы**

*Взрослые мужчины (в возрасте от 18 до 64 лет):*

Рекомендуемая стартовая доза для всех пациентов составляет 30 мг, принимается в случае необходимости за 1-3 часа до сексуальной активности. Лечение дапоксетином не следует начинать с дозы 60 мг.

В случае недостаточного индивидуального эффекта при дозе 30 мг и отсутствии у пациента побочных реакций умеренной или тяжелой степени, или же продромальных симптомов, проявляющихся обмороками, доза может быть увеличена до максимальной рекомендованной дозы 60 мг, которая принимается в случае необходимости, приблизительно за 1-3 часа до сексуальной активности. При дозе 60 мг частота и тяжесть побочных эффектов выше.

При наличии у пациента ортостатических реакций во время приема начальной дозы производить увеличение до 60мг не следует.

*Для пожилых (в возрасте 65 лет и старше):*

Эффективность и безопасность дапоксетина у пациентов в возрасте 65 лет и старше установлены не были.

*Для детей:*

Соответствующего использования дапоксетина по причине преждевременной эякуляции в этой группе населения нет. У детей в возрасте до 18 использование дапоксетин таблеток 30/60 мг не рекомендуется.

*Почечная и печеночная недостаточность:*

Следует с осторожностью принимать пациентам с легкой и умеренной почечной недостаточностью и не следует принимать больным с тяжелой почечной недостаточностью. Дапоксетин противопоказан пациентам с умеренными и тяжелыми нарушениями функции печени (по Чайлду-Пью классы В и С).

**Побочные действия**

Побочные эффекты дапоксетина относят к категориям очень часто, часто, редко и очень редко, и перечислены в таблице 1.

В таблице 1 представлены прежде зарегистрированные побочные реакции.

|  |  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- | --- |
| **Таблица 1:** Частота побочных реакций | | | | |
| **Класс системы органов** | **Очень часто**  **(> 1/10)** | **Часто**  **(≥ 1/100 до**  **< 1/10)** | **Редко**  **(≥ 1/1000 до < 1/100)** | **Очень редко**  **(≥ 1/10000 до**  **< 1/1000)** |
| *Психиатрические расстройства* |  | тревога, агитация, беспокойство, бессонница, аномальные сновидения, пониженное либидо | депрессия, депрессивное состояние, эйфорическое состояние, изменения настроения, апатия, спутанное состояние сознания, дезориентация, аномальное мышление, сверх настороженность, нарушения сна, бессонница, ночные кошмары, бруксизм, потеря либидо, аноргазмия |  |
| *Расстройства нервной системы* | головокружение, головные боли | сонливость, расстройства внимания, тремор, парэстезия | обморок, вазовагальный обморок, постуральное головокружение, акатизия, дисгевзия, гиперсомния, вялость | внезапное наступление сна |
| *Расстройства со стороны зрения* |  | затуманенное зрение | мидриаз, боль в глазах, визуальные нарушения |  |
| *Со стороны уха и лабиринта* |  | звон в ушах | головокружение |  |
| *Сердечные растойства* |  |  | синус-арест, синусная брадикардия, тахикардия |  |
| *Сосудистые расстройства* |  | покраснение кожи | гипотензия, систоли-ческая гипертензия |  |
| *Респираторные, торакальныеи медиастинальные растройства* |  | синусные заторы, зевание |  |  |
| *Гастро-энтерологические растройства* | тошнота | диарея, рвота, больв животе, диспепсия, метеоризм, дискомфорт в желудке, вздутие живота, сухость во рту | абдоминальный дискомфорт, дискомфорт в эпигастрии | позывы к дефекации |
| *Со стороны кожи и подкожной клетчатки* |  | гипергидроз | зуд, холодный пот |  |
| *Со стороны репродуктивной системы* |  | расстройства  рекции | неспособность к эякуляции, расстройства мужского оргазма, генитальная парэстезия |  |
| *Общие расстройства и местные реакции* |  | усталость, раздражительность | астения, чувство жара, нервозность, аномальные ощущения, чувство опьянения |  |
| *Обследования* |  | повышенное АД | увеличение частоты сердечных сокращений, увеличение диастолического давления, увеличение ортостатического давления |  |

**Противопоказания**

Дапоксетин противопоказан пациентам с гиперчувствительностью к дапоксетина гидрохлориду или к любым вспомогательным веществам, используемым в композиции.

Значительные патологические сердечные состояния, такие как:

* Сердечная недостаточность (класс NYHA II-IV);
* Развитие аномалий АВ-блокады или синдром слабости синусового узла;
* Выраженная ишемическая болезнь сердца;
* Выраженные поражения клапанов;
* Обмороки в анамнезе;
* Мании или тяжелые депрессии в анамнезе.

**Лекарственные взаимодействия:**

*Взаимодействие с тиоридазином:* Дапоксетин подавляет метаболизм тиоридазина и, как результат, повышенный уровень тиоридазина увеличивает удлинение интервала QTc.

*С ингибиторами ФДЭ-5:* Пациенты, принимающие ингибиторы ФДЭ-5 в связи с возможным понижением ортостатической толерантности, не должны принимать Дапоксетин.

*Эффекты совместно вводимых лекарственных средств на фармакокинетику дапоксетина:* ин витро исследования для человеческой печени, почек и кишечных микросом указывают, что, главным образом, дапоксетин метаболизируется с помощью CYP2D6, CYP3A4 и флавин монооксигеназы 1 (ФMO1). Таким образом, ингибиторы этих ферментов могут привести к уменьшению элиминации дапоксетина.

**Особые указания**

*Фертильность, беременность и лактация*

Дапоксетин не предназначен для женщин.

Какие-либо прямые или косвенные вредные воздействия в отношении рождаемости, беременности или развития эмбриона/плода во время исследований на животных не выявлены.

Также неизвестно, выделяется ли дапоксетин и его метаболиты из организма с материнским молоком.

*Общие рекомендации*

Дапоксетин назначается только мужчинам, страдающим преждевременной эякуляцией, согласно критериям, указанных в разделе терапевтических показаний. Мужчинам, не диагностированным с таким диагнозом дапоксетин назначать не следует.

*Другие формы сексуальной дисфункции*

До лечения, пациенты с другими формами сексуальной дисфункции, в том числе эректильной дисфункции, должны быть тщательно обследованы врачами. Мужчины с эректильной дисфункцией (ЭД), использующие ингибиторы ФДЭ-5,дапоксетин использовать не должны.

*При ортостатической гипотензии*

В случаях документированной истории болезни или подозреваемой ортостатической реакции, следует избегать лечения с использованием дапоксетин.

*Влияние на способность вождения транспортных средств и управления механизмами*

Дапоксетин имеет незначительное или заметное влияние на способность вождения автотранспорта и управления механизмами. В клинических испытаниях у получающих дапоксетин пациентов были зарегистрированы головокружение, нарушение внимания, обмороки, помутнение зрения и сонливость. Поэтому, пациенты должны быть предупреждены избегать ситуаций, приводящих к травме, в том числе вождения и эксплуатации опасных машин.

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте и не использовать после истечения срока годности.

**Передозировка**

В клинических фармакологических исследованиях при приеме суточных доз дапоксетина до 240 мг (две 120 мг дозы, с перерывом между приемами 3 часа) каких-либо неожиданных побочных реакций выявлено не было. В целом, симптомы передозировки СИОЗС средств включают обусловленные серотонином побочные реакции, такие как сонливость, желудочно-кишечные расстройства (тошнота и рвота), тахикардия, тремор, беспокойство и головокружение.

В случае передозировки должны быть предприняты стандартные поддерживающие меры в соответствии с требованиями. В связи с высоким уровнем связывания белка и большого объема распределения дапоксетина гидрохлорида, форсированный диурез, диализ, гемоперфузия и обменное переливание вряд ли принесут облегчение. Специфические антидоты дапоксетина пока не известны.

**Форма выпуска**

1 или 4 таблетки в блистере, 1 блистер в картонной упаковке вместе с инструкцией по медицинскому применению.

**Условия хранения**

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

**Срок годности**

2 года.

**Условия отпуска из аптек**

По рецепту.

**Производитель**

«Kusum Healthcare Pvt. Ltd.»

**Адрес**

SP 289(A), RIICOINDL.AREA, CHOPANKI, BHIWADI (RAJ.), INDIA.