

ІНСТРУКЦІЯ

ДЛЯ МЕДИЧНОГО ЗАСТОСУВАННЯ ЛІКАРСЬКОГО ЗАСОБУ

ЙОХІМБІНУ ГІДРОХЛОРИД

(YOHIMBINE HYDROCHLORIDE)

Склад:

діюча речовина: yohimbine hydrochloride;

1 таблетка містить йохімбіну гідрохлориду 5 мг;

допоміжні речовини: крохмаль картопляний; лактоза, моногідрат; кальцію стеарат; гіпромелоза; целактоза (суміш лактози, моногідрату, та целюлози порошкоподібної (75:25)).

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого або білого з жовтуватим відтінком кольору, з фаскою.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що застосовуються при еректильній дисфункції. Йохімбін. Код АТХ G04B E04.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Йохімбіну гідрохлорид – лікарський засіб, що посилює потенцію (афродизіак), алкалоїд з кори західноафриканського дерева *Corynanthe*.

Механізм дії зумовлений селективним блокуванням α_2 -адренорецепторів. Збільшує центральний обмін адреналіну, тобто активує адренергічні нейрони у центральній нервовій системі, що спричиняє психостимулюючий ефект і посилення реакції. Крім того, можливо, він впливає на серотонінергічні, допамінергічні та холінергічні системи передачі нервових імпульсів.

Експериментально встановлено, що йохімбін активує статеву поведінку і нормалізує знижену внаслідок стресу статеву активність та здатність до коїтусу, відновлює порушення ерекції, спричинене активацією α -адренорецепторів.

Терапевтичний ефект у людини більшою мірою пояснюється ефектами йохімбіну на центральну нервову систему. Крім того, можливим механізмом дії є розширення судин статевого члена і прямий ефект на тканини, що беруть участь в ерекції.

Поясненням частих затримок появи ефекту на 2-3 тижні може бути накопичення активного метаболіту 11-гідроксйохімбіну.

Фармакокінетика.

Всмоктування. Йохімбін повністю абсорбується у травному тракті протягом 1 години. $C_{\max}$ у крові досягається через 45–75 хвилин. AUC (площа під кривою концентрації у плазмі крові) як параметр біодоступності демонструє виражені коливання. Це спричинено не повним всмоктуванням зі шлунково-кишкового тракту, а ефектом першого проходження через печінку. $C_{\max}$ і AUC залежать від дози. При пероральному застосуванні препарату у рекомендованих дозах кумуляції препарату не відбувається.

Розподіл. Рівномірно розподіляється у тканинах. У плазмі крові 82 % йохімбіну зв'язується з білком. Тільки невелика частина йохімбіну та активного метаболіту 11-гідроксйохімбіну (приблизно 2 % від плазмової концентрації) проникає у міжклітинну рідину.

Метаболізм. Йохімбін метаболізується печінкою і позапечінково. Виявлено два гідроксильованих метаболіти: активний метаболіт 11-гідроксйохімбін і менш активний 10-гідроксйохімбін.

Виведення. $T_{1/2}$ йохімбіну після застосування одноразової дози становить від 0,25 до 2,5 години. $T_{1/2}$ 11-гідроксйохімбіну більш тривалий – приблизно 6 годин. Після багаторазового застосування йохімбін виводиться у діапазоні часу від менше 1 години до більше 8 годин.

Клінічні характеристики.

Показання.

Еректильна дисфункція різного походження.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до будь-яких компонентів лікарського засобу. Тяжка артеріальна гіпотензія. Наявність тяжких захворювань печінки і нирок, лікування адреноміметиками.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Не показане одночасне призначення клонідину, оскільки ефекти препаратів взаємно нейтралізуються; можливе також різке зниження артеріального тиску. Йохімбін може змінювати активність антигіпертензивних засобів (антагоністів кальцію, β -адреноблокаторів, інгібіторів ангіотензинперетворюючого ферменту). Йохімбін може потенціювати дію антидепресантів і підвищувати ризик виникнення їх побічних ефектів, може знижувати активність транквілізаторів, зокрема алпразоламу, – не слід застосовувати йохімбін разом з цими лікарськими засобами. Кломіпрамін підвищує рівень йохімбіну у плазмі крові. При застосуванні одночасно з адреноміметиками

(адреналіном, норадреналіном, мезатоном, фетанолом, ефедрином) може знижуватися їх ефективність, у поодиноких випадках – посилюватися гіпертензивна дія.

Особливості застосування.

Слід з обережністю призначати препарат пацієнтам з артеріальною гіпертензією, захворюваннями серця (ішемічна хвороба серця, тахіаритмії), виразковою хворобою шлунка та дванадцятипалої кишки, порушеннями функції нирок або печінки, психічними захворюваннями **з афективними симптомами або тривожними станами, глаукомою.**

Не слід застосовувати пацієнтам літнього віку.

Не рекомендується застосовувати препарат у випадках небезпеки раптового зниження артеріального тиску з рефлекторною тахікардією.

Препарат містить лактозу, тому, якщо у пацієнта встановлена непереносимість деяких цукрів, треба проконсультуватися з лікарем, перш ніж приймати цей лікарський засіб.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Препарат не призначений для застосування жінкам.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Враховуючи, що у хворих з підвищеною індивідуальною чутливістю при застосуванні препарату можуть виникнути побічні реакції (запаморочення, тремор), під час прийому препарату слід утримуватися від керування транспортними засобами та інших робіт, що потребують концентрації уваги.

Спосіб застосування та дози.

Призначати дорослим всередину, під час їди, не розжовуючи та запиваючи склянкою води.

Рекомендована доза – 1-2 таблетки 1-3 рази на добу.

Дозу необхідно підбирати індивідуально, розпочинаючи з прийому 2,5 мг йохімбіну 3 рази на добу і поступово збільшуючи дозу максимально до 1-2 таблеток (5-10 мг) 3 рази на добу.

При необхідності прийому йохімбіну у разовій дозі 2,5 мг слід застосовувати препарат з можливістю такого дозування.

Ефект часто настає із запізненням на 2-3 тижні. У разі виникнення побічних ефектів рекомендується зменшення дози. Після зникнення побічних ефектів дозу можна поступово збільшити.

Тривалість лікування залежить від тяжкості захворювання і становить 3–4 тижні.

Діти. Не застосовувати дітям.

Передозування.

Симптоми інтоксикації. Приблизно через 20–30 хвилин після перорального прийому надмірної дози виникають загальна слабкість, генералізовані парестезії, порушення пам'яті та координації, сильний головний біль, запаморочення, тремор, тахікардія, артеріальна гіпертензія, відчуття страху і тривожності, значне підвищення рівня норадреналіну у плазмі крові (у нормі 150–550 пг/мл), нудота, блювання, мідріаз, слино- та сльозотеча, підвищена пітливість. Приблизно через 4 години виникає біль у грудях, що може тривати кілька годин. Головний біль, артеріальна гіпертензія і тахікардія можуть також зберігатися протягом кількох годин.

Лікування. Відміна лікарського засобу. На ранніх етапах – промивання шлунка з наступним застосуванням активованого вугілля і сульфату натрію (глауберової солі) або тільки активованого вугілля.

Як антидот при передозуванні можна застосовувати клонідин, що швидко нейтралізує як психічні ефекти, так і ефекти з боку симпатичної нервової системи. Початкова доза клонідину становить 0,1–0,2 мг всередину. Далі необхідно прийняти кілька окремих доз по 0,1 мг через інтервали в 1 годину до нормалізації серцево-судинної діяльності і зменшення інших симптомів.

Для лікування гіпертонічного кризу можна застосовувати β -адреноблокатори у комбінації з α -адреноблокатором (наприклад, фентоламіном) або периферичним вазодилататором (наприклад, нітропрусидом). При відчутті страху, тривожності, при галюцинаціях можна призначити бензодіазепіни, якщо симпатоміметичні реакції відсутні або слабо виражені. Не можна призначати нейролептики фенотіазинового ряду.

Побічні реакції.

Кардіальні порушення: збільшення частоти серцевих скорочень.

Неврологічні розлади: головний біль, запаморочення, порушення сну, поява нервозності, тремор, підвищена збудженість, посилення тривожності, манія, пітливість.

Шлунково-кишкові розлади: рідко – нудота та блювання, втрата апетиту, діарея.

Зміни з боку шкіри і підшкірної клітковини: почервоніння шкіри.

Судинні розлади: підвищення артеріального тиску.

Інші: зменшення діурезу, пріапізм (патологічний стан, що характеризується виникненням

тривалої ерекції, яка не пов'язана зі статевим збудженням); в осіб із підвищеною індивідуальною чутливістю можливі алергічні реакції (у т. ч. бронхоспазм, вовчакоподібний синдром, ангіоневротичний набряк).

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. Таблетки № 50 у контейнері у коробці; № 50 у контейнері; № 10×5 у блістерах у коробці. |таблетки|

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. Товариство з обмеженою відповідальністю «Фармацевтична компанія «Здоров'я».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 61013, Харківська обл., місто Харків, вулиця Шевченка, будинок 22.