Инструкция по применению
Абилифай таблетки 30мг N28

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Пуэрто-Рико
Производитель: Бристол-Майерс
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Арипипразол
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 30 мг
Срок годности: 36

Действующее вещество

Арипипразол

Состав

Таблетки арипипразол 30 мг вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, МКЦ, крахмал кукурузный, гидроксипропилцеллюлоза, магния стеарат, краситель железа оксид красный 30 мг

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание: После приема внутрь арипипразол быстро всасывается из ЖКТ. Cmax в плазме достигается через 3-5 ч. Абсолютная биодоступность - 87%. Прием пищи не влияет на биодоступность арипипразола. Распределение и метаболизм: Css достигается через 14 дней. Кумуляция препарата при многократном приеме предсказуема. Показатели фармакокинетики арипипразола в равновесном состоянии пропорциональны дозе. Не отмечено суточных колебаний распределения арипипразола и его метаболита дегидроарипипразола. Арипипразол интенсивно распределяется в тканях, Vd составляет 4.9 л/кг. При терапевтической концентрации более 99% арипипразола связывается с белками сыворотки, главным образом с альбумином. Установлено, что дегидроарипипразол, главный метаболит в плазме человека, обладает такой же аффинностью к допаминовым D2-рецепторам, как и арипипразол. Арипипразол подвергается пресистемному метаболизму лишь в минимальной степени. Метаболизируется в печени тремя способами: дегидрированием, гидроксилированием и N-дезалкилированием. In vitro дегидрирование и гидроксилирование арипипразола происходит под действием изоферментов CYP3A4 и CYP2D6, N-дезалкилирование - CYP3A4. Активность Абилифая главным образом обусловлена наличием неизмененного арипипразола. В равновесном состоянии AUC дегидроарипипразола в плазме составляет около 39% от AUC арипипразола. Выведение: Средний T1/2 арипипразола - около 75 ч. После однократного приема меченного 14C арипипразола примерно 27% и 60% радиоактивности определяется в моче и кале соответственно. Менее 1% неизменного арипипразола определяется в моче и примерно 18% принятой дозы в неизмененном виде выводится с калом. Общий клиренс арипипразола составляет 0.7 мл/мин/кг, главным образом за счет выведения печенью. Арипипразол не влияет на фармакокинетику и фармакодинамику варфарина, т.е. не вытесняет варфарин из связи с белками крови.

Показания

Острые приступы шизофрении (лечение и поддерживающая терапия).Острые маниакальные эпизоды биполярного расстройства I типа (лечение).У пациентов с биполярным расстройством I типа, недавно перенесших маниакальный или смешанный эпизод (поддерживающая терапия).

Способ применения и дозы

Внутрь, независимо от приема пищи. Шизофрения: рекомендуется назначать Абилифай в начальной дозе 10 или 15 мг 1 раз в день. Поддерживающая доза составляет 15 мг/сут. В клинических исследованиях показана эффективность препарата в дозах от 10 до 30 мг/сут. Маниакальные эпизоды при биполярном расстройстве: препарат следует принимать, начиная с дозы 15 или 30 мг/сут. Изменение дозы, при необходимости, надо проводить с интервалом не менее 24 ч. В клинических исследованиях продемонстрирована эффективность препарата в дозах 15–30 мг/сут при маниакальных эпизодах при приеме в течение 3–12 нед. Безопасность доз выше 30 мг/сут в клинических исследованиях не оценивалась. При наблюдении за пациентами с биполярным расстройством I типа и маниакальными или смешанными эпизодами, у которых не было симптомов на фоне приема Абилифая (15 или 30 мг/сут при начальной дозе - 30 мг/сут) в течение 6 нед, установлен благоприятный эффект такой поддерживающей терапии. Следует периодически обследовать пациентов для определения необходимости продолжения поддерживающей терапии. Не требуется изменение дозировки препарата при назначении препарата пациентам с почечной недостаточностью, печеночной недостаточностью (класс А, В и С по классификации Чайлд-Пью). Хотя опыт применения препарата у пациентов в возрасте старше 65 лет ограничен, корректировка дозы для этой категории пациентов не требуется.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к арипипразолу или любому другому компоненту, входящему в состав препарата. Возраст до 18 лет.С осторожностью: Пациентам с сердечно-сосудистыми заболеваниями (ибс или перенесенный инфаркт миокарда, сердечная недостаточность и нарушения проводимости). Пациентам с цереброваскулярными заболеваниями и состояниями, предрасполагающими к гипотензии (обезвоживание, гиповолемия и прием гипотензивных препаратов), в связи с возможностью развития ортостатической гипотензии. Пациентам с судорожными припадками или страдающим заболеваниями, при которых возможны судороги. Пациентам с повышенным риском гипертермии, например при интенсивных физических нагрузках, перегревании, приеме антихолинергических препаратов, при обезвоживании (из-за способности нейролептиков нарушать терморегуляцию). Пациентам с повышенным риском аспирационной пневмонии (из-за риска нарушения моторной функции пищевода и аспирации). Пациентам, страдающим ожирением и при наличии диабета в семье.

Применение при беременности и кормлении грудью

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований безопасности применения при беременности не проводилось. Абилифай можно применять при беременности в случаях, когда потенциальная польза терапии для матери превышает возможный риск для плода. Неизвестно, выделяется ли арипиразол с грудным молоком у человека. Не рекомендуется применение препарата в период лактации (грудного вскармливания). В экспериментальных исследованиях показано, что арипипразол выделяется с молоком у лактирующих крыс.

Побочные действия

Частота побочных эффектов приведена в соответствии со следующей шкалой очень редко - ≤0,01%. редко - ≥0,01% и меньше0,1%. не часто - ≥0,1% и меньше1%. часто - ≥1% и меньше10%. очень часто - ≥10%.Сердечно-сосудистая система очень редко - обмороки. редко - вазовагальный синдром, расширение сердца, трепетание предсердий, тромбофлебит, внутричерепное кровоизлияние, ишемия головного мозга. нечасто - брадикардия, сердцебиение, инфаркт миокарда, удлинение QT интервала, остановка сердца, кровоизлияния, фибрилляция предсердий, сердечная недостаточность, AV блокада, ишемия миокарда, тромбоз глубоких вен, флебит, экстрасистолия. часто - ортостатическая гипотензия, тахикардия.Пищеварительная система очень редко - повышение активности АЛТ и АСТ. редко - эзофагит, кровоточивость десен, воспаление языка, кровавая рвота, кишечные кровотечения, язва двенадцатиперстной кишки, хейлит, гепатит, увеличение печени, панкреатит, прободение кишечника. иногда - повышение аппетита, гастроэнтерит, затрудненное глотание, метеоризм, гастрит, кариес, гингивит, геморрой, желудочно-пищеводный рефлюкс, желудочно-кишечные кровоизлияния, периодонтальный абсцесс, отек языка, недержание кала, колит, ректальные кровотечения, стоматит, изъязвления во рту, холецистит, фекалома, кандидоз слизистой оболочки рта, желчно-каменная болезнь, отрыжка, язва желудка. часто - диспепсия, рвота, запор. очень часто - тошнота, потеря аппетита.Иммунная система очень редко - аллергические реакции (анафилаксия, ангионевротический отек, зуд и крапивница).Костно-мышечная система очень редко - увеличение активности креатинфосфокиназы, рабдомиолиз, тендинит, тендобурсит, ревматоидный артрит, миопатия. иногда - боль в суставах и костях, миастения, артрит, артроз, мышечная слабость, спазмы, бурсит. часто - миалгия, судороги.Нервная система редко - бред, эйфория, буккоглоссальный синдром, акинезия, угнетение сознания вплоть до потери сознания, сниженные рефлексы, навязчивые мысли, злокачественный нейролептический синдром. нечасто - дистония, мышечные подергивания, ослабление концентрации внимания, парестезия, тремор конечностей, импотенция, брадикинезия,

пониженное/повышенное либидо, панические реакции, апатия, дискинезия, ослабление памяти, ступор, амнезия, инсульт, гиперактивность, деперсонализация, дискинезия, синдром «беспокойных ног» (акатизия), миоклонус, подавленное настроение, повышенные рефлексы, замедление мыслительной функции, повышенная чувствительность к раздражителям, гипотония, нарушение глазодвигательной реакции. часто - головокружение, тремор, экстрапирамидный синдром, психомоторное возбуждение, депрессия, нервозность, повышенное слюноотделение, враждебность, суицидальные мысли, маниакальные мысли, нетвердая походка, спутанность сознания, сопротивление выполнению пассивных движений (синдром зубчатого колеса). очень часто - бессонница, сонливость, акатизия.Дыхательная система редко - кровохарканье, аспирационная пневмония, усиленное выделение мокроты, сухость слизистой оболочки носа, отек легких, легочная эмболия, гипоксия, дыхательная недостаточность, апноэ. не часто - астма, носовое кровотечение, икота, ларингит. часто - одышка, пневмония.Кожа и кожные покровы редко - макулопапулезная сыпь, эксфолиативный дерматит, крапивница. не часто - акне, везикулобулезная (пузырчатая) сыпь, экзема, алопеция (облысение), псориаз, себорея. часто - сухость кожи, зуд, повышенная потливость, кожные изъязвления.Органы чувств редко - усиленное слезотечение, частое мигание, наружный отит, амблиопия, глухота, диплопия, глазные кровоизлияния, фотофобия. не часто - сухость глаз, боль в глазах, звон в ушах, воспаление среднего уха, катаракта, потеря вкуса, блефарит. часто - конъюнктивит, боль в ушах.Мочеполовая система редко - боли в молочной железе, цервицит, галакторея, аноргазмия, жжение в области мочеполовой системы, глюкозурия, гинекомастия (увеличение молочных желез у мужчин), мочекаменная болезнь, болезненная эрекция. не часто - цистит, учащенное мочеиспускание, лейкорея, задержка мочеиспускания, гематурия, дизурия, аменорея, преждевременная эякуляция, влагалищное кровотечение, вагинальный кандидоз, почечная недостаточность, маточное кровотечение, меноррагия, альбуминурия, камни в почках, никтурия, полиурия, позывы к мочеиспусканию. часто - недержание мочи. Организм в целом редко - боли в горле, скованность в спине, тяжесть в голове, кандидоз, скованность в области горла, синдром Мендельсона, тепловой удар. не часто - боли в области таза, отек лица, недомогание, светочувствительность, челюстные боли, озноб, скованность челюстей, вздутие живота, напряжение в груди. часто - гриппоподобный синдром, периферический отек, боли в грудной клетке, в шее. Метаболические и нарушения, связанные с питанием редкие - гиперкалиемия, подагра, гипернатриемия, цианоз, закисление мочи, гипогликемическая реакция. не часто - обезвоживание, отек, гиперхолестеринемия, гипергликемия, гипокалиемия, сахарный диабет, повышенный уровень АЛТ, гиперлипидемия, гипогликемия, жажда, повышенное содержание мочевины в крови, гипонатриемия, повышенный уровень АСТ, повышение уровня ЩФ, железодефицитная анемия, повышенный креатинин,

билирубинемия, повышенный уровень лактатдегидрогеназы, ожирение. часто - потеря веса, повышение уровня креатинфосфокиназы.

Передозировка

В клинических исследованиях описаны случайная или умышленная передозировки арипипразола с однократным приемом до 1260 мг, не сопровождавшиеся летальным исходом. Симптомы: летаргия, повышение АД, сонливость, тахикардия, потеря сознания. У госпитализированных пациентов не выявлено клинически значимых изменений основных физиологических показателей, лабораторных параметров и ЭКГ. Описаны случаи передозировки арипипразола у детей (прием до 195 мг). Потенциально опасными симптомами передозировки являются экстрапирамидные расстройства и преходящая потеря сознания. Лечение: контроль жизненно важных функций, ЭКГ, поддерживающая терапия, обеспечение проходимости дыхательных путей, оксигенация, эффективная вентиляция легких, активированный уголь, симптоматическое лечение, тщательное медицинское наблюдение до исчезновения всех симптомов. Данных о применении гемодиализа при передозировке арипипразола нет; благоприятный эффект этого метода маловероятен, т.к. арипипразол не выводится почками в неизмененном виде и в значительной мере связывается с белками плазмы.

Взаимодействие с другими препаратами

Не выявлено существенного влияния блокатора гистаминовых H2-рецепторов фамотидина, вызывающего мощное угнетение секреции соляной кислоты в желудке, на фармакокинетику арипипразола. Известны различные пути метаболизма арипипразола, в т.ч. с участием ферментов CYP2D6 и CYP3A4. В исследованиях у здоровых добровольцев мощные ингибиторы CYP2D6 (хинидин) и CYP3A4 (кетоконазол) уменьшали клиренс арипипразола при приеме внутрь на 52% и 38% соответственно (при одновременном применении с ингибиторами CYP3A4 и CYP2D6 следует уменьшать дозу арипипразола). Прием арипипразола в дозе 30 мг одновременно с карбамазепином, мощным индуктором CYP3A4, сопровождался уменьшением Cmax и AUC арипипразола на 68% и 73% соответственно, и уменьшением Cmax и AUC его активного метаболита дегидроарипипразола на 69% и 71% соответственно. Можно ожидать аналогичное действие и других мощных индукторов CYP3A4 и CYP2D6. В метаболизме арипипразола in vitro не участвуют изоферменты CYP1A1, CYP1A2, CYP2A6, CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19 и CYP2E1, в связи с чем маловероятно его взаимодействие с препаратами и другими факторами (например, курение), способными ингибировать или активировать эти ферменты. Одновременный прием лития или вальпроата с арипипразолом в дозе 30 мг 1 раз/сут не оказал клинически значимого воздействия на фармакокинетику арипипразола. В клинических исследованиях арипипразол в дозах 10-30 мг/сут не оказывал значимого влияния на метаболизм субстратов CYP2D6 (декстрометорфан), CYP2C9 (варфарин), CYP2C19 (омепразол, варфарин) и CYP3A4 (декстрометорфан). Кроме того, арипипразол и его основной метаболит дегидроарипипразол не изменял метаболизм с участием фермента CYP1A2 in vitro. Маловероятно клинически значимое влияние арипипразола на лекарственные препараты, метаболизирующиеся с участием этих изоферментов. При одновременном применении арипипразола (10-30 мг/сут) и ламотриджина (100-400 мг/сут) у пациентов с биполярным расстройством не было изменений фармакокинетики ламотриджина, поэтому коррекции его дозы не требуется. Арипипразол не оказывал влияния на фармакокинетику эсциталопрама, и венлафаксина у здоровых добровольцев, поэтому коррекции доз этих препаратов не требуется при одновременном назначении с арипипразолом. При применении у пациентов с большим депрессивным расстройством арипипразола одновременно с флуоксетином (20-40 мг/сут), пароксетином (37.5 -50 мг/сут) и сертралином (2-20 мг /сут) значительных изменений концентраций антидепрессантов в плазме не выявлено.

Особые указания

Склонность к суицидальным мыслям и попыткам характерна для пациентов с психозом, биполярным расстройством и большим депрессивным расстройством,

поэтому лекарственная терапия должна сочетаться с тщательным медицинским наблюдением. Абилифай следует назначать в минимальной эффективной дозе; это уменьшит риск передозировки. Риск развития поздней дискинезии возрастает по мере увеличения длительности терапии нейролептиками, поэтому при появлении на фоне приема препарата Абилифай симптомов поздней дискинезии следует уменьшить дозу или отменить препарат. После отмены терапии эти симптомы могут временно усилиться или даже впервые появиться. При лечении нейролептиками, в т.ч. арипипразолом возможно развитие ЗНС, который проявляется гиперпирексией, мышечной ригидностью, нарушениями психики и нестабильностью вегетативной нервной системы (нерегулярный пульс и АД, тахикардия, потливость, аритмия). Кроме того, иногда возникают увеличение активности КФК, миоглобинурия (рабдомиолиз) и острая почечная недостаточность. В случае возникновения симптомов ЗНС или необъяснимой лихорадки все нейролептики, в т.ч. Абилифай, следует отменить. Как и другие нейролептики, Абилифай следует применять с осторожностью у пациентов с судорогами в анамнезе и риском их развития. У пациентов с психозами, обусловленными старческим слабоумием, при лечении атипичными нейролептиками риск летального исхода возрастает. При психозах у пациентов старше 65 лет с болезнью Альцгеймера отмечались нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: инфаркт, преходящее ишемическое нарушение мозгового кровообращения, в т.ч. с летальным исходом. Не рекомендуется применение препарата Абилифай при психозах, обусловленных старческим слабоумием и у пожилых пациентов с болезнью Альцгеймера. Гипергликемия, в некоторых случаях выраженная и сопровождающаяся кетоацидозом, которая может привести к гиперосмолярной коме с летальным исходом, была отмечена у пациентов, принимавших атипичные нейролептики. Хотя связь между приемом атипичных нейролептиков и нарушениями гипергликемического типа остается неясной, больные, у которых диагностирован сахарный диабет, должны регулярно проводить определение уровня глюкозы в крови при приеме атипичных нейролептиков. Пациенты, у которых присутствуют факторы риска возникновения сахарного диабета (ожирение, диабет в семейном анамнезе), при приеме атипичных нейролептиков должны проводить определение уровня глюкозы в крови в начале курса и периодически в процессе приема препарата. У пациентов, принимающих атипичные нейролептики, необходим постоянный мониторинг симптомов гипергликемии (усиленная жажда, учащенное мочеиспускание, полифагия, слабость). Особое внимание следует уделять пациентам с сахарным диабетом и факторами риска его развития. В связи с риском развития ортостатической гипотензии Абилифай следует применять с осторожностью у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями (инфаркт миокарда, ИБС, сердечная недостаточность, нарушения сердечной проводимости в анамнезе), нарушениями мозгового кровообращения или состояниями, предрасполагающими к

артериальной гипотензии (обезвоживание, гиповолемия, терапия антигипертензивными средствами). При применении нейролептиков отмечались случаи нарушений перистальтики пищевода и, как следствие, аспирационная пневмония. С осторожностью следует назначать препарат пациентам с факторами риска развития аспирационной пневмонии. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами: Как и при применении других нейролептиков, при назначении Абилифая пациент должен быть предупрежден об опасности работы с движущимися механизмами и управлении автомобилем.

Условия хранения

В сухом месте