Инструкция по применению
Меладапт таблетки покрытые пленочной оболочкой 3 мг 10 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Озон
Порядок отпуска: без рецепта
Действующее вещество: Мелатонин
Количество в упаковке: 10
Дозировка действующего вещества: 3 мг

Описание

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые плёночной оболочкой белого или почти белого цвета, с риской с одной стороны. На поперечном разрезе таблетки видны два слоя: ядро белого или белого с желтоватым оттенком цвета и плёночная оболочка.

Действующее вещество

Мелатонин

Состав

Состав на 1 таблетку: Действующее вещество: мелатонин — 3,00 мг. Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфата дигидрат — 143,25 мг, целлюлоза микрокристаллическая (МКЦ-102) — 100,00 мг, магния стеарат — 2,50 мг, кроскармеллоза натрия — 1,25 мг. Состав оболочки: поливиниловый спирт — 2,70 мг, макрогол-4000 — 1,30 мг, титана диоксид — 1,00 мг

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Абсорбция Мелатонин после приёма внутрь быстро всасывается в желудочно-кишечном тракте. У пожилых пациентов скорость всасывания может быть снижена на 50 %. Фармакокинетика мелатонина в диапазоне доз от 2–8 мг линейная. При приёме

внутрь в дозе 3 мг максимальная концентрация (Cmax) в плазме крови и слюне достигается соответственно через 20 минут и 60 минут. Время достижения Cmax в сыворотке крови 60 минут (нормальный диапазон 20–90 минут). После приёма 3–6 мг мелатонина Cmax в сыворотке крови, как правило, в 10 раз больше эндогенного мелатонина в сыворотке крови ночью. Одновременный приём пищи снижает абсорбцию мелатонина. Биодоступность мелатонина при приёме внутрь колеблется в диапазоне от 9 до 33 % (приблизительно составляет 15 %). Распределение В исследованиях in vitro связь мелатонина с белками плазмы крови составляет 60 %. В основном мелатонин связывается с альбумином, #1-кислым гликопротеином и липопротеидами высокой плотности. Объём распределения около 35 л. Быстро распределяется в слюне и проходит через гематоэнцефалический барьер, определяется в плаценте. Концентрация в спинномозговой жидкости в 2,5 раза ниже, чем в плазме крови. Метаболизм Мелатонин метаболизируется преимущественно в печени. После приёма внутрь подвергается существенному метаболизму при «первичном прохождении» через печень, где происходит его гидроксилирование и конъюгация с сульфатом и глюкуронидом с образованием 6-сульфатоксимелатонина, уровень пресистемного метаболизма может достигать 85 %. Экспериментальные исследования позволяют предположить, что в процессе метаболизма мелатонина принимают участие изоферменты CYP1A1, CYP1A2 и, возможно, CYP2C19 системы цитохрома P450. Основной метаболит мелатонина — 6-сульфатоксимелатонин, неактивен. Выведение Мелатонин выводится почками. Средний период полувыведения (T½) составляет 45 минут. Выведение осуществляется почками, около 90 % в виде сульфатного и глюкуронового конъюгатов 6-сульфатоксимелатонина, а около 2 % — 10 % выводится в неизменённом виде. На фармакокинетические показатели влияют возраст, приём кофеина, табакокурение, приём пероральных контрацептивов. У критических пациентов наблюдается ускоренная абсорбция и нарушенная элиминация. Особые группы пациентов Пожилые пациенты Метаболизм мелатонина, как известно, замедляется с возрастом. При разных дозах мелатонина более высокие значения показателей площади под кривой «концентрация-время» (AUC) и Cmax получены у пожилых пациентов, что отражает сниженный метаболизм мелатонина у этой группы пациентов. Пациенты с нарушением функции почек При длительном применении мелатонина кумуляции не отмечено. Эти данные согласуются с коротким T½ мелатонина у людей. Пациенты с нарушением функции печени Печень является основным органом, участвующим в метаболизме мелатонина, поэтому заболевания печени приводят к повышению концентрации эндогенного мелатонина. У пациентов с циррозом печени плазменная концентрация мелатонина в дневное время суток существенно увеличивалась.

Показания

При расстройствах сна, в том числе обусловленных нарушением ритма «сон-бодрствование», таких как десинхроноз (резкая смена часовых поясов)

Способ применения и дозы

Принимать внутрь. При нарушении сна по 1 таблетке (3 мг) за 30–40 минут до сна, один раз в сутки. При десинхронозе в качестве адаптогена при смене часовых поясов — за 1 день до перелёта и в последующие 2–5 дней — по 1 таблетке за 30–40 минут до сна. Максимальная суточная доза — 2 таблетки (6 мг). Применение у особых групп пациентов Пожилые пациенты (старше 65 лет) С возрастом происходит снижение метаболизма мелатонина, что необходимо учитывать при выборе режима дозирования у пожилых пациентов. С учётом этого у пациентов пожилого возраста возможен приём препарата Меладапт за 60–90 минут до сна. Нарушения функции почек Влияние различной степени нарушений функции почек на фармакокинетику мелатонина не изучено, поэтому препарат Меладапт необходимо принимать с осторожностью у пациентов с лёгкой и умеренной степенью почечной недостаточности. Применение препарата у пациентов с тяжёлой почечной недостаточностью (КК менее 30 мл/мин) противопоказано (см. раздел «Противопоказания»).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к мелатонину и другим компонентам препарата, тяжёлые нарушения функции почек (клиренс креатинина менее 30 мл/мин) аутоиммунные заболевания (отсутствуют клинические данные), печёночная недостаточность, беременность и период грудного вскармливания, возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Применение при беременности и кормлении грудью

Беременность Отсутствуют данные о воздействии мелатонина на течение беременности. Применение препарата Меладапт во время беременности и у женщин, планирующих беременность, не рекомендуется. Период грудного вскармливания В связи с тем, что эндогенный мелатонин определяется в грудном молоке, вероятно, экзогенный мелатонин также может проникать в грудное молоко. При необходимости применения препарата Меладапт в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Побочные действия

Побочные действия систематизированы относительно каждой из систем органов в

зависимости от частоты встречаемости с использованием классификации Всемирной организации здравоохранения: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100), нечасто (≥1/1 000, <1/100), редко (≥1/10 000, <1/1 000), очень редко (<1/10 000, включая единичные случаи), частота неизвестна (недостаточно данных для оценки частоты развития). Инфекционные и паразитарные заболевания: редко — опоясывающий герпес. Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: редко — лейкопения, тромбоцитопения. Нарушения со стороны иммунной системы: частота неизвестна — реакции повышенной чувствительности. Нарушения со стороны обмена веществ и питания: редко — гипертриглицеридемия, гипокалиемия, гипонатриемия. Нарушения со стороны психики: нечасто — раздражительность, нервозность, беспокойство, бессонница, необычные сновидения, ночные кошмары, тревога, редко — перемены настроения, агрессия, ажитация, плаксивость, симптомы стресса, дезориентация, раннее утреннее пробуждение, повышение либидо, снижение настроения, депрессия. Нарушения со стороны нервной системы: нечасто — мигрень, головная боль, вялость, психомоторная гиперактивность, головокружение, сонливость, редко — обморок, нарушение памяти, нарушение концентрации внимания, делирий, синдром «беспокойных ног», плохое качество сна, парестезия. Нарушения со стороны органа зрения: редко — снижение остроты зрения, нечёткость зрения, повышенное слезотечение. Нарушение со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: редко — вертиго, позиционное вертиго. Нарушения со стороны сосудов: нечасто — повышение артериального давления, редко — «приливы» крови к лицу. Нарушения со стороны сердца: редко — стенокардия напряжения, ощущение сердцебиения. Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: нечасто — боль в животе, боль в верхней части живота, диспепсия, язвенный стоматит, сухость во рту, тошнота: редко — гастроэзофагеальная болезнь, желудочно-кишечные нарушения или расстройства, буллезный стоматит, язвенный глоссит, рвота, усиление перистальтики, вздутие живота, гиперсекреция слюны, неприятный запах изо рта, дискомфорт в животе, дискинезия желудка, гастрит. Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: нечасто — гипербилирубинемия. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто — дерматит, повышенное потоотделение по ночам, кожный зуд и генерализованный зуд, кожная сыпь, сухость кожи, редко — экзема, эритема, дерматит рук, псориаз, генерализованная сыпь, зудящая сыпь, поражение ногтей, частота неизвестна — ангионевротический отёк (отёк Квинке), отёк слизистой оболочки полости рта, отёк языка. Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани: нечасто — боль в конечностях, редко — артрит, спазм мышц, боль в шее, ночные судороги. Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: нечасто — глюкозурия, протеинурия, редко — полиурия, гематурия, никтурия. Нарушения со стороны половых органов и молочной железы: нечасто — менопаузальные симптомы, редко — приапизм, простатит, частота неизвестна —

галакторея. Общие расстройства и нарушения в месте введения: нечасто — астения, боль в груди, редко — повышенная утомляемость, боль, чувство жажды. Лабораторные и инструментальные данные: нечасто — отклонение от нормы лабораторных показателей функции печени, увеличение массы тела, редко — повышение активности «печёночных» трансаминаз, отклонение от нормы содержания электролитов в крови, отклонение от нормы результатов лабораторных тестов. Если при применении препарата появляются любые из указанных в инструкции побочных эффектов. или они усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

По опубликованным данным, применение мелатонина в суточной дозе до 300 мг не вызывало клинически значимых нежелательных реакций. Наблюдались гиперемия, спазмы в брюшной полости, диарея, головная боль и скотома при применении мелатонина в дозах 3000–6600 мг в течение нескольких недель. При применении очень высоких доз мелатонина (до 1 г) наблюдалась непроизвольная потеря сознания. При передозировке возможно развитие сонливости. Лечение: промывание желудка и приём активированного угля, симптоматическая терапия. Клиренс действующего вещества предполагается в пределах 12 часов после приёма внутрь.

Взаимодействие с другими препаратами

Фармакокинетическое взаимодействие Известно, что в концентрациях, значительно превышающих терапевтические, мелатонин индуцирует изофермент CYP3A в условиях in vitro. Клиническое значение этого факта до конца неизвестно. В случае развития признаков индукции следует рассмотреть вопрос о снижении дозы одновременно применяемых лекарственных препаратов. В концентрациях, значительно превышающих терапевтические, мелатонин не индуцирует изоферменты группы CYP1A в условиях in vitro. Следовательно, взаимодействие мелатонина с лекарственными препаратами, вследствие влияния мелатонина на изоферменты группы CYP1A, по-видимому, незначительно. Метаболизм мелатонина, главным образом, опосредован изоферментами CYP1A. Следовательно, возможно взаимодействие мелатонина с другими лекарственными препаратами, вследствие влияния мелатонина на изоферменты группы CYP1A. Следует соблюдать осторожность в отношении пациентов, принимающих флувоксамин, который при одновременном применении с мелатонином повышает его концентрацию (увеличение AUC в 17 раз и Cmax в 12 раз) в плазме крови за счёт ингибирования его метаболизма изоферментами системы цитохрома P450: CYP1A2 и CYP2C19. Следует избегать их одновременного применения. Необходимо соблюдать осторожность в отношении

пациентов, принимающих 5- и 8-метоксипсорален, который повышает концентрацию мелатонина в плазме крови вследствие ингибирования его метаболизма. Следует соблюдать осторожность в отношении пациентов, принимающих циметидин (ингибитор изофермента CYP2D), поскольку он повышает концентрацию мелатонина в плазме крови за счёт ингибирования последнего. Табакокурение снижает концентрацию мелатонина в плазме крови за счёт ингибирования изофермента CYP1A2. Требуется соблюдать осторожность в отношении пациентов, принимающих эстрогены (например, контрацептивы или заместительную гормональную терапию), которые увеличивают концентрацию мелатонина в плазме крови за счёт ингибирования их метаболизма изоферментами CYP1A1 и CYP1A2. Ингибиторы изофермента CYPA2, например, хинолоны, способны повышать экспозицию мелатонина при одновременном применении. Индукторы изофермента CYP1A2, такие как карбамазепин и рифампицин, способны снижать плазменную концентрацию мелатонина при одновременном применении. В современной литературе опубликовано множество данных, касающихся влияния агонистов/антагонистов адренергических и опиоидных рецепторов, антидепрессантов, ингибиторов простагландина, бензодиазепинов, триптофана и этанола на секрецию эндогенного мелатонина. Исследования возможного взаимодействия этих лекарственных препаратов на фармакодинамику и фармакокинетику мелатонина не проводились. Фармакодинамическое взаимодействие Этанол при одновременном применении с мелатонином снижает его эффективность. Меладапт потенцирует седативное действие бензодиазепиновых и небензодиазепиновых снотворных препаратов, таких как залеплон, золпидем и зопиклон. В ходе клинического исследования наблюдались чёткие признаки транзиторного фармакодинамического взаимодействия между мелатонином и золпидемом через 1 час после их применения. Одновременное применение может приводить к прогрессирующему расстройству внимания, памяти и координации в сравнении с монотерапией золпидемом. В ходе клинических исследований мелатонин применялся одновременно стиоридазином и имипрамином, лекарственными препаратами, которые влияют на центральную нервную систему. Ни в одном случае не было выявлено клинически значимого фармакокинетического взаимодействия. Тем не менее, одновременное применение с мелатонином приводило к увеличению ощущения спокойствия и к затруднениям в выполнении определённых занятий в сравнении с монотерапией имипрамином, а также к усилению чувства «помутнения в голове», в сравнении с монотерапией тиоридазином.

Особые указания

В период применения препарата Меладапт рекомендуется избегать пребывания на ярком свету. Необходимо проинформировать женщин, планирующих беременность, о наличии у препарата слабого контрацептивного действия. Отсутствуют клинические данные о применении мелатонина у пациентов с аутоиммунными заболеваниями, в связи с чем, применение препарата у данной категории пациентов не рекомендуется (см. раздел «Противопоказания»). При применении препарата Меладапт не следует употреблять алкоголь, который снижает его эффективность. С возрастом происходит снижение метаболизма мелатонина, что необходимо учитывать при выборе режима дозирования у пожилых пациентов (см. раздел «Способ применения и дозы»). Влияние на способность управлять транспортными средствами или работать с механизмами При применении препарата Меладапт следует воздержаться от вождения транспортных средств и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций (риск развития сонливости).

Срок хранения после открытия

3 года. Не применять по истечении срока, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить в сухом защищенном от света недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.