Инструкция по применению
Резолор Таблетки покрытые пленочной оболочкой 2 мг 28 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Италия
Производитель: Janssen-Cilag
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Прукалоприд
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 2 мг



Описание

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой розового цвета. На одной стороне - гравировка «PRU 2». На поперечном разрезе ядро таблетки белого или почти белого цвета.

Действующее вещество

Прукалоприд

Состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 2 мг:Действующее вещество: прукалоприда сукцинат 2,642 мг в пересчете на 2 мг прукалоприда.Вспомогательные вещества:Ядро таблетки: лактозы моногидрат - 165,458 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 30,00 мг, кремния диоксид коллоидный - 0,40 мг, магния стеарат - 1,50 мг, пленочное покрытие розовое 7,00 мг.Состав пленочного покрытия розового в процентах по массе:Гипромеллоза 6 сР - 40%, краситель железа оксид красный (Е172) - 0,09%, титана диоксид - 23,88%, макрогол 3000 - 8 %, триацетин - 6%, лактозы моногидрат - 22 %, индигокармин (Е132) - 0,02 %, краситель железа оксид желтый (Е172) - 0,01%.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание:Прукалоприд быстро всасывается, после однократного перорального приема дозы 2 мг у здоровых субъектов максимальная концентрация (Cmax) достигалась через 2-3 ч. Абсолютная биодоступность после перорального приема составляет > 90%. Прием препарата во время еды не влияет на биодоступность. Распределение:Прукалоприд распределяется по всему организму, объем распределения в равновесном состоянии (Vdss) составляет 567 л. Связывание прукалоприда с белками плазмы крови составляет примерно 30%.Метаболизм: Прукалоприд выводится в основном в неизмененном виде. Метаболизм препарата в печени человека in vitro протекает очень медленно, и образуется лишь небольшое количество метаболитов. В исследовании пероральных доз прукалоприда с радиоактивной меткой у человека было обнаружено семь метаболитов в небольшом количестве в моче и кале. На основной метаболит в экскрементах, R107504, приходилось 3,2% и 3,1% дозы в моче и кале, соответственно. Другими метаболитами, идентифицированными и количественно определенными в моче и кале, были R084536 (образованный путем N-деалкилирования), составляющий 3% дозы, и продукты гидроксилирования (3% от дозы) и N-окисления (2% от дозы). Неизмененное действующее вещество составило около 92-94 % от общей радиоактивности плазмы. R107504, R084536 и R104065 (образованные путем O-деметилирования) были идентифицированы как второстепенные метаболиты плазмы.Выведение:Большая часть перорально принятой дозы активного компонента выводится в неизмененном виде (примерно 60-65 % почками и по крайней мере 5% с калом). Выведение неизмененного прукалоприда почками включает пассивную фильтрацию и активную секрецию. Клиренс прукалоприда из плазмы крови составляет в среднем 317 мл/мин, конечный период полувыведения - примерно 1 день. Равновесное состояние достигается через 3-4 дня приема препарата, причем при приеме прукалоприда в дозе 2 мг 1 раз в день минимальная и максимальная концентрации в плазме крови в равновесном состоянии составляют 2,5 и 7 нг/мл соответственно. При приеме 1 раз в день коэффициент k препарата колеблется от 1,9 до 2,3. Фармакокинетика прукалоприда пропорциональна дозе в терапевтическом диапазоне и за его пределами (проверено до 20 мг). При длительном приеме препарата 1 раз в день его фармакокинетика не зависит от длительности приема.Особые группы пациентов: Популяционная фармакокинетикаПопуляционный анализ фармакокинетики показал, что общий клиренс прукалоприда коррелирует с клиренсом креатинина и не зависит от возраста, веса тела, пола или расы пациентов.Пациенты пожимого возрастаПри приеме препарата пожилыми пациентами в дозе 1 мг 1 раз в день максимальная концентрация прукалоприда в плазме крови и площадь под кривой «концентрациявремя» (AUC) были на 26% и 28% соответственно больше, чем у молодых пациентов. Это различие может быть связано с ослаблением функции почек у пожилых людей.Нарушение функции почекПо сравнению с пациентами с

нормальной функцией почек, у пациентов со слабым (клиренс креатинина 50-79 мл /мин) и умеренно выраженным (КК 25-49 мл/мин) нарушением функции почек концентрация прукалоприда в плазме крови после однократного приема в дозе 2 мг была повышена на 25% и 51% соответственно. У пациентов с тяжелым нарушением функции почек (клиренс креатинина ⩽ 24 мл/мин) концентрация прукалоприда в плазме крови была в 2,3 раза выше, чем у здоровых людей (См. разделы ”Способ применения и дозы“ и ”Особые указания”).Нарушение функции печениОколо 35% прукалоприда выводится экстраренально. В небольшом фармакокинетическом исследовании Cmax и AUC прукалоприда были в среднем на 10 - 20% выше у пациентов с умеренной и тяжелой печеночной недостаточностью по сравнению со здоровыми субъектами (см. разделы «Способ применения и дозы» и «Особые указания»).

Показания

Резолор предназначен для симптоматической терапии хронического запора у взрослых людей, у которых слабительные средства не обеспечили достаточного эффекта в облегчении симптомов.

Способ применения и дозы

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 2 мг:Действующее вещество: прукалоприда сукцинат 2,642 мг в пересчете на 2 мг прукалоприда.Вспомогательные вещества:Ядро таблетки: лактозы моногидрат - 165,458 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 30,00 мг, кремния диоксид коллоидный - 0,40 мг, магния стеарат - 1,50 мг, пленочное покрытие розовое 7,00 мг.Состав пленочного покрытия розового в процентах по массе:Гипромеллоза 6 сР - 40%, краситель железа оксид красный (Е172) - 0,09%, титана диоксид - 23,88%, макрогол 3000 - 8 %, триацетин - 6%, лактозы моногидрат - 22 %, индигокармин (Е132) - 0,02 %, краситель железа оксид желтый (Е172) - 0,01%.

Противопоказания

Гиперчувствительность к активному компоненту или любому вспомогательному веществу. Нарушение функции почек, требующее проведения диализа. Перфорация или обструкция кишечника вследствие анатомических или функциональных нарушений стенки кишечника, механическая кишечная непроходимость, тяжелое воспаление кишечника, такие как болезнь Крона, язвенный колит и токсический мегаколон/мегаректум.

Применение при беременности и кормлении грудью

Женщины с детородным потенциаломЖенщины с детородным потенциалом должны использовать надежные методы контрацепции во время лечения прукалопридом. БеременностьОпыт применения прукалоприда во время беременности ограничен. В клинических исследованиях зарегистрированы случаи выкидыша, хотя, учитывая наличие других факторов риска, связь этих явлений с применением прукалоприда остается недоказанной. Исследования на животных не выявили прямого или опосредованного неблагоприятного влияния на течение беременности, развитие эмбриона/плода, роды и постнатальное развитие потомства. Препарат Резолор не рекомендуется применять во время беременности и у женщин, способных к деторождению, не использующих контрацепцию.Период грудного вскармливанияИсследование на людях показало, что прукалоприд выделяется с грудным молоком. При приеме терапевтических доз препарата Резолор не ожидается никакого воздействия на новорожденны/ младенцев, находящихся на грудном вскармливании. В связи с отсутствием данных о применении препарата у женщин, которые активно кормили грудью во время приема препарата Резолор, решение о прекращении грудного вскармливания или прекращении терапии препаратом Резолор следует принимать с учетом пользы грудного вскармливания для ребенка и пользы терапии для женщины.Фертильность: Исследования на животных показывают, что применение препарата не влияет на мужскую или женскую фертильность.

Побочные действия

Самыми частыми нежелательными реакциями при применении препарата Резолор 2 мг были головная боль (17,8%) и нежелательные реакции со стороны желудочно-кишечного тракта (боль в животе (13,7 %), тошнота (13,7%) и диарея (12,0%)). Нежелательные реакции развивались преимущественно в начале лечения и обычно исчезали через несколько дней, не требуя отмены лечения. Другие нежелательные реакции наблюдались эпизодически. Большинство неблагоприятных нежелательных реакций были слабой или средней степени тяжести. Следующие нежелательные реакции были зарегистрированы в контролируемых клинических исследованиях при рекомендуемой дозе 2 мг с частотой, соответствующей следующей классификации: очень часто (≥1 /10), часто (≥1/100 до Нарушения метаболизма и питанияЧасто: пониженный аппетит.Со стороны центральной нервной системыОчень часто: головная боль,Часто: головокружение,Нечасто: тремор, мигрень.Нарушения со стороны сердцаНечасто: учащенное сердцебиение.Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтаНечасто: вертиго.Нарушения со стороны желудочно-кишечного трактаОчень часто: тошнота, диарея, боль в животе,Часто: рвота, диспепсия, метеоризм, патологические кишечные шумы,Нечасто: ректальное кровотечение.Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путейЧасто: поллакиурия.Общие нарушения и реакции в месте введенияЧасто: слабость,Нечасто: лихорадка, плохое самочувствие. Описание отдельных нежелательных реакцийПосле первого дня лечения наиболее частые нежелательные реакции регистрировались с одинаковой частотой (частота возникновения реакций различалась не более чем на 1% между группами прукалоприда и плацебо) во время терапии Резолором, как и в группе плацебо, за исключением тошноты и диареи, которые возникали чаще во время терапии Резолором, но были менее выражены (различия в частоте встречаемости между группами Резолора и плацебо 1,3 % и 3,4 % соответственно).Учащенное сердцебиение было зарегистрировано у 0,7 % пациентов, получавших плацебо, 0,9 % пациентов, получавших прукалоприд в дозе 1 мг, 0,9 % пациентов, получавших прукалоприд в дозе 2 мг, и 1,9 % пациентов, получавших прукалоприд в дозе 4 мг. Большинство пациентов продолжали прием прукалоприда. Как и в случае любого нового симптома, пациенты должны обсудить впервые развившееся учащенное сердцебиение со своим врачом.

Передозировка

Самыми частыми нежелательными реакциями при применении препарата Резолор 2 мг были головная боль (17,8%) и нежелательные реакции со стороны желудочно-кишечного тракта (боль в животе (13,7 %), тошнота (13,7%) и диарея (12,0%)). Нежелательные реакции развивались преимущественно в начале лечения и обычно исчезали через несколько дней, не требуя отмены лечения. Другие нежелательные реакции наблюдались эпизодически. Большинство неблагоприятных нежелательных реакций были слабой или средней степени тяжести. Следующие нежелательные реакции были зарегистрированы в контролируемых клинических исследованиях при рекомендуемой дозе 2 мг с частотой, соответствующей следующей классификации: очень часто (≥1 /10), часто (≥1/100 до Нарушения метаболизма и питанияЧасто: пониженный аппетит.Со стороны центральной нервной системыОчень часто: головная боль,Часто: головокружение,Нечасто: тремор, мигрень.Нарушения со стороны сердцаНечасто: учащенное сердцебиение.Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтаНечасто: вертиго.Нарушения со стороны желудочно-кишечного трактаОчень часто: тошнота, диарея, боль в животе,Часто: рвота, диспепсия, метеоризм, патологические кишечные шумы,Нечасто: ректальное кровотечение.Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путейЧасто: поллакиурия.Общие нарушения и реакции в месте введенияЧасто: слабость,Нечасто: лихорадка, плохое самочувствие. Описание отдельных нежелательных реакцийПосле первого дня лечения наиболее частые нежелательные реакции регистрировались с одинаковой частотой (частота возникновения реакций различалась не более чем на 1% между группами прукалоприда и плацебо) во время терапии Резолором, как и в группе плацебо, за исключением тошноты и диареи, которые возникали чаще во время терапии Резолором, но были менее выражены (различия в частоте встречаемости между группами Резолора и плацебо 1,3 % и 3,4 % соответственно).Учащенное сердцебиение было зарегистрировано у 0,7 % пациентов, получавших плацебо, 0,9 % пациентов, получавших прукалоприд в дозе 1 мг, 0,9 % пациентов, получавших прукалоприд в дозе 2 мг, и 1,9 % пациентов, получавших прукалоприд в дозе 4 мг. Большинство пациентов продолжали прием прукалоприда. Как и в случае любого нового симптома, пациенты должны обсудить впервые развившееся учащенное сердцебиение со своим врачом.

Взаимодействие с другими препаратами

Прукалоприд имеет низкий потенциал фармакокинетического взаимодействия. Он в большей степени выводится в неизмененном виде с мочой (примерно 60% дозы), а его метаболизм in vitro очень медленный.В исследованиях in vitro на микросомах печени человека прукалоприд не подавлял специфическую активность CYP450 в терапевтически значимых концентрациях.Хотя прукалоприд может быть слабым субстратом для гликопротеина P (P-gp), он не является ингибитором P-gp в клинически значимых концентрациях.Влияние прукачоприда на фармакокинетику других лекарственных средствПри одновременном применении прукалоприда было обнаружено 30%-ное увеличение концентрации эритромицина в плазме крови. Механизм этого взаимодействия не ясен. Прукалоприд не оказывал клинически значимого воздействия на фармакокинетику варфарина, дигоксина, спирта, пароксетина или пероральных контрацептивов.Влияние других лекарственных средств на фармакокинетику прукалопридаКетоконазол (200 мг два раза в день), мощный ингибитор CYP3A4 и P-gp, увеличивал системное воздействие прукалоприда примерно на 40%. Этот эффект слишком мал, чтобы быть клинически значимым. Аналогичного взаимодействия можно ожидать с другими мощными ингибиторами P-gp, такими как верапамил, циклоспорин А и хинидин.Терапевтические дозы пробенецида, циметидина, эритромицина и пароксетина не влияли на фармакокинетику прукалоприда.

Особые указания

Основной путь выведения прукалоприда - через почки (см. раздел ” фармакокинетика”).Для пациентов с тяжелым нарушением функции почек рекомендуемая доза составляет 1 мг (см. раздел ”Способ применения и дозы”). Следует соблюдать осторожность при назначении Резолора пациентам с тяжелой печеночной недостаточностью (класс С по Чайлд-Пью) из-за ограниченных данных применения у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью (см. Раздел «Способ применения и дозы»).Имеется ограниченная информация о безопасности и эффективности Резолора для применения у пациентов с тяжелыми и клинически нестабильными сопутствующими заболеваниями (например, сердечно-сосудистыми или легочными, неврологическими или психическими расстройствами, раком или СПИДом и другими эндокринными заболеваниями). Следует проявлять осторожность при назначении Резолора пациентам с этими заболеваниями, особенно пациентам с аритмией или ишемической сердечно-сосудистой болезнью в анамнезе.При тяжелой диарее может снижаться эффективность пероральных контрацептивов, и рекомендуется использовать дополнительные методы контрацепции для предотвращения снижения эффективности пероральных контрацептивов (см. инструкции по применению пероральных контрацептивов).Препарат содержит лактозу. Пациентам с редкой наследственной непереносимостью галактозы, полной лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.В клинических исследованиях и по данным пострегистрационного наблюдения сообщалось о случаях самоубийств, суицидальных попытках и суицидальных мыслях. Причинно-следственная связь между лечением препаратом Резолор и повышенным риском суицидальных мыслей и поведения не установлена.За всеми пациентами, получающими Резолор, необходимо наблюдение в отношении стойкого усугубления депрессии или появления суицидальных мыслей и поведения. Законные представители пациентов, лица, осуществляющие за ними уход, и члены семей пациентов должны быть осведомлены о любых необычных изменениях в настроении или поведении и немедленно оповещать о них медицинского работника. Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.:Резолор может оказывать незначительное влияние на способность управлять автомобилем и механизмами, поскольку в ходе клинических исследований, особенно в течение первого дня лечения, наблюдались головокружение и утомляемость (см. раздел «Побочное действие»).

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке, при температуре не выше 25 °С.Хранить в недоступном для детей месте.Хранить в оригинальной упаковке для защиты от влаги.