Инструкция по применению
Везигамп Таблетки покрытые оболочкой 5 мг 30 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Индия
Производитель: Ранбакси
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Солифенацин
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 5 мг

Описание

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, от почти белого до светло-желтого цвета с маркировкой RK75 на одной стороне и гладкие на другой.

Действующее вещество

Солифенацин

Состав

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:Таблетки 5 мгДействующее вещество: солифенацина сукцинат - 5,00 мгВспомогательные вещества: лактоза безводная* - 133,00 мг, гипромеллоза - 3,00 мг, крахмал кукурузный - 7,50 мг, магния стеарат - 1,50 мг, краситель железа оксид желтый- 0,003 мг, Опадрай (YS-1-7040) белый-4,122 мг.* количество регулируется с учетом фактического содержания солифенацина сукцината для поддержания постоянной величины "средняя масса таблетки".

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

ВсасываниеМаксимальная концентрация в плазме (Cmax) достигается через 3-8 часов. Время достижения Cmax не зависит от дозы. Показатели Cmax и площадь под кривой "концентрация-время" (AUC) увеличиваются пропорционально повышению дозе от 5 до 40 мг. Абсолютная биодоступность около 90%.Прием пищи не влияет на показатели Cmax и AUC.РаспределениеКажущийся объем распределения солифенацина после внутривенного введения около 600 л. Связь с белками плазмы достигает 98%, преимущественно #1-кислым гликопротеином.
МетаболизмСолифенацин подвергается активному метаболизму в печени. Метаболизм в основном обусловлен изоферментом цитохрома CYP3A4. Существуют также альтернативные пути метаболизма солифенацина. Системный клиренс солифенацина составляет 9,5 л/ч. После приема внутрь в плазме крови, кроме солифенацина, определяются один фармакологически активный (4R-гидроксисолифенацин) и три неактивных метаболита солифенацина (N-глюкуронид, N-оксид и 4R-гидрокси-N-оксид солифенацина).ВыведениеПосле однократного применения 10 мг 14C-меченого солифенацина спустя 26 дней около 70% вещества определяется в моче и 23% в кале. В моче содержится приблизительно 11% неизмененного солифенацина, 18% в виде N-оксида, 9% в виде 4R-гидрокси-N-оксида и 8% в виде 4R-гидроксисолифенацина (активный метаболит). Период полувыведения равен 45-68 ч.Фармакокинетика является линейной в терапевтическом диапазоне доз.Особенности фармакокинетики у отдельных категорий пациентовВозрастКоррекция дозы в зависимости от возраста не требуется. Исследования не выявили различия в показателе экспозиции солифенацина (5 и 10 мг), выраженной в виде AUC, между группой пожилых пациентов 65-80 лет и здоровых молодых добровольцев младше 55 лет.Время достижения Cmax было несколько больше, а период полувыведения был на 20% длиннее у пожилых пациентов. Эти незначительные различия не являются клинически значимыми. Исследования фармакокинетики у детей и подростков не проводились.ПолРазличий в фармакокинетике солифенацина между мужчинами и женщинами не выявлено.
РасаРасовых отличий в фармакокинетике солифенацина не выявлено.Почечная недостаточностьПоказатели AUC и Cmax у пациентов с почечной недостаточностью легкой или средней степени тяжести незначительно отличаются от соответствующих показателей у здоровых добровольцев.У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина (КК) Исследований фармакокинетики солифенацина у пациентов, находящихся на лечении гемодиализом, не проводилось.
Печеночная недостаточностьУ пациентов с печеночной недостаточностью средней степени тяжести (стадия В по шкале Чайлд-Пью) не отмечалось изменения Cmax, отмечалось увеличение AUC на 60% и увеличение периода полувыведения в два раза. Фармакокинетика солифенацина у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью не изучалась.

Показания

Симптоматическое лечение недержания мочи, учащенного мочеиспускания и ургентных позывов к мочеиспусканию у пациентов с синдромом гиперактивного мочевого пузыря.

Способ применения и дозы

Взрослые, в том числе пожилыеВнутрь.Таблетку солифенацина принимают внутрь целиком, запивая достаточным количеством жидкости. Солифенацин принимают независимо от приема пищи.Рекомендуемая доза 5 мг однократно в сутки. При необходимости доза может быть увеличена до 10 мг однократно в сутки.Дети до 18 летЭффективность и безопасность у детей не установлена. Применение солифенацина у детей противопоказано.Почечная недостаточностьПациенты с почечной недостаточностью легкой и средней степени тяжести (КК >30 мл/мин) в коррекции дозы не нуждаются.У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК Печеночная недостаточностьПациенты с печеночной недостаточностью легкой степени тяжести в коррекции дозы не нуждаются. У пациентов с печеночнойнедостаточностью средней степени тяжести (стадия В по шкале Чайлд-Пью) солиценацин применяют с осторожностью, доза при этом не должна превышать 5 мг/сут.Сильные ингибиторы изофермента CYP3A4При одновременном лечении кетоконазолом или другими сильными ингибиторами CYP3A4 (например, ритонавир, нелфинавир, итраконазол) максимальная доза солифенацина не должна превышать 5 мг/сут.

Противопоказания

Гиперчувствительность к действующему веществу или любому другому компоненту препарата, задержка мочеиспускания, тяжелые желудочно-кишечные заболевания (включая токсический мегаколон), миастения gravis, закрытоугольная глаукома, проведение гемодиализа, тяжелая печеночная недостаточность, тяжелая почечная недостаточность или печеночная недостаточность средней степени тяжести при одновременном лечении сильными ингибиторами изофермента CYP3A4 (например, кетоконазолом), детский возраст до 18 лет, непереносимость галактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Применение при беременности и кормлении грудью

Клинических данных о влиянии солифенацина на беременность, наступившую у женщин в период применения солифенацина, нет. Исследования на животных не выявили прямого неблагоприятного воздействия на фертильность, эмбриогенез, плод и родовую деятельность. Следует соблюдать осторожность при применении солифенацина у беременных. Применение солифенацина у беременных женщин возможно в случае, если потенциальная польза для матери превышает потенциальный риск для плода.Нет данных о проникновении солифенацина в грудное молоко. У мышей солифенацин и/или его метаболиты проникали в грудное молоко и вызывали дозозависимое нарушение развития у новорожденных мышей. Применение препарата противопоказано в период грудного вскармливания.

Побочные действия

Солифенацин может вызывать антихолинергические эффекты чаще слабой или умеренной выраженности. Частота этих эффектов зависит от дозы.Наиболее частым побочным эффектов является сухость во рту, которая встречается у 11% пациентов при применении солифенацина в дозе 5 мг в сутки и у 22% пациентов при применении в дозе 10 мг/сут. Выраженность этого симптома была слабой и лишь в редких случаях приводила к прерыванию лечения.По частоте побочные эффекты разделены согласно критериям ВОЗ на следующие категории: очень часто (≥ 1: 10), часто (≥ 1: 100 и Инфекционные и паразитарные заболеванияНечасто - инфекция мочевых путей, цистит.Нарушения со стороны иммунной системыЧастота неизвестна- анафилактические реакции*.Нарушения со стороны обмена веществ и питанияЧастота неизвестна - снижение аппетита*, гиперкалиемия.Нарушения психикиОчень редко - галлюцинации*, спутанность сознания*, частота неизвестна - делирий*.Нарушения со стороны нервной системыНечасто - сонливость, дисгевзия (нарушение вкуса), редко - головокружение*, головная боль*.Нарушения со стороны органа зренияЧасто - нечеткость зрения ((нарушение аккомодации), нечасто - сухость глаз, частота неизвестна - глаукома*.Нарушения со стороны сердцаЧастота неизвестна - "пируэтная" желудочковая тахикардия*, удлинение интервала QT на электрокардиограмме*, фибрилляция предсердий*, ощущение сердцебиения*, тахикардия*.Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостенияНечасто - сухость слизистой оболочки полости носа, частота неизвестна - дисфония*.Нарушения со стороны желудочно-кишечного трактаОчень часто - сухость во рту, часто - запор, тошнота, диспепсия, боль в животе, нечасто - гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь, сухость глотки, редко -непроходимость толстой кишки, копростаз, рвота*, частота неизвестна - илеус*, дискомфорт в животе*. Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путейЧастота неизвестна - нарушение функции печени*, повышение активности "печеночных" трансаминаз*. Нарушение со стороны кожи и подкожных тканейНечасто - сухость кожи, редко - кожный зуд*, сыпь*, очень редко - многоформная эритема*, крапивница*, ангионевротический отек*, частота неизвестна - эксфолиативный дерматит*. Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной тканиЧастота неизвестна - мышечная слабость*.Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путейНечасто - затруднение мочеиспускания, редко - задержка мочи, частота неизвестна - почечная недостаточность*.Общие расстройства и нарушения в месте введенияНечасто - усталость, периферические отеки.* наблюдалось в постмаркетинговом периоде

Передозировка

СимптомыПередозировка солифенацина может привести к тяжелым антихолинергическим эффектам. Известен случай передозировки, при котором пациент случайно принял 280 мг солифенацина в течение пяти часов, что вызвало изменения в психическом статусе, которые не требовали госпитализации.ЛечениеВ случае передозировки солифенацина назначают активированный уголь внутрь. Промывание желудка эффективно в течение 1 часа после передозировки. Рвоту вызывать не рекомендуется. Проводится симптоматическое лечение (как и при передозировке других антихолинергических средств): Тяжелые центральные антихолинергические эффекты (галлюцинации, выраженное возбуждение) - применяют физостигмин, карбахол. Судороги или выраженное возбуждение - применяют бензодиазепины. Дыхательная недостаточность - проводят искусственную вентиляцию легких. Тахикардия - применяют бета-адреноблокаторы. Острая задержка мочи - выполняют катетеризацию мочевого пузыря. Мидриаз - применяют глазные капли с пилокарпином и/или помещают пациента в темное помещение.Как и при передозировке других антихолинэргических препаратов, особое внимание следует уделять пациентам с установленным риском удлинения интервала QT (гипокалиемия, брадикардия, при одновременном применении препаратов, вызывающих удлинение интервала QT) и пациентам с ранее выявленными сердечными заболеваниями (ишемическая болезнь сердца, аритмия, хроническая сердечная недостаточность).

Взаимодействие с другими препаратами

Фармакологическое взаимодействиеОдновременное применение с другими препаратами, обладающими антихолинергическими свойствами, может привести к более выраженному терапевтическому эффекту и к нежелательным реакциям. После окончания лечения солифенацином и до начала терапии другим антихолинергическим средством должен быть сделан приблизительно недельный интервал. Терапевтический эффект солифенацина может быть уменьшен при одновременном назначении агонистов холинергических рецепторов.Солифенацин может уменьшить эффект препаратов, стимулирующих моторику желудочно-кишечного тракта, таких как метоклопрамид и цизаприд.Фармакокинетическое взаимодействиеВ экспериментах in vitro в терапевтической концентрации солифенацин не ингибирует изоферменты CYP 1A1/2, 2C9, 2C19, 2D6, 3A4, выделенные из микросом печени человека. Поэтому маловероятно, что солифенацин может изменить клиренс лекарственных средств, метаболизируемых этими CYP-ферментами.Влияние других лекарственных средств на фармакокинетику солифенацинаМетаболизм солифенацина осуществляется главным образом изоферментом CYP3A4. Одновременное применение сильного ингибитора CYP3A4 кетоконазола в дозе 200 мг/сут приводит к двукратному увеличению показателя AUC солифенацина. Одновременное применение кетоконазола в дозе 400 мг/сут приводит к трехкратному увеличению AUC солифенацина. Поэтому максимальная доза солифенацина не должна превышать 5 мг/сут при одновременном применении с кетоконазолом или другими сильными ингибиторами CYP3A4 (ритонавир, нелфинавир, итраконазол) в терапевтических дозах.Одновременное применение солифенацина и сильных ингибиторов CYP3A4 противопоказано у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью или печеночной недостаточностью средней степени тяжести.Поскольку солифенацин метаболизируется изоферментом CYP3A4, возможно фармакокинетическое взаимодействие с другими субстратами изофермента CYP3A4 с более высоким сродством к нему (например, верапамил, дилтиазем), и индукторами изофермента CYP3A4 (например, рифампицин, фенитоин, карбамазепин). Влияние солифенацина на фармакокинетику других лекарственных средствПероральные контрацептивыПри одновременном применении солифенацина с комбинированными пероральными контрацептивами (этинилэстрадиол /левоноргестрел) фармакокинетического взаимодействия не отмечено. ВарфаринОдновременное применение солифенацина не влияет на фармакокинетические показатели R-варфарина или S-варфарина, а также на их эффективность, определяемую протромбиновым временем.ДигоксинОдновременное применение солифенацина не меняет фармакокинетические показатели дигоксина.

Особые указания

До начала лечения солифенацином необходимо установить, не является ли учащенное мочеиспускание следствием таких состояний как сердечная недостаточность или заболевание почек. При наличии инфекции мочевых путей как причины частого мочеиспускания необходимо начать соответствующее антибактериальное лечение.У пациентов с такими факторами риска как удлинение интервала QT и гипокалиемия сообщалось о случаях удлинения интервала QT и развития желудочковой тахикардии по типу "пируэт".При наличии нейрогенной гиперактивности мочевого пузыря эффективность и безопасность солифенацина не установлены.Сообщалось о редких случаях ангионевротического отека с обструкцией дыхательных путей и анафилатических реакциях при применении солифенацина. При развитии подобных реакций лечение солифенацином должно быть немедленно прекращено и приняты соответствующие меры.Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.:При лечении солифенацином, как и при применении других антихолинергических средств, может возникать нечеткость зрения, сонливость и чувство усталости, что может отрицательно сказаться на способности управлять транспортными средствами и механизмами. Поэтому необходимо соблюдать меры предосторожности при управлении транспортными средствами и занятиями другими видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты реакции.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.Хранить в недоступном для детей месте.