Инструкция по применению
Везикар Таблетки покрытые оболочкой 5 мг 30 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки покрытые оболочкой
Страна: Нидерланды
Производитель: Астеллас
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Солифенацин
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 5 мг
Срок годности: 36.0



Действующее вещество

Солифенацин

Состав

1 таблетка содержит:Активные вещества: солифенацина сукцинат - 5 мг. Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 107.5 мг, крахмал кукурузный - 30 мг, гипромеллоза 3 мПа·с - 6 мг, магния стеарат - 1.5 мг, вода очищенная* - 54 мг. Состав пленочной оболочки: опадрай желтый 03F12967 (гипромеллоза 6 мПа·с - 61.83%, тальк - 18.54%, макрогол 8000 - 11.6%, титана диоксид - 7.88%, железа оксид желтый - 0.15%) - 4 мг, вода очищенная* - 36 мг.

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой

Фармакокинетика

ВсасываниеПосле приема внутрь Cmax в плазме крови достигается через 3-8 ч. Tmax не зависит от дозы. Cmax и AUC увеличиваются пропорционально повышению дозы от 5 до 40 мг. Абсолютная биодоступность - 90%. Прием пищи не влияет на Cmax и AUC солифенацина.Фармакокинетика солифенацина имеет линейный характер в терапевтическом диапазоне доз.РаспределениеПосле в/в введения Vd солифенацина составляет около 600 л. Связывание солифенацина с белками плазмы, преимущественно с α1-кислым гликопротеином, составляет около 98%. МетаболизмСолифенацин активно метаболизируется в печени, преимущественно изоферментом CYP3A4. Однако существуют альтернативные пути метаболизма солифенацина. Системный клиренс солифенацина составляет около 9.5 л/ч, а конечный T1/2 составляет 45-68 ч. После приема препарата внутрь в плазме помимо солифенацина были идентифицированы следующие метаболиты: один фармакологически активный (4R-гидроксисолифенацин) и три неактивных (N-глюкуронид, N-оксид и 4R-гидрокси-N-оксид солифенацина).ВыведениеПосле однократного введения 10 мг 14C-меченого солифенацина через 26 сут около 70% радиоактивности было обнаружено в моче и 23% в кале. В моче примерно 11% радиоактивности обнаружено в виде неизмененного активного вещества, около 18% в виде N-оксидного метаболита, 9% - в виде 4R-гидрокси-N-оксида солифенацина и 8% - в виде 4R-гидрокси метаболита (активный метаболит).Фармакокинетика в особых клинических случаяхНет необходимости корректировать дозу в зависимости от возраста больных. Исследования показали, что экспозиция солифенацина (5 и 10 мг), выраженная в виде AUC, была сходной у здоровых людей пожилого возраста (от 65 до 80 лет) и у здоровых молодых людей (до 55 лет). У людей пожилого возраста средняя скорость абсорбции, выраженная в виде TCmax, была несколько ниже, а конечный T1/2 увеличивался примерно на 20%. Эти незначительные различия не являются клинически значимыми.Фармакокинетика солифенацина у детей и подростков не изучена.Фармакокинетика солифенацина не зависит от пола пациента и расовой принадлежности.У пациентов с почечной недостаточностью легкой и умеренной степени Cmax и AUC солифенацина незначительно отличаются от соответствующих показателей у здоровых добровольцев.У пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК ≤30 мл/мин) экспозиция солифенацина значительно выше - увеличение Cmax составляет около 30%, AUC - более 100% и T1/2 - более 60%. Отмечена статистически значимая взаимосвязь между КК и клиренсом солифенацина.Фармакокинетика у пациентов, подвергающихся гемодиализу, не изучалась.У пациентов с умеренной печеночной недостаточностью (от 7 до 9 баллов по шкале Чайлд-Пью) величина Cmax не меняется, AUC увеличивается на 60%, T1/2 увеличивается в 2 раза. Фармакокинетика у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью не изучена.

Показания

— лечение ургентного (императивного) недержания мочи, учащенного мочеиспускания и ургентных (императивных) позывов к мочеиспусканию, характерных для пациентов с синдромом гиперактивного мочевого пузыря.

Способ применения и дозы

Взрослым 18 лет и старше, в т.ч. пожилым пациентам, препарат назначают внутрь по 5 мг 1 раз/сут, независимо от приема пищи. При необходимости доза может быть увеличена до 10 мг 1 раз/сут.Таблетки следует запивать достаточным количеством жидкости.

Противопоказания

— задержка мочеиспускания;— тяжелые желудочно-кишечные заболевания (включая токсический мегаколон);— myasthenia gravis;— закрытоугольная глаукома;— тяжелая печеночная недостаточность;— тяжелая почечная недостаточность или умеренная печеночная недостаточность при одновременном лечении ингибиторами CYP3A4 (например, кетоконазолом);— проведение гемодиализа;— детский возраст (отсутствие данных по эффективности и безопасности);— повышенная чувствительность к компонентам препарата.Пациенты с редкими наследственными нарушениями переносимости галактозы, лактазной недостаточностью лопарей (саамов), глюкозо-галактозной мальабсорбцией не должны принимать препарат.С осторожностью следует назначать препарат пациентам:— с клинически значимой обструкцией выходного отверстия мочевого пузыря, ведущей к риску развития задержки мочи;— с желудочно-кишечными обструктивными заболеваниями (в т.ч. застой пищи в желудке); — с риском пониженной моторики ЖКТ;— с тяжелой почечной (КК ≤30 мл/мин) и умеренной печеночной (7-9баллов по шкале Чайлд-Пью) недостаточностью (дозы для этих пациентов не должны превышать 5 мг);— одновременно принимающим мощный ингибитор изофермента CYP3A4, например, кетоконазол;— с грыжей пищеводного отверстия диафрагмы, гастроэзофагеальным рефлюксом и пациентам, одновременно принимающим лекарственные препараты (например, бисфосфонаты), которые могут вызвать или усилить эзофагит;— с автономной невропатией;— с такими факторами риска, как синдром удлинения интервала QT и гипокалиемия (наблюдалась пролонгация интервала QT и тахикардия типа пируэт).

Применение при беременности и кормлении грудью

Не имеется клинических данных о женщинах, у которых наступила беременность во время приема солифенацина. Следует с осторожностью назначать Везикар; при беременности.Данные о выделении солифенацина с грудным молоком у человека отсутствуют. Применение Везикара не рекомендуется в период грудного вскармливания.В экспериментальных исследованиях на животных не выявлено прямого неблагоприятного воздействия на фертильность, развитие эмбриона/плода или роды.

Побочные действия

Везикар; может вызывать побочные эффекты, связанные с м-холиноблокирующим действием солифенацина, чаще слабой или умеренной выраженности. Частота этих нежелательных эффектов зависит от дозы. Наиболее часто отмечаемый побочный эффект Везикара - сухость во рту (отмечалась у 11% пациентов, получавших препарат в суточной дозе 5 мг, у 22% пациентов, получавших препарат в суточной дозе 10 мг, и у 4% пациентов, получавших плацебо). Выраженность этого побочного эффекта обычно была слабой и лишь в редких случаях приводила к прерыванию лечения. В целом приверженность лечению была очень высока.Ниже приводятся остальные побочные эффекты, зарегистрированные в клинических исследованиях по применению Везикара. Использовались следующие критерии оценки частоты встречаемости побочных явлений: частые (больше1/100, меньше1/10); нечастые (больше1/1000, меньше1/100); редкие (больше1/10 000, меньше1/1000), очень редкие (меньше1/10 000 и с неизвестной частотой, которая не может быть оценена по представленным данным).Со стороны пищеварительной системы: часто - запор, тошнота, диспепсия, боль в животе; нечасто - гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь, сухость глотки; редко - кишечная непроходимость, копростаз; очень редко - рвота*, снижение аппетита*.Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - инфекции мочевыводящих путей, затруднение мочеиспускания; редко - острая задержка мочеиспускания; очень редко - почечная недостаточность*.Со стороны ЦНС: нечасто - сонливость, дисгевзия (нарушение вкуса); очень редко - головокружение*, головная боль*.Психические нарушения: очень редко - галлюцинации*, спутанность сознания*, сонливость*, бредовое состояние*.Со стороны органа зрения: часто - нечеткость зрительного восприятия (нарушение аккомодации); нечасто - сухость глаз. Со стороны дыхательной системы: нечасто - сухость полости носа.Со стороны кожи и подкожной клетчатки: нечасто - сухость кожи; очень редко - многоформная эритема*, зуд*, сыпь*, крапивница*, ангионевротический отек*, эксфолиативный дерматит*. Прочие: нечасто - усталость, отеки нижних конечностей.*- наблюдались после регистрации препарата.При использовании солифенацина после регистрации в различных странах, сообщалось об удлинении интервала QT и тахикардии типа пируэт. Также сообщалось о нарушениях функции печени, характеризующихся повышением уровня печеночных ферментов (АЛТ, АСТ, ГГТ), случаях гиперкалиемии. В связи с тем, что данные были получены методом спонтанных сообщений в период после регистрации, определение частоты и причинно-следственной связи представляется затруднительным.Аллергические реакции во время клинических исследований не отмечались. Однако возможность аллергических реакций не следует исключать. У некоторых пациентов, получавших лечение солифенацином после регистрации препарата, была отмечена анафилактическая реакция. При развитии анафилактических реакций лечение солифенацином должно быть прекращено и необходимо проведение соответствующего лечения.

Передозировка

Передозировка солифенацина может сопровождаться тяжелыми м-холиноблокирующими нарушениями и требует соответствующего лечения. Описан случай ошибочного приема солифенацина в дозе 280 мг за 5-часовой промежуток времени, в результате чего у пациента развилось изменение психического состояния, не приведшее к госпитализации.Симптомы: при применении препарата у добровольцев в дозе 100 мг однократно наиболее часто отмечались следующие побочные эффекты: головная боль (легкая), сухость во рту (умеренная), головокружение (умеренное), сонливость (легкая) и неясность зрения (умеренная). О случаях острой передозировки не сообщалось.Лечение: в случае передозировки следует назначить активированный уголь, сделать промывание желудка, но не следует вызывать рвоту. При необходимости проводят симптоматическую терапию:— при тяжелых антихолинергических эффектах центрального действия (галлюцинации, выраженная возбудимость) назначают физостигмин или карбахол;— при судорогах или выраженной возбудимости - бензодиазепины;— при дыхательной недостаточности - искусственное дыхание;— при тахикардии - бета-адреноблокаторы;— при острой задержке мочи - катетеризация;— при мидриазе - закапывают в глаза пилокарпин и/или помещают больного в темное помещение.Как и в случае передозировки других м-холиноблокаторов, особое внимание следует уделять пациентам с установленным риском удлинения интервала QT (т.е. при гипокалиемии, брадикардии и при одновременном приеме препаратов, вызывающих удлинение интервала QT) и пациентам с заболеваниями сердца (ишемия миокарда, аритмии, хроническая сердечная недостаточность).

Взаимодействие с другими препаратами

Фармакологическое взаимодействиеПри сопутствующем лечении препаратами с м-холиноблокирующими свойствами может отмечаться более выраженное терапевтическое действие и развитие нежелательных эффектов. После прекращения приема солифенацина следует сделать недельный перерыв, прежде чем начинать лечение другим м-холиноблокатором. Терапевтический эффект может быть снижен при одновременном приеме м-холиномиметиков.Солифенацин может снизить эффект препаратов, стимулирующих моторику ЖКТ, например, метоклопрамида и цизаприда. Фармакокинетическое взаимодействиеИсследования in vitro показали, что в терапевтических концентрациях солифенацин не ингибирует изоферменты CYP1A 1/2, 2C9, 2C19, 2D6 или 3A4. Поэтому маловероятно, что солифенацин изменит клиренс препаратов, метаболизируемых этими изоферментами.Воздействие других лекарственных средств на фармакокинетику солифенацинаСолифенацин метаболизируется CYP3A4. Одновременное введение кетоконазола в дозе 200 мг/сут, ингибитора CYP3A4, вызывало двукратное увеличение AUC солифенацина, а в дозе 400 мг/сут - трехкратное увеличение. Поэтому максимальная доза Везикара не должна превышать 5 мг, если больной одновременно принимает кетоконазол или терапевтические дозы других ингибиторов CYP3A4 (таких как ритонавир, нелфинавир, итраконазол). Одновременное назначение солифенацина и ингибитора CYP3A4 противопоказано пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени или с умеренной печеночной недостаточностью. Поскольку солифенацин метаболизируется CYP3A4, возможны фармакокинетические взаимодействия с другими субстратами CYP3A4 с более высоким сродством (верапамил, дилтиазем) и с индукторами CYP3A4 (рифампицин, фенитоин, карбамазепин).Влияние солифенацина на фармакокинетику других лекарственных средствНе выявлено фармакокинетического взаимодействия солифенацина и комбинированных пероральных контрацептивов (этинилэстрадиол /левоноргестрел).Одновременный прием солифенацина не вызывал изменений фармакокинетики R-варфарина или S-варфарина или их влияния на протромбиновое время.Одновременный прием солифенацина не оказывал влияния на фармакокинетику дигоксина.

Особые указания

Прежде чем начать лечение Везикаром, следует установить, нет ли других причин нарушения мочеиспускания (сердечная недостаточность или заболевания почек). Если выявлена инфекция мочевыводящих путей, следует начать соответствующее противомикробное лечение.Влияние на способность к вождению автотранспортом и управлению механизмамиСолифенацин, подобно другим м-холиноблокаторам, может вызывать нечеткость зрительного восприятия, а также сонливость (редко) и чувство усталости, что может отрицательно сказаться на способности управлять автомобилем и работать с механизмами. Необходимо соблюдать меры предосторожности при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения

Беречь от детей