Инструкция по применению
Заласта Таблетки 10 мг 28 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Польша
Производитель: KPKA
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Оланзапин
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 10 мг
Срок годности: 60.0



Действующее вещество

Оланзапин

Состав

Действующее вещество: Оланзапин (Olanzapinum)Концентрация действующего вещества (мг): 10

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Абсорбция оланзапина высокая, не зависит от приема пищи; Tmax после перорального приема - 5–8 ч.Связывание с белками - 93% в диапазоне концентраций от 7 до 1000 нг/мл. Оланзапин связывается, в основном, с альбумином и α1-гликопротеином. Проникает через гистогематические барьеры, в т.ч. ГЭБ. Метаболизируется в печени, активных метаболитов не образуется, основной циркулирующий метаболит - глюкуронид - не проникает через ГЭБ.Курение, пол и возраст влияют на T1/2 и плазменный клиренс. У лиц старше 65 лет T1/2 составляет 51,8 ч и плазменный клиренс - 17,5 л/ч; у лиц моложе 65 лет - 33,8 ч и плазменный клиренс - 18,2 л/ч.Плазменный клиренс ниже у пациентов с печеночной недостаточностью, женщин и некурящих больных в сравнении с соответствующими группами лиц. Тем не менее, степень влияния возраста, пола или курения на клиренс и T1/2 оланзапина незначительна по сравнению с индивидуальной вариабельностью фармакокинетики между отдельными людьми. Выводится преимущественно почками (60%) в виде метаболитов.

Показания

Симптоматическая терапия болезненных и воспалительных процессов различного происхождения, в том числе: - воспалительные и дегенеративные заболевания опорно-двигательного аппарата: • ревматоидный артрит; • серонегативные артриты: анкилозирующий спондилоартрит – болезнь Бехтерева, псориатический артрит, реактивный артрит (синдром Рейтера); • подагра, псевдоподагра; • остеоартроз; - болевой синдром: • головная боль; • тендинит, бурсит, миалгия, невралгия, радикулит; • посттравматический и послеоперационный болевой синдром; • болевой синдром при онкологических заболеваниях; • альгодисменорея.

Способ применения и дозы

Препарат назначают внутрь, 1 раз/сут. Т.к. пища не влияет на всасывание препарата, таблетки можно принимать независимо от приема пищи. В случае отмены препарата рекомендуется постепенное снижение дозы.При шизофрении рекомендуемая начальная доза препарата - 10 мг/сут.При эпизодах мании начальная доза составляет 15 мг в 1 прием при монотерапии или 10 мг/сут в составе комбинированной терапии. Для профилактики рецидивов при биполярном расстройстве рекомендуемая начальная доза препарата в состоянии ремиссии - 10 мг/сут. Для пациентов, уже получающих препарат Заласта для лечения эпизода мании, поддерживающая терапия проводится в тех же дозах. На фоне терапии препаратом Заласта в случае развития нового маниакального, смешанного или депрессивного эпизода при необходимости следует увеличить дозу препарата с дополнительным лечением нарушений настроения, в соответствии с клиническими показаниями.Суточная доза препарата при терапии шизофрении, маниакального эпизода или профилактики рецидивов биполярного расстройства может составлять 5-20 мг/сут, в зависимости от клинического состояния пациента. Увеличение дозы свыше рекомендуемой начальной возможно только после адекватной повторной клинической оценки состояния пациента и обычно проводится с интервалом не менее 24 ч.У пожилых пациентов снижение начальной дозы (до 5 мг/сут) обычно не рекомендуется, но возможно у пациентов старше 65 лет при наличии факторов риска.Пациентам с заболеваниями печени и/или почек рекомендовано уменьшение начальной дозы до 5 мг/сут. При умеренной печеночной недостаточности (цирроз, класс А или В по классификации Чайлд-Пью печеночно-клеточной недостаточности у больных циррозом печени) начальная доза составляет 5 мг/сут, возможно дальнейшее увеличение дозы с осторожностью.Женщинам не требуется изменения в дозировании по сравнению с мужчинами.У некурящих пациентов коррекции дозы по сравнению с курящими пациентами не требуется.При наличии у пациента более одного фактора, способного влиять на всасывание препарата (женский пол, пожилой возраст, некурящий), возможно потребуется снижение начальной дозы. При необходимости возможно дальнейшее увеличение дозы с осторожностью.

Противопоказания

Закрытоугольная глаукома;- детский возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);- период лактации;- непереносимость галактозы, дефицит лактазы lapp или нарушение всасывания глюкозы-галактозы;- повышенная чувствительность к оланзапину или другим компонентам препарата.

Применение при беременности и кормлении грудью

Имеются очень редкие сообщения о развитии гипергликемии и/или декомпенсации сахарного диабета, иногда сопровождавшихся развитием кетоацидоза или кетоацидотической комы, в т.ч. есть сообщения о нескольких фатальных случаях. В некоторых случаях отмечалось предшествующее декомпенсации увеличение массы тела, которое могло стать предрасполагающим фактором. У пациентов с сахарным диабетом и факторами риска развития этого заболевания рекомендован регулярный клинический контроль и контроль уровня глюкозы крови.При изменении уровня липидов требуется коррекция терапии.При резком прекращении приема оланзапина очень редко (менее 0,01%) возможно развитие следующих симптомов: потливость, бессонница, тремор, тревога, тошнота или рвота. При отмене препарата рекомендуется постепенное снижение дозы.Антихолинергическая активность. Поскольку клинический опыт применения оланзапина у людей с сопутствующими заболеваниями ограничен, препарат следует с осторожностью назначать пациентам с гиперплазией предстательной железы, паралитической кишечной непроходимостью. Опыт применения оланзапина у больных с психозами при болезни Паркинсона, вызванных приемом дофаминомиметиков. Оланзапин не рекомендован для лечения психозов при болезни Паркинсона, вызванных приемом дофаминомиметиков. Усиливаются симптомы паркинсонизма и галлюцинации. При этом оланзапин по эффективности лечения психозов не превосходил плацебо.Оланзапин не показан для лечения психозов и/или поведенческих расстройств при деменции в связи с повышенной смертностью и увеличением риска цереброваскулярных нарушений (инсульт, транзиторные ишемические атаки). Увеличение смертности не зависит от дозы оланзапина или длительности терапии. К факторам риска, предрасполагающим к увеличению смертности, относятся: возраст старше 65 лет, дисфагия, седация, недостаточное питание и обезвоживание, заболевания легких (например пневмония, в т.ч. аспирационная), одновременный прием бензодиазепинов. Тем не менее, повышенная частота смерти в группах оланзапина по сравнению с плацебо не зависела от этих факторов риска.При терапии антипсихотиками улучшение клинического состояния пациента наступает в период от нескольких дней до нескольких недель. В течение этого периода пациент нуждается в тщательном наблюдении.Нарушения функции печени. В начале терапии возможно бессимптомное повышение трансаминаз печени (АЛТ и АСТ). У пациентов с изначально повышенными уровнями АСТ и/или АЛТ, печеночной недостаточностью и состояниями, потенциально ограничивающими функциональные возможности печени, а также у принимающих гепатотоксические лекарственные препараты, следует соблюдать осторожность при назначении оланзапина. При повышении АЛТ и/или АСТ на фоне терапии препаратом рекомендуется медицинское наблюдение за пациентом и, возможно, уменьшение дозы препарата. При диагностировании гепатита (в том числе гепатоклеточного, холестатического или смешанного) оланзапин необходимо отменить.

Гематологические изменения. Препарат следует с осторожностью применять у пациентов с лейкопенией и/или нейтропенией любого генеза, миелосупрессией лекарственного генеза, а также на фоне радиационной или химиотерапии, вследствие сопутствующих заболеваний, у пациентов с гиперэозинофильными состояниями или миелопролиферативными заболеваниями. Нейтропения часто отмечалась при одновременном применении оланзапина и вальпроевой кислоты (см. «Побочные действия»).Злокачественный нейролептический синдром. Потенциально угрожающее жизни состояние, связанное с терапией антипсихотическими средствами (нейролептиками), в т.ч. оланзапином. Характеризуется следующими клиническими проявлениями: лихорадка, ригидность мышц, нарушение сознания, вегетативные нарушения (нестабильный пульс или лабильное АД, тахикардия, повышенное потоотделение, аритмии). Дополнительные симптомы ЗНС: повышение КФК, миоглобинурия (на фоне рабдомиолиза) и острая почечная недостаточность. При развитии симптомов ЗНС, а также повышении температуры тела без видимых причин, необходимо отменить все нейролептики, в т.ч. оланзапин.Судорожный синдром. Оланзапин следует осторожно назначать пациентам с судорогами в анамнезе или наличием факторов, снижающих порог судорожной готовности. На фоне приема оланзапина судороги регистрировались редко.Поздняя дискинезия. Терапия оланзапином сопровождалась значительно меньшей частотой развития поздней дискинезии в сравнении с галоперидолом. Риск развития поздней дискинезии повышается при увеличении продолжительности лечения. При появлении признаков этого состояния у пациента, принимающего оланзапин, следует отменить препарат или уменьшить его дозу. Симптомы дискинезии могут временно нарастать после отмены препарата.Общая активность в отношении ЦНС. Следует соблюдать осторожность при одновременном применении других лекарственных средств центрального действия и алкоголя.Цереброваскулярные нежелательные явления, включая инсульт у пожилых пациентов с деменцией. У пожилых людей нечасто наблюдается постуральная артериальная гипотензия. У пациентов старше 65 лет рекомендуется периодически контролировать АД. Оланзапин следует с осторожностью назначать пациентам с установленным увеличением интервала QTc, особенно пожилым, с врожденным синдромом удлиненного интервала QT, застойной сердечной недостаточностью, гипертрофией миокарда, гипокалиемией и гипомагниемией.При приеме оланзапина очень редко (менее 0,01%) зарегистрированы случаи развития тромбоэмболии вен. Причинно-следственная связь между терапией оланзапином и тромбозом вен не установлена. Поскольку у пациентов с шизофренией часто имеются приобретенные факторы риска венозных тромбозов, следует выявлять все возможные другие факторы (например иммобилизацию) и принимать профилактические меры. Таблетки Заласта содержат лактозу. Препарат не следует принимать пациентам с редкими наследственными

проблемами непереносимости галактозы, дефицитом лактазы Лаппа или нарушением всасывания глюкозы-галактозы.Влияние на способность управлять автомобилем или выполнять работы, требующие повышенной скорости физических и психических реакций. В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Побочные действия

Потенциальные лекарственные взаимодействия, влияющие на метаболизм оланзапина: оланзапин метаболизируется ферментом CYP1A2, поэтому ингибиторы или индукторы изоферментов цитохрома P450, проявляющих специфическую активность в отношении CYP1A2, могут влиять на фармакокинетические параметры оланзапина.Индукторы CYP1A2: клиренс оланзапина может быть повышен у курящих пациентов или при одновременном приеме карбамазепина, что приводит к снижению концентрации оланзапина в плазме крови. Рекомендуется клиническое наблюдение, т. к. некоторые случаи требуют повышения дозы препарата.Ингибиторы CYP1A2: флувоксамин - специфический ингибитор CYP1A2 - значительно снижает клиренс оланзапина. Среднее повышение Cmax оланзапина после приема флувоксамина у некурящих женщин составило 54%, а у курящих мужчин - 77%. Среднее увеличение AUC оланзапина у этих категорий пациентов составило соответственно 5 и 108%. У пациентов, принимающих флувоксамин или любой другой ингибитор CYP1A2 (например ципрофлоксацин), терапию оланзапином рекомендуется начинать с меньших доз. Уменьшение дозы оланзапина также может потребоваться в случае присоединения к терапии ингибиторов CYP1A2.Лекарственные взаимодействия, влияющие/не влияющие на биодоступность оланзапина. Активированный уголь снижает абсорбцию оланзапина при пероральном приеме на 50–60%, поэтому его следует принимать не менее чем за 2 ч до или после приема оланзапина.Флуоксетин (ингибитор CYP450), однократная доза магний- или алюминийсодержащих антацидов или циметидин не влияют на фармакокинетику оланзапина.Потенциальная способность оланзапина влиять на другие лекарственные средства. Оланзапин может ослаблять действие прямых и непрямых агонистов дофамина.В условиях in vitro оланзапин не подавляет основные изоферменты CYP450 (например 1A2, 2D6, 2C9, 2C19, 3A4). In vivo не было обнаружено угнетения метаболизма следующих активных веществ: трициклические антидепрессанты (CYP2D6), варфарин (CYP2C9), теофиллин (CYP1A2) и диазепам (CYP3A4 и 2C19).Не выявлено взаимодействия при одновременном применении с литием или бипериденом. Терапевтический мониторинг содержания вальпроевой кислоты в плазме показал, что при одновременном назначении с оланзапином изменений доз вальпроевой кислоты не требуется (см. раздел «Побочные действия»).Следует соблюдать осторожность при одновременном применении других лекарственных средств центрального действия. Несмотря на то что однократная доза алкоголя (45 мг/70 кг) не оказывает фармакокинетического эффекта, прием алкоголя вместе с оланзапином может сопровождаться усилением депрессивного действия на ЦНС.

Передозировка

Классификация частоты развития побочных эффектов (ВОЗ): очень часто (больше1 /10), часто (от больше1/100 до меньше1/10), нечасто (от больше1/1000 до меньше1 /100), редко от (больше1/10 000 до меньше1/1000), очень редко от (меньше1/10 000, включая отдельные сообщения).Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: очень часто - сонливость; часто - головокружение, акатизия, паркинсонизм, дискинезия; редко - судорожный синдром (чаще на фоне судорожного синдрома в анамнезе); очень редко -злокачественный нейролептический синдром, дистония (включая окулогирный криз) и позднюю дискинезию. При резкой отмене оланзапина очень редко отмечены такие симптомы, как потливость, бессонница, тремор, тревога, тошнота или рвота.Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - артериальная гипотензия (в т.ч. ортостатическая); нечасто - брадикардия с коллапсом или без; очень редко - увеличение интервала QTc на ЭКГ, желудочковая тахикардия/фибрилляция и внезапная смерть, тромбоэмболии (включая эмболию легочных артерий и тромбоз глубоких вен).Со стороны пищеварительной системы: часто - транзиторные антихолинергические эффекты, в т.ч. запоры и сухость во рту, транзиторное, бессимптомное повышение уровня печеночных трансаминаз (АЛТ, АСТ), особенно в начале лечения; редко - гепатит (в т.ч. гепатоклеточное, холестатическое или смешанное поражение печени); очень редко - панкреатит, повышение уровня ЩФ и общего билирубина.Со стороны обмена веществ: очень часто - увеличение массы тела; часто - повышение аппетита; очень редко - гипергликемия и/или декомпенсация сахарного диабета, иногда проявляющаяся кетоацидозом или комой, включая фатальный исход; гипертриглицеридемия, гиперхолестеринемия, гипотермия.Со стороны органов кроветворения: часто - эозинофилия; редко - лейкопения; очень редко - тромбоцитопения, нейтропения.Со стороны костно-мышечной системы: очень редко - рабдомиолиз.Со стороны мочеполовой системы: очень редко - задержка мочи, приапизм.Со стороны кожи и подкожной клетчатки: нечасто - реакции фотосенсибилизации.Аллергические реакции: редко - кожная сыпь; очень редко - анафилактоидные реакции, ангионевротический отек, кожный зуд или крапивница. Прочие: часто - астения, периферические отеки; очень редко - алопеция. Лабораторные показатели: очень часто - гиперпролактинемия, но клинические проявления (например, гинекомастия, галакторея и увеличение молочных желез) отмечаются редко. У большинства пациентов уровень пролактина спонтанно нормализовывался без отмены терапии. Нечасто - повышение уровня креатинфосфокиназы (КФК). У пожилых пациентов с деменцией зарегистрирована в исследованиях большая частота смертей и цереброваскулярных нарушений (инсульт, транзиторные ишемические атаки). Очень часто у этой категории пациентов отмечались нарушения походки и падения. Также часто наблюдались пневмония, повышение температуры тела, летаргия, эритема, зрительные галлюцинации и недержание мочи.Среди пациентов с лекарственными (на фоне приема агонистов

допамина) психозами на фоне болезни Паркинсона часто регистрировались ухудшение паркинсонической симптоматики и развитие галлюцинаций.Есть данные о развитии нейтропении (4.1%) на фоне комбинированной терапии с вальпроевой кислотой у пациентов с биполярной манией. Одновременная терапия с вальпроевой кислотой или литием способствует увеличению частоты (больше 10%) тремора, сухости во рту, повышению аппетита и увеличению массы тела. Также часто регистрировались нарушения речи (от 1 до 10%). В первые 6 недель комбинированной терапии с литием увеличивается частота увеличения массы тела. Длительная терапия оланзапином (до 12 месяцев) с целью профилактики рецидивов у пациентов с биполярным расстройством сопровождалась увеличением массы тела.

Взаимодействие с другими препаратами

Меры предосторожности

Особые указания

Симптомы: очень часто(больше10%) - тахикардия, возбуждение/агрессия, дизартрия, различные экстрапирамидные симптомы, снижение уровня сознания от заторможенности до комы; менее чем в 2% случаев - делирий, конвульсии, кома, злокачественный нейролептический синдром (ЗНС), угнетение дыхания, аспирация, повышение или снижение АД, сердечная аритмия; в очень редких случаях - сердечно-легочная недостаточность. Минимальная доза оланзапина при острой передозировке с летальным исходом - 450 мг, зарегистрирована максимальная доза при передозировке с благоприятным исходом (выживание) - 1500 мг.Лечение: промывание желудка, прием активированного угля (снижает биодоступность оланзапина на 60%), симптоматическое лечение под контролем жизненно важных функций, включая лечение артериальной гипотензии и сосудистого коллапса, поддержание функции дыхания. Специфического антидота не существует. Не рекомендуется индуцировать рвоту, применять эпинефрин, допамин или другие симпатомиметики с бета-адреномиметической активностью, т.к. последние могут усугубить артериальную гипотензию. Для выявления возможных аритмий необходим мониторинг сердечно-сосудистой деятельности. Пациент должен находиться под непрерывным медицинским наблюдением до полного выздоровления.

Условия хранения

В сухом месте