Арипипразол ОД-Тева



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Арипипразол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки, диспергируемые в полости рта от белого до светло-желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с шероховатой поверхностью, на одной стороне риска; допускается легкий фруктовый запах.

	1 таб.
арипипразол	30 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 122.25 мг, целлюлоза микрокристаллическая силицинизированная - 165 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 9 мг, кармеллоза - 60 мг, кросповидон - 15 мг, ксилитол - 15 мг, аспартам - 9 мг, калия ацесульфам - 9 мг, винная кислота - 9 мг, ароматизатор ананасовый - 2.25 мг, магния стеарат - 4.5 мг.

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антипсихотическое средство (нейролептик). Предполагается, что терапевтическое действие арипипразола при шизофрении обусловлено сочетанием частичной агонистической активности в отношении допаминовых D_2- и серотониновых 5-HT_{1a}- рецепторов и антагонистической активностью в отношении серотониновых 5-HT_2- рецепторов.

Арипипразол обладает высокой аффинностью in vitro к допаминовым D_2- и D_3-рецепторам, серотониновым 5-HT_{1a}- и 5-HT_{2a}-рецепторам и умеренной аффинностью к допаминовым D_4-, серотониновым 5-HT_{2c}- и 5-HT_7-, α_1-адренорецепторам и гистаминовым H_1-рецепторам. Арипипразол характеризуется также умеренной аффинностью к участкам обратного захвата серотонина и отсутствием аффинности к мускариновым рецепторам.

Фармакокинетика

После приема внутрь арипипразол быстро всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме достигается через 3-5 ч. Абсолютная биодоступность - 87%. Прием пищи не влияет на биодоступность арипипразола.

C_{ss} достигается через 14 дней. Кумуляция препарата при многократном приеме предсказуема. Показатели фармакокинетики арипипразола в равновесном состоянии пропорциональны дозе. Не отмечено суточных колебаний

распределения арипипразола и его метаболита дегидроарипипразола.

Арипипразол интенсивно распределяется в тканях, V_d составляет 4.9 л/кг. При терапевтической концентрации более 99% арипипразола связывается с белками сыворотки, главным образом с альбумином.

Установлено, что дегидроарипипразол, главный метаболит в плазме человека, обладает такой же аффинностью к допаминовым D_2-рецепторам, как и арипипразол.

Арипипразол подвергается пресистемному метаболизму лишь в минимальной степени. Арипипразол метаболизируется в печени тремя способами: дегидрированием, гидроксилированием и N-дезалкилированием. In vitro дегидрирование и гидроксилирование арипипразола происходит под действием изоферментов CYP3A4 и CYP2D6, N-дезалкилирование - CYP3A4.

В равновесном состоянии AUC дегидроарипипразола составляет около 39% от AUC арипипразола в плазме.

Средний $T_{1/2}$ арипипразола - около 75 ч.

После однократного приема меченного ^{14}C арипипразола примерно 27% и 60% радиоактивности определяется в моче и кале, соответственно. Менее 1% неизмененного арипипразола определяется в моче и примерно 18% принятой дозы в неизмененном виде выводится с калом. Общий клиренс арипипразола составляет 0.7 мл/мин/кг, главным образом за счет выведения печенью.

Показания к применению:

Лечение острых приступов шизофрении, поддерживающая терапия шизофрении.

Лечение острых маниакальных эпизодов биполярного расстройства I типа и для поддерживающей терапии у пациентов с биполярным расстройством I типа, недавно перенесших маниакальный или смешанный эпизод.

Относится к болезням:

- Биполярное расстройство
- Шизофрения

Противопоказания:

Сенильная деменция, период лактации, детский и подростковый возраст до 18 лет, повышенная чувствительность к арипипразолу.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный, в зависимости от показаний, течения заболевания, переносимости терапии. Доза составляет 10-30 мг 1 раза/сут.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - ортостатическая гипотензия, тахикардия; возможно - брадикардия, сердцебиение, инфаркт миокарда, удлинение QT интервала, остановка сердца, кровоизлияния, фибрилляция предсердий, сердечная недостаточность, AV-блокада, ишемия миокарда, тромбоз глубоких вен, флебит, экстрасистолия; редко - вазовагальный синдром, расширение сердца, трепетание предсердий, тромбофлебит, внутричерепное кровотечение, ишемия головного мозга; очень редко - обмороки.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - тошнота, потеря аппетита; часто - диспепсия, рвота; запор; возможно - усиление аппетита, гастроэнтерит, затрудненное глотание, метеоризм, гастрит, зубной кариес, гингивит, геморрой, желудочно-пищеводный рефлюкс, желудочно-кишечные кровоизлияния, периодонтальный абсцесс, отек языка, недержание кала, колит, ректальные кровоизлияния, стоматит, изъязвления во рту, холецистит, фекалома, кандидоз слизистой оболочки рта, желчнокаменная болезнь, отрыжка, язва желудка; редко - эзофагит, кровотечение десен, воспаление языка, кровавая рвота, кишечные кровотечения, язва двенадцатиперстной кишки, хейлит, гепатит, увеличение печени, панкреатит, прободение кишечника; очень редко - повышение активности АЛТ, АСТ, ЩФ.

Аллергические реакции: очень редко - анафилаксия, ангионевротический отек, зуд и крапивница.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - миалгия, судороги; возможно - боль в суставах и костях, миастения,

артрит, артроз, мышечная слабость, спазмы, бурсит; очень редко - увеличение активности КФК, рабдомиолиз, тенденит, тенобурсит, ревматоидный артрит, миопатия.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: очень часто - бессонница, сонливость, акатизия; часто - головокружение, тремор, экстрапирамидный синдром, психомоторное возбуждение, депрессия, нервозность, повышенное слюноотделение, враждебность, суицидальные мысли, маниакальные мысли, нетвердая походка, спутанность сознания, сопротивление выполнению пассивных движений (синдром зубчатого колеса); возможно - дистония, мышечные подергивания, ослабление концентрации внимания, парестезия, тремор конечностей, импотенция, брадикинезия, пониженное/повышенное либидо, панические реакции, апатия, ослабление памяти, ступор, амнезия, инсульт, гиперактивность, деперсонализация, дискинезия, синдром "беспокойных ног" (акатизия), миоклонус, подавленное настроение, повышенные рефлексы, замедление мыслительной функции, повышенная чувствительность к раздражителям, гипотония, нарушение глазодвигательной реакции; редко - бред, эйфория, буккоглоссальный синдром, акинезия, угнетение сознания вплоть до потери сознания, сниженные рефлексы, навязчивые мысли, ЗНС.

Со стороны дыхательной системы: часто - одышка, пневмония; возможно - астма, носовое кровотечение, икота, ларингит; редко - кровохарканье, аспирационная пневмония, усиленное выделение мокроты, сухость слизистой оболочки носа, отек легких, легочная эмболия, гипоксия, дыхательная недостаточность, апноэ.

Дерматологические реакции: часто - сухость кожи, зуд, повышенная потливость, кожные изъязвления; возможно - акне, везикулобулезная (пузырчатая) сыпь, экзема, алопеция, псориаз, себорея; редко - макуло-папулезная сыпь, эксфолиативный дерматит, крапивница.

Со стороны органов чувств: часто - конъюнктивит, боль в ушах; возможно - сухость глаз, боль в глазах, звон в ушах, воспаление среднего уха, катаракта, потеря вкуса, блефарит; редко - усиленное слезотечение, частое мигание, наружный отит, амблиопия, глухота, диплопия, глазные кровоизлияния, фотофобия.

Со стороны мочевыделительной системы: часто - недержание мочи; возможно - цистит, учащенное мочеиспускание, лейкорея, задержка мочеиспускания, гематурия, дизурия, аменорея, преждевременная эякуляция, влагалищное кровотечение, вагинальный кандидоз, почечная недостаточность, маточное кровотечение, меноррагия, альбуминурия, камни в почках, никтурия, полиурия, позывы к мочеиспусканию; редко - боли в молочной железе, цервицит, галакторея, аноргазмия, жжение в области мочеполовой системы, гликозурия, гинекомастия (увеличение молочных желез у мужчин), мочекаменная болезнь, болезненная эрекция.

Со стороны организма в целом: часто - гриппоподобный синдром, периферический отек, боли в грудной клетке, в шее; возможно - боли в области таза, отек лица, недомогание, светочувствительность, челюстные боли, озноб, скованность челюстей, вздутие живота, напряжение в груди; редко - боли в горле, скованность в спине, тяжесть в голове, кандидоз, скованность в области горла, синдром Мендельсона, тепловой удар.

Со стороны обмена веществ: часто - потеря веса, повышение уровня КФК; возможно - обезвоживание, отек, гиперхолестеринемия, гипергликемия, гипокалиемия, сахарный диабет, гиперлипидемия, гипогликемия, жажда, повышенное содержание мочевины в крови, гипонатриемия, железодефицитная анемия, повышенный креатинин, билирубинемия, повышенный уровень ЛДГ, ожирение; редко - гиперкалиемия, подагра, гипернатриемия, цианоз, закисление мочи, гипогликемическая реакция.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований безопасности применения при беременности не проводилось. Арипиразол можно применять при беременности в случаях, когда потенциальная польза терапии для матери превышает возможный риск для плода.

Неизвестно, выделяется ли арипиразол с грудным молоком у человека. Применение арипипразола в период лактации (грудного вскармливания) противопоказано.

В *экспериментальных исследованиях* показано, что арипипразол выделяется с молоком у лактирующих крыс.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Существуют различные пути метаболизма арипипразола, в т.ч. с участием ферментов CYP2D6 и CYP3A4. В исследованиях у здоровых людей мощные ингибиторы CYP2D6 (хинидин) и CYP3A4 (кетоконазол) уменьшали клиренс арипипразола при приеме внутрь на 52% и 38% соответственно (следует уменьшать дозу арипипразола при одновременном применении с ингибиторами CYP3A4 и CYP2D6).

Прием арипипразола в дозе 30 мг одновременно с карбамазепином, мощным индуктором CYP3A4, сопровождался уменьшением C_{max} и AUC арипипразола на 68% и 73% соответственно, и уменьшением C_{max} и AUC его активного метаболита дегидроарипипразола на 69% и 71% соответственно. Можно ожидать аналогичное действие и других мощных индукторов CYP3A4 и CYP2D6.

Особые указания и меры предосторожности:

Диагнозы

- Алкоголизм
- Аутизм
- Булимия
- Депрессия

Источник: http://drugs.thead.ru/Aripiprazol_OD-Teva