Чампикс



Код АТХ:

- N07BA03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Варениклин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой в комплектах (0,5 мг — блистеры 11 шт. + 1 мг — блистеры 14 шт. или 0,5 — блистеры 11 шт.+1 мг — блистеры 14 шт. и блистеры 28 шт.); в упаковке картонной 1 комплект. В банках ПЭ 56 шт. (табл. по 1 мг); в пачке картонной 1 банка или в блистерах 14 или 28 шт. (табл. по 1 мг); в пачке картонной 1, 2, 4 или 8 блистеров по 14 шт. или 2 блистера по 28 шт.

Состав:

Одна таблетка содержит

Активное вещество: варениклина тартрат 850 мкг/1.71 мг (что соответствует 500 мкг/1 мг варениклина)

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кальция гидрофосфат, кроскармеллоза натрия, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: опадрай белый YS-1-18202-A (гипромеллоза, титана диоксид, макрогол)/опадрай синий 03B90547 (гипромеллоза, титана диоксид, макрогол, алюминиевый лак на основе индигокармина), опадрай прозрачный YS-2-19114-A (гипромеллоза, триацетин).

Описание:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 1мг: светло-голубого цвета (в составе пленочной оболочки опадрай синий 03B90547), капсуловидные, двояковыпуклые, с гравировкой "Pfizer" на одной стороне и "CHX 1.0" - на другой.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 0,5мг: белого или почти белого цвета (в составе пленочной оболочки опадрай белый YS-1-18202-A), капсуловидные, двояковыпуклые, с гравировкой "Pfizer" на одной стороне и "CHX 0.5" - на другой.

Фармакотерапевтическая группа:

- Разные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Препарат для лечения никотиновой зависимости. Варениклин с высокой аффинностью и селективностью связывается с α4β2 н-холинорецепторами, в отношении которых он является частичным агонистом никотина, т.е. одновременно проявляет агонистическую активность (но в меньшей степени, чем никотин) и антагонизм в присутствии никотина.

Электрофизиологические исследования in vitro и нейробиохимические исследования in vivo показали, что варениклин связывается с α4β2 н-холинорецепторами и стимулирует их, но в значительно меньшей степени, чем никотин. Никотин конкурентно связывается с тем же участком рецептора, к которому варениклин обладает более высоким сродством. Таким образом, варениклин эффективно блокирует способность никотина стимулировать α4β2-рецепторы и активировать мезолимбическую допаминовую систему - нейрональный механизм, который лежит в основе реализации механизмов формирования никотиновой зависимости (получение удовольствия от курения).

Эффективность варениклина как средства для лечения никотиновой зависимости обусловлена его частичным агонизмом в отношении α4β2 никотиновых рецепторов, связывание с которыми уменьшает тягу к курению и облегчает проявление синдрома отмены (агонистическая активность) и одновременно приводит к уменьшению чувства удовольствия от курения (антагонизм в присутствии никотина).

Фармакокинетика

Варениклин характеризуется линейной фармакокинетикой при однократном (0.1-3 мг) и повторном (1-3 мг/сут) применении.

Всасывание. После приема внутрь варениклин практически полностью абсорбируется из ЖКТ. C_{max} в плазме обычно достигается в течение 3-4 ч . Биодоступность высокая и не зависит от приема пищи или времени приема препарата. После многократного приема равновесное состояние у здоровых добровольцев достигается в течение 4 дней.

Распределение. Варениклин распределяется в тканях, проникает через ГЭБ и проникает в головной мозг. Связывание с белками плазмы низкое (≤20%) и не зависит от возраста и функции почек.

Метаболизм и выведение. Варениклин подвергается минимальному метаболизму. Выводится с мочой 92% дозы в неизмененном виде, менее 10% - в виде метаболитов. В моче обнаружены варениклин N-карбамоилглюкуронид и гидроксиварениклин. В крови варениклин циркулирует в неизмененном виде (91%) и в виде метаболитов - N-карбамоилглюкуронид варениклин и N-глюкозилварениклин.

$T_{1/2}$ составляет около 24 ч. Выведение почками осуществляется в основном путем клубочковой фильтрации в сочетании с активной канальцевой секрецией.

Фармакокинетика в особых клинических случаях. Фармакокинетика варениклина существенно не зависит от возраста, расы, пола, статуса курения или сопутствующей терапии.

Фармакокинетика варениклина не изменялась у пациентов с легким нарушением функции почек (КК > 50 мл/мин и ≤ 80 мл/мин). У пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести (КК > 30 мл/мин и ≤ 50 мл/мин) AUC варениклина увеличилась в 1.5 раза по сравнению с таковой у пациентов с нормальной функцией почек (КК > 80 мл/мин). У пациентов с тяжелым нарушением функции почек (КК < 30 мл/мин) AUC варениклина увеличилась в 2.1 раза. У пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности варениклин эффективно удалялся при гемодиализе.

Учитывая отсутствие выраженного метаболизма в печени, маловероятно изменение фармакокинетики варениклина у пациентов с нарушением функции печени.

Фармакокинетика варениклина у пациентов пожилого возраста с нормальной функцией почек (возраст 65-75 лет) не изменяется.

Показания к применению:

Никотиновая зависимость у взрослых.

Относится к болезням:

- Никотиновая зависимость

Противопоказания:

Чампикс не должен применяться при наличии какого-либо из состояний, перечисленных ниже:

— терминальная стадия почечной недостаточности;

— возраст до 18 лет (недостаточно клинических данных по эффективности и безопасности препарата в данной возрастной группе);

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Способ применения и дозы:

Внутрь, проглатывая целиком, запивая водой, вне зависимости от приема пищи.

Вероятность успешной терапии препаратом для прекращения курения повышается у пациентов, мотивированных на отказ от курения, которым предоставляется дополнительная консультативная помощь и поддержка.

Лечение препаратом Чампикс® следует начинать за 1 нед до выбранной пациентом даты прекращения курения. Рекомендуемая доза препарата составляет 1 мг два раза в сутки с титрацией дозы по следующей схеме:

День приема препарата	Доза
1–3-й день	0,5 мг 1 раз в сутки
4–7-й день	0,5 мг 2 раза в сутки
с 8-го дня до конца лечения	1 мг 2 раза в сутки

Если пациент не переносит побочные эффекты Чампикса®, то дозу можно временно или постоянно уменьшить.

Курс лечения — 12 нед. Для пациентов, которые успешно прекратили курение к концу 12 нед, может быть проведен дополнительный курс лечения препаратом в дозе 1 мг 2 раза в сутки в течение 12 нед.

Пациентам, которым не удается бросить курить в ходе начального 12-недельного курса лечения или у которых после лечения наступает рецидив, следует рекомендовать предпринять еще одну попытку, при условии, что были установлены причины неудачи первой попытки и предприняты меры для их устранения.

Нарушение функции почек. Изменение дозы Чампикса® у больных с легкой степенью нарушения функции почек (Cl креатинина >50 мл/мин и ≤80 мл/мин) и умеренно выраженной почечной недостаточностью (Cl креатинина >30 мл/мин и ≤50 мл/мин) не требуется.

У больных с тяжелым нарушением функции почек (Cl креатинина <30 мл/мин) рекомендуемая доза Чампикса® составляет 1 мг 1 раз в сутки. Лечение начинают с дозы 0,5 мг 1 раз в сутки, которую через 3 дня увеличивают до 1 мг 1 раз в сутки.

По причине недостатка клинических данных по применению Чампикса® у больных с терминальной стадией почечной недостаточности препарат не рекомендуется назначать таким пациентам (см. раздел «Противопоказания»).

Нарушение функции печени. Коррекция дозы Чампикса® у больных с нарушением ее функции не требуется.

Пожилые пациенты. Коррекция дозы Чампикса® у пожилых пациентов не требуется. У пожилых людей выше вероятность снижения функции почек, поэтому ее целесообразно оценить перед началом лечения.

Дети. Чампикс® не рекомендуется назначать детям и подросткам до 18 лет, поскольку сведения о его безопасности и эффективности в этой возрастной группе недостаточны (См. раздел «Противопоказания»).

Побочное действие:

Реакции, связанные с прекращением курения (синдром отмены никотина), на фоне или без терапии Чампиксом: снижение настроения и дисфория, бессонница, раздражительность, чувство неудовольствия и гнева, тревога, нарушение концентрации внимания, двигательное беспокойство, уменьшение ЧСС, усиление аппетита или увеличение массы тела, возможно обострение сопутствующих психических расстройств.

Ни при разработке схем клинических исследований Чампикса, ни в ходе анализа их результатов не предпринимались попытки разграничить нежелательные явления, связанные с применением исследуемого препарата, и нежелательные реакции, возможно, связанные собственно с синдромом отмены никотина.

По результатам клинических исследований нежелательные реакции обычно появлялись в первую неделю после начала лечения, были, как правило, слабо или умеренно выраженными и их частота не зависела от возраста, расы или пола пациента. У пациентов, получавших Чампикс® в рекомендуемой дозе 1 мг 2 раза/сут после периода титрования, самым частым из зарегистрированных побочных реакций была тошнота (28.6%). В большинстве случаев тошнота возникала на ранних этапах терапии, была выражена слабо или умеренно, прекращение приема препарата требовалось редко.

Частота прерывания терапии из-за нежелательных явлений составила 11.4% в группе, получавшей варениклин и 9.7% для группы плацебо. Частота прекращения терапии из-за основных побочных реакций в группе, получавшей варениклин и в группе плацебо соответственно: тошнота – 2.7% и 0.6%; головная боль – 0.6% и 1.0%; бессонница – 1.3% и 1.2%; необычные сновидения – 0.2% и 0.2%.

Определение частоты побочных реакций: очень часто (≥ 1/10); часто (≥ 1/100 но < 1/10); редко (≥ 1/1000, но < 1/100).

*Инфекции:*редко — бронхит, назофарингит, синусит, грибковые инфекции, вирусные инфекции.

Нарушения метаболизма и питания: часто — повышение аппетита; редко — анорексия, снижение аппетита, полидипсия.

Психические расстройства: очень часто — необычные сновидения, бессонница; редко — паническая реакция, брадифрения, нарушение мышления, колебания настроения.

Неврологические нарушения: очень часто — головная боль; часто — сонливость, головокружение, дисгевзия; редко — тремор, нарушение координации, дизартрия, гипертония, двигательное беспокойство, дисфория, гипестезия, снижение вкусовых ощущений, апатия, повышение, снижение либидо.

Изменения со стороны сердца: редко — фибрилляция предсердий, сердцебиение.

Изменения со стороны органа зрения: редко — скотома, изменение цвета склеры, боли в глазном яблоке, расширение зрачков, фотофобия, миопия, повышенное слезотечение.

Изменения со стороны органа слуха и вестибулярного аппарата: редко — шум в ушах.

Изменения со стороны дыхательной системы, грудной клетки и средостения: редко — одышка, кашель, охриплость голоса, боль в глотке и гортани, раздражение глотки, застойные явления в дыхательных путях, застой в придаточных пазухах носа, экссудация в носоглотке, ринорея, храп.

Желудочно-кишечные нарушения: очень часто — тошнота; часто — рвота, запор, диарея, вздутие живота, дискомфорт в желудке, диспепсия, метеоризм, сухость во рту; редко — рвота кровью, примесь крови в стуле, гастрит, гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь, боли в животе, кишечные расстройства, нарушение стула, отрыжка, афтозный стоматит, болезненность десен, обложенный язык.

Изменения кожи и подкожных тканей: редко — генерализованная сыпь, эритема, прурит, акне, гипергидроз, ночные поты.

Изменения со стороны опорно-двигательного аппарата и соединительной ткани: редко — скованность суставов, мышечные спазмы, боли в грудной стенке, костохондрит.

Изменения со стороны почек и мочевыводящих путей: редко — глюкозурия, никтурия, полиурия.

Изменения со стороны репродуктивной системы и молочной железы: редко — меноррагия, выделения из влагалища, сексуальная дисфункция.

Общие и местные реакции: часто — усталость; редко — дискомфорт в груди, боли в груди, лихорадка, ощущение холода, астения, нарушение циркадного ритма сна, недомогание, киста.

Результаты исследований: редко — повышение АД, депрессия сегмента ST на ЭКГ, уменьшение амплитуды зубца Т на ЭКГ, увеличение ЧСС, изменение показателей функции печени, уменьшение числа тромбоцитов, увеличение массы тела, изменение спермы, повышение уровня С-реактивного белка, снижение уровня кальция в крови.

Прекращение курения на фоне терапии или без нее сопровождается развитием синдрома отмены никотина и обострением сопутствующих психических расстройств. В ходе пострегистрационных исследований у пациентов, пробующих отказаться от курения с помощью Чампикса®, регистрировались случаи депрессивного настроения, ажитации, нарушения поведения, суицидальной настроенности и суицидальных попыток. Поскольку указанные явления фиксируются по результатам добровольного сообщения популяцией неопределенного размера, не всегда возможно точно установить их частоту или причинно-следственную связь с действием препарата. Не у всех пациентов, описанных в этих сообщениях, имелись в анамнезе психические расстройства, и не все они прекратили курить. Роль Чампикса®в развитии реакций, описанных в этих сообщениях, неизвестна.

Зарегистрированы также случаи реакций гиперчувствительности, таких как ангионевротический отек и отеки лица.

Передозировка:

Случаев передозировки варениклина не зарегистрировано.

Лечение: проведение симптоматической терапии. Варениклин выводится при гемодиализе у пациентов с тяжелым нарушением функции почек, однако опыта применения гемодиализа при передозировке нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых исследований по безопасности применения Чампикса при беременности не проводилось, поэтому назначение препарата противопоказано.

Неизвестно, выделяется ли варениклин с грудным молоком у человека. При необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Клинически значимых взаимодействий варениклина с другими препаратами не выявлено. Коррекции дозы варениклина или перечисленных ниже препаратов при одновременном применении не требуется.

Исследования *in vitro* свидетельствуют о том, что варениклин не изменяет фармакокинетику препаратов, которые метаболизируются под действием изоферментов цитохрома Р450. Поскольку клиренс варениклина менее чем на 10% осуществляется за счет метаболизма, маловероятно, что вещества, влияющие на активность изоферментов цитохрома Р450, могут повлиять на фармакокинетику варениклина, в связи с чем коррекция его дозы не требуется.

Варениклин в терапевтических концентрациях не подавляет почечный транспорт белков у человека. Следовательно, варениклин не должен влиять на фармакокинетику ЛС, клиренс которых осуществляется за счет почечной секреции (в частности метформина).

Метформин. Варениклин не влияет на фармакокинетику метформина. Метформин не вызывает изменения фармакокинетики варениклина.

Циметидин вызывает увеличение AUC варениклина на 29% за счет снижения его почечного клиренса.

Дигоксин. Варениклин не влияет на фармакокинетику дигоксина в равновесном состоянии.

Варфарин. Варениклин не изменяет фармакокинетику варфарина и не влияет на протромбиновое время (МНО). Прекращение курения само по себе может привести к изменению фармакокинетики варфарина.

Применение в сочетании с другими средствами против курения

Бупропион. Варениклин не влияет на фармакокинетику бупропиона в равновесном состоянии.

Никотинзаместительная терапия (НЗТ). При одновременном применении у курильщиков варениклина и пластырей, содержащих никотин, в течение 12 дней было выявлено статистически значимое снижение среднего сАД (на 2,6 мм рт. ст.) в последний день исследования. При этом частота проявления тошноты, головной боли, рвоты, головокружения, диспепсии и усталости на фоне комбинированной терапии была выше, чем на фоне одной НЗТ.

Безопасность и эффективность варениклина в сочетании с другими средствами против табакокурения не изучались.

Особые указания и меры предосторожности:

Физиологические изменения, которые возникают после отказа от курения на фоне терапии варениклином или без нее, могут повлиять на фармакокинетику или фармакодинамику некоторых ЛС, что может потребовать коррекции их дозы (например теофиллин, варфарин и инсулин).

Завершение лечения варениклином у 3% пациентов сопровождалось повышением раздражительности, тягой к курению, депрессией и/или бессонницей.

В ходе пострегистрационного применения препарата поступали сообщения о появлении психоневрологических симптомов, включая нарушение поведения, ажитацию, депрессивное настроение, суицидальную настроенность и суицидальное поведение у пациентов, пытающихся бросить курить с помощью варениклина (см. раздел «Побочные

эффекты»). Врач должен разъяснять пациентам, пробующим бросить курить с помощью варениклина, возможность развития психоневрологических симптомов и учитывать возможность постепенного снижения дозы. Пациентов, членов их семей или ухаживающих за ними лиц следует информировать о необходимости прекращения приема Чампикса® и немедленного обращения к врачу при появлении нарушений поведения, ажитации или депрессивного настроения, которые ранее не были свойственны данному пациенту, а также при возникновении суицидальной настроенности или поведения. До начала лечения нужно рекомендовать пациентам сообщать о любых психических расстройствах, которые у них были раньше.

Учитывая, что варениклин может вызвать головокружение и сонливость, пациентам не рекомендуется управлять автомобилем, пользоваться сложной техникой или выполнять другие потенциально опасные задачи, пока они не оценят свою реакцию на лекарственный препарат.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте, при температуре от 15° до 30°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Champiks