Галантамин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Галантамин

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	**1 таб.**
галантамин	4 мг
-"-	8 мг
-"-	12 мг

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (6) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный, конкурентный и обратимый ингибитор ацетилхолинэстеразы. Стимулирует никотиновые рецепторы и повышает чувствительность постсинаптической мембраны к ацетилхолину. Облегчает проведение возбуждения в нервно-мышечном синапсе и восстанавливает нервно-мышечную проводимость в случаях ее блокады миорелаксантами недеполяризующего типа действия. Повышает тонус гладкой мускулатуры, усиливает секрецию пищеварительных и потовых желез, вызывает миоз. Повышая активность холинергической системы, галантамин улучшает когнитивные функции у пациентов с деменцией альцгеймеровского типа, но не оказывает влияния на развитие самого заболевания.

Фармакокинетика

После приема внутрь быстро и полностью всасывается в ЖКТ. Абсолютная биодоступность является высокой - до 90%. Терапевтическая концентрация достигается через 30 мин после приема. C_{max} после приема в дозе 8 мг наблюдается на 2-м часу и составляет 1.2 мг/мл.

$T_{1/2}$ - 5 ч. После многократного приема устанавливается равновесная концентрация.

В незначительной степени связывается с белками крови. Легко проходит через гемато-энцефалический барьер. В незначительной степени (около 10%) метаболизируется в печени путем деметилирования.

Выводится (в неизмененном виде и виде метаболитов), в основном, с мочой (до 74%). Почечный клиренс составляет приблизительно 100 мл/мин.

У пациентов с болезнью Альцгеймера плазменная концентрация галантамина может повыситься. При умеренном и тяжелом нарушении функции печени и почек плазменные концентрации галантамина повышаются.

Показания к применению:

— деменция альцгеймеровского типа легкой или умеренной степени;

— полиомиелит (непосредственно после прекращения фебрильного периода, а также в восстановительном периоде и периоде остаточных явлений);

— миастения gravis, прогрессирующая мышечная дистрофия, детский церебральный паралич, неврит, радикулит, миопатия.

Относится к болезням:

- Деменция
- Детский церебральный паралич
- Миопия
- Неврит
- Паралич
- Полиомиелит
- Радикулит

Противопоказания:

— бронхиальная астма;

— брадикардия;

— атриовентрикулярная блокада;

— артериальная гипертензия;

— стенокардия;

— хроническая сердечная недостаточность;

— эпилепсия;

— гиперкинезы;

— тяжелые почечные (клиренс креатинина - менее 9 мл/мин) и печеночные (более 9 баллов : по шкале Child-Pugh) нарушения;

— механическая кишечная непроходимость;

— хроническая обструктивная болезнь легких;

— обструктивные заболевания или недавно перенесенное оперативное вмешательство на органах желудочно-кишечного тракта;

— обструктивные заболевания или недавно перенесенное оперативное лечение мочевыводящих путей или предстательной железы;

— детский возраст до 9 лет;

— беременность и период лактации;

— гиперчувствительность к любому из компонентов препарата.

С *осторожностью*:

— легкие и умеренные нарушения функции почек или печени;

— синдром слабости синусового узла и другие суправентрикулярные нарушения проводимости;

— одновременный прием препаратов, замедляющих частоту сердечных сокращений (дигоксин, бета-адреноблокаторы);

— общая анестезия;

— язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, повышенный риск развития эрозивно-язвенного поражения ЖКТ.

Способ применения и дозы:

Внутрь, во время еды, запивая водой.

Взрослые:

Суточная доза составляет 8-32 мг, разделенная в 2-4 приема.

При *миастении gravis* суточная доза разделяется на 3 приема.

При *болезни Альцгеймера* лечение рекомендуется начинать с приема таблеток по 4 мг 2 раза/сут. В течении 4 нед суточную дозу постепенно можно повысить до 16 мг - по 1 таб., по 8 мг 2 раза/сут - утром и вечером. Во время лечения препаратом необходимо обеспечить прием достаточного количества жидкости. Если во время лечения потребуется прекращение приема препарата, то восстановление лечения необходимо начинать с наиболее низкой дозы и постепенно ее повышать.

Пациентам с **умеренно выраженным нарушением функции печени и почек:**

Начальная доза - 4 мг 1 раз/сут, которую принимают утром, в течение не менее 1 недели, после чего дозу увеличивают до 4 мг 2 раза/сут и принимают в течение 4 недель.

Общая суточная доза не должна превышать 12 мг.

Дети (с 9 лет):

Лечение полиомиелита, детского церебрального паралича:

с 9 до 11 лет - суточная доза - 4-12 мг, разделенная на 2-3 приема;

с 12 до 15 лет - суточная доза составляет 4-16 мг, разделенная на 2-4 приема.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение или повышение АД, ортостатический коллапс, сердечная недостаточность, отеки, атриовентрикулярная блокада, трепетание или мерцание предсердий, удлинение QT-интервала, вентрикулярная и суправентрикулярная тахикардия, наджелудочковая экстрасистолия, «приливы», брадикардия, ишемия или инфаркт миокарда.

Со стороны пищеварительной системы: вздутие живота, диспепсия, желудочно-кишечный дискомфорт, анорексия, диарея, абдоминальная боль, тошнота, рвота, гастрит, дисфагия, сухость во рту, повышенное выделение слюны, дивертикулит, гастроэнтерит, дуоденит, гепатит, перфорация слизистой оболочки пищевода, кровотечение из верхних и нижних отделов желудочно-кишечного тракта.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: мышечные спазмы, мышечная слабость, лихорадка.

Лабораторные показатели: повышение активности печеночных ферментов, анемия, гипокалнемия, повышение уровня сахара или щелочной фосфатазы в крови.

Гематологические: тромбоцитопения, пурпура.

Со стороны мочевыделительной системы: недержание мочи, гематурия, учащенное мочеиспускание, инфекции мочевыводящих путей, задержка мочи, калькулез, почечная колика.

Со стороны нервной системы: часто тремор, синкопе, заторможенность, извращение вкуса, зрительные и слуховые галлюцинации, поведенческие реакции, включая возбуждение/агрессию; преходящее нарушение мозгового кровообращения или инсульт; головная боль, головокружение, судороги, мышечные спазмы, парестезия, атаксия, гипо-или гиперкинезы, апраксия, афазия, анорексия, сонливость, бессонница.

Со стороны органов чувств: ринит, носовое кровотечение, нарушения зрения, спазм аккомодации, нечасто - шум в ушах.

Со стороны психики: депрессия (очень редко - с суицидом), апатия, параноидные реакции, повышение либидо, делирий.

Общие: боль в груди, повышенная потливость, уменьшение массы тела, чувство усталости, дегидратация (в редких случаях - с развитием почечной недостаточности), бронхоспазм.

Передозировка:

Симптомы: угнетение сознания (вплоть до комы), судороги, усиление степени выраженности побочных эффектов, выраженная мышечная слабость в сочетании с гиперсекрецией желез слизистой оболочки трахеи и бронхоспазмом может привести к летальной блокаде дыхательных путей.

Лечение: промывание желудка, симптоматическая терапия. В качестве антидота - в/в введение атропина в дозах 0.5-1 мг. Последующие дозы атропина определяются в зависимости от терапевтического ответа и состояния пациента.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано при беременности. На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не рекомендуется комбинировать с другими холиномиметиками.

Является антагонистом опиоидов по действию на дыхательный центр. Проявляет фармакодинамический антагонизм к м-холинолитикам (атропину, гоматропина метилбромиду и др.), ганглиоблокаторам, недеполяризующим миорелаксантам, хинину, прокаинамиду.

Аминогликозидные антибиотики могут снижать терапевтическое действие галантамина. Галантамин усиливает нервно-мышечную блокаду во время общей анестезии (в т.ч. при использовании в качестве периферического миорелаксанта суксаметония). Лекарственные средства, снижающие частоту сердечных сокращений (дигоксин, бета-адреноблокоторы) увеличивают риск усугубления брадикардии. Циметидин может увеличить биодоступность галантамина.

Все препараты, которые ингибируют и изоферменты системы цитохрома P450 (CYP2D6 и CYP3A4), могут повысить плазменные концентрации галантамина при одновременном их применении, в результате чего может повышаться частота холинергических побочных эффектов (главным образом, тошноты и рвоты). В этом случае, в зависимости от переносимости терапии конкретным пациентом, может понадобиться снижение поддерживающей дозы галантамина.

Ингибиторы изофермента CYP2D6 (амитриптилин, флуоксетин, флувоксамин, пароксетин, хинидин) снижают клиренс галантамина на 25-30%. По этой причине не рекомендуется назначать одновременно с кетоконазолом, зидовудином, эритромицином. Усиливает угнетающее действие на центральную нервную систему этанола и седативных средств.

Особые указания и меры предосторожности:

Лечение ингибиторами ацетилхолинэстеразы сопровождается уменьшением массы тела. Особенно это необходимо иметь ввиду при лечении пациентов с болезнью Альцгеймера, у которых обычно наблюдается похудание. В связи с этим необходимо следить за массой тела у таких больных.

В период лечения необходимо обеспечить достаточное потребление жидкости. Как и другие холиномиметики, препарат может вызвать ваготонические эффекты со стороны сердечно-сосудистой системы (в т.ч. брадикардию), что необходимо учитывать у пациентов с синдромом слабости синусового узла и другими нарушениями проводимости, а также при одновременном применении с лекарственными средствами, снижающими частоту сердечных сокращений (дигоксин или бета-адреноблокоторы).

При лечении Галантамином существует риск появления синкопе, в связи с чем необходимо чаще контролировать артериальное давление, особенно при приеме препарата в более высоких дозах (40 мг суточная доза). С целью предотвращения подобных побочных эффектов необходимо внимательно подбирать дозу препарата в начале лечения. Эффективность препарата у пациентов с другими типами деменции и нарушения памяти не установлена.

Препарат не предназначен для лечения пациентов со слабым когнитивным нарушением, т.е. с изолированным нарушением памяти, превышающим ожидаемый уровень для их возраста и образования, но не удовлетворяющим критериям болезни Альцгеймера.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения следует воздержаться от выполнения работ, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, в том числе управления автомобилем.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции почек. С осторожностью при легких и умеренных нарушениях функции почек

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции печени. С осторожностью при легких и умеренных нарушениях функции печени

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям младше 9 лет.

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте. Не применять по истечении срока годности.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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