

Галантамин-Тева



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 таб.
галантамин	4 мг
14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.	
Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 таб.
галантамин	8 мг
14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.	
14 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.	

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Галантамин - третичный алкалоид - ингибитор холинэстеразы. Селективный конкурентный и обратимый ингибитор холинэстеразы усиливает и пролонгирует действие эндогенного ацетилхолина на никотиновые рецепторы, вероятно, вследствие связывания с аллостерическим участком рецептора. Благодаря повышению активности холинергической системы, за счет стимуляции центральных холинореактивных систем, может улучшать когнитивную функцию у пациентов с деменцией альцгеймеровского типа.

Фармакокинетика

Фармакокинетика галантамина носит линейный характер в диапазоне доз 4-16 мг 2 раза в сутки.

Всасывание. После однократного приема внутрь в дозе 8 мг галантамин быстро всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается через 1,2 ч и составляет около 43 нг/мл, площадь под кривой AUC - 427 ВТ*ч/мл.

Распределение. Абсолютная биодоступность при приеме внутрь составляет 88,5%. Прием галантамина с пищей замедляет его абсорбцию (C_{max} уменьшается на 25%), но не влияет на AUC. После многократного приема галантамина в дозе 12 мг 2 раза в сутки средние концентрации в конце курса и C_{max} в плазме крови варьировали от 30 нг/мл до 90 нг/мл. Объем распределения - 175 л. Связывание галантамина с белками плазмы - около 18%. В цельной крови галантамин находится преимущественно в форменных элементах (52,7%) и в плазме (39%), тогда как его фракция, связанная с белками плазмы, составляет лишь 8,4%.

Метаболизм. Исследования *in vitro* показали, что основными изоферментами системы цитохрома P450, участвующими в метаболизме галантамина, являются изофермент CYP2D6, с которым связано формирование O-деметилгалантамина, и изофермент CYP3A4, с которым связано формирование N-оксидгалантамина. Количества радиоактивных веществ, выводимых с мочой и калом, у людей с быстрым и медленным метаболизмом не отличались. В плазме у людей с быстрым и медленным метаболизмом основную часть радиоактивных веществ составляют неизменный галантамин и его глюкуронид. После однократного приема галантамина в плазме «быстрых» и «медленных» метаболизаторов ни один из активных метаболитов (норгалантамин, O-деметилгалантамин и O-

деметилноргалантамин) не присутствовал в неконъюгированной форме. Норгалантамин был обнаружен в плазме крови пациентов после многократного приема галантамина, но его концентрация составляла не более 10% от концентрации галантамина. Элиминация галантамина носит биоэкспоненциальный характер. Конечный $T_{1/2}$ - 7-8 ч. Плазменный клиренс галантамина - около 200 мл/мин. В течение 7 дней после однократного приема внутрь 3Н-галантамина в дозе 4 мг 90-97% радиоактивности выделилось с мочой и 2,2-6,3% - с калом. После внутривенного введения и приема внутрь 18-22% галантамина выводится в неизменном виде с мочой в течение 24 ч, почечный клиренс - около 65 мл/мин, что составляет 20-25% общего клиренса из плазмы.

У пациентов с болезнью Альцгеймера концентрация галантамина в плазме крови на 30-40% выше, чем у здоровых лиц.

У пациентов с легкими нарушениями функции печени (5-6 баллов по шкале Чайлд-Пью) фармакокинетические параметры были сходны с таковыми у здоровых лиц. У пациентов с умеренными нарушениями функции печени (7-9 баллов по шкале Чайлд-Пью) AUC и $T_{1/2}$ галантамина были повышены примерно на 30%.

Популяционное фармакокинетическое исследование и анализ с использованием ряда моделей показали, что у пациентов с болезнью Альцгеймера и нарушением функции почек при клиренсе креатинина (КК) не менее 9 мл/мин дозу галантамина корректировать не требуется.

Показания к применению:

— симптоматическое лечение деменции альцгеймеровского типа легкой и умеренной степени тяжести.

Относится к болезням:

- [Деменция](#)

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к галантамину и другим компонентам препарата;
- тяжелое нарушение функции печени (тип С по Чайлд-Пью);
- тяжелое нарушение функции почек (КК менее 9 мл/мин);
- непереносимость лактозы;
- дефицит лактазы;
- синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции;
- детский возраст до 18 лет;
- беременность;
- период грудного вскармливания;
- обструктивные заболевания ЖКТ и мочевыводящих путей или недавно перенесенная хирургическая операция на органах ЖКТ и мочевыводящих путей, в том числе на мочевом пузыре.

С осторожностью:

Синдром слабости синусового узла; нарушения суправентрикулярной, проводимости; гиперкалиемия; гипокалиемия; период после острого инфаркта миокарда; впервые выявленная мерцательная аритмия; атриовентрикулярная блокада II-III степени, нестабильная стенокардия; хроническая сердечная недостаточность (ХСН) III и IV функционального класса по классификации NYHA; одновременное применение с препаратами, способствующими снижению ЧСС (дигоксин, бета-адреноблокаторы), седативными средствами, этанолом; артериальная гипертензия; эпилепсия; ХОБЛ; инфекционные заболевания легких; анестезия.

Способ применения и дозы:

Внутрь, 2 раза в день, желательно во время утреннего и вечернего приема пищи. Таблетки проглатывают целиком, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды. Начальная доза - 8 мг/сут (по 4 мг 2 раза в сутки) в течение 4 недель. Поддерживающая доза - 16 мг/сут (по 8 мг 2 раза в сутки) не менее 4 недель. Решение о применении более высоких доз препарата Галантамин-Тева следует принимать после оценки клинического состояния пациента, в т.ч. достигнутого эффекта и индивидуальной переносимости. Максимальная рекомендуемая доза - 24 мг/сут (по 12 мг 2

раза в сутки).

При перерыве в приеме препарата Галантамин-Тева в течение нескольких дней следует возобновить прием в начальной дозе, а затем повышать ее до прежней поддерживающей дозы по приведенной выше схеме.

У пациентов с умеренной печеночной недостаточностью начальная доза - 4 мг 1 раз в сутки, ежедневно, утром, в течение не менее 1 недели. После этого пациенты могут принимать по 8 мг/сут (по 4 мг 2 раза в сутки) не менее 4 недель. Суточная доза не должна превышать 8 мг/сут.

У пациентов с нарушением функции почек (КК более 9 мл/мин) коррекция дозы не требуется.

Побочное действие:

Частота побочных эффектов классифицирована в соответствии с рекомендациями Всемирной организации здравоохранения: очень часто - не менее 10%; часто - не менее 1%, но менее 10%; нечасто - не менее 0,1%, но менее 1%; редко - не менее 0,01%, но менее 0,1%; очень редко - менее 0,01%, включая единичные сообщения.

Со стороны обмена веществ и питания: часто - анорексия, снижение массы тела; редко - обезвоживание (в редких случаях приводящее к развитию почечной недостаточности), гипокалиемия.

Со стороны ЦНС: часто - головокружение, головная боль, сонливость, обморок, тремор, спутанность сознания, депрессия (очень редко с суицидом), бессонница, астения, недомогание, усталость, лихорадка; нечасто - парестезии, цереброваскулярное заболевание, преходящее нарушение кровообращения ишемического типа, агрессия, ажитация, галлюцинации, шум в ушах; очень редко - обострение течения болезни Паркинсона, судороги, потливость.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - аритмия, острый инфаркт миокарда, ишемическая болезнь сердца, тахикардия; редко - брадикардия; очень редко - атриовентрикулярная блокада.

Со стороны ЖКТ: очень часто - рвота, тошнота; часто - боль в животе, диарея, диспепсия; очень редко - дисфагия, гастроинтестинальные кровотечения.

Со стороны кожи и подкожных тканей: редко - кожная сыпь.

Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани: часто - падение, травматизм; нечасто - судорога в мышцах ног, мышечная слабость.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: часто - инфекция органов мочевыделительного тракта.

Прочие: часто - инфекционный ринит.

Передозировка:

Симптомы: возможны мышечная слабость, фасцикуляция, некоторые или все симптомы холинергического криза (сильная тошнота, рвота, спастическая боль в животе, повышенное слюноотделение, слезотечение, недержание мочи и кала, повышенное потоотделение, брадикардия, снижение АД, коллапс, судорога). Выраженная мышечная слабость в сочетании с гиперсекрецией слизистой оболочки трахеи и бронхоспазмом может привести к летальному исходу. В сообщениях, полученных в постмаркетинговый период, описаны случаи развития двунаправлено-веретенообразной желудочковой тахикардии, удлинения интервала QT, желудочковой тахикардии, сопровождающейся кратковременной потерей сознания, при случайном приеме 32 мг галантамина.

Лечение: при необходимости проводят симптоматическую терапию. В тяжелых случаях в качестве антидота в/в вводят атропин (начальная доза - 0,5-1 мг; частота введения и последующие дозы зависят от динамики клинического состояния пациента).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Галантамин-Тева при беременности противопоказано.

В период терапии препаратом Галантамин-Тева грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременный прием пищи несколько замедляет скорость абсорбции галантамина, но не влияет на ее объем. Пациентам рекомендуется принимать галантамин вместе с пищей для минимизации возможных холинергических нежелательных явлений.

Одновременное применение галантамина с другими холиномиметическими препаратами противопоказано.

Фармакодинамическое взаимодействие галантамина возможно с лекарственными препаратами, которые значительно снижают ЧСС, таких как дигоксин, бета-адреноблокаторы, блокаторы «медленных» кальциевых каналов и амиодарон. Следует соблюдать осторожность при одновременном применении с лекарственными препаратами, которые имеют потенциальную возможность вызвать аритмию типа «пируэт». В этих случаях необходимо проводить лечение под контролем показателей электрокардиограммы.

Галантамин может усиливать блокаду нервно-мышечной передачи деполяризующего типа во время общей анестезии (при применении в качестве периферического миорелаксанта суксаметония).

При одновременном применении галантамин усиливает действие деполяризующих миорелаксантов, ослабляет - недеполяризующих миорелаксантов; является слабым антагонистом морфина и его структурных аналогов в отношении угнетающего действия на дыхательный центр. Усиливает действие этанола и седативных лекарственных препаратов. Восстанавливает нервно-мышечную проводимость, блокированную недеполяризующими миорелаксантами (тубокурарин и др.).

М-холиноблокаторы (атропин и др.) устраняют периферические мускариноподобные эффекты галантамина, недеполяризующие миорелаксанты и ганглиоблокаторы - никотиноподобные эффекты галантамина.

При одновременном применении с лекарственными препаратами, являющимися активными ингибиторами изоферментов CYP2D6 или CYP3A4 (такими как кетоконазол, пароксетин, эритромицин, амитриптилин, флуоксетин, флувоксамин, хинидин), AUC увеличивается на 10-40% и повышается риск развития нежелательных эффектов (главным образом тошноты и рвоты), обусловленных холинергическим действием галантамина, вследствие чего может потребоваться снижение дозы галантамина.

При применении в дозах до 12 мг 2 раза в сутки галантамин не изменял фармакокинетические параметры дигоксина и варфарина и не влиял на увеличение протромбинового времени, вызванного варфарином.

Галантамин является антагонистом морфина и его структурных аналогов в отношении угнетающего действия на дыхательный центр.

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат Галантамин-Тева применяют у пациентов с деменцией альцгеймеровского типа легкой и умеренной степени тяжести. Эффективность применения препарата Галантамин-Тева у пациентов с другими типами деменции и другими типами нарушения памяти не установлена.

Также не установлено положительное влияние препарата на замедление когнитивных нарушений или замедление перехода в клинически выраженную деменцию у пациентов с синдромом мягкого когнитивного снижения («мягкие» типы нарушения памяти, не удовлетворяющие критериям деменции при болезни Альцгеймера). Терапия препаратом Галантамин-Тева должна проводиться под контролем врача и под наблюдением человека, который ухаживает за пациентом.

Прием препарата Галантамин-Тева сопровождается снижением массы тела, поэтому во время лечения необходимо контролировать этот показатель.

Препарат Галантамин-Тева нельзя применять одновременно с другими ингибиторами холинэстеразы.

Препарат Галантамин-Тева следует применять с осторожностью при заболеваниях сердечно-сосудистой системы, т.к. вследствие своего фармакологического действия холиномиметики могут вызывать ваготонические эффекты (например, брадикардию). С осторожностью применяют препарат Галантамин-Тева (как и другие холиномиметики) у пациентов с синдромом слабости синусового узла; нарушениями суправентрикулярной проводимости; при одновременной терапии с лекарственными препаратами, снижающими ЧСС (дигоксин, бета-адреноблокаторы); нарушениями электролитного обмена (гиперкалиемия, гипокалиемия); в период после острого инфаркта миокарда; при впервые выявленной мерцательной аритмии, атриовентрикулярной блокаде II-III степени; нестабильной стенокардией, ХСН III и IV функционального класса по классификации NYHA.

При терапии деменции альцгеймеровского типа препаратом Галантамин-Тева может повыситься риск развития нежелательных реакций со стороны сердечно-сосудистой системы (см. раздел «Побочное действие»).

У пациентов с повышенным риском развития эрозивно-язвенных поражений ЖКТ, например имеющих язвенную болезнь в анамнезе, необходимо контролировать состояние с целью раннего выявления соответствующих патологических симптомов. Препарат Галантамин-Тева не рекомендуется применять у пациентов с обструкцией ЖКТ, а также у пациентов, которые недавно перенесли хирургическое вмешательство на органах пищеварения.

Холиномиметики обладают определенной способностью вызывать генерализованные судороги. Следует помнить, что судорожная активность может быть проявлением самой болезни Альцгеймера. Описаны случаи ухудшения течения болезни Паркинсона. Нельзя исключить возможности развития нарушения мозгового кровообращения у пациентов с болезнью Альцгеймера на фоне заболеваний сосудов головного мозга. С осторожностью применяют препарат

Галантамин-Тева

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

Галантамин-Тева у пациентов с тяжелой бронхиальной астмой, ХОБЛ и инфекционными заболеваниями легких из-за его холиномиметической активности.

Препарат Галантамин-Тева не рекомендуется применять у пациентов с обструкцией мочевыводящих путей, а также у лиц, недавно перенесших хирургическую операцию на мочевом пузыре.

Необходимо учитывать, что препарат Галантамин-Тева, как холиномиметик, увеличивает миорелаксацию при сукцинил-холиновом типе анестезии.

После резкой отмены препарата Галантамин-Тева (например, при подготовке к операции) обострения симптомов не возникает.

Влияние на способность к вождению транспорта и управление техникой

Во время терапии препаратом Галантамин-Тева следует воздержаться от вождения транспорта и управления другими механизмами, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Препарат противопоказан пациентам с тяжелым нарушением функции почек (КК менее 9 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан пациентам с тяжелым нарушением функции печени (тип С по Чайлд-Пью).

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

При температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте. Срок годности - 2,5 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Galantamin-Teva>