Голдлайн Плюс



Код АТХ:

- A08A

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Сибутрамин
- Целлюлоза микрокристаллическая

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Капсулы твердые желатиновые, размер №2, с желтым корпусом и голубой крышечкой; содержимое капсул - порошок от белого до почти белого цвета.

1 капс.сибутрамина гидрохлорида моногидрат10 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

Состав корпуса капсулы: краситель солнечный закат желтый, краситель хинолин желтый, титана диоксид, натрия лаурилсульфат, желатин.

Состав крышечки капсулы: краситель фуксин кислый (D&C33), краситель бриллиантовый голубой, титана диоксид, натрия лаурилсульфат, желатин.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

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

Капсулы твердые желатиновые, размер №2, с белым корпусом и голубой крышечкой; содержимое капсул - порошок от белого до почти белого цвета.

1 капс.сибутрамина гидрохлорида моногидрат15 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

Состав корпуса капсулы: титана диоксид, натрия лаурилсульфат, желатин.

Состав крышечки капсулы: краситель фуксин кислый (D&C33), краситель бриллиантовый голубой, титана диоксид, натрия лаурилсульфат, желатин.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Препарат для лечения ожирения центрального действия. Сибутрамин является пролекарством и проявляет свое действие in vivo за счет метаболитов (первичных и вторичных аминов), ингибирующих обратный захват моноаминов (преимущественно серотонина и норадреналина). Увеличение содержания в синапсах нейротрансмиттеров повышает активность центральных серотониновых 5НТ-рецепторов и адренорецепторов, что способствует увеличению чувства насыщения и снижению потребности в пище, а также увеличению термопродукции. Опосредованно активируя β_3-адренорецепторы, сибутрамин воздействует на бурую жировую ткань.

Снижение массы тела сопровождается увеличением концентрации в сыворотке крови ЛПВП и понижением количества триглицеридов, общего холестерина, ЛПНП и мочевой кислоты.

Сибутрамин и его метаболиты не влияют на высвобождение моноаминов, не ингибируют МАО, не обладают сродством к большому числу нейромедиаторных рецепторов, включая серотониновые ($5HT_1$-, $5HT_{1A}$-, $5HT_{1B}$-, $5HT_{2A}$-, $5HT_{2C}$-), адренергические (β_1-, β_2-, β_3-, α_1-, α_2-), допаминовые (D_1-, D_2-), мускариновые, гистаминовые (H_1-), бензодиазепиновые и NMDA-рецепторы.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь быстро всасывается из ЖКТ не менее чем на 77%. При "первом прохождении" через печень подвергается биотрансформации под влиянием изофермента цитохрома Р450 3А4 с образованием двух активных метаболитов (моно- и дидесметилсибутрамин). После приема разовой дозы 15 мг C_{max} монодесметилсибутрамина составляет 4 нг/мл (3.2-4.8 нг/мл), C_{max} дидесметилсибутрамина - 6.4 нг/мл (5.6-7.2 нг/мл). T_{max} сибутрамина - 1.2 ч, T_{max} активных метаболитов - 3-4 ч. Одновременный прием пищи снижает C_{max} метаболитов на 30% и увеличивает время ее достижения на 3 ч, не изменяя AUC.

Распределение

Быстро распределяется по тканям. Связывание с белками составляет 97% (сибутрамин) и 94% (моно- и дидесметилсибутрамин). C_{ss} активных метаболитов в крови достигается в течение 4 дней после начала лечения и примерно в 2 раза превышает плазменный уровень после приема разовой дозы.

Метаболизм и выведение

$T_{1/2}$ сибутрамина - 1.1 ч, монодесметилсибутрамина - 14 ч, дидесметилсибутрамина -16 ч. Активные метаболиты подвергаются гидроксилированию и конъюгации с образованием неактивных метаболитов, которые выводятся преимущественно почками.

Показания к применению:

— алиментарное ожирение с индексом массы тела (ИМТ) ≥30 кг/м^2;

— алиментарное ожирение с ИМТ ≥ 27 кг/м^2 в сочетании с сахарным диабетом 2 типа или дислипопротеинемией.

Относится к болезням:

- Ожирение
- Сахарный диабет

Противопоказания:

— наличие органических причин ожирения (например, гипотиреоз);

— серьезные нарушения питания (нервная анорексия или нервная булимия);

— психические заболевания;

— синдром Жиль де ля Туретта (генерализованные тики);

— одновременный прием ингибиторов МАО или их использование в течение 2 недель до назначения препарата Голдлайн;

— применение других препаратов, действующих на ЦНС (например, антидепрессантов, нейролептиков);

— применение препаратов, назначаемых при нарушениях сна, содержащих триптофан, а также других препаратов центрального действия для снижения массы тела;

— ИБС, декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность, врожденные пороки сердца, окклюзионные заболевания периферических артерий, тахикардия, аритмия, цереброваскулярные заболевания (инсульт, транзиторные нарушения мозгового кровообращения);

— неконтролируемая артериальная гипертензия (АД выше 145/90 мм рт. ст.);

— тиреотоксикоз;

— тяжелые нарушения функции печени и/или почек;

— доброкачественная гиперплазия предстательной железы;

— феохромоцитома;

— закрытоугольная глаукома;

— установленная фармакологическая, наркотическая или алкогольная зависимость;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— возраст до 18 лет и старше 65 лет;

— установленная повышенная чувствительность к сибутрамину или к другим компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при следующих состояниях: аритмия в анамнезе, хроническая недостаточность кровообращения, заболевания коронарных артерий (в т.ч. в анамнезе), холелитиаз, артериальная гипертензия (контролируемая и в анамнезе), неврологические нарушения, включая задержку умственного развития и судороги (в т.ч. в анамнезе), нарушение функции печени и/или почек легкой и средней степени тяжести, моторные и вербальные тики в анамнезе.

Способ применения и дозы:

Голдлайн назначают внутрь 1 раз/сут. Дозу устанавливают индивидуально, в зависимости от переносимости и клинической эффективности. Рекомендуется начальная доза 10 мг, при плохой переносимости возможен прием 5 мг. Капсулы следует принимать утром, не разжевывая и запивая достаточным количеством жидкости (стакан воды). Препарат можно принимать как натощак, так и сочетать с приемом пищи. Если в течение 4-х недель от начала лечения не достигнуто снижение массы тела на 5% и более, то доза увеличивается до 15 мг/сут.

Лечение Голдлайном не должно продолжаться более 3 мес у больных, которые недостаточно хорошо реагируют на терапию, т.е. которым в течение 3 мес лечения не удается достигнуть 5% снижения массы тела от исходного уровня. Лечение не следует продолжать, если при дальнейшей терапии, после достигнутого снижения массы тела, пациент вновь прибавляет в массе тела 3 кг и более. Длительность лечения не должна превышать 2 года, поскольку в отношении более продолжительного периода приема сибутрамина данные об эффективности и безопасности

отсутствуют.

Лечение Голдлайном должно осуществляться в комплексе с диетой и физическими упражнениями под контролем врача, имеющего практический опыт лечения ожирения.

Побочное действие:

Чаще всего побочные эффекты возникают в начале лечения (в первые 4 недели). Их выраженность и частота с течением времени ослабевают.

Побочные эффекты носят, в целом, нетяжелый и обратимый характер и, в зависимости от воздействия на органы и системы органов, представлены в следующем порядке: часто (>10%), иногда (1-10%), редко (< 1%).

Со стороны ЦНС: часто - бессонница; иногда - головная боль, головокружение, беспокойство, парестезии.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: иногда - тахикардия, сердцебиение, повышение АД, симптомы вазодилатации (в т.ч. гиперемия кожи), обострение геморроя. Наблюдается умеренный подъем АД в покое на 1-3 мм рт. ст. и умеренное увеличение пульса на 3-7 уд./мин. В отдельных случаях не исключаются более выраженное повышение АД и ЧСС. Клинически значимые изменения уровня АД и пульса регистрируются преимущественно в начале лечения (в первые 4-8 недель).

Со стороны пищеварительной системы: часто - сухость во рту, потеря аппетита и запор; иногда - тошнота, изменение вкуса.

Дерматологические реакции: иногда - повышенное потоотделение.

В единичных случаях при лечении сибутрамином описаны следующие нежелательные клинически значимые явления: дисменорея, отеки, гриппоподобный синдром, зуд кожи, боль в спине, боль в животе, парадоксальное повышение аппетита, жажда, ринит, депрессия, сонливость, эмоциональная лабильность, тревожность, раздражительность, нервозность, острый интерстициальный нефрит, кровотечения, пурпура Шенлейн-Геноха (кровоизлияния в кожу), судороги, тромбоцитопения, транзиторное повышение активности печеночных ферментов в крови.

У одного пациента с шизоаффективным расстройством, которое предположительно существовало до начала лечения, после лечения развился острый психоз.

Реакции на отмену, такие как головная боль или повышенный аппетит, наблюдаются редко.

Нет данных о том, что после лечения наблюдается абстинентный синдром, синдром отмены или нарушения настроения.

Передозировка:

Имеются крайне ограниченные данные по передозировке сибутрамина. Специфические признаки передозировки неизвестны, тем не менее, следует учитывать возможность более выраженного проявления побочных действий. Следует известить своего лечащего врача в случае возникновения предполагаемой передозировки.

Наиболее часто встречаются следующие *симптомы*: тахикардия, повышение АД, головная боль, головокружение.

Лечение: специального лечения и специфических антидотов не существует. Необходимо обеспечить свободное дыхание, наблюдать за состоянием сердечно-сосудистой системы, а также при необходимости осуществлять поддерживающую симптоматическую терапию. Своевременное применение активированного угля может уменьшить всасывание сибутрамина в кишечнике. Промывание желудка также уменьшает всасывание препарата. Больным с повышенным АД и тахикардией можно назначить бета-адреноблокаторы. Эффективность форсированного диуреза или гемодиализа не установлена.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Поскольку до настоящего времени не имеется достаточно убедительного количества исследований в отношении безопасности воздействия сибутрамина на плод, данный препарат не следует применять при беременности.

Не следует принимать Голдлайн во время грудного вскармливания.

Женщины детородного возраста во время приема препарата Голдлайн должны использовать контрацептивные средства.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Ингибиторы микросомального окисления, в т.ч. ингибиторы изофермента CYP3A4 (кетоконазол, эритромицин, циклоспорин), повышают в плазме концентрации метаболитов сибутрамина с повышением ЧСС и клинически несущественным увеличением интервала QT.

Рифампицин, антибиотики из группы макролидов, фенитоин, карбамазепин, фенобарбитал и дексаметазон могут ускорять метаболизм сибутрамина.

Одновременное применение нескольких препаратов, повышающих содержание серотонина в крови, может привести к развитию серьезного взаимодействия.

Серотониновый синдром может развиться в редких случаях при одновременном применении препарата Голдлайн с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (препаратами для лечения депрессии), с некоторыми препаратами для лечения мигрени (суматриптан, дигидроэрготамин), с опиоидными анальгетиками (пентазоцин, петидин, фентанил) или противокашлевыми препаратами (декстрометорфан).

Сибутрамин не влияет на действие пероральных контрацептивов.

Лекарственные средства, повышающие АД или ЧСС (эфедрин, фенилпропаноламин, псевдоэфедрин, а также комбинированные лекарственные препараты для лечения простудных заболеваний, содержащие эти лекарственные вещества), увеличивают риск повышения АД и ЧСС.

При одновременном приеме сибутрамина и алкоголя не было отмечено усиления негативного действия этанола. Однако алкоголь абсолютно не сочетается с рекомендуемыми при приеме сибутрамина диетическими мероприятиями.

Особые указания и меры предосторожности:

Голдлайн следует применять только в тех случаях, когда все немедикаментозные мероприятия по снижению массы тела малоэффективны, если снижение массы тела в течение 3 мес составило менее 5 кг.

Лечение препаратом Голдлайн должно осуществляться в рамках комплексной терапии по снижению массы тела под контролем врача, имеющего практический опыт лечения ожирения. Комплексная терапия включает в себя как изменение диеты и образа жизни, так и увеличение физической активности. Важным компонентом терапии является создание предпосылок к стойкому изменению привычек питания и образа жизни, которые необходимы для сохранения достигнутого снижения массы тела и после отмены медикаментозной терапии. Пациентам необходимо в рамках терапии препаратом Голдлайн изменить свой жизненный уклад и привычки таким образом, чтобы после завершения лечения обеспечить сохранение достигнутого уменьшения массы тела. Пациенты должны четко представлять себе, что несоблюдение этих требований приведет к повторному увеличению массы тела и повторным обращениям к лечащему врачу.

У пациентов, принимающих Голдлайн, необходимо измерять уровень АД и ЧСС. В первые 2 мес лечения эти параметры следует контролировать каждые 2 недели, а затем ежемесячно. У пациентов с артериальной гипертензией, у которых на фоне гипотензивной терапии уровень АД выше 145/90 мм рт. ст., этот контроль должен проводиться особенно тщательно и, при необходимости, через более короткие интервалы. У пациентов, у которых АД дважды при повторном измерении превышало уровень 145/90 мм рт. ст., лечение препаратом Голдлайн должно быть приостановлено.

Особого внимания требует одновременное назначение препаратов, увеличивающих интервал QT. К этим препаратам относятся блокаторы гистаминовых H_1-рецепторов (астемизол, терфенадин), антиаритмические препараты, увеличивающие интервал QT (амиодарон, хинидин, флекаинид, мексилетин, пропафенон, соталол), цизаприд, пимозид, сертиндол и трициклические антидепрессанты. Это касается и состояний, которые способны приводить к увеличению интервала QT, таких как, гипокалиемия и гипомагниемия.

Интервал между приемом ингибиторов МАО и препарата Голдлайн должен составлять не менее 2 недель.

Хотя не установлена связь между приемом препарата Голдлайн и развитием первичной легочной гипертензии, однако, учитывая общеизвестный риск препаратов данной группы, при регулярном медицинском контроле необходимо особое внимание обращать на такие симптомы, как прогрессирующее диспноэ, боль в грудной клетке и отеки на ногах.

При пропуске дозы препарата Голдлайн, не следует принимать в следующий прием двойную дозу препарата, рекомендовано продолжать дальнейший прием препарата по предписанной схеме.

Длительность приема Голдлайн не должна превышать 2 лет.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Прием препарата Голдлайн может ограничить способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Сибутрамин относится к Списку сильнодействующих веществ, утвержденному Постановлением Правительства РФ от 29.12.2007г. № 964.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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