Каликста



Код АТХ:

- N06AX11

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Миртазапин

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 желтого цвета, продолговатые, с риской на одной стороне.

	1 таб.
миртазапин	15 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 44.4 мг, крахмал кукурузный - 28 мг, гипролоза - 15 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 15 мг, крахмал прежелатинизированный - 15 мг, тальк - 1.4 мг, магния стеарат - 0.7 мг, кремния диоксид - 0.5 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза-5 CPS - 2.4 мг, макрогол 6000 - 0.2 мг, титана диоксид - 0.25 мг, краситель железа оксид желтый (E172) - 0.1 мг, тальк - 0.05 мг.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой коричневато-розового цвета, продолговатые, с риской на одной стороне.

	1 таб.
миртазапин	30 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 88.8 мг, крахмал кукурузный - 56 мг, гипролоза - 30 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 30 мг, крахмал прежелатинизированный - 30 мг, тальк - 2.8 мг, магния стеарат - 1.4 мг, кремния диоксид - 1 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза-5 CPS - 4.8 мг, макрогол 6000 - 0.4 мг, титана диоксид - 0.5 мг, краситель железа

оксид желтый (E172) - 0.15 мг, краситель железа оксид красный (E172) - 0.05 мг, тальк - 0.1 мг.

15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, продолговатые.

	1 таб.
миртазапин	45 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 133.2 мг, крахмал кукурузный - 84 мг, гипролоза - 45 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 45 мл, крахмал прежелатинизированный - 45 мг, тальк - 4.2 мг, магния стеарат - 2.1 мг, кремния диоксид - 1.5 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза-5 CPS - 7.2 мг, макрогол 6000 - 0.6 мг, титана диоксид - 1.05 мг, тальк - 0.15 мг.

15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Миртазапин является антагонистом пресинаптических α_2-адренорецепторов в ЦНС и усиливает центральную норадренергическую и серотонинергическую передачу нервных импульсов. При этом усиление серотонинергической передачи реализуется только через серотониновые 5-HT_1-рецепторы, поскольку миртазапин блокирует серотониновые 5-HT_2- и 5-HT_3-рецепторы. Считается, что оба энантиомера миртазапина обладают антидепрессивной активностью, S(+) энантиомер - блокируя α_2-адрено- и серотониновые 5-HT_2-рецепторы, aR(-) энантиомер - блокируя серотониновые 5-HT_3-рецепторы.

Седативные свойства миртазапина обусловлены его антагонистической активностью по отношению к H_1-гистаминовым рецепторам.

Миртазапин обычно хорошо переносится. В терапевтических дозах - практически не оказывает м-холинблокирующего действия и практически не влияет на сердечно-сосудистую систему.

Фармакокинетика

После перорального приема препарата миртазапин быстро всасывается (биодоступность около 50%), достигая C_{max} в плазме крови приблизительно через 2 ч. Около 85% миртазапина связывается с белками плазмы. Средний $T_{1/2}$ составляет от 20 до 40 ч (редко до 65 ч). Более короткий $T_{1/2}$ наблюдается у молодых людей. Равновесная концентрация вещества достигается через 3-4 дня и в дальнейшем она не меняется. В рекомендуемом диапазоне доз фармакокинетические показатели миртазапина имеют линейную зависимость от введенной дозы препарата. Прием пищи не оказывает влияние на фармакокинетику препарата. Миртазапин активно метаболизируется и выводится с мочой и калом в течение нескольких дней. Основными путями его метаболизма в организме являются деметилирование и окисление с последующей конъюгацией. Изоферменты цитохрома P450 (CYP2D6 и CYP1A2) участвуют в образовании 8-гидроксиметаболита миртазапина, в то время как CYP3A4 предположительно определяет образование N-деметилированных и N-окисленных метаболитов. Деметилмиртазапин фармакологически активен. Клиренс миртазапина снижается при почечной или печеночной недостаточности.

Показания к применению:

Депрессия.

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к миртазапину или к какому-либо из вспомогательных веществ;

— больным с такими редкими наследственными проблемами, как непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция, препарат Каликста назначать не следует;

— поскольку безопасность и эффективность препарата Каликста для детского возраста не установлены, то применять препарат Каликста для лечения детей до 18 лет не рекомендуется.

С осторожностью

Коррекция режима дозирования и регулярный врачебный контроль необходимы для следующих категорий больных:

— больные эпилепсией и органическими поражениями головного мозга (на фоне терапии препаратом Каликста в редких случаях возможно развитие судорог);

— больные с печеночной или почечной недостаточностью;

— больные с заболеваниями сердца (нарушение проводимости, стенокардия или недавно перенесенный инфаркт миокарда);

— больные с цереброваскулярными заболеваниями (в т.ч. с ишемическим инсультом в анамнезе);

— больные с артериальной гипотензией и с состояниями, предрасполагающими к артериальной гипотензии (в т.ч. с дегидратацией и гиповолемией);

— больные, злоупотребляющие лекарственными средствами, с зависимостью от лекарственных средств, влияющих на ЦНС, с маниями, гипоманиями.

Как и другие антидепрессанты, препарат Каликста следует с осторожностью применять в следующих случаях:

— нарушение мочеиспускания, в т.ч. при гиперплазии предстательной железы;

— острая закрытоугольная глаукома и повышенное внутриглазное давление;

— сахарный диабет;

— при одновременном применении бензодиазепинов с препаратом Каликста.

Способ применения и дозы:

Таблетки следует принимать внутрь, при необходимости запивая жидкостью, и проглатывать не разжевывая.

Взрослые:

Эффективная суточная доза обычно составляет между 15 мг и 45 мг; начальная доза составляет 15 мг или 30 мг.

Пожилые пациенты:

Рекомендованная доза та же, что и для взрослых. У пожилых больных, чтобы добиться удовлетворительного и безопасного ответа на лечение, увеличение дозы следует производить под непосредственньм наблюдением врача.

Нарушения функции печени и почек:

У больных с почечной или печеночной недостаточностью клиренс миртазапина может быть снижен. Это следует учитывать при назначении препарата Каликста в этой категории больных.

Препарат Каликста можно принимать 1 раз/сут, предпочтительнее в одно и то же время, перед сном. Препарат Каликста можно также назначать для приема 2 раза/сут, поделив суточную дозу пополам (один раз утром и один раз на ночь, более высокую дозу следует принимать на ночь).

Лечение следует по возможности продолжать в течение 4-6 месяцев до полного исчезновения симптомов у больного. После этого, лечение можно постепенно отменять. Миртазапин начинает оказывать свое действие обычно после 1-2 недель лечения. Лечение адекватной дозой должно привести к положительному результату через 2-4 недели. При необходимости дозу можно увеличивать до максимальной дозы (до 45 мг). В случае отсутствия положительной динамики лечения еще через 2-4 недели лечение следует прекратить.

Побочное действие:

У больных депрессией наблюдается ряд симптомов, обусловленных заболеванием, поэтому иногда бывает трудно различить симптомы, связанные с заболеванием, и симптомы, вызванные применением препарата.

Для обозначения частоты побочных эффектов используется следующая классификация: очень часто (≥1/10), часто (>1/100 и ≤1/10), нечасто (>1/1000 и ≤1/100), редко (>1/10000 и ≤1/1000), частота не установлена (≤1/10000)

Со стороны крови и лимфатической системы: частота не установлена - угнетение костного мозга (гранулоцитопения, агранулоцитоз, апластическая анемия и тромбоцитопения), эозинофилия.

Со стороны нервной системы: очень часто - сонливость (которая может приводить к нарушенной концентрации внимания), обычно возникающая в течение первых недель лечения. (N.B. снижение дозы обычно не приводит к

меньшему седативному эффекту, но может снизить эффективность антидепрессанта), седация, головная боль; часто - летаргия, головокружение, тремор; нечасто - парестезия, синдром «беспокойных ног», обморок; редко - миоклонус, очень редко - судороги (инсульт), серотониновый синдром, парестезии слизистой оболочки полости рта.

Со стороны ЖКТ: очень часто - сухость во рту; часто - тошнота, диарея, рвота; нечасто - снижение чувствительности слизистой оболочки полости рта; частота не установлена - отек слизистой оболочки полости рта.

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

Со стороны скелетно-мышечной системы и соединительной ткани: часто - артралгия, миалгия, боль в спине.

Со стороны эндокринной системы: частота не установлена - нарушение секреции антидиуретического гормона.

Со стороны обмена веществ и питания: очень часто - повышенный аппетит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - ортостатическая гипотензия; нечасто - снижение АД.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: часто - местный отёк; нечасто - утомляемость.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: редко - повышение активности трансаминаз сыворотки.

Нарушения психики: часто - необычные сны, спутанность сознания, тревога*, бессонница*, нечасто - ночные кошмары, мания, ажитация, галлюцинации, психомоторное возбуждение (включая акатазию и гиперкинезию); частота не установлена - суицидальные идеи, суицидальное поведение.

* обычно при лечении антидепрессантами тревога и бессонница, которые могут быть симптомами депрессии, могут развиться или ухудшиться. При лечении препаратом Каликста о развитии или ухудшении тревоги и бессонницы сообщалось очень редко.

Передозировка:

Имеющийся опыт относительно передозировки только препаратом Каликста указывает на то, что симптомы обычно бывают слабыми. Сообщалось об угнетении ЦНС, сопровождавшемся дезориентацией и продолжительным седативным эффектом в сочетании с тахикардией и слабым повышением или снижением АД. Однако существует вероятность более тяжелых результатов (включая летальный исход) при дозах, намного превышающих терапевтическую дозу, в особенности при передозировках несколькими препаратами, принятыми одновременно.

В случае передозировки должна проводиться симптоматическая терапия для поддержания жизненно важных функций организма. Следует ввести активированный уголь или промыть желудок.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения препарата Каликста при беременности у человека не установлена, однако у животных тератогенного эффекта не выявлено, поэтому препарат может быть применен во время беременности только в том случае, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Применение препарата Каликста в период лактации не рекомендуется из-за отсутствия данных о его выведении с грудным молоком у человека.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Фармакокинетическое взаимодействие

Миртазапин интенсивно метаболизируется с участием изоферментов CYP2D6 и CYP3A4, и в меньшей степени с участием изофермента CYP1A2. Изучение взаимодействия у здоровых добровольцев показало, что пароксетин, ингибитор изофермента CYP2D6, не оказывает влияния на фармакокинетику миртазапина при равновесном состоянии. Введение в сочетании с мощным ингибитором изофермента CYP3A4, кетоконазолом повышало максимальную концентрацию в плазме и AUC миртазапина приблизительно на 40% и 50% соответственно. Следует проявлять осторожность при применении миртазапина в сочетании с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4, ингибиторами протеазы ВИЧ, азольными
противогрибковыми лекарственными средствами, эритромицином или нефазодоном.

Карбамазепин и фенитоин, индукторы изофермента CYP3A4, увеличивали клиренс миртазапина приблизительно в два раза, что приводило к 45-60% снижению концентраций миртазапина в плазме. При добавлении карбамазепина или другого индуктора микросомальных ферментов печени (например, рифампицина) к терапии миртазапином, дозу миртазапина при необходимости следует увеличить. При прекращении лечения таким лекарственным препаратом может возникнуть необходимость снижения дозы миртазапина.

При применении миртазапина в сочетании с циметидином биодоступность миртазапина может увеличиваться более чем на 50%. Дозу миртазапина при необходимости следует уменьшить в начале лечения в сочетании с циметидином или увеличить при прекращении лечения циметидином.

В исследованиях по изучению взаимодействий, проводимых in vivo, миртазапин не оказывал влияния на фармакокинетику рисперидона или пароксетина (субстрат изофермента CYP2D6), карбамазепина (субстрат изофермента CYP3A4), амитриптилина, циметидина или фенитоина.

Не наблюдалось важных клинических эффектов или изменений фармакокинетики у человека при лечении миртазапином в сочетании с литием.

Фармакодинамическое взаимодействие

Миртазапин не следует применять в сочетании с ингибиторами МАО или в течение двух недель после прекращения лечения ингибитором МАО.

Миртазапин может усиливать седативные свойства бензодиазепинов и других седативных средств. Следует проявлять осторожность при назначении этих лекарственных средств вместе с миртазапином.

Миртазапин может усиливать депрессивное действие алкоголя на ЦНС. Поэтому пациенты должны быть предупреждены о необходимости избегать употребления спиртных напитков.

В случае применения других серотонинергических лекарственных средств (например, селективных ингибиторов захвата серотонина и венлафаксина) в сочетании с миртазапином, существует риск взаимодействия, который может привести к развитию серотонинового синдрома.

Миртазапин в дозе 30 мг 1 раз/сут вызывал небольшое, но статистически достоверное повышение МНО (международное нормализованное отношение) у субъектов, получавших лечение варфарином. Нельзя исключать более выраженный эффект при более высокой дозе миртазапина. Рекомендуется контролировать МНО в случае лечения варфарином в сочетании с миртазапином.

Особые указания и меры предосторожности:

При применении препарата Каликста, следует иметь в виду:

— Ухудшение психотических симптомов может происходить при применении антидепрессантов для лечения больных с шизофренией или другими психотическими нарушениями; могут усилиться параноидальные идеи.

— Депрессивная фаза маниакально-депрессивного психоза на фоне лечения может трансформироваться в маниакальную фазу.

— У молодых людей (младше 24 лет) с депрессией и другими психическими нарушениями, антидепрессанты, по сравнению с плацебо, повышают риск возникновения суицидальных мыслей и суицидального поведения. Поэтому при назначении препарата Каликста у молодых людей (младше 24 лет) следует соотнести риск суицида и пользу от применения препарата. В краткосрочных исследованиях у людей старше 24 лет риск суицида не повышался, а у людей старше 65 лет - несколько снижался. Любое депрессивное расстройство само по себе увеличивает риск суицида. Поэтому во время лечения за пациентом должно быть установлено наблюдение с целью выявления нарушений или изменений поведения, а также суицидальных наклонностей.

— Несмотря на то, что препарат Каликста не вызывает привыкания, исходя их пострегистрационного опыта оказалось, что резкое прекращение лечения после продолжительного применения может иногда стать причиной симптомов отмены. Большинство реакций отмены являются слабыми и самоограничивающимися. Наиболее часто сообщалось о следующих симптомах отмены: головокружение, ажитация, тревога, головная боль и тошнота. Хотя о них сообщалось как о симптомах отмены, следует понимать, что эти симптомы могут быть связаны с основным заболеванием. Рекомендуется прекращать лечение миртазапином постепенно.

— Больные пожилого возраста обычно более чувствительны, особенно в отношении побочных эффектов. В клинических исследованиях препарата Каликста не отмечалось, что у больных пожилого возраста побочные эффекты бывают чаще, чем в других возрастных группах, но они могут быть более выражены, однако данные до сих пор ограничены.

— При появлении признаков желтухи лечение следует прекратить.

— Больным рекомендуют избегать применения алкоголя при лечении препаратом Каликста.

— Угнетение функций костного мозга, обычно появляющееся в виде гранулоцитопении или агранулоцитоза, редко наблюдается при применении препарата Каликста. Появляется большей частью после 4-6 недель лечения и обратимо после прекращения лечения. Врачу следует внимательно отнестись к таким симптомам, как повышение температуры тела, боли в горле, стоматит, и другим признакам гриппоподобного синдрома и проинформировать об этом пациента; при появлении подобных симптомов надо прекратить лечение и сделать анализ крови.

Влияние на способность управления транспортными средствами и механизмами

Препарат Каликста может снижать концентрацию внимания. В процессе лечения антидепрессантами больным следует избегать выполнения потенциально опасных видов деятельности, требующих высокой скорости психомоторных реакций, таких, как вождение автомобиля или управление механизмами.

При нарушениях функции почек

Применять с осторожностью у больных с почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

Применять с осторожностью у больных с печеночной недостаточностью.

Применение в пожилом возрасте

У пожилых больных, чтобы добиться удовлетворительного и безопасного ответа на лечение, увеличение дозы следует производить под непосредственньм наблюдением врача.

Применение в детском возрасте

Поскольку безопасность и эффективность препарата Каликста для детского возраста не установлены, то применять препарат Каликста для лечения детей до 18 лет не рекомендуется.

Условия хранения:

Препарат хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Не применять по истечении срока годности.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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