Квентиакс



Код АТХ:

- N05AH04

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Кветиапин

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 коричневато-красного цвета, круглые, двояковыпуклые, с фаской.

	1 таб.
кветиапина фумарат	28.78 мг,
что соответствует содержанию кветиапина	25 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, кальция гидрофосфата дигидрат, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А), магния стеарат.

Состав оболочки: гипромеллоза, титана диоксид (Е171), макрогол 4000, краситель железа оксид желтый (Е172), краситель железа оксид красный (Е172).

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой светло-желтого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
кветиапина фумарат	115.13 мг,
что соответствует содержанию кветиапина	100 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, кальция гидрофосфата дигидрат, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А), магния стеарат.

Состав оболочки: гипромеллоза, титана диоксид (E171), макрогол 4000, краситель железа оксид желтый (E172).

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с фаской.

	1 таб.
кветиапина фумарат	172.69 мг,
что соответствует содержанию кветиапина	150 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, кальция гидрофосфата дигидрат, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А), магния стеарат.

Состав оболочки: гипромеллоза, титана диоксид (E171), макрогол 4000.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
кветиапина фумарат	230.26 мг,
что соответствует содержанию кветиапина	200 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, кальция гидрофосфата дигидрат, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А), магния стеарат.

Состав оболочки: гипромеллоза, титана диоксид (E171), макрогол 4000.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, овальные, двояковыпуклые.

	1 таб.
кветиапина фумарат	345.39 мг,
что соответствует содержанию кветиапина	300 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, кальция гидрофосфата дигидрат, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А), магния стеарат.

Состав оболочки: гипромеллоза, титана диоксид (E171), макрогол 4000.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антипсихотический препарат (нейролептик). Кветиапин является атипичным антипсихотическим препаратом, который проявляет более высокое сродство к серотониновым $5HT_2$-рецепторам, чем к допаминовым D_1- и D_2-рецепторам головного мозга. Кветиапин обладает сродством к гистаминовым и α_1-адренорецепторам, и меньшим сродством по отношению к α_2-адренорецепторам. Не обнаружено заметного сродства кветиапина к холинергическим мускариновым и бензодиазепиновым рецепторам.

В стандартных тестах кветиапин проявляет антипсихотическую активность.

Результаты изучения экстрапирамидных симптомов у животных выявили, что кветиапин вызывает слабую каталепсию в дозе, эффективно блокирующей допаминовые D_2-рецепторы. Кветиапин вызывает селективное уменьшение активности мезолимбических А10-допаминергических нейронов, в сравнении с А9-нигростриатными нейронами, вовлеченными в двигательные функции.

Не выявлено различий между применением кветиапина (в дозе 75-750 мг/сут) и плацебо по частоте возникновения случаев экстрапирамидной симптоматики и по сопутствующему использованию антихолинергических препаратов. Не вызывает длительного повышения концентрации пролактина в плазме крови.

Кветиапин длительно поддерживает клиническое улучшение у тех пациентов, у которых положительный эффект

развивался в самом начале лечения.

Длительность воздействия кветиапина на серотониновые $5HT_2$-рецепторы и допаминовые и D_2-рецепторы составляет менее 12 ч после приема препарата.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Абсорбция - высокая, прием пищи не влияет на биодоступность. Связывание с белками плазмы - 83%.

Фармакокинетика кветиапина имеет линейный характер и не различается у мужчин и женщин.

Метаболизм

Активно метаболизируется в печени с образованием фармакологически неактивных метаболитов под воздействием изофермента CYP3A4. Кветиапин и некоторые его метаболиты являются слабыми ингибиторами изоферментов 1A2, 2C9, 2C19, 2D6 и 3A4 цитохрома P450 человека, но только в концентрациях, как минимум, в 10-50 раз превышающих концентрации препарата при применении в диапазоне эффективных доз от 300 до 450 мг/сут.

Основываясь на результатах in vitro, не следует ожидать, что одновременное назначение кветиапина с другими препаратами приведет к клинически выраженному ингибированию цитохрома P450 опосредованного метаболизма других лекарственных средств.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет приблизительно 7 ч. Выводится почками примерно 73% и через кишечник - 21%. Менее 5% кветиапина не подвергается метаболизму и выводится в неизменном виде.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Средний клиренс кветиапина у пожилых пациентов на 30-50% меньше, чем у пациентов в возрасте от 18 до 65 лет.

Средний клиренс кветиапина плазмы у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК < 30 мл/мин/1.73 $м^2$) и у пациентов с поражением печени (стабилизированный алкогольный цирроз) снижен примерно на 25%.

Показания к применению:

— лечение острых и хронических психозов, включая шизофрению;

— лечение маниакальных эпизодов при биполярном расстройстве.

Относится к болезням:

- Биполярное расстройство
- Шизофрения

Противопоказания:

— период грудного вскармливания;

— дети и подростки до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— повышенная чувствительность к кветиапину или другим компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам с кардиоваскулярными и цереброваскулярными заболеваниями или другими состояниями, предрасполагающими к артериальной гипотензии, при врожденном увеличении интервала QT на ЭКГ или при наличии условий, потенциально способных вызвать увеличение интервала QT (одновременное назначение препаратов, удлиняющих интервал QT, застойная сердечная недостаточность, гипокалиемия, гипомагниемия), при печеночной недостаточности, эпилепсии, судорожных припадках в анамнезе, беременности, пациентам пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Препарат назначают внутрь, 2 раза/сут, независимо от приема пищи.

При *лечении острых и хронических психозов, включая шизофрению,* суточная доза в первые 4 дня составляет: 1-й день - 50 мг; 2-й день - 200 мг; 3-й день - 200 мг и 4-й день - 300 мг. Начиная с 4-го дня, суточная доза составляет 300 мг. В зависимости от клинического эффекта и переносимости препарата его доза может индивидуально варьировать от 150 мг/сут до 750 мг/сут. Максимальная суточная доза при лечении шизофрении - 750 мг.

При *лечении маниакальных эпизодов при биполярном расстройстве* кветиапин рекомендуется в качестве монотерапии или в качестве адъювантной терапии для стабилизации настроения.

Суточная доза в первые 4 дня составляет: 1-й день - 100 мг; 2-й день - 200 мг; 3-й день - 300 мг и 4-й день - 400 мг. Увеличение суточной дозы в дальнейшем возможно по 200 мг/сут и к 6 дню терапии составляет 800 мг. В зависимости от клинического эффекта и переносимости препарата его доза может индивидуально варьировать от 200 мг/сут до 800 мг/сут. Как правило, эффективная доза составляет от 400 мг до 800 мг/сут. Максимальная суточная доза - 800 мг.

Т.к. плазменный клиренс кветиапина у **пациентов пожилого возраста** снижен на 30-50%, назначать препарат следует с осторожностью, особенно в начале терапии. Стартовая доза - 25 мг/сут, с последующим увеличением на 25-50 мг до достижения эффективной дозы.

У **пациентов с почечной и печеночной недостаточностью** рекомендуется начинать терапии с 25 мг/сут. В дальнейшем рекомендуется увеличивать дозу ежедневно на 25-50 мг до достижения эффективной дозы.

Побочное действие:

Классификация частоты развития побочных эффектов (ВОЗ): очень часто (>1/10), часто (>1/100, <1/10), нечасто (>1/1000, <1/100), редко (>1/10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000, включая отдельные сообщения).

Со стороны кроветворной системы: часто - лейкопения; нечасто - эозинофилия; очень редко - нейтропения.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: очень часто — головокружение, сонливость, головная боль; часто - синкопальные состояния; нечасто - тревожность, возбуждение, бессонница, акатизия, тремор, судороги, депрессия, парестезии; редко - злокачественный нейролептический синдром (гипертермия, нарушение сознания, мышечная ригидность, вегето-сосудистые нарушения, увеличение концентрации КФК); очень редко - поздняя дискинезия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - тахикардия, ортостатическая артериальная гипотензия, удлинение интервала QT на ЭКГ.

Со стороны дыхательной системы: ринит, фарингит.

Со стороны пищеварительной системы: часто - сухость во рту, запор, диарея, диспепсия, повышение уровня сывороточных трансаминаз (АСТ или АЛТ); редко - желтуха, тошнота, рвота, боль в животе; очень редко - гепатит.

Аллергические реакции: нечасто - кожная сыпь, реакции повышенной чувствительности; очень редко - ангионевротический отек, синдром Стивенса-Джонсона.

Со стороны половой системы: редко - приапизм.

Со стороны эндокринной системы: часто - повышение массы тела (преимущественно в первые недели лечения); очень редко - гипергликемия или декомпенсация сахарного диабета.

Лабораторные показатели: нечасто - повышение сывороточного уровня ГГТ и содержания триглицеридов (не натощак), гиперхолестеринемия; снижение уровня гормонов щитовидной железы (общий Т4 и свободный Т4 /в первые 4 недели/, а также общего Т3 и реверсивного Т3 /только при приеме высоких доз кветиапина/).

Прочие: часто - периферические отеки, астения; редко - боль в пояснице, боль в грудной клетке, субфебрилитет, миалгия, сухость кожи, ослабление зрения.

Передозировка:

Данные о передозировке кветиапина ограничены. Описаны случаи приема кветиапина в дозе, превышающей 30 г. У большинства пациентов побочные эффекты не отмечались, в случаях же их развития побочные эффекты проходили самостоятельно. Зарегистрирован случай летального исхода при приеме 13.6 г кветиапина. Крайне редко сообщалось о случаях передозировки кветиапином, приводивших к удлинению интервала QT, коме или смерти. У пациентов с тяжелыми сердечно-сосудистыми заболеваниями в анамнезе риск развития побочных эффектов при передозировке может увеличиваться.

Симптомы: чрезмерная седация, сонливость, тахикардия, снижение артериального давления.

Лечение: проводят симптоматическую терапию, мероприятия, направленные на поддержание функции дыхания, сердечно-сосудистой системы, адекватную оксигенацию и вентиляцию легких. Специфических антидотов нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность и эффективность кветиапина у беременных не установлены. Поэтому при беременности кветиапин можно применять только, если ожидаемая польза оправдывает потенциальный риск.

Степень выведения кветиапина с молоком матери не установлена. Женщинам необходимо рекомендовать избегать грудного вскармливания во время приема кветиапина.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Кветиапин не вызывает индукцию ферментных систем печени, вовлеченных в метаболизм феназона и лития.

Одновременное назначение кветиапина с препаратами, потенциально ингибирующими печеночные ферменты, такие как карбамазепин или фенитоин, а также с барбитуратами, рифампицином, возможно снижение плазменных концентраций кветиапина, что может потребовать увеличения дозы Квентиакса, в зависимости от клинического эффекта. Это также необходимо учитывать при отмене фенитоина или карбамазепина, или другого индуктора ферментной системы печени или замене на препарат, неиндуцирующий микросомальные ферменты печени (например, вальпроевая кислота).

Основной фермент, отвечающий за метаболизм кветиапин, является изофермент CYP3A4. Фармакокинетика кветиапина не изменяется при одновременном применении циметидина (ингибитор P450), флуоксетина (ингибитор CYP3A4 и CYP2D6) или антидепрессанта имипрамина (ингибитор CYP2D6).

Рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном применении кветиапина и системном применении ингибиторов CYP3A4 (противогрибковые средства группы азолов и макролидные антибиотики), т.к. плазменные концентрации кветиапина могут повышаться. Поэтому следует применять более низкие дозы кветиапина. Особое внимание должно быть уделено пожилым и ослабленным пациентам.

Фармакокинетика кветиапина существенно не изменялась при одновременном введении с антипсихотическими средствами - рисперидоном или галоперидолом. Однако одновременный прием кветиапина с тиоридазином приводил к повышению клиренса кветиапина.

Лекарственные средства, угнетающие ЦНС, и этанол повышают риск развития побочных эффектов.

Особые указания и меры предосторожности:

При резкой отмене высоких доз антипсихотических препаратов могут наблюдаться следующие острые реакции (синдром отмены) - тошнота, рвота, редко бессонница. Сообщалось о случаях обострения психотических симптомов и появлении непроизвольных двигательных расстройств (акатизия, дистония, дискинезия). В связи с чем, отмену препарата рекомендуется проводить постепенно.

При назначении кветиапина одновременно с препаратами, удлиняющими интервал QT, необходимо соблюдать осторожность, особенно у пациентов пожилого возраста, при застойной сердечной недостаточности, гипокалиемии и гипомагниемии.

Учитывая, что кветиапин влияет на ЦНС, препарат должен быть использован с осторожностью в комбинации с другими препаратами, обладающими угнетающим действием на ЦНС. Рекомендуется воздерживаться от употребления алкоголя.

При появлении симптомов поздней дискинезии следует уменьшить дозу или прекратить использование кветиапина.

В контролируемых клинических исследованиях не было установлено различий по частоте возникновения судорог между кветиапином и плацебо. Однако, также как и при терапии другими антипсихотическими средствами, рекомендуется соблюдать осторожность при лечении пациентов с наличием судорожных приступов в анамнезе.

Злокачественный нейролептический синдром может быть связан с проводимым антипсихотическим лечением. Клинические проявления синдрома включают: гипертермию, измененный ментальный статус, мышечную ригидность, нестабильность вегетативной нервной системы, увеличение уровня КФК. При развитии этого синдрома кветиапин должен быть отменен и проведено соответствующее лечение.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения кветиапином рекомендуется соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и

быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

У **пациентов с почечной недостаточностью** рекомендуется начинать терапии с 25 мг/сут. В дальнейшем рекомендуется увеличивать дозу ежедневно на 25-50 мг до достижения эффективной дозы.

При нарушениях функции печени

У **пациентов с печеночной недостаточностью** рекомендуется начинать терапии с 25 мг/сут. В дальнейшем рекомендуется увеличивать дозу ежедневно на 25-50 мг до достижения эффективной дозы.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: дети и подростки до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте, при температуре не выше 30°С. Не использовать препарат после истечения срока годности.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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