

Кветиапин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Кветиапин](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 таб.
кветиапин	200 мг
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.	
Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 таб.
кветиапин	100 мг
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.	
Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 таб.
кветиапин	150 мг
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.	
Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 таб.
кветиапин	25 мг
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.	
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (6) - пачки картонные.	

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кветиапин является атипичным антипсихотическим препаратом, который проявляет более высокое сродство к серотониновым (гидрокситриптаминовым) рецепторам (5HT₂), чем к дофаминовым рецепторам D₁ и D₂ головного мозга. Кветиапин также обладает более выраженным сродством к гистаминовым и альфа₁-адренорецепторам и меньшим по отношению к альфа₂-адренорецепторам. Не обнаружено заметного сродства кветиапина к мускариновым и бензодиазепиновым рецепторам. В стандартных тестах кветиапин проявляет антипсихотическую активность.

Фармакокинетика

При пероральном применении кветиапин хорошо всасывается из ЖКТ и активно метаболизируется в печени. Основные метаболиты, находящиеся в плазме, не обладают выраженной фармакологической активностью.

Прием пищи существенно не влияет на биодоступность кветиапина. T_{1/2} составляет около 7 ч. Приблизительно 83% кветиапина связывается с белками плазмы.

Фармакокинетика кветиапина линейная, различий фармакокинетических показателей у мужчин и женщин не

наблюдается.

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

Средний плазменный клиренс кветиапина меньше приблизительно на 25% у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 30 мл/мин/1.73 м²) и у пациентов с поражением печени, но межиндивидуальные показатели клиренса находятся в пределах, соответствующих здоровым добровольцам. Приблизительно 73% кветиапина выводится с мочой и 21% с фекалиями. Менее 5% кветиапина не подвергается метаболизму и выводится в неизменном виде почками или с фекалиями. Установлено, что CYP3A4 является ключевым изоферментом метаболизма кветиапина, опосредованного цитохромом P450.

В исследовании фармакокинетики кветиапина в различной дозе применение кветиапина до приема кетоконазола или одновременно с кетоконазолом, приводило к увеличению, в среднем, C_{max} и площади под кривой «концентрация-время» (AUC) кветиапина на 235% и 522% соответственно, а также к уменьшению клиренса кветиапина, в среднем, на 84%. T_{1/2} кветиапина увеличивался, но T_{max} не изменялось.

Кветиапин и некоторые его метаболиты обладают слабой ингибирующей активностью по отношению к изоферментам цитохрома P450 1A2, 2C9, 2C19, 2D6 и 3A4, но только при концентрации в 10-50 раз превышающей концентрации, наблюдаемые при обычно используемой эффективной дозе 300-450 мг/сут.

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

Показания к применению:

- острые и хронические психозы, включая шизофрению;
- маниакальные эпизоды в структуре биполярного расстройства.

Относится к болезням:

- [Шизофрения](#)

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата;
- одновременный прием с ингибиторами CYP3A4, такими как ингибиторы ВИЧ-протеазы, азольные противогрибковые лекарственные средства, эритромицин, кларитромицин, нефазодон;
- детский возраст до 18 лет;
- период лактации.

С осторожностью применять у пациентов с сердечно-сосудистыми и цереброваскулярными заболеваниями или другими состояниями, предрасполагающими к артериальной гипотензии; в пожилом возрасте; при печеночной недостаточности; судорожных припадках в анамнезе; беременности.

Способ применения и дозы:

Взрослые:

Острые и хронические психозы, включая шизофрению

Суточная доза для первых 4-х дней терапии составляет: 1-й день - 50 мг, 2-й день - 100 мг, 3-й день - 200 мг, 4-й день - 300 мг. Начиная с 4-го дня, доза должна подбираться до клинически эффективной дозы, которая обычно находится в пределах от 300 до 450 мг/сут. В зависимости от клинического эффекта и индивидуальной переносимости доза может варьировать в пределах от 150 до 750 мг/сут.

Лечение маниакальных эпизодов в структуре биполярного расстройства

Кветиапин применяется в качестве монотерапии или в качестве адъювантной терапии для стабилизации настроения.

Суточная доза для первых 4-х дней терапии составляет: 1-й день - 100 мг, 2-й день - 200 мг, 3-й день - 300 мг, 4-й день - 400 мг. В дальнейшем к 6-му дню терапии суточная доза препарата может быть увеличена до 800 мг.

Увеличение суточной дозы не должно превышать 200 мг в день.

В зависимости от клинического эффекта и индивидуальной переносимости, доза может варьировать в пределах от 200 до 800 мг/сут. Обычно эффективная доза составляет от 400 до 800 мг/сут.

Для лечения *шизофрении* максимальная рекомендованная суточная доза кветиапина составляет 750 мг, для лечения маниакальных эпизодов в структуре биполярного расстройства максимальная рекомендованная суточная доза кветиапина составляет 800 мг/сут.

У пожилых пациентов начальная доза кветиапина составляет 25 мг/сут. Дозу следует увеличивать ежедневно на 25-50 мг до достижения эффективной дозы, которая, вероятно, будет меньше, чем у молодых пациентов.

У пациентов с почечной или печеночной недостаточностью рекомендуется начинать терапию кветиапином с 25 мг/сут. Рекомендуется увеличивать дозу ежедневно на 25-50 мг до достижения эффективной дозы.

Побочное действие:

Наиболее часто встречающиеся неблагоприятные реакции, связанные с приемом препарата: сонливость (17.5%), головокружение (10%), запор (9%), диспепсия (6%), ортостатическая гипотензия и тахикардия (7%), сухость во рту (7%), повышение активности «печеночных» ферментов в сыворотке крови (6%), повышение концентрации холестерина и триглицеридов в плазме крови.

Прием кветиапина может сопровождаться развитием умеренной астении, ринита и диспепсии, увеличением массы тела (преимущественно в первые недели лечения). Кветиапин может вызвать ортостатическую гипотензию (сопровождающуюся головокружением), тахикардию и у некоторых пациентов - обморок; эти побочные реакции в основном встречаются в начальный период подбора дозы (см. раздел «Особые указания»). Терапия кветиапином связана с небольшим дозозависимым снижением концентрации гормонов щитовидной железы, в частности, общего Т4 и свободного Т4. Максимальное снижение общего и свободного Т4 зарегистрировано на 2-ой и 4-ой неделе терапии кветиапином, без дальнейшего снижения концентрации гормонов при длительном лечении. В дальнейшем не было признаков клинически значимых изменений в концентрации тиреотропного гормона.

При длительном применении кветиапина существует потенциальная возможность развития поздней дискинезии. При возникновении симптомов поздней дискинезии необходимо уменьшить дозу или прекратить дальнейшее лечение кветиапином. При резкой отмене высоких доз антипсихотических препаратов могут наблюдаться следующие острые реакции (синдром «отмены»): тошнота, рвота, редко - бессонница.

Возможны случаи обострения психотических симптомов и появления непроизвольных двигательных расстройств (акатизия, дистония, дискинезия). В связи с чем отмену препарата рекомендуется проводить постепенно.

Ниже перечислены побочные реакции, наблюдавшиеся при применении кветиапина и распределенные по органам и системам:

Со стороны нервной системы: сонливость, головокружение, головная боль, тревожность, астения, враждебность, возбуждение, бессонница, акатизия, тремор, судороги, депрессия, парестезии, злокачественный нейролептический синдром (гипертермия, мышечная ригидность, изменения ментального статуса, лабильность вегетативной нервной системы, повышение активности креатинфосфокиназы), синдром «беспокойных ног».

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия, тахикардия, удлинение интервала Q-T.

Со стороны пищеварительной системы: сухость слизистой оболочки полости рта, тошнота, рвота, боль в животе, диарея или запор, повышение активности "печеночных" трансаминаз, желтуха, гепатит.

Со стороны дыхательной системы: фарингит, ринит.

Аллергические реакции: кожная сыпь, эозинофилия, ангионевротический отек, синдром Стивенса-Джонсона, анафилактические реакции.

Лабораторные показатели: лейкопения, нейтропения, гиперхолестеринемия, гипертриглицеридемия, снижение концентрации Т4 (первые 4 нед), гипергликемия.

Прочие: боль в пояснице, боль в грудной клетке, субфебрилитет, повышение массы тела (преимущественно в первые недели лечения), миалгия, сухость кожи, нарушение зрения, в т.ч. нечеткость зрительного восприятия, декомпенсация существующего сахарного диабета, приапизм, галакторея.

Передозировка:

Данные о передозировке кветиапина ограничены. Описаны случаи приема кветиапина в дозе, превышающей 20 г, без фатальных последствий и с полным восстановлением, однако имеются сообщения о крайне редких случаях передозировки кветиапином, приводивших к смерти или коме.

Симптомы могут быть следствием усиления известных фармакологических эффектов препарата, таких как сонливость и чрезмерная седация, тахикардия и снижение АД.

Лечение: нет специфических антидотов к кветиапину. В случаях передозировки возможно промывание желудка (после интубации, в случае, если пациент находится без сознания), прием активированного угля и слабительных средств для выведения неабсорбированного кветиапина, однако, эффективность этих мер не изучена. Показана симптоматическая терапия и мероприятия, направленные на поддержание функции дыхания, сердечно-сосудистой системы, обеспечение адекватной оксигенации и вентилиации. Медицинский контроль и наблюдение должно быть продолжено до полного выздоровления пациента.

Применение при беременности и кормлении грудью:

С осторожностью применять при беременности. Противопоказан в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении препаратов, обладающих мощным ингибирующим действием на изофермент CYP3A4 (таких как противогрибковые средства группы азолов и эритромицин, кларитромицин, нефазодон) концентрация кветиапина в плазме повышается, поэтому одновременный прием их с кветиапином противопоказан. При одновременном применении кветиапина с препаратами, индуцирующими ферментную систему печени, такими как карбамазепин, возможно снижение концентрации препарата в плазме, что может потребовать увеличения дозы кветиапина, в зависимости от клинического эффекта. В исследовании фармакокинетики кветиапина в различных дозах, при применении его до или одновременно с карбамазепином (индуктором печеночных ферментов) приводило к значительному увеличению клиренса кветиапина. Такое увеличение клиренса кветиапина уменьшало AUC в среднем на 13% по сравнению с применением кветиапина без карбамазепина. Одновременное применение кветиапина с другим индуктором микросомальных ферментов печени - фенитоином, также приводило к повышению клиренса кветиапина. При одновременном применении кветиапина и фенитоина (или других индукторов печеночных ферментов, таких как барбитураты, рифампицин) может потребоваться увеличение дозы кветиапина. Также может потребоваться снижение дозы кветиапина при отмене фенитоина или карбамазепина или другого индуктора ферментной системы печени или замене на препарат, не индуцирующий микросомальные ферменты печени (например, вальпроевую кислоту).

Фармакокинетика препаратов лития не изменяется при одновременном применении кветиапина.

Кветиапин не вызывал индукции печеночных ферментных систем, участвующих в метаболизме антипирина. Фармакокинетика кветиапина существенно не изменяется при одновременном применении с антипсихотическими препаратами - рисперидоном или галоперидолом. Однако одновременный прием кветиапина и тиоридазина приводил к повышению клиренса кветиапина. CYP3A4 является ключевым ферментом, принимающим участие в цитохром P450-опосредованном метаболизме кветиапина. Фармакокинетика кветиапина существенно не изменяется при одновременном применении циметидина, являющегося ингибитором P450.

Фармакокинетика кветиапина существенно не изменялась при одновременном применении имипрамина (CYP2D6 ингибитор) или флуоксетина (CYP3A4 и CYP2D6 ингибитор). Лекарственные средства, угнетающие ЦНС, и этанол повышают риск развития побочных эффектов кветиапина.

Особые указания и меры предосторожности:

Кветиапин может вызвать ортостатическую гипотензию, особенно в начальный период подбора дозы (у пожилых пациентов наблюдается чаще, чем у молодых). Не выявлено взаимосвязи между приемом кветиапина и увеличением QT_c-интервала. Однако, при применении кветиапина одновременно с препаратами, удлиняющими интервал QT_c, необходимо соблюдать осторожность, особенно у лиц пожилого возраста. В период лечения при снижении числа нейтрофилов менее 1000/мкл прием кветиапина необходимо прекратить.

При развитии ортостатической гипотензии на фоне лечения препаратом, необходимо снизить дозу или более медленно проводить титрование доз. Препарат не показан для лечения психозов, связанных с деменцией. В случае развития симптомов поздней дискинезии дозу препарата необходимо снизить или постепенно отменить препарат. Симптомы поздней дискинезии могут усиливаться или даже появляться после прекращения приема препарата.

В случае развития злокачественного нейролептического синдрома препарат необходимо отменить.

Принимая во внимание, что кветиапин, главным образом, влияет на ЦНС, препарат должен быть использован с осторожностью в комбинации с другими препаратами, угнетающими ЦНС, или алкоголем. У детей, подростков и молодых людей (младше 24 лет) с депрессией и др. психическими нарушениями, антидепрессанты, по сравнению с плацебо, повышают риск возникновения суицидальных мыслей и суицидального поведения. Поэтому при назначении Кветиапина или любых др. антидепрессантов у детей, подростков и молодых людей (младше 24 лет) следует соотносить риск суицида и пользу от их применения. В краткосрочных исследованиях у людей старше 24 лет риск

Кветиапин

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

суицида не повышался, а у людей старше 65 лет несколько снижался. Любое депрессивное расстройство само по себе увеличивает риск суицида. Поэтому во время лечения антидепрессантами за всеми пациентами должно быть установлено наблюдение с целью раннего выявления нарушений или изменений поведения, а также суицидальных наклонностей.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Кветиапин может вызывать сонливость, поэтому в период лечения пациентам рекомендуется воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью рекомендуется начинать терапию кветиапином с 25 мг/сут. Рекомендуется увеличивать дозу ежедневно на 25-50 мг до достижения эффективной дозы.

При нарушениях функции печени

У пациентов с печеночной недостаточностью рекомендуется начинать терапию кветиапином с 25 мг/сут. Рекомендуется увеличивать дозу ежедневно на 25-50 мг до достижения эффективной дозы.

Применение в пожилом возрасте

У пожилых пациентов начальная доза кветиапина составляет 25 мг/сут. Дозу следует увеличивать ежедневно на 25-50 мг до достижения эффективной дозы, которая, вероятно, будет меньше, чем у молодых пациентов.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Срок годности:

2 года.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Kvetiapin>