Линдакса



Код АТХ:

- A08AA10

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Сибутрамин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы твердые желатиновые, с желтым корпусом и коричневой крышечкой, с маркировкой "10"; содержимое капсул - белый или почти белый порошок.

	1 капс.
сибутрамина гидрохлорида моногидрат	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Состав корпуса капсулы: краситель хинолиновый желтый, краситель Солнечный закат желтый, титана диоксид, желатин, чернила черные 1012 (шеллак, железа оксид черный, н-бутанол, этанол денатурированный (промышленный метилированный спирт), лецитин соевый, пеногаситель DC 1510).

Состав крышечки капсулы: краситель железа оксид черный, краситель железа оксид красный, титана диоксид, желатин.

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

Капсулы твердые желатиновые, с желтым корпусом и синей крышечкой, с маркировкой "15"; содержимое капсул - белый или почти белый порошок.

	1 капс.
сибутрамина гидрохлорида моногидрат	15 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Состав корпуса капсулы: краситель хинолиновый желтый, краситель Солнечный закат желтый, титана диоксид, желатин, чернила черные 1012 (шеллак, железа оксид черный, н-бутанол, этанол денатурированный (промышленный метилированный спирт), лецитин соевый, пеногаситель DC 1510).

Состав крышечки капсулы: титана диоксид, краситель индигокармин, желатин.

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Анорексигенный препарат, усиливающий чувство насыщения. In vivo проявляет свое действие за счет метаболитов (первичные и вторичные амины), подавляющих обратный захват моноаминов (серотонина и норадреналина). Увеличение содержания в синапсах нейротрансмиттеров повышает активность центральных серотонитовых 5НТ-рецепторов и адренорецепторов, что способствует снижению аппетита и увеличению термопродукции. Опосредованно возбуждая β_3-адренорецепторы, воздействует на бурую жировую ткань.

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

Фармакокинетика

Всасывание

Сибутрамин хорошо всасывается и интенсивно метаболизируется при "первом прохождении" через печень. После приема препарата внутрь в дозе 20 мг T_{max} сибутрамина достигается через 1.2 ч, T_{max} активных метаболитов М1 и М2 достигается через 3 ч.

Распределение

Связывание сибутрамина с белками - 97%, М1 и М2 - 94%.Быстро и хорошо распределяется в тканях.

Метаболизм

Практически полностью метаболизируется в печени при участии изоферментов CYP3A4 с образованием моно-(дезметилсибутрамин) и ди-дезметил (ди-дезметилсибутрамин) форм активных метаболитов (М1 и М2), а также путем гидроксилирования и конъюгирования с образованием неактивных метаболитов.

Выведение

$T_{1/2}$ сибутрамина составляет 1.1 ч, $T_{1/2}$ активных метаболитов М1 и М2 составляет соответственно 14 ч и 16 ч.

Выводится в основном почками в виде неактивных метаболитов.

Фармакокинетика в особых случаях

При почечной недостаточности основные фармакокинетические параметры сибутрамина и его активных метаболитов существенно не изменяются.

Фаромакокинетика сибутрамина не зависит от массы тела, пола и возраста.

Показания к применению:

— алиментарное ожирение с индексом массы тела от 30 кг/м^2 и более;

— алиментарное ожирение с индексом массы тела от 27 кг/м^2 и более у пациентов, имеющих обусловленные избыточной массой тела факторы риска (сахарный диабет типа 2, дислипопротеинемия).

Относится к болезням:

- Ожирение
- Сахарный диабет

Противопоказания:

— органическая причина ожирения;

— серьезные нарушения питания (анорексия или булимия);

— психические заболевания;

— синдром Жиль де ля Туретта (хронический генерализованный тик);

— одновременный прием ингибиторов МАО (например, фентермина, фенфлурамина, дексфенфлурамина, этиламфетамина, эфедрина) или их использование в течение 2 недель до назначения Линдаксы; ингибиторов обратного захвата серотонина, снотворных препаратов, препаратов, содержащих триптофан, других препаратов центрального действия для снижения массы тела;

— заболевания сердечно-сосудистой системы, в т.ч. ИБС, хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, 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 лекарственная, наркотическая или алкогольная зависимость;

— беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— возраст старше 65 лет;

— повышенная чувствительность к сибутрамину или другим компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при аритмиях в анамнезе, хронической сердечной недостаточности, холелитиазе, артериальной гипертензии (контролируемой и в анамнезе), неврологических нарушениях (включая задержку умственного развития и судороги /в т.ч. в анамнезе/), нарушениях функции печени и/или почек легкой и средней степени тяжести, моторных и вербальных тиках в анамнезе.

Способ применения и дозы:

Дозу устанавливают индивидуально, в зависимости от переносимости и клинической эффективности.

Препарат принимают 1 раз/сут, утром, независимо от приема пищи (во время приема пищи или натощак).

Начальная доза составляет 10 мг. При недостаточной эффективности (снижение массы тела менее чем на 2 кг за 4 недели), но при условии хорошей переносимости, суточная доза может быть увеличена до 15 мг. Если после увеличения дозы эффективность препарата остается низкой (снижение массы тела менее 2 кг за 4 недели), продолжение лечения нецелесообразно.

Лечение следует прекратить через 3 мес у тех пациентов, у которых в течение этого времени не удалось достичь снижения массы тела на 5% от исходного уровня.

Лечение не следует продолжать, если на фоне терапии препаратом после достигнутого снижения массы тела пациент прибавляет в массе тела на 3 кг и более.

Длительность лечения сибутрамином не должна превышать 2 года, поскольку в отношении более продолжительного периода приема препарата данные об эффективности и безопасности применения отсутствуют.

Капсулу следует проглатывать целиком, запивая небольшим количеством жидкости (стакан воды).

Побочное действие:

Чаще всего побочные эффекты отмечаются в начале лечения (в первые 4 недели). Их выраженность и частота со временем ослабевают. Побочные эффекты носят, как правило, легкий и обратимый характер.

Побочные эффекты встречаются: часто (>10%), иногда (1-10%), редко (<1%).

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: часто - бессонница; иногда - головная боль, головокружение, беспокойство, парестезии, изменение вкуса.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: иногда - тахикардия (увеличение пульса на 3-7 уд./мин), ощущение сердцебиения, повышение АД (в покое на 1-3 мм рт.ст.), вазодилатация (гиперемия кожи, приливы); в отдельных случаях не исключаются более выраженные повышения АД и ЧСС.

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

Прочие: иногда - повышение потоотделения, обострение геморроя.

В *единичных случаях* описаны следующие клинически значимые побочные 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 Шенлейна-Геноха, судороги, тромбоцитопения, транзиторное повышение активности печеночных ферментов в плазме крови.

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

Передозировка:

Имеются крайне ограниченные данные по поводу передозировки сибутрамина. Специфические признаки передозировки неизвестны, тем не менее, следует учитывать возможность более выраженного проявления побочных действий.

Лечение: специфического антидота не существует; следует обеспечить свободное дыхание, наблюдать за состоянием сердечно-сосудистой системы, при необходимости проводить симптоматическую терапию. Показано назначение активированного угля, промывание желудка, при повышении АД и тахикардии - бета-адреноблокаторов. Эффективность форсированного диуреза или гемодиализа не установлена.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременный прием сибутрамина с ингибиторами изофермента CYP3A4 (кетоконазол, эритромицин, тролеандомицин, циклоспорин) приводит к повышению концентрации метаболитов сибутрамина с повышением ЧСС и клинически незначимым удлинением интервала QT.

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

При одновременном применении сибутрамина с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (антидепрессантами), с препаратами для лечения мигрени (суматриптан, дигидроэрготамин), с сильнодействующими анальгетиками (пентазоцин, петидин, фентанил), с противокашлевыми препаратами (декстрометорфан) в редких случаях может развиться серотониновый синдром.

Лекарственное взаимодействие сибутрамина с препаратами, повышающими АД и ЧСС, с противокашлевыми, противоаллергическими препаратами в настоящее время недостаточно изучено.

Сибутрамин не влияет на действие пероральных контрацептивов.

При одновременном приеме сибутрамина и этанола не было отмечено усиления действия последнего.

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат Линдакса следует применять только в тех случаях, когда немедикаментозные мероприятия по снижению массы тела (диета и физические нагрузки) малоэффективны (снижение массы тела в течение 3 мес составило менее

5 кг).

Лечение сибутрамином 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 привычек питания и образа жизни, так и увеличение физической активности. Пациентам необходимо 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 необходимости повторного лечения.

В период приема препарата Линдакса необходимо контролировать уровень АД и ЧСС в первые 2 месяца каждые 2 недели, а затем - ежемесячно. У пациентов с артериальной гипертензией контроль необходимо осуществлять особо тщательно и через более короткие интервалы. Если при контрольном измерении АД дважды превышало уровень 145/90 мм рт. ст., прием Линдаксы следует приостановить.

С осторожностью следует назначать сибутрамин одновременно с препаратами, удлиняющими интервал QT, в т.ч. блокаторами гистаминовых H_1-рецепторов (астемизол, терфенадин), антиаритмическими препаратами (амиодарон, хинидин, флекаинид, мексилетин, пропафенон, соталол), цизапридом, пимозидом, сертиндолом и трициклическими антидепрессантами. Это касается и состояний, которые способны приводить к удлинению интервала QT (например, гипомагниемия).

Интервал между приемом ингибиторов МАО (в т.ч. фуразолидона, прокарбазина, селегилина) и сибутрамина должен составлять не менее 2 недель.

Хотя и не установлена связь между приемом сибутрамина и развитием первичной легочной гипертензии, однако при применении препарата необходимо обращать внимание на появление прогрессирующего нарушения дыхания, болей в грудной клетке и отеков на ногах. При пропуске дозы сибутрамина не следует принимать в следующий прием двойную дозу препарата, рекомендуется продолжать дальнейший прием препарата по схеме.

Реакции на отмену препарата (головная боль, повышенный аппетит) наблюдаются редко. Нет данных о том, что после отмены препарата наблюдается абстинентный синдром, синдром отмены или нарушения настроения.

В период приема препарата не следует принимать алкогольные напитки, т.к. прием алкоголя абсолютно не сочетается с рекомендуемыми при приеме препарата Линдакса диетическими мероприятиями.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Препараты, влияющие на ЦНС, могут ограничивать умственную активность, память и скорость реакций.

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Препарат противопоказан при тяжелых нарушения функции почек.

С осторожностью следует назначать препарат при нарушениях функции почек легкой и средней степени тяжести.

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при тяжелых нарушения функции печени.

С осторожностью следует назначать препарат при нарушениях функции печени легкой и средней степени тяжести.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.