

## Мелатонин-СЗ



### Код АТХ:

- [N05CH01](#)

### Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Мелатонин](#)

### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)

[Госреестр](#)<sup>МНН</sup> [Википедия](#)<sup>МНН</sup>

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 3 мг. По 10 или 30 табл. в контурной ячейковой упаковке. По 30 табл. в банках полимерных из ПЭНД с крышкой из ПЭВД или во флаконах полимерных из ПЭНД с крышкой из ПЭВД. Каждую банку, флакон, 1, 2, 3 контурные ячейковые упаковки по 10 табл. или 1, 2 контурные ячейковые упаковки по 30 табл. помещают в картонную пачку.

### Состав:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 табл.
<i>активное вещество:</i>	
мелатонин	3 мг
<i>вспомогательные вещества:</i> МКЦ — 48,5 мг; карбоксиметилкрахмал натрия — 6,5 мг; кальция гидрофосфата дигидрат — 41 мг; магния стеарат — 1 мг	
<i>оболочка пленочная:</i> гипромеллоза — 1,53 мг;	

## Мелатонин-СЗ

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

полисорбат80 (твин80) — 0,64 мг; тальк — 0,51 мг; титана диоксид (E171) — 0,32 мг
--

### Описание:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые с риской с одной стороны. На поперечном разрезе — ядро белого или почти белого цвета.

### Фармакотерапевтическая группа:

- [Нейротропные средства](#)
- [Нейротропные средства](#)

### Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — нормализующее биологические ритмы, нормализующее физиологический сон, адаптогенное.

#### Фармакодинамика

Синтетический аналог гормона шишковидного тела (эпифиза); оказывает адаптогенное, седативное, снотворное действие.

Нормализует циркадные ритмы. Увеличивает концентрацию ГАМК и серотонина в среднем мозге и гипоталамусе, изменяет активность пиридоксалькиназы, участвующей в синтезе ГАМК, дофамина и серотонина. Регулирует цикл сон-бодрствование, суточные изменения локомоторной активности и температуры тела, положительно влияет на интеллектуально-мнестические функции мозга, эмоционально-личностную сферу.

Способствует организации биологического ритма и нормализации ночного сна. Улучшает качество сна, ускоряет засыпание, регулирует нейроэндокринные функции. Адаптирует организм метеочувствительных людей к изменениям погодных условий.

#### Фармакокинетика

##### Всасывание

Мелатонин после приема внутрь быстро всасывается из ЖКТ. У пожилых людей скорость всасывания может быть снижена на 50%. Кинетика мелатонина в диапазоне 2-8 мг линейна. При приеме внутрь в дозе 3 мг  $C_{max}$  в плазме крови и слюне достигается соответственно через 20 мин и 60 мин. Время достижения максимальной концентрации  $T_{max}$  в сыворотке крови 60 мин (нормальный диапазон 20-90 мин). После приема 3-6 мг мелатонина  $C_{max}$  в сыворотке крови, как правило, в 10 раз больше эндогенного мелатонина в сыворотке крови ночью. Сопутствующий прием пищи задерживает абсорбцию мелатонина.

**Биодоступность.** Биодоступность мелатонина при пероральном приеме колеблется в диапазоне от 9 до 33% (приблизительно составляет 15%).

##### Распределение

В исследованиях *in vitro* связывание мелатонина с белками плазмы составляет 60%. В основном мелатонин связывается с альбумином,  $\alpha_1$ -кислым гликопротеином и ЛПНП.  $V_d$  около 35 л. Быстро распределяется в слюну, проникает через ГЭБ, определяется в плаценте. Концентрация в спинномозговой жидкости в 2.5 раза ниже, чем в плазме.

##### Метаболизм

Мелатонин метаболизируется преимущественно в печени. После приема внутрь мелатонин подвергается существенному преобразованию при "первом прохождении" через печень, где происходит его гидроксилирование и конъюгация с сульфатом и глюкуроном с образованием 6-сульфатоксимелатонина; уровень пресистемного метаболизма может достигать 85%. Экспериментальные исследования позволяют предположить, что в процессе метаболизма мелатонина принимают участие изоферменты CYP1A1, CYP1A2 и, возможно, CYP2C19 системы цитохрома P450. Основной метаболит мелатонина - 6-сульфатоксимелатонин, неактивен.

##### Выведение

Мелатонин выводится из организма почками. Средний  $T_{1/2}$  мелатонина составляет 45 мин. Выведение осуществляется с мочой, около 90% в виде сульфатного и глюкуронового конъюгатов 6-гидроксимелатонина, а около 2-10% выводится в неизменном виде.

## Мелатонин-С3

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

---

### Фармакокинетика у особых групп пациентов

На фармакокинетические показатели влияют возраст, прием кофеина, курение, прием пероральных контрацептивов.

У критически больных наблюдается ускоренная абсорбция и нарушенная элиминация.

*Пациенты пожилого возраста.* Метаболизм мелатонина, как известно, замедляется с возрастом. При разных дозах мелатонина более высокие значения показателей AUC и  $C_{max}$  получены у пожилых, что отражает сниженный метаболизм мелатонина у этой группы пациентов.

*Пациенты с нарушением функции почек.* При длительном лечении кумуляции мелатонина не отмечено. Эти данные согласуются с коротким  $T_{1/2}$  мелатонина у человека.

*Пациенты с нарушением функции печени.* Печень является основным органом, участвующим в метаболизме мелатонина, поэтому заболевания печени приводят к повышению концентрации эндогенного мелатонина. У пациентов с циррозом печени плазменная концентрация мелатонина в дневное время суток существенно увеличивалась.

## Показания к применению:

— при расстройствах сна, в т.ч. обусловленных нарушением ритма "сон-бодрствование", таких как десинхронизация (резкая смена часовых поясов).

## Противопоказания:

- повышенная чувствительность к компонентам препарата;
- аутоиммунные заболевания;
- печеночная недостаточность;
- тяжелая почечная недостаточность;
- беременность;
- период грудного вскармливания;
- детский возраст до 18 лет.

С осторожностью применять Мелатонин-С3 у пациентов с различной степенью почечной недостаточности.

## Способ применения и дозы:

Внутрь.

При *нарушении сна* - по 3 мг 1 раз/сут за 30-40 минут до сна.

При *десинхронизации* в качестве адаптогена при смене часовых поясов - за 1 день до перелета и в последующие 2-5 дней - по 3 мг за 30-40 мин до сна.

Максимальная суточная доза - 6 мг.

**Пациенты пожилого возраста:** с возрастом происходит снижение метаболизма мелатонина, что необходимо учитывать при выборе режима дозирования для пожилых пациентов. С учетом этого у пациентов пожилого возраста, возможен прием препарата за 60-90 мин до сна.

**Почечная недостаточность:** влияние различной степени почечной недостаточности на фармакокинетику мелатонина не изучено, поэтому мелатонин следует применять с осторожностью у таких пациентов. Пациентам с тяжелой почечной недостаточностью применение препарата противопоказано.

## Побочное действие:

Классификация частоты развития побочных эффектов согласно рекомендациям ВОЗ: очень часто ( $\geq 1/10$ ), часто (от

## Мелатонин-СЗ

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

---

$\geq 1/100$  до  $< 1/10$ ), нечасто (от  $\geq 1/1000$  до  $< 1/100$ ), редко (от  $\geq 1/10\ 000$  до  $< 1/1000$ ), очень редко ( $< 1/10\ 000$ ), включая отдельные сообщения; частота неизвестна (по имеющимся данным установить частоту возникновения не представляется возможным).

*Инфекционные и паразитарные заболевания:* редко - опоясывающий герпес.

*Со стороны системы кроветворения и лимфатической системы:* редко - лейкопения, тромбоцитопения.

*Со стороны иммунной системы:* частота неизвестна - реакции гиперчувствительности.

*Со стороны обмена веществ и питания:* редко - гипертриглицеридемия, гипокалиемия, гипонатриемия.

*Нарушения психики:* нечасто - раздражительность, нервозность, беспокойство, бессонница, необычные сновидения, ночные кошмары, тревога; редко - перемены настроения, агрессия, ажитация, плаксивость, симптомы стресса, дезориентация, раннее утреннее пробуждение, повышение либидо, сниженное настроение, депрессия.

*Со стороны нервной системы:* нечасто - мигрень, головная боль, вялость, психомоторная гиперактивность, головокружение, сонливость; редко - обморок, нарушение памяти, нарушение концентрации внимания, делирий, синдром "беспокойных ног", плохое качество сна, парестезии.

*Со стороны органа зрения:* редко - снижение остроты зрения, нечеткость зрения, повышенное слезотечение.

*Со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения:* редко - вертиго, позиционное вертиго.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* нечасто - артериальная гипертензия; редко - стенокардия напряжения, ощущение сердцебиения, приливы.

*Со стороны ЖКТ:* нечасто - абдоминальная боль, абдоминальная боль в верхней части живота, диспепсия, язвенный стоматит, сухость во рту, тошнота; редко - гастроэзофагеальная болезнь, желудочно-кишечное нарушение или расстройство, буллезный стоматит, язвенный глоссит, рвота, усиление перистальтики, вздутие живота, гиперсекреция слюны, неприятный запах изо рта, абдоминальный дискомфорт, дискинезия желудка, гастрит.

*Со стороны печени и желчевыводящих путей:* нечасто - гипербилирубинемия.

*Со стороны кожи и подкожных тканей:* нечасто - дерматит, потливость по ночам, зуд и генерализованный зуд, сыпь, сухость кожи; редко - экзема, эритема, дерматит рук, псориаз, генерализованная сыпь, зудящая сыпь, поражение ногтей; частота неизвестна - отек Квинке, отек слизистой оболочки полости рта, отек языка.

*Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани:* нечасто - боль в конечностях; редко - артрит, мышечный спазм, боль в шее, ночные судороги.

*Со стороны мочевыделительной системы:* нечасто - глюкозурия, протеинурия; редко - полиурия, гематурия, никтурия.

*Со стороны половых органов и молочной железы:* нечасто - менопаузные симптомы; редко - приапизм, простатит; частота неизвестна: галакторея.

*Общие реакции:* нечасто - астения, боль в груди; редко: утомляемость, боль, жажда.

*Лабораторные и инструментальные данные:* нечасто - отклонение от нормы лабораторных показателей функции печени, увеличение массы тела; редко - повышение активности печеночных трансаминаз, отклонение от нормы содержания электролитов в крови, отклонение от нормы результатов лабораторных тестов.

## Передозировка:

*Симптомы:* по имеющимся литературным данным, применение мелатонина в суточной дозе до 300 мг не вызывало клинически значимых нежелательных реакций. Наблюдались гиперемия, спазмы в брюшной полости, диарея, головная боль и скотома при применении мелатонина в дозах 3000-6600 мг в течение нескольких недель. При применении очень высоких доз мелатонина (до 1 г) наблюдалась непроизвольная потеря сознания.

При передозировке возможно развитие сонливости.

*Лечение:* промывание желудка и применение активированного угля, симптоматическая терапия.

Выведение активного вещества предполагается в пределах 12 ч после приема внутрь.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

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

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами:**

### *Фармакокинетическое взаимодействие*

Известно, что в концентрациях, значительно превышающих терапевтические, мелатонин индуцирует изофермент CYP3A *in vitro*. Клиническое значение этого явления до конца не выяснено. В случае развития признаков индукции следует рассмотреть вопрос о снижении дозы одновременно применяемых лекарственных средств.

В концентрациях, значительно превышающих терапевтические, мелатонин не индуцирует изоферменты группы CYP1A *in vitro*. Следовательно, взаимодействие мелатонина с другими лекарственными средствами вследствие влияния мелатонина на изоферменты группы CYP1A, по-видимому, незначимо.

Метаболизм мелатонина, главным образом, опосредован изоферментами CYP1A. Следовательно, возможно взаимодействие мелатонина с другими лекарственными средствами вследствие влияния мелатонина на изоферменты группы CYP1A.

Следует соблюдать осторожность в отношении пациентов, принимающих флувоксамин, который повышает концентрацию мелатонина (увеличение AUC в 17 раз и  $C_{max}$  в 12 раз) за счет ингибирования его метаболизма изоферментами цитохрома P450: CYP1A2 и CYP2C19. Следует избегать такой комбинации.

Следует соблюдать осторожность в отношении пациентов, принимающих 5- и 8-метоксипсорален, который повышает концентрацию мелатонина вследствие ингибирования его метаболизма.

Следует соблюдать осторожность в отношении пациентов, принимающих циметидин (ингибитор изоферментов CYP2D), поскольку он повышает содержание мелатонина в плазме за счет ингибирования последнего.

Курение способно снизить концентрацию мелатонина за счет индукции изофермента CYP1A2.

Следует соблюдать осторожность в отношении пациентов, принимающих эстрогены (например, контрацептивы или заместительную гормональную терапию), которые увеличивают концентрацию мелатонина путем ингибирования их метаболизма изоферментами CYP1A1 и CYP1A2.

Ингибиторы изоферментов CYP2A2, например, хинолоны, способны повышать экспозицию мелатонина.

Индукторы изофермента CYP1A2, такие как карбамазепин и рифампицин, способны снижать плазменную концентрацию мелатонина.

В современной литературе имеется множество данных, касающихся влияния агонистов/антагонистов адренергических и опиоидных рецепторов, антидепрессантов, ингибиторов простагландин, бензодиазепинов, триптофана и алкоголя на секрецию эндогенного мелатонина. Исследования взаимного влияния этих препаратов на динамику или кинетику мелатонина не проводилось.

### *Фармакодинамическое взаимодействие*

Во время приема мелатонина не следует употреблять алкоголь, т.к. он снижает эффективность препарата.

Мелатонин потенцирует седативное действие бензодиазепиновых и небензодиазепиновых снотворных средств, таких как залеплон, золпидем и зопиклон. В ходе клинического исследования наблюдались четкие признаки транзиторного фармакодинамического взаимодействия между мелатонином и золпидемом спустя час после их приема. Комбинированное применение может приводить к прогрессирующему расстройству внимания, памяти и координации в сравнении с монотерапией золпидемом.

В ходе исследований мелатонин назначался совместно с тиоридазином и имипрамином, препаратами, которые влияют на ЦНС. Ни в одном из случаев не было выявлено клинически значимого фармакокинетического взаимодействия. Тем не менее, одновременное применение с мелатонином приводило к повышению ощущения спокойствия и к затруднениям в выполнении определенных заданий в сравнении с монотерапией имипрамином, а также к усилению чувства "помутнения в голове", в сравнении с монотерапией тиоридазином.

## **Особые указания и меры предосторожности:**

В период применения препарата Мелатонин-СЗ рекомендуется избегать пребывания на ярком свете.

Необходимо проинформировать женщин, желающих забеременеть, о наличии у препарата слабого контрацептивного действия.

Отсутствуют клинические данные о применении мелатонина у больных с аутоиммунными заболеваниями, в связи с чем, применение у данной категории пациентов противопоказано.

## **Мелатонин-СЗ**

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

---

### *Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами*

Препарат Мелатонин-СЗ вызывает сонливость, в связи с этим в период лечения следует воздержаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

### **Условия хранения:**

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

### **Срок годности:**

3 года.

### **Условия отпуска в аптеке:**

Без рецепта.

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Melatonin-SZ>