Меридиа



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 синей крышечкой, с надпечаткой "10"; содержимое капсул - белый или почти белый, легко сыпучий порошок.

	1 капс.
сибутрамина гидрохлорида моногидрат	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, индигодин (Е132), титана диоксид (Е171), натрия лаурилсульфат, чернила (серые), хинолиновый желтый.

7 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (6) - пачки картонные.

Капсулы твердые желатиновые, с белым корпусом и синей крышечкой, с надпечаткой "15"; содержимое капсул - белый или почти белый, легко сыпучий порошок.

	1 капс.
сибутрамина гидрохлорида моногидрат	15 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, индиготин (Е132), титана диоксид (Е171), желатин, натрия лаурилсульфат, чернила (серые), хинолиновый желтый.

14 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Препарат для лечения ожирения. Терапевтический эффект сибутрамина обусловлен его метаболитами, которые относятся к первичным и вторичным аминам (метаболит M1 и метаболит M2) и являются ингибиторами обратного захвата норадреналина, серотонина (5-гидрокситриптамин; 5-HT) и допамина. В тканях головного мозга человека метаболиты M1 и M2 подавляют обратный захват норадреналина и серотонина в 3 раза активней, чем допамина: 73%, 54%, 16%, соответственно.

Сибутрамин и его метаболиты не влияют на высвобождение моноаминов, не ингибируют МАО. Они обладают низким сродством к большому количеству рецепторов нейромедиаторов, в т.ч. серотонинергическим (5-HT_1, 5-HT_{1A}, 5-HT_{1B}, 5-HT_{2A}, 5-HT_{2C}), адренергические (β_1, β_2, β_3, α_1, α_2), допаминовые (D_1, D_2), мускариновые, гистаминовые (H_1), бензодиазепиновые и глютаматные NMDA-рецепторы.

В клинических исследованиях у человека было показано, что сибутрамин снижает массу тела за счет усиления чувства насыщения. Имеются данные о связи теплообразующего действия препарата с угнетением адаптивного замедления метаболизма при снижении массы тела. Вызванное сибутрамином снижение массы тела сопровождается благоприятными изменениями липидного профиля и уровня глюкозы в плазме крови у пациентов с дислипидемией и сахарным диабетом 2 типа.

Фармакокинетика

Всасывание

Сибутрамин хорошо всасывается из пищеварительного тракта и подвергается значительному эффекту "первого прохождения" через печень. C_{max} препарата в плазме наблюдалась через 1.2 ч после однократного перорального приема 20 мг сибутрамина.

Распределение и метаболизм

Сибутрамин метаболизируется изоферментом CYP3A4 до деметилированных метаболитов M1 и M2. Фармакологически активные метаболиты M1 и M2 достигают C_{max} через 3 ч. Показано, что линейная кинетика имеет место в диапазоне дозы от 10 до 30 мг, причем не наблюдается дозозависимого изменения $T_{1/2}$, но имеется прямо пропорциональное дозе увеличение концентрации препарата в плазме крови. При повторном приеме доз C_{ss} метаболитов M1 и M2 достигалась в течение 4 дней, причем наблюдалось почти двукратное накапливание. Фармакокинетика сибутрамина и его метаболитов у тучных пациентов аналогична таковой у пациентов с нормальной массой тела.

Связывание сибутрамина и его метаболитов M1 и M2 с белками плазмы происходит на уровне приблизительно 97%, 94% и 94%, соответственно.

Первичным этапом выведения сибутрамина и его активных метаболитов M1 и M2 является метаболизм в печени. Другие (неактивные) метаболиты выводятся в основном почками, а также через кишечник в соотношении 10:1.

$T_{1/2}$ сибутрамина составляет 1.1 ч, $T_{1/2}$ метаболитов M1 и M2 - 14 ч и 16 ч соответственно.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Доступные в настоящее время относительно ограниченные данные не указывают на существование клинически значимых различий в фармакокинетике у мужчин и женщин.

Фармакокинетика, наблюдаемая у пожилых здоровых пациентов (средний возраст 70 лет), аналогична таковой у молодых.

Почечная недостаточность не оказывает действия на AUC активных метаболитов M1 и M2, кроме метаболита M2 у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на диализе. У них клиренс эндогенного креатинина был приблизительно в 2 раза меньше, чем у здоровых лиц (CL>80 мл/мин).

У пациентов с умеренной печеночной недостаточностью AUC активных метаболитов M1 и M2 была на 24% выше после однократного приема сибутрамина.

Показания к применению:

— алиментарное ожирение с индексом массы тела (ИМТ) 30 кг/$м^2$ и более;

— алиментарное ожирение с ИМТ 27 кг/$м^2$ и более в сочетании с сахарным диабетом 2 типа (инсулиннезависимым) или дислипопротеинемией.

Относится к болезням:

- Инсульт
- Ожирение
- Сахарный диабет

Противопоказания:

— наличие органических причин ожирения (например, гипотиреоз);

— серьезные нарушения пищевого поведения - нервная анорексия или нервная булимия;

— психические заболевания;

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

— одновременный прием ингибиторов МАО или их использование в течение 2 недель до назначения Меридиа и 2 недель после; применение других препаратов, действующих на ЦНС, ингибирующих обратный захват серотонина (например, антидепрессантов, нейролептиков); снотворных препаратов, содержащих триптофан, а также других препаратов центрального действия для снижения массы тела или для лечения психических расстройств;

— сердечно-сосудистые заболевания (в анамнезе и текущие): ИБС (стенокардия, инфаркт миокарда); декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность; 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 (грудного вскармливания);

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— возраст старше 65 лет;

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— установленная повышенная чувствительность к сибутрамину или к другим компонентам препарата.

С *осторожностью*

— артериальная гипертензия в анамнезе;

— хроническая недостаточность кровообращения;

— заболевания коронарных артерий (в т.ч. в анамнезе);

— судороги (в т.ч. в анамнезе);

— эпилепсия;

— нарушения функции печени и/или почек легкой и средней степени тяжести, холелитиаз;

— склонность к кровотечению, нарушения свертываемости крови, прием препаратов, влияющих на гемостаз или функцию тромбоцитов;

— моторные и вербальные тики в анамнезе;

— глаукома.

Способ применения и дозы:

Дозу устанавливают индивидуально, в зависимости от переносимости и клинической эффективности. В качестве начальной дозы ежедневно следует принимать 1 капсулу Меридиа 10 мг. У пациентов, слабо реагирующих на прием Меридиа 10 мг (снижение массы тела менее чем на 2 кг за первые 4 недели), при условии хорошей переносимости препарата, суточная доза может быть увеличена до 15 мг, т.е. 1 капсула Меридиа 15 мг. У пациентов, слабо реагирующих на прием Меридиа 15 мг (снижение массы тела менее 2 кг за первые 4 недели), дальнейшее лечение этим препаратом следует прекратить.

Капсулы Меридиа следует принимать утром, не разжевывая и запивая достаточным количеством жидкости (стакан воды). Препарат можно принимать как натощак, так и сочетать с приемом пищи.

Лечение не должно продолжаться более 3-х месяцев у больных, которые недостаточно хорошо реагируют на терапию, т.е. которым в течение 3-х месяцев лечения не удается достичь снижения массы тела на 5% от исходного уровня. Лечение не следует продолжать, если на фоне терапии Меридиа после достигнутого снижения массы тела, пациент прибавляет в массе тела 3 кг и более. Длительность лечения Меридиа не должна превышать 1 год.

Побочное действие:

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

Побочные эффекты, в зависимости от воздействия на органы и системы, представлены в следующем порядке: очень часто (≥ 10%), часто (≥1%, <10%).

Очень часто: бессонница, сухость во рту, запор.

Со стороны ЦНС: часто головная боль, головокружение, беспокойство, парестезии, изменение вкуса.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - тахикардия, сердцебиение, повышение АД, вазодилатация/гиперемия кожи с ощущением тепла. В клинических исследованиях наблюдалось повышение систолического и диастолического АД в покое в среднем на 2-3 мм рт.ст. и учащение ЧСС на 3-7 уд./мин. У некоторых пациентов отмечалось более значительное повышение АД и учащение ЧСС. Клинически значимое повышение АД и учащение ЧСС в основном наблюдались в начале лечения (первые 4-12 недель). В таких случаях лечение должно быть прекращено.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, обострение геморроя.

Со стороны кожных покровов: часто - потливость.

В ходе постмаркетинговых исследований были описаны дополнительные побочные реакции, перечисленные ниже по системам органов.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: мерцательная аритмия.

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения.

Со стороны иммунной системы: реакции аллергической гиперчувствительности (от умеренных высыпаний на коже, зуда и крапивницы до ангионевротического отека /отека Квинке/ и анафилаксии).

Психические расстройства: депрессия, психоз, состояния суицидально направленного мышления, суицид и мания. При возникновении подобных состояний препарат необходимо отменить.

Со стороны нервной системы: судороги, сонливость, эмоциональная лабильность, кратковременные нарушения памяти.

Со стороны органа зрения: затуманивание зрения ("пелена перед глазами").

Со стороны пищеварительной системы: диарея, рвота, боль в животе, повышение аппетита, жажда, обратимое повышение уровней печеночных ферментов в крови.

Со стороны кожных покровов: алопеция, пурпура Шенлейна-Геноха.

Со стороны мочевыделительной системы: острый интерстициальный нефрит, задержка мочи.

Со стороны репродуктивной системы: нарушения эякуляции/оргазма, импотенция, нарушение менструального цикла, маточные кровотечения.

Прочие: ринит, синусит, боль в спине, гриппоподобный синдром, периферические отеки, кровотечения.

Реакции на отмену, такие как головная боль или повышенный аппетит, наблюдаются редко.

Передозировка:

Имеются ограниченные данные по поводу передозировки сибутрамина. Пациенту следует известить своего лечащего врача в случае предполагаемой передозировки.

Наиболее часто встречающиеся *неблагоприятные реакции*, связанные с передозировкой: тахикардия, артериальная гипертензия, головная боль, головокружение.

Лечение: специального лечения и специфических антидотов не существует. Необходимо выполнить общие мероприятия направленные на поддержание жизненно важных функций организма: обеспечить свободное дыхание, наблюдать за состоянием сердечно-сосудистой системы, а также при необходимости осуществить поддерживающую симптоматическую терапию. Своевременное применение активированного угля, а также промывание желудка может уменьшить поступление сибутрамина в организм. Исследования у больных с почечной недостаточностью в терминальной стадии, находящихся на диализе, показали, что метаболиты сибутрамина при гемодиализе в значительной степени не выводятся.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Не следует принимать препарат Меридиа при беременности и в период лактации (грудного вскармливания), поскольку до настоящего времени не имеется достаточного количества исследований в отношении безопасности воздействия Меридиа на плод.

Женщины детородного возраста, принимающие препарат Меридиа, должны использовать методы контрацепции.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Препараты, ингибирующие цитохром CYP3A4

Одновременный прием препаратов, ингибирующих активность данного фермента, таких как кетоконазол, эритромицин, циметидин в сочетании с сибутрамином приводил к повышению концентраций последнего в плазме крови. Следует соблюдать осторожность при одновременном применении сибутрамина с лекарственными средствами, ингибирующими активность изоферментов цитохрома Р450.

Препараты влияющие на гемостаз и функцию тромбоцитов

Наблюдались единичные случаи кровотечения у пациентов, принимавших сибутрамин. Хотя причинная связь остается неясной, следует проявлять осторожность при назначении сибутрамина пациентам, предрасположенным к возникновению кровотечений, а также при применении одновременно с сибутрамином других препаратов, влияющих на гемостаз или функцию тромбоцитов.

Ингибиторы МАО

Противопоказан прием сибутрамина одновременно с ингибиторами МАО. Перед началом терапии сибутрамином следует выдержать интервал не менее 2 недель после отмены приема ингибиторов МАО. Одновременный прием нескольких препаратов, каждый из которых повышает уровень серотонина в головном мозге, может привести к развитию серотонинового синдрома. Редко наблюдалось возникновение серотонинового синдрома при одновременном приеме селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (СИОЗС) совместно с некоторыми препаратами для лечения мигрени или некоторыми опиатами или в случаях одновременного приема двух СИОЗС. Так как сибутрамин ингибирует обратный захват серотонина, то он не должен использоваться одновременно с другими препаратами, повышающими уровень серотонина в головном мозге.

Препараты, повышающие АД и ЧСС

Лекарственное взаимодействие при одновременном применении сибутрамина с препаратами, повышающими АД и ЧСС, в настоящее время недостаточно полно изучено. Эта группа препаратов включает деконгестанты, противокашлевые, противопростудные и противоаллергические препараты, в состав которых входят эфедрин или псевдоэфедрин. Поэтому в случаях одновременного приема этих препаратов с сибутрамином следует соблюдать осторожность.

Пероральные контрацептивы

Сибутрамин не влияет на действие пероральных контрацептивов.

Препараты, влияющие на ЦНС

Совместное применение сибутрамина с препаратами для снижения веса, действующими на ЦНС, или препаратами

для лечения психических расстройств противопоказано.

Этанол

Не было обнаружено дополнительного ухудшения когнитивных и психомоторных реакций при приеме 20 мг сибутрамина одновременно с одной дозой алкоголя (0.5 мл/кг). Однако одновременный прием сибутрамина и этанола не рекомендуется.

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат Меридиа следует применять только в тех случаях, когда все немедикаментозные мероприятия по снижению массы тела малоэффективны - если снижение массы тела в течение 3-х месяцев составило менее 5 кг.

Для решения вопроса о приеме препарата Меридиа необходимо получить консультацию врача, даже если ранее уже приходилось обращаться к нему по этому вопросу.

Лечение препаратом Меридиа 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 диеты и образа жизни, так и увеличение физической активности. Важным компонентом терапии является создание предпосылок к стойкому изменению привычек питания и образа жизни, которые необходимы для сохранения достигнутого снижения массы тела и после отмены медикаментозной терапии. Пациентам необходимо в рамках терапии препаратом Меридиа 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 повторным обращениям к лечащему врачу.

У пациентов с сопутствующей патологией, связанной с ожирением, рекомендуется продолжать лечение только в том случае, если снижение массы тела сочетается с клиническим улучшением других показателей, например, с улучшением липидного профиля у пациентов с дислипидемией или улучшением гликемического профиля у пациентов с сахарным диабетом.

У некоторых пациентов сибутрамин приводит к значимому подъему АД и/или увеличению ЧСС. Пациентам, принимающим препарат Меридиа, необходимо регулярно измерять уровень АД и ЧСС. В первые 3 месяца лечения эти параметры следует контролировать каждые 2 недели, с 4 -го по 6-й месяц - 1 раз в месяц, а затем - регулярно, но не реже 1 раза в 3 месяца. Если во время двух визитов подряд выявляется увеличение ЧСС ≥ 10 уд./мин или систолического/диастолического АД ≥ 10 мм рт.ст., необходимо прекратить лечение. У пациентов, у которых АД дважды при повторном измерении превышало уровень 145/90 мм рт.ст., лечение препаратом Меридиа должно быть отменено.

У пациентов с синдромом апноэ во сне необходимо особенно тщательно контролировать уровень АД.

Хотя не установлена связь между приемом сибутрамина и развитием первичной легочной гипертензии, однако, учитывая общеизвестный риск препаратов данной группы, при регулярном медицинском контроле необходимо особое внимание обращать на такие симптомы, как прогрессирующее диспноэ (нарушение дыхания), боль в грудной клетке и отеки на ногах.

Обычно при совместном приеме сибутрамина и других ингибиторов обратного захвата серотонина существует повышенный риск развития кровотечений. У пациентов, предрасположенных к кровотечениям, а также принимающих препараты, влияющие на гемостаз или функцию тромбоцитов, сибутрамин следует применять с осторожностью.

При пропуске дозы Меридиа, не следует принимать в следующий прием двойную дозу препарата, рекомендовано продолжать дальнейший прием препарата по предписанной схеме.

Длительность приема Меридиа не должна превышать 1 год.

Хотя клинические данные о привыкании к сибутрамину отсутствуют, следует выяснить, не было ли в анамнезе больного случаев лекарственной зависимости и обратить внимание на возможные признаки злоупотреблений лекарственными препаратами.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Препараты, влияющие на ЦНС, могут ограничивать умственную активность, память и скорость реакций. И хотя в исследованиях сибутрамин не влиял на эти функции, тем не менее, прием препарата Меридиа может ограничить способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами.

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

При нарушениях функции почек

С осторожностью назначают при нарушениях функции почек легкой и средней степени тяжести.

При тяжелых нарушениях функции почек препарат противопоказан.

При нарушениях функции печени

С осторожностью назначают при нарушениях функции печени легкой и средней степени тяжести.

При тяжелых нарушениях функции печени препарат противопоказан.

Применение в пожилом возрасте

Противопоказание: возраст старше 65 лет.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат относится к списку сильнодействующих веществ, утвержденному Постановлением правительства РФ от 29.12.2007 N 964.

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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