Паликсид-Рихтер

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	**1 таб.**
донепезила гидрохлорид	10 мг

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	**1 таб.**
донепезила гидрохлорид	5 мг

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Специфический и обратимый ингибитор холинэстеразы. Ингибируя холинэстеразу в головном мозге, блокирует распад ацетилхолина, осуществляющего передачу возбуждения в ЦНС. Однократный прием 5 и 10 мг препарата сопровождается угнетением активности холинэстеразы (измеренная в мембранах эритроцитов) на 63.6 и 77.3% соответственно. Замедляет прогрессирование болезни Альцгеймера, уменьшает выраженность когнитивных симптомов, в ряде случаев восстанавливает дневную активность больных и облегчает уход за ними.

Фармакокинетика

C_{max} донепезила отмечается приблизительно через 3-4 ч после приема. Концентрация и площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) повышается пропорционально дозе. $T_{1/2}$ - 70 часов. Ежедневный прием препарата 1 раз в день постепенно приводит к достижению равновесного состояния (Css), которое достигается в течение 3 недель после начала терапии. В равновесном состоянии концентрация донепезила в плазме крови и связанные с этим фармакодинамические эффекты незначительно меняются в течение дня.

Прием пищи не влияет на всасывание донепезила.

Связь с белками плазмы - 95%. Сведений о связывании с белками плазмы его активного метаболита 6-О-дезметилдонепезила нет. Распределение донепезила в различных тканях организма изучено недостаточно. Донепезил и/или его метаболиты могут сохраняться в организме более 10 дней.

Выводится с почками в неизмененном виде. После однократного введения 5 мг концентрация неизмененного донепезила в плазме - 30% от введенной дозы, 6-О-дезметилдонепезила - 11% (единственный метаболит, обладающий сходной активностью с донепезилом), донепезил-цис-N-оксида - 9%, 5-О-дезметилдонепезила - 7% и глюкуронового конъюгата 5-О-дезметилдонепезила -3%. Примерно 57% введенной дозы обнаружено в моче (17% в неизмененном виде) и 14.5% в кале. Пол, раса и курение не оказывает существенного влияния на концентрацию донепезила в плазме крови. Средние концентрации донепезила в плазме крови пациентов соответствуют таковым у здоровых добровольцев.

Показания к применению:

— симптоматическое лечение деменции Альцгеймеровского типа легкой, средней и тяжелой степени.

Относится к болезням:

- Деменция

Противопоказания:

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

— беременность, период лактации;

— непереносимость лактозы;

— дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция (т.к. в состав препарата входит лактоза);

— индивидуальная повышенная чувствительность к одному из компонентов препарата (в т.ч. к производным пиперидина);

С осторожностью: нарушения сердечного ритма, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, хроническая обструктивная болезнь легких (ХОБЛ), бронхиальная астма, одновременный прием нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП), холиноблокаторов или других ингибиторов холинэстеразы, при проведении общей анестезии.

Способ применения и дозы:

Терапию начинают с приема 5 мг 1 раз/сут, вечером, перед сном, в течение не менее 1 месяца, при необходимости, дозу можно увеличить до 10 мг/сут, что является максимальной суточной дозой. Препарат Паликсид-Рихтер применяют независимо от приема пищи. Поддерживающую дозу можно продолжать до тех пор, пока сохраняется терапевтический эффект.

Пациенты с нарушением функции печени и почек

При **нарушении функции почек легкой или средней степени тяжести** можно применять общепринятые дозы донепезила, так как клиренс препарата в этих состояниях не меняется.

При **нарушении функции печени легкой или средней степени тяжести** из-за риска повышенной экспозиции препарата дозу можно увеличивать постепенно, с учетом индивидуальной переносимости донепезила.

Нет данных о применении препарата **у больных с тяжелой печеночной недостаточностью.** Применение препарата Паликсид-Рихтер у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью не рекомендуется.

Побочное действие:

Нежелательные побочные реакции разделяются по частоте и системам органов: Частые - 1/100 назначений, нечастые - 1/1000 назначений, редкие - 1/10000 назначений.

Со стороны ЖКТ:

Частые: диспептические расстройства, тошнота, рвота, диарея;

Не частые: язва желудка и двенадцатиперстной кишки, нарушение функции печени (включая гепатит), желудочно-кишечные кровотечения, анорексия.

Со стороны нервной системы:

Частые: обморок, головная боль, бессонница, головокружение, мышечные судороги, повышенная утомляемость, галлюцинации, ажитация, агрессивность.

Не частые: эпилептические припадки.

Редкие: экстрапирамидные симптомы.

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

Не частые: брадикардия.

Редкие: атриовентрикулярная блокада, синоатриальная блокада.

Со стороны кожи и подкожных тканей:

Частые: кожный зуд и сыпь.

Со стороны почек и мочевыводящих путей:

Частые: недержание мочи.

Общие расстройства:

Частые: боль различной локализации.

Не частые: повышение активности креатининфосфокиназа (КФК) в сыворотке крови

Передозировка:

Передозировка холинэстеразы ингибиторов вызывает холинергический криз, что характеризуется тяжелой тошнотой, рвотой, слюнотечением, брадикардией, снижением артериального давления, угнетением дыхания, коллапсом и судорогами. Усугубление мышечной слабости, особенно при распространении ее на дыхательные мышцы, может вызывать летальный исход.

При передозировке необходимо проводить поддерживающую терапию. В качестве антидота можно применять третичные холиноблокаторы, например, атропин в начальной дозе 1.0-2.0 мг в/в, затем дозу подбирают в зависимости от эффекта. При применении других холиномиметических средств и других четвертичных м-холиноблокаторов (гликопиррония бромид) отмечали атипичные изменения артериального давления и частоты сердечных сокращений.

Нет данных о том, донепезил и его метаболиты удаляются из организма при диализе (гемодиализ, перитонеальный диализ или гемофильтрация).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Беременность

Исследования, проведенные на животных, не выявили тератогенную активность, но показали токсическое действие препарата в пренатальном и постнатальном периоде. Данные о применении донепезила у женщин во время беременности отсутствуют. В случае возникновения беременности прием препарата следует немедленно прекратить.

Кормление грудью

Данные о выделении препарата с грудным молоком отсутствуют. При необходимости назначения препарата Паликсид-Рихтер в период лактации грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Изучение лекарственного взаимодействия проводились только на взрослых.

Донепезил и/или его метаболиты в организме человека не ингибируют метаболизм теофиллина, варфарина, циметидина или дигоксина. Циметидин или дигоксин при совместном применении не влиял на метаболизм донепезила. В метаболизме донепезила принимают участие изофермент CYP3A4, и, в меньшей степени, изофермент CYP2D6. Кетоконазол и хинидин, являющиеся ингибиторами изофермента CYP3A4 и изофермента CYP2D6 соответственно, подавляют метаболизм донепезила. Следовательно, эти и другие ингибиторы изофермента CYP3A4, такие как итраконазол и эритромицин, и ингибиторы изофермента CYP2D6, такие как флуоксетин, могут ингибировать метаболизм донепезила. У здоровых добровольцев кетоконазол повышал средние концентрации донепезила в плазме крови примерно на 30 %. Индукторы микросомальных ферментов печени, такие как рифампицин, фенитоин, карбамазепин и этанол могут вызвать снижение концентрации донепезила в плазме крови. В связи с тем, что степень такого ингибирующего или индуцирующего действия не известна, эти средства в комбинации с донепезилом следует применять с особой осторожностью.

Также имеется возможность взаимодействия с холиноблокаторами. При одновременном применении донепезил

может усиливать действие суксаметония, других миорелаксантов или агонистов холинергических рецепторов и бета-адреноблокаторов, которые влияют на проводимость миокарда.

Особые указания и меры предосторожности:

Поддерживающую терапию можно продолжать до тех пор, пока сохраняется терапевтический эффект, который следует регулярно оценивать. Если препарат перестает действовать, его следует отменить. После прекращения лечения наблюдается постепенное уменьшение действия донепезила, сведений о синдроме «отмены» в случае резкого прекращения приема препарата нет. Индивидуальную реакцию на терапию донепезилом предсказать невозможно.

Эффективность донепезила у больных с другими типами деменции, кроме деменции Альцгеймеровского типа, не изучалась.

Анестезия

Донепезил является ингибитором холинэстеразы и может усиливать миорелаксацию, вызванную деполяризующими миорелаксантами, во время анестезии.

Сердечно-сосудистые заболевания

Вследствие своего фармакологического действия ингибиторы холинэстеразы могут оказывать ваготоническое действие на частоту сердечных сокращений (в частности, вызывать брадикардию). Возможность такого действия может иметь большое значение для больных с синдромом слабости синусового узла или другими нарушениями наджелудочковой проводимости, такими как синоатриальная или атриовентрикулярная блокада.

Желудочно-кишечные заболевания

Холиномиметики могут усиливать секрецию кислоты в желудке. При повышенном риске развития пептической язвы, например, у больных с язвенной болезнью желудка и двенадцатиперстной кишки в анамнезе или у пациентов, получающих сопутствующую терапию нестероидными противовоспалительными препаратами, во время лечения необходимо контролировать соответствующие симптомы. Однако в плацебо-контролируемых исследованиях донепезила не было выявлено увеличения частоты развития пептических язв или желудочно-кишечного кровотечения.

Урогенитальные заболевания

Несмотря на то, что в клинических исследованиях донепезила не отмечалось подобного действия, холиномиметики могут вызывать нарушение мочеиспускания.

Неврологические заболевания

Холиномиметики могут вызывать судороги, однако появление судорог может быть также проявлением болезни Альцгеймера. Холиномиметики могут вызывать или усугублять экстрапирамидные симптомы.

Заболевания легких

Учитывая холиномиметическое действие ингибиторов холинэстеразы, их следует назначать с осторожностью больным с бронхиальной астмой или обструктивными заболеваниями легких в анамнезе.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Деменция Альцгеймеровского типа сама может сопровождаться нарушением способности к управлению автомобилем и использованию сложной техники. Кроме того, донепезил может вызывать слабость, головокружение, судороги мышц, особенно в начале терапии или при повышении дозы препарата.

Лечащий врач должен решить, может ли больной с деменцией Альцгеймеровского типа во время лечения препаратом Паликсид-Рихтер управлять автомобилем или работать с механизмами с повышенным риском травматизма.

При нарушениях функции почек

При **нарушении функции почек легкой или средней степени тяжести** можно применять общепринятые дозы донепезила, так как клиренс препарата в этих состояниях не меняется.

При нарушениях функции печени

При **нарушении функции печени легкой или средней степени тяжести** из-за риска повышенной экспозиции препарата дозу можно увеличивать постепенно, с учетом индивидуальной переносимости донепезила.

Нет данных о применении препарата **у больных с тяжелой печеночной недостаточностью.** Применение

препарата Паликсид-Рихтер у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью не рекомендуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

Хранить при температуре не выше 30°C. Хранить недоступном для детей месте!

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Paliksid-Rihter