Слимия

Код АТХ:

- A08AA10

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Сибутрамин

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Средство для лечения ожирения центрального действия. Механизм действия обусловлен селективным ингибированием обратного захвата серотонина и норадреналина, в меньшей степени - допамина. Ускоряет наступление и пролонгирует чувство насыщения, что приводит к уменьшению потребления пищи. Увеличивает расход энергии за счет стимуляции термогенеза путем опосредованной активации β_3-адренорецепторов. Действует на обе стороны баланса энергии и способствует снижению массы тела.

Сибутрамин и его метаболиты не высвобождают моноамины и не являются ингибиторами МАО, не обладают сродством к серотонинергическим, адренергическим, допаминергическим, мускариновым, гистаминовым, бензодиазепиновым и NMDA рецепторам.

Фармакокинетика

После приема внутрь сибутрамин быстро абсорбируется из ЖКТ. Практически полностью метаболизируется в печени при участии изоферментов системы цитохрома CYP3A4 с образованием моно- (дисметилсибутрамин) и ди-дисметил (ди-дисметилсибутрамин) форм активных метаболитов (M1 и M2), а также путем гидроксилирования и конъюгирования с образованием неактивных метаболитов. C_{max} сибутрамина достигается через 1.2 ч, M1 и M2 – через 3-4 ч. C_{max} M1 и M2 после однократного приема внутрь в дозе 15 мг – 4 нг/мл (3.2-4.8 нг/мл) и 6.4 нг/мл (5.6-7.2 нг/мл) соответственно. Прием с пищей увеличивает время достижения C_{max} и снижает величину C_{max} дисметил метаболитов на 3 ч и 30% соответственно; не влияет на величину AUC дисметил метаболитов. Быстро и хорошо распределяется в тканях. Связывание с белками плазмы: сибутрамин – 97%, M1 и M2 – 94%. $T_{1/2}$ сибутрамина – 1.1 ч, M1 – 14 ч, M2 – 16 ч. Выводится, в основном, почками в виде неактивных метаболитов.

При почечной недостаточности основные фармакокинетические параметры (C_{max}, $T_{1/2}$, AUC) сибутрамина и его активных метаболитов существенно не изменяются.

Показания к применению:

В составе поддерживающей комплексной терапии пациентов с избыточной массой тела при алиментарном ожирении с индексом массы тела от 30 кг/м^2 и более, при алиментарном ожирении с индексом массы тела от 27 кг/м^2 и более при наличии других факторов риска, обусловленных избыточной массой тела, в т.ч. сахарного диабета типа 2 (инсулиннезависимого) или гиперлипидемии.

Относится к болезням:

- Инсульт
- Ожирение

Противопоказания:

Органическая причина ожирения, известные и установленные серьезные нарушения питания (нервная анорексия или нервная булимия), психические заболевания, синдром Туретта, ИБС, хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, врожденные пороки сердца, окклюзионные заболевания периферических артерий, тахикардии, аритмии, нарушения мозгового кровообращения (в т.ч. транзиторные), неконтролируемая артериальная гипертензия (АД более 145/90 мм рт.ст.), гипертиреоз, тяжелые нарушения функции почек, тяжелые нарушения функции печени, доброкачественная гиперплазия предстательной железы с формированием остаточной мочи, феохромоцитома, глаукома, установленная фармакологическая наркотическая и алкогольная зависимость, беременность, лактация (грудное вскармливание), одновременный прием или период до 2 недель после отмены ингибиторов МАО или других препаратов, оказывающих угнетающее действие на ЦНС (антидепрессанты, нейролептики, триптофан) или других лекарственных средств для снижения массы тела, повышенная чувствительность к сибутрамину.

Способ применения и дозы:

Начальная доза составляет 10 мг/сут. При недостаточной эффективности при применении в этой дозе (снижение массы тела менее чем на 2 кг за 4 недели) и при хорошей переносимости дозу можно повысить до 15 мг/сут.

При отсутствии эффекта при применении в дозе 15 мг/сут (снижение массы тела менее 2 кг за 4 недели) сибутрамин следует отменить.

У пациентов, недостаточно адекватно реагирующих на проводимую терапию, т.е. у которых в течение 3 мес не удается достигнуть 5% уровня снижения массы тела от исходного уровня, длительность применения должна составлять не более 3 мес.

Курс лечения составляет не более 1 года, т.к. нет данных об эффективности и безопасности более продолжительного применения.

Не следует продолжать применение, если после достигнутого снижения массы тела в ходе дальнейшей терапии пациент вновь прибавляет в массе 3 кг и более.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: часто - потеря аппетита, запор, сухость во рту, тошнота, транзиторное повышение активности печеночных ферментов.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: бессонница, головные боли, головокружение, беспокойство, парестезии, усиление потоотделения, изменение вкуса, судорожные припадки; у одного пациента с шизоаффективным нарушением, которое предположительно существовало до начала терапии сибутрамином, после лечения развился острый психоз.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, ощущение сердцебиения, повышение АД (умеренный подъем АД в покое на 1-3 мм рт.ст. и умеренное увеличение пульса на 3-7 уд./мин), вазодилатация (покраснение кожи с ощущением тепла), обострение геморроя; в отдельных случаях - более выраженное повышение АД и учащение ЧСС.

Со стороны мочевыделительной системы: в единичных случаях - острый интерстициальный нефрит, мезангиокапиллярный гломерулонефрит.

Со стороны свертывающей системы крови: тромбоцитопения, пурпура Шенлейн-Геноха.

Чаще всего побочные эффекты проявляются в начале терапии (в первые 4 недели), их выраженность и частота

возникновения с течением времени ослабевают.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Сибутрамин противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Женщины детородного возраста в период лечения должны применять адекватные методы контрацепции.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении со средствами, ингибирующими активность изофермента CYP3A4 (кетоконазол, эритромицин, тролеандомицин, циклоспорин) повышаются концентрации в плазме метаболитов сибутрамина, незначительно увеличивается интервал QT.

При одновременном применении с рифампицином, фенитоином, карбамазепином, фенобарбиталом, дексаметазоном, антибиотиками группы макролидов возможно ускорение метаболизма сибутрамина.

При одновременном применении с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (с циталопрамом, флуоксетином, пароксетином, сертралином), агонистами 5-HT_1-рецепторов, производными алкалоидов спорыньи, опиоидными анальгетиками, противокашлевыми средствами центрального действия повышается риск развития серотонинового синдрома.

Особые указания и меры предосторожности:

Применять только в тех случаях, когда все мероприятия по снижению массы тела малоэффективны (т.е. снижение массы тела составляет менее 5 кг в течение 3 мес).

Лечение следует проводить только 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. Таким образом, формируются предпосылки к стойкому изменению привычек питания и образа жизни, которые необходимы для сохранения достигнутого снижения массы тела после отмены медикаментозной терапии.

С осторожностью применять одновременно с препаратами, увеличивающими интервал QT, у пациентов с гипокалиемией и гипомагниемией, эпилепсией, с нарушениями функции печени легкой и средней степени тяжести (т.к. при этом возможно бессимптомное повышение концентрации сибутрамина в плазме крови), с нарушениями функции почек легкой и средней степени тяжести (т.к. неактивные метаболиты частично выводятся почками), у пациентов с моторными тиками или вокализмами в семейном анамнезе, одновременно с препаратами, повышающими АД и ЧСС (в т.ч. с лекарственными средствами, применяемыми при кашле, аллергии и простуде).

Не применяют у лиц старше 65 лет в связи с отсутствием достаточного клинического опыта применения сибутрамина в гериартрии.

В период лечения следует контролировать АД и ЧСС: в первые 2 мес терапии - каждые 2 недели, затем ежемесячно. У пациентов с артериальной гипертензией (АД более 145/90 мм рт.ст.) контроль этих параметров следует осуществлять особенно тщательно и, при необходимости, более часто. Если АД при повторном измерении дважды превышало 145/90 мм рт.ст., то сибутрамин следует отменить.

При проведении регулярного медицинского контроля в период лечения следует обращать внимание на прогрессирующее диспноэ, боли в грудной клетке и отеки, хотя связь между приемом сибутрамина и развитием первичной легочной гипертензии не установлена.

Реакции на отмену сибутрамина (головная боль, повышенный аппетит) наблюдаются редко.

В период лечения не следует употреблять алкоголь из-за необходимости соблюдения диеты.

Не следует применять у детей и подростков в возрасте до 18 лет в связи с отсутствием достаточного клинического опыта применения у данной категории пациентов.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управление механизмами

В настоящее время не установлено влияние сибутрамина на способность к занятиям потенциально опасными видами деятельности. Однако исключить возможность такого воздействия нельзя. С осторожностью применять у пациентов, деятельность которых требует повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции почек.

С осторожностью применять у пациентов с нарушениями функции почек легкой и средней степени тяжести (т.к. неактивные метаболиты частично выводятся почками).

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции печени.

С осторожностью применять у пациентов с нарушениями функции печени легкой и средней степени тяжести (т.к. при этом возможно бессимптомное повышение концентрации сибутрамина в плазме крови).

Применение в пожилом возрасте

Не применяют у лиц старше 65 лет в связи с отсутствием достаточного клинического опыта применения сибутрамина в гериартрии.

Применение в детском возрасте

Не следует применять у детей и подростков в возрасте до 18 лет в связи с отсутствием достаточного клинического опыта применения у данной категории пациентов.

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