Яснал



Код АТХ:

- N06DA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Донепезил

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 7, 10 шт. - блистеры (1, 3, 4, 6, 8, 12, 14) - пачки картонные.

Состав:

Одна таблетка содержит

Активное вещество: донепезила гидрохлорид 10 мг

Описание:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого или чуть бежевого оттенка цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный и обратимый ингибитор ацетилхолинэстеразы, которая является преобладающим типом холинэстеразы в головном мозге. Донепезил ингибирует этот фермент более чем в 1000 раз сильнее, чем бутирилхолинэстеразу, содержащуюся, в основном, вне ЦНС.

После однократного приема донепезила в дозах 5 мг или 10 мг степень подавления активности

ацетилхолинэстеразы, измеренная в мембранах эритроцитов, составляла соответственно 63.6 и 77.3%.

Ингибирование ацетилхолинэстеразы в эритроцитах под действием донепезила коррелирует с изменениями шкалы ADAS-cog (шкала оценки когнитивных функций при болезни Альцгеймера).

Фармакокинетика

После приема внутрь C_{max} донепезила в плазме крови достигается примерно через 3-4 ч. Плазменные концентрации и AUC увеличиваются пропорционально дозе. $T_{1/2}$ из плазмы составляет примерно 70 ч, поэтому при систематическом применении в однократных дозах C_{ss} достигается, как правило, в течение 2-3 недель после начала терапии. После достижения равновесного состояния концентрация донепезила в плазме и связанные с этим фармакодинамические эффекты существенно не изменяются в течение дня. Прием пищи не влияет на всасывание донепезила.

Связывание с белками плазмы - около 95%. Предполагается, что донепезил и/или его метаболиты могут сохраняться в организме более 10 дней.

Донепезил подвергается метаболизму в печени. Главными продуктами метаболизма донепезила являются соединения M1 и M2 (продукты O-дезалкилирования и гидроксилирования), M 11 и M12 (продукты глюкуронирования M1 и M2 соответственно), M4 (продукт гидролиза) и M6 (продукт N-окисления). Сведений о внутрипеченочной рециркуляции донепезила и/или продуктов его метаболизма не имеется.

Выводится донепезил, также как и его метаболиты, в основном, с мочой: 79% дозы обнаруживается в моче и 21% - в кале. В моче преимущественно обнаруживается донепезил.

Показания к применению:

Симптоматическое лечение деменции альцгеймеровского типа легкой или средней степени тяжести.

Относится к болезням:

- Деменция

Противопоказания:

Препарат не должен применяться при наличии какого-либо из состояний, перечисленных ниже:

— повышенная чувствительность к атазанавиру или любому другому компоненту препарата;

— тяжелая печеночная недостаточность при любых режимах дозирования;

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

— в комбинации с астемизолом, терфенадином, цизапридом, пимозидом, бепридилом, хинидином, триазоламом, мидазоламом (для приема внутрь), алкалоидами спорыньи (особенно эрготамином, дигидроэрготамином, эргометрином, метилэргометрином), препаратами зверобоя продырявленного, симвастатином, ловастатином, индинавиром, иринотеканом, рифампицином, алфузозином, силденафилом (при его назначении для лечения легочной артериальной гипертензии), салметеролом;

— детский возраст до 18 лет.

С осторожностью: сахарный диабет, гипергликемия, дислипидемия, гипербилирубинемия, нефролитиаз, вирусные гепатиты, хронический активный гепатит, печеночная недостаточность легкой и средней степени тяжести (для атазанавира), печеночная недостаточность слабой степени тяжести (для комбинации атазанавир/ритонавир), гемофилия A и B, синдром врожденного удлинения интервала PR, синдром врожденного удлинения интервала QT, повышенная кислотность желудочного сока, совместное применение с невирапином, эфавирензом, ГКС.

Способ применения и дозы:

Взрослым (в т.ч. пациентам пожилого возраста) назначают в начальной дозе 5 мг 1 раз/сут. Прием в начальной дозе продолжают в течение не менее 4-6 недель, чтобы достичь равновесных концентраций донепезила и определить ранний клинический эффект терапии. Через 1 мес дозу можно увеличить до 10 мг/сут.

Максимальная суточная доза составляет 10 мг/сут.

Поддерживающую терапию можно продолжать до тех пор, пока сохраняется терапевтический эффект, который следует регулярно оценивать.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: часто - диарея, тошнота, рвота; возможны диспепсия, гепатит, язвы желудка и двенадцатиперстной кишки и кровотечения из ЖКТ, анорексия.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: часто - утомляемость, бессонница, мышечные судороги; возможны головная боль, головокружение, галлюцинации, тревожное состояние, агрессивное поведение, эпилептические припадки.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - обморок, брадикардия, синоатриальная и AV-блокада.

Прочие: редко - незначительное повышение концентрации мышечной КФК в сыворотке; возможны боль различной локализации, несчастные случаи, простуда, мышечные судороги.

Передозировка:

Симптомы: в ходе клинических испытаний прием здоровыми добровольцами доз препарата до 1200 мг однократно не сопровождался какими-либо нежелательными явлениями.

Единственный случай передозировки препарата ВИЧ-инфицированным пациентом, принявшим 29,2 г препарата (доза, в 73 раза превышающая рекомендованную дозу 400 мг) сопровождался бессимптомной блокадой обеих ножек пучка Гиса и удлинением интервала PR. Данные признаки по данным ЭКГ исчезли спонтанно. Ожидаемыми симптомами передозировки препарата являются желтуха без изменений результатов печеночных тестов (из-за повышения концентрации непрямого билирубина) и нарушение сердечного ритма (удлинение интервала PR).

Лечение: специфического антидота нет. При передозировке препарата Реатаз® следует осуществлять контроль основных физиологических показателей, вести наблюдение за общим состоянием пациента, контролировать ЭКГ, назначить промывание желудка, вызвать рвоту для удаления остатков препарата, назначить активированный уголь.

Диализ неэффективен для выведения препарата из организма, т.к. атазанавир характеризуется интенсивным метаболизмом в печени и высокой степенью связывания с белками.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых исследований применения донепезила при беременности и в период лактации не проводилось. Сведений о выведении донепезила с грудным молоком нет.

При беременности применение возможно только в том случае, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает потенциальный риск для плода.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Клинический опыт применения донепезила ограничен, поэтому при применении следует учитывать риск неизвестных до настоящего момента проявлений взаимодействия с другими препаратами.

Донепезил метаболизируется при участии изофермента CYP3A4 и в меньшей степени - CYP2D6. Кетоконазол и хинидин, являющиеся ингибиторами CYP3A4 и CYP2D6 соответственно, подавляют метаболизм донепезила. Следовательно, эти и другие ингибиторы CYP3A4, такие как итраконазол и эритромицин, и ингибиторы CYP2D6, такие как флуоксетин, могут ингибировать метаболизм донепезила. У здоровых добровольцев кетоконазол повышал средние концентрации донепезила примерно на 30%. Однако это действие было не сравнимо с действием кетоконазола на другие вещества, метаболизирующиеся при участии CYP3A4, поэтому оно вряд ли имеет клиническое значение.

Индукторы ферментов, такие как рифампицин, фенитоин, карбамазепин и этанол могут вызвать снижение донепезила. Однако степень такого ингибирующего или индуцирующего действия неизвестна (при одновременном применении требуется осторожность).

Донепезил может оказывать влияние на действие препаратов, обладающих антихолинергической активностью. Кроме того, при одновременном применении, донепезил может усиливать действие сукцинилхолина, других миорелаксантов или агонистов холинергических рецепторов и бета-блокаторов, оказывающих влияние на проводимость сердца, хотя исследование in vitro показало, что донепезила гидрохлорид оказывает минимальное действие на гидролиз сукцинилхолина.

При одновременном применении донепезила с другими холиномиметиками и четвертичными антихолинергическими

препаратами, такими как гликопирролат, описаны случаи атипичных изменений АД и ЧСС.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять у пациентов с обструктивными заболеваниями легких в анамнезе (в т.ч. с бронхиальной астмой), с нарушениями ритма сердца, при проведении анестезии, а также больным с повышенным риском развития язвы (например, пациентам с язвенной болезнью в анамнезе или получающим сопутствующую терапию НПВС).

Необходимо избегать одновременного применения с другими ингибиторами ацетилхолинэстеразы, агонистами или антагонистами холинергической системы.

Лечение должен назначать и проводить врач, имеющий опыт ведения больных с болезнью Альцгеймера.

Поддерживающую терапию можно продолжать до тех пор, пока сохраняется терапевтический эффект. Если терапевтический эффект исчезает, то донепезил следует отменить. После прекращения лечения наблюдается постепенное уменьшение действия донепезила, сообщения о синдроме отмены в случае резкого прекращения приема отсутствуют. Индивидуальную реакцию на терапию донепезилом предсказать невозможно.

Эффективность донепезила у пациентов с тяжелой формой деменции альцгеймеровского типа, другими типами деменции или другими типами нарушения памяти (например, возрастным ухудшением когнитивной функции) не изучалась.

Донепезил, являясь ингибитором холинэстеразы, может усиливать миорелаксацию сукцинилхолинового типа во время проведения анестезии.

Ингибиторы холинэстеразы (в т.ч. донепезил) могут оказывать ваготоническое действие на ЧСС (в частности, вызывать брадикардию). Потенциальная возможность такого действия может иметь важное значение для больных с СССУ или другими нарушениями наджелудочковой проводимости, такими как синоатриальная или AV-блокада.

Полагают, что холиномиметики способны вызывать генерализованные судороги. Однако появление судорог в период лечения донепезилом может быть также проявлением болезни Альцгеймера.

Безопасность и эффективность применения донепезила у детей не изучалась, поэтому препарат не рекомендуется назначать этой категории пациентов.

Деменция альцгеймеровского типа сама может сопровождаться нарушением способности к управлению автомобилем и использованию сложной техники. Кроме того, донепезил, в основном в начале лечения или при повышении дозы, может вызывать утомляемость, головокружение и судороги мышц. Вопрос о способности пациента с деменцией альцгеймеровского типа во время применения донепезила управлять автомобилем или пользоваться сложной техникой должен решить врач после оценки индивидуальной реакции пациента на лечение.

Условия хранения:

Хранить препарат следует при температуре не выше 30 °C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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