Заласта



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки светло-желтого цвета, круглые, слегка двояковыпуклые; допускаются вкрапления более темного оттенка.

	1 таб.
оланзапин	2.5 мг

Вспомогательные вещества: целлактоза (высушенное распылением соединение, состоящее из 75% альфа-лактозы моногидрата и 25% целлюлозы), крахмал прежелатинизированный, крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.

Таблетки светло-желтого цвета, круглые, слегка двояковыпуклые, с надписью "5"; допускаются вкрапления более темного оттенка.

	1 таб.
оланзапин	5 мг

Вспомогательные вещества: целлактоза (высушенное распылением соединение, состоящее из 75% альфа-лактозы моногидрата и 25% целлюлозы), крахмал прежелатинизированный, крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.

Таблетки светло-желтого цвета, круглые, слегка двояковыпуклые, с надписью "7.5"; допускаются вкрапления более темного оттенка.

	1 таб.
оланзапин	7.5 мг

Вспомогательные вещества: целлактоза (высушенное распылением соединение, состоящее из 75% альфа-лактозы моногидрата и 25% целлюлозы), крахмал прежелатинизированный, крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.

Таблетки светло-желтого цвета, круглые, слегка двояковыпуклые, с надписью "10"; допускаются вкрапления более темного оттенка.

	1 таб.
оланзапин	10 мг

Вспомогательные вещества: целлактоза (высушенное распылением соединение, состоящее из 75% альфа-лактозы моногидрата и 25% целлюлозы), крахмал прежелатинизированный, крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.

Таблетки светло-желтого цвета, круглые, слегка двояковыпуклые, с надписью "15"; допускаются вкрапления более темного оттенка.

	1 таб.
оланзапин	15 мг

Вспомогательные вещества: целлактоза (высушенное распылением соединение, состоящее из 75% альфа-лактозы моногидрата и 25% целлюлозы), крахмал прежелатинизированный, крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.

Таблетки светло-желтого цвета, круглые, слегка двояковыпуклые, с надписью "20"; допускаются вкрапления более темного оттенка.

	1 таб.
оланзапин	20 мг

Вспомогательные вещества: целлактоза (высушенное распылением соединение, состоящее из 75% альфа-лактозы моногидрата и 25% целлюлозы), крахмал прежелатинизированный, крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антипсихотический препарат (нейролептик) с широким фармакологическим спектром действия. Антипсихотическое действие обусловлено блокадой допаминовых D_2-рецепторов мезолимбической и мезокортикальной системы; седативное действие - блокадой адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга; противорвотное действие - блокадой допаминовых D_2-рецепторов триггерной зоны рвотного центра; гипотермическое действие - блокадой допаминовых рецепторов гипоталамуса. Кроме того, оказывает влияние на мускариновые, адренергические, гистаминовые H_1-рецепторы и некоторые субклассы серотониновых рецепторов.

Оланзапин достоверно снижает продуктивную (бред, галлюцинации) и негативную симптоматику (враждебность, подозрительность, эмоциональный и социальный аутизм) психозов. Редко вызывает экстрапирамидные нарушения.

Фармакокинетика

Всасывание

Абсорбция оланзапина высокая, не зависит от приема пищи. T_{max} в плазме крови после перорального приема - 5-8 ч.

Распределение

Связывание с белками - 93% в диапазоне концентраций от 7 до 1000 нг/мл. Оланзапин связывается, в основном, с альбумином и α_1-гликопротеином. Проникает через гистогематические барьеры, в т.ч. ГЭБ.

Метаболизм

Метаболизируется в печени, активных метаболитов не образуется, основной циркулирующий метаболит - глюкуронид, не проникает через ГЭБ.

Выведение

Выводится преимущественно почками (60%) в виде метаболитов.

Курение, пол и возраст влияют на $T_{1/2}$ и плазменный клиренс. У лиц старше 65 лет $T_{1/2}$ составляет 51.8 ч и плазменный клиренс - 17.5 л/ч, у лиц моложе 65 лет - 33.8 ч и плазменный клиренс - 18.2 л/ч.

Плазменный клиренс ниже у больных с печеночной недостаточностью, женщин и некурящих в сравнении с соответствующими группами лиц. Тем не менее, степень влияния возраста, пола или курения на клиренс и $T_{1/2}$ оланзапина незначительна по сравнению с индивидуальной вариабельностью фармакокинетики между отдельными людьми.

Показания к применению:

— для лечения шизофрении (Заласта эффективно поддерживает улучшение клинической симптоматики при

длительном лечении у пациентов с исходной положительной реакцией на препарат);

— для лечения умеренных или тяжелых эпизодов мании;

— для профилактики рецидивов мании при биполярном расстройстве (у пациентов с маниакальными эпизодами при хорошем эффекте терапии оланзапином).

Относится к болезням:

- Биполярное расстройство
- Шизофрения

Противопоказания:

— закрытоугольная глаукома;

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

— период лактации;

— непереносимость галактозы, дефицит лактазы lapp или нарушение всасывания глюкозы-галактозы;

— повышенная чувствительность к оланзапину или другим компонентам препарата.

С *осторожностью*: почечная недостаточность, печеночная недостаточность, гиперплазия предстательной железы, паралитическая кишечная непроходимость, эпилепсия, судорожный синдром в анамнезе, лейкопения и/или нейтропения различного генеза, миелосупрессия различного генеза, в т.ч. миелопролиферативные заболевания, гиперэозинофильный синдром, кардиоваскулярные и цереброваскулярные заболевания или другие состояния, предрасполагающие к артериальной гипотензии, врожденное увеличение интервала QT на ЭКГ (увеличение QT_c на ЭКГ), или при наличии условий, потенциально способных вызвать увеличение интервала QT (например, одновременное назначение препаратов, удлиняющих интервал QT, застойная сердечная недостаточность, гипокалиемия, гипомагниемия), пожилой возраст, а также одновременный прием других лекарственных средств центрального действия; иммобилизация, беременность.

Способ применения и дозы:

Препарат назначают внутрь, 1 раз/сут. Т.к. пища не влияет на всасывание препарата, таблетки можно принимать независимо от приема пищи. В случае отмены препарата рекомендуется постепенное снижение дозы.

При *шизофрении* рекомендуемая начальная доза препарата - 10 мг/сут.

При **эпизодах мании** начальная доза составляет 15 мг в 1 прием при монотерапии или 10 мг/сут в составе комбинированной терапии.

Для *профилактики рецидивов при биполярном расстройстве* рекомендуемая начальная доза препарата в состоянии ремиссии - 10 мг/сут. Для пациентов, уже получающих препарат Заласта для лечения эпизода мании, поддерживающая терапия проводится в тех же дозах. На фоне терапии препаратом Заласта в случае развития нового маниакального, смешанного или депрессивного эпизода при необходимости следует увеличить дозу препарата с дополнительным лечением нарушений настроения, в соответствии с клиническими показаниями.

Суточная доза препарата при терапии шизофрении, маниакального эпизода или профилактики рецидивов биполярного расстройства может составлять 5-20 мг/сут, в зависимости от клинического состояния пациента. Увеличение дозы свыше рекомендуемой начальной возможно только после адекватной повторной клинической оценки состояния пациента и обычно проводится с интервалом не менее 24 ч.

У **пожилых пациентов** снижение начальной дозы (до 5 мг/сут) обычно не рекомендуется, но возможно у **пациентов старше 65 лет** при наличии факторов риска.

Пациентам с заболеваниями печени и/или почек рекомендовано уменьшение начальной дозы до 5 мг/сут. При **умеренной печеночной недостаточности (цирроз, класс А или В по классификации Чайлд-Пью печеночно-клеточной недостаточности у больных циррозом печени)** начальная доза составляет 5 мг/сут, возможно дальнейшее увеличение дозы с осторожностью.

Женщинам не требуется изменения в дозировании по сравнению с мужчинами.

У некурящих пациентов коррекции дозы по сравнению с курящими пациентами не требуется.

При наличии у пациента более одного фактора, способного влиять на всасывание препарата (женский пол, пожилой возраст, некурящий), возможно потребуется снижение начальной дозы. При необходимости возможно дальнейшее

увеличение дозы с осторожностью.

Побочное действие:

Классификация частоты развития побочных эффектов (ВОЗ): очень часто (>1/10), часто (от >1/100 до <1/10), нечасто (от >1/1000 до <1/100), редко от (>1/10 000 до <1/1000), очень редко от (<1/10 000, включая отдельные сообщения).

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: очень часто - сонливость; часто - головокружение, акатизия, паркинсонизм, дискинезия; редко - судорожный синдром (чаще на фоне судорожного синдрома в анамнезе); очень редко -злокачественный нейролептический синдром, дистония (включая окулогирный криз) и позднюю дискинезию. При резкой отмене оланзапина очень редко отмечены такие симптомы, как потливость, бессонница, тремор, тревога, тошнота или рвота.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - артериальная гипотензия (в т.ч. ортостатическая); нечасто - брадикардия с коллапсом или без; очень редко - увеличение интервала QT_c на ЭКГ, желудочковая тахикардия/фибрилляция и внезапная смерть, тромбоэмболии (включая эмболию легочных артерий и тромбоз глубоких вен).

Со стороны пищеварительной системы: часто - транзиторные антихолинергические эффекты, в т.ч. запоры и сухость во рту, транзиторное, бессимптомное повышение уровня печеночных трансаминаз (АЛТ, АСТ), особенно в начале лечения; редко - гепатит (в т.ч. гепатоклеточное, холестатическое или смешанное поражение печени); очень редко - панкреатит, повышение уровня ЩФ и общего билирубина.

Со стороны обмена веществ: очень часто - увеличение массы тела; часто - повышение аппетита; очень редко - гипергликемия и/или декомпенсация сахарного диабета, иногда проявляющаяся кетоацидозом или комой, включая фатальный исход; гипертриглицеридемия, гиперхолестеринемия, гипотермия.

Со стороны органов кроветворения: часто - эозинофилия; редко - лейкопения; очень редко - тромбоцитопения, нейтропения.

Со стороны костно-мышечной системы: очень редко - рабдомиолиз.

Со стороны мочеполовой системы: очень редко - задержка мочи, приапизм.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: нечасто - реакции фотосенсибилизации.

Аллергические реакции: редко - кожная сыпь; очень редко - анафилактоидные реакции, ангионевротический отек, кожный зуд или крапивница.

Прочие: часто - астения, периферические отеки; очень редко - алопеция.

Лабораторные показатели: очень часто - гиперпролактинемия, но клинические проявления (например, гинекомастия, галакторея и увеличение молочных желез) отмечаются редко. У большинства пациентов уровень пролактина спонтанно нормализовывался без отмены терапии. Нечасто - повышение уровня креатинфосфокиназы (КФК). У пожилых пациентов с деменцией зарегистрирована в исследованиях большая частота смертей и цереброваскулярных нарушений (инсульт, транзиторные ишемические атаки). Очень часто у этой категории пациентов отмечались нарушения походки и падения. Также часто наблюдались пневмония, повышение температуры тела, летаргия, эритема, зрительные галлюцинации и недержание мочи.

Среди пациентов с лекарственными (на фоне приема агонистов допамина) психозами на фоне болезни Паркинсона часто регистрировались ухудшение паркинсонической симптоматики и развитие галлюцинаций.

Есть данные о развитии нейтропении (4.1%) на фоне комбинированной терапии с вальпроевой кислотой у пациентов с биполярной манией. Одновременная терапия с вальпроевой кислотой или литием способствует увеличению частоты (> 10%) тремора, сухости во рту, повышению аппетита и увеличению массы тела. Также часто регистрировались нарушения речи (от 1 до 10%). В первые 6 недель комбинированной терапии с литием увеличивается частота увеличения массы тела. Длительная терапия оланзапином (до 12 месяцев) с целью профилактики рецидивов у пациентов с биполярным расстройством сопровождалась увеличением массы тела.

Передозировка:

Симптомы: очень частыми (>10%) при передозировке оланзапином являются: тахикардия, возбуждение/агрессия, дизартрия, различные экстрапирамидные симптомы, снижение уровня сознания от заторможенности до комы; менее чем в 2% случаев возникают: делирий, конвульсии, кома, злокачественный нейролептический синдром, угнетение дыхания, аспирация, повышение или снижение артериального давления, сердечные аритмии; в очень редких случаях - сердечно-легочная недостаточность. Минимальная доза оланзапина при острой передозировке с летальным исходом - 450 мг, зарегистрирована максимальная доза при передозировке с благоприятным исходом (выживание) - 1500 мг.

Лечение: специфического антидота не существует. Не рекомендуется провоцировать рвоту. Необходимо провести промывание желудка, прием активированного угля (снижает биодоступность оланзапина на 60%), симптоматическое лечение под контролем жизненно важных функций, включая лечение артериальной гипотензии и сосудистого коллапса, поддержание функции дыхания. Не рекомендуется применение эпинефрина, допамина или других симпатомиметиков с бета-адреномиметической активностью, т.к. последние могут усугубить артериальную гипотензию. Для выявления возможных аритмий необходим мониторинг сердечно-сосудистой деятельности. Пациент должен находиться под непрерывным медицинским наблюдением до полного выздоровления.

Применение при беременности и кормлении грудью:

В связи с ограниченным опытом применения препарата у беременных, оланзапин следует применять при беременности, только если ожидаемая польза для матери оправдывает потенциальный риск для плода. Женщины должны быть проинформированы о необходимости сообщить врачу о наступившей или планируемой беременности на фоне терапии оланзапином. Имеются единичные сообщения о треморе, артериальной гипертонии, летаргии и сонливости у детей, рожденных от матерей, принимавших оланзапин в III триместре беременности.

В исследовании было выявлено, что оланзапин выделяется в грудное молоко. Средняя дозировка (мг/кг), получаемая ребенком при достижении равновесной концентрации у матери, составляла 1.8% дозы оланзапина матери (мг/кг). Не рекомендуется кормление грудью на фоне терапии оланзапином.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Оланзапин метаболизируется ферментом CYP1A2, поэтому ингибиторы или индукторы изоферментов цитохрома P450, проявляющих специфическую активность в отношении CYP1A2, могут влиять на фармакокинетические параметры оланзапина.

Индукторы CYP1A2: клиренс оланзапина может быть повышен у курящих пациентов или при одновременном приеме карбамазепина, что приводит к снижению концентрации оланзапина в плазме крови. Рекомендуется клиническое наблюдение, т.к. некоторые случаи требуют повышения дозы препарата.

Ингибиторы CYP1A2: флувоксамин, специфический ингибитор CYP1A2 - значительно снижает клиренс оланзапина. Среднее повышение C_{max} оланзапина после приема флувоксамина у некурящих женщин составило 54%, а у курящих мужчин - 77%. Среднее увеличение AUC оланзапина в этих категориях пациентов составило соответственно 52% и 108%. У пациентов, принимающих флувоксамин или любой другой ингибитор CYP1A2 (например, ципрофлоксацин), терапию оланзапином рекомендуется начинать с меньших доз. Уменьшение дозы оланзапина также может потребоваться в случае присоединения к терапии ингибиторов CYP1A2.

Активированный уголь снижает абсорбцию оланзапина при пероральном приеме на 50-60%, поэтому его следует принимать не менее чем за 2 ч до или после приема оланзапина.

Флуоксетин (ингибитор CYP450), однократная доза магний или алюминийсодержащих антацидов или циметидин не влияют на фармакокинетику оланзапина.

Оланзапин может ослаблять действие прямых и непрямых агонистов допамина.

В условиях in vitro оланзапин не подавляет основные изоферменты CYP450 (например, 1A2, 2D6, 2C9, 2C19, 3A4). In vivo не было обнаружено угнетения метаболизма следующих активных веществ: трициклические антидепрессанты (CYP2D6), варфарин (CYP2C9), теофиллин (CYP1A2) и диазепам (CYP3A4 и 2C19).

Не выявлено взаимодействия при одновременном применении с литием или бипериденом.

Терапевтический мониторинг содержания вальпроевой кислоты в плазме показал, что при одновременном назначении с оланзапином изменений доз вальпроевой кислоты не требуется.

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении других лекарственных средств центрального действия. Несмотря на то, что однократная доза алкоголя (45 мг/70 кг) не оказывает фармакокинетического эффекта, прием алкоголя вместе с оланзапином может сопровождаться усилением депрессивного действия на ЦНС.

Особые указания и меры предосторожности:

Имеются очень редкие сообщения о развитии гипергликемии и/или декомпенсации сахарного диабета, иногда сопровождавшаяся развитием кетоацидоза или кетоацидотическая комы, в т.ч. есть сообщения о нескольких фатальных случаях. В некоторых случаях отмечалось предшествующее декомпенсации увеличение массы тела, которое могло стать предрасполагающим фактором. У пациентов с сахарным диабетом и факторами риска развития этого заболевания рекомендован регулярный клинический контроль и контроль уровня глюкозы крови.

При изменении уровня липидов требуется коррекция терапии.

При резком прекращении приема оланзапина очень редко (менее 0.01%) возможно развитие следующих симптомов: потливость, бессонница, тремор, тревога, тошнота или рвота. При отмене препарата рекомендуется постепенное снижение дозы.

Поскольку клинический опыт применения оланзапина у людей с сопутствующими заболеваниями ограничен, препарат следует с осторожностью назначать пациентам с гиперплазией предстательной железы, паралитической кишечной непроходимостью.

Опыт применения оланзапина у больных с психозами при болезни Паркинсона, вызванных приемом допаминомиметиков. Оланзапин не рекомендован для лечения психозов при болезни Паркинсона, вызванных приемом допаминомиметиков. Усиливаются симптомы паркинсонизма и галлюцинации. При этом оланзапин по эффективности лечения психозов не превосходил плацебо.

Оланзапин не показан для лечения психозов и/или поведенческих расстройств при деменции, в связи с повышенной смертностью и увеличением риска цереброваскулярных нарушений (инсульт, транзиторные ишемические атаки). Увеличение смертности не зависит от дозы оланзапина или длительности терапии. К факторам риска, предрасполагающим к увеличению смертности, относятся: возраст старше 65 лет, дисфагия, седация, недостаточное питание и обезвоживание, заболевания легких (например, пневмония, в т.ч. аспирационная), одновременный прием бензодиазепинов. Тем не менее, повышенная частота смерти в группах оланзапина по сравнению с плацебо не зависела от этих факторов риска

При терапии антипсихотиками улучшение клинического состояния пациента наступает в период от нескольких дней до нескольких недель. В течение этого периода пациент нуждается в тщательном наблюдении.

В начале терапии возможно бессимптомное повышение трансаминаз печени (АЛТ и АСТ). У пациентов с изначально повышенными уровнями АСТ и/или АЛТ, с печеночной недостаточностью и состояниями, потенциально ограничивающими функциональные возможности печени, а также принимающих гепатотоксические лекарственные препараты, следует соблюдать осторожность при назначении оланзапина. При повышении АЛТ и/или АСТ на фоне терапии препаратом рекомендуется медицинское наблюдение за пациентом и, возможно, уменьшение дозы препарата. При диагностировании гепатита (в т.ч. гепатоклеточного, холестатического или смешанного) оланзапин необходимо отменить.

Препарат следует с осторожностью применять у пациентов с лейкопенией и/или нейтропенией любого генеза, миелосупрессией лекарственного генеза, а также на фоне радиационной или химиотерапии, вследствие сопутствующих заболеваний, у пациентов с гиперэозинофильными состояниями или миелопролиферативными заболеваниями. Нейтропения часто отмечалась при одновременном применении оланзапина и вальпроевой кислоты.

ЗНС - потенциально угрожающее жизни состояние, связанное с терапией антипсихотическими средствами (нейролептиками), в т.ч. оланзапином. Клинические проявления ЗНС: лихорадка, ригидность мышц, нарушение сознания, вегетативные нарушения (нестабильный пульс или лабильное артериальное давление, тахикардия, повышенное потоотделение, аритмии). Дополнительные симптомы ЗНС: повышение КФК, миоглобинурия (на фоне рабдомиолиза) и острая почечная недостаточность. При развитии симптомов ЗНС, а также повышении температуры тела без видимых причин, необходимо отменить все нейролептики, в т.ч. оланзапин.

Оланзапин следует осторожно назначать пациентам с судорогами в анамнезе или наличием факторов, снижающих порог судорожной готовности. На фоне приема оланзапина судороги регистрировались редко.

Терапия оланзапином сопровождалась значительно меньшей частотой развития поздней дискинезии, в сравнении с галоперидолом. Риск развития поздней дискинезии повышается при увеличении продолжительности лечения. При появлении признаков этого состояния у пациента, принимающего оланзапин, следует отменить препарат или уменьшить его дозу. Симптомы дискинезии могут временно нарастать после отмены препарата.

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении других лекарственных средств центрального действия и алкоголя.

У пожилых людей нечасто наблюдается постуральная артериальная гипотензия. У пациентов старше 65 лет рекомендуется периодически контролировать АД. Оланзапин следует с осторожностью назначать пациентам с установленным увеличением интервала QT_c, особенно пожилым, с врожденным синдромом удлиненного интервала QT, застойной сердечной недостаточностью, гипертрофией миокарда, гипокалиемией и гипомагниемией.

При приеме оланзапина очень редко (менее 0.01%) зарегистрированы случаи развития тромбоэмболии вен. Причинно-следственная связь между терапией оланзапином и тромбозом вен не установлена. Поскольку у пациентов с шизофренией часто имеются приобретенные факторы риска венозных тромбозов, следует выявлять все возможные другие факторы (например, иммобилизацию) и принимать профилактические меры.

Таблетки Заласта содержат лактозу. Препарат не следует принимать пациентам с редкими наследственными проблемами непереносимости галактозы, дефицитом лактазы lapp или нарушением всасывания глюкозы-галактозы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

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

При нарушениях функции почек

С *осторожностью*: почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью*: печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

У пожилых пациентов снижение начальной дозы (до 5 мг/сут) обычно не рекомендуется, но возможно у пациентов старше 65 лет при наличии факторов риска.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте, при температуре не выше 30°C. Срок годности таблеток 5 мг и 10 мг - 5 лет, таблеток 2.5 мг, 7.5 мг, 15 мг и 20 мг - 3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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