Заласта Ку-Таб



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки диспергируемые в полости рта	**1 таб.**
оланзапин	10 мг

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

Таблетки диспергируемые в полости рта	**1 таб.**
оланзапин	15 мг

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

Таблетки диспергируемые в полости рта	**1 таб.**
оланзапин	20 мг

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

Таблетки диспергируемые в полости рта	**1 таб.**
оланзапин	5 мг

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

Таблетки диспергируемые в полости рта	**1 таб.**
оланзапин	7.5 мг

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Оланзапин - антипсихотическое средство (нейролептик) с широким фармакологическим спектром действия. Антипсихотическое действие обусловлено блокадой дофаминовых D2-рецепторов мезолимбической и мезокортикальной системы; седативное действие - блокадой адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга; противорвотное действие - блокадой дофаминовых D2-рецепторов триггерной зоны рвотного центра; гипотермическое действие - блокадой дофаминовых рецепторов гипоталамуса. Кроме того, оказывает влияние на мускариновые, адренергические, H1-гистаминовые 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

Абсорбция оланзапина высокая, не зависит от приема пищи; время, необходимое для достижения максимальной концентрации препарата в плазме крови (TC

max)после перорального приема - 5-8 ч. Проникает через гистогематические барьеры, в т.ч. гематоэнцефалический барьер (ГЭБ). Метаболизируется в печени, активных метаболитов не образуется, основной циркулирующий метаболит - глюкуронид, не проникает через ГЭБ. 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/час; у лиц моложе 65 лет - 33,8 ч и плазменный клиренс - 18,2 л/час. Плазменный клиренс ниже у больных с печеночной недостаточностью, женщин и некурящих в сравнении с соответствующими группами лиц. Выводится преимущественно почками (60%) в виде метаболитов.

Показания к применению:

— препарат показан для лечения шизофрении.

Заласта Ку-таб эффективно поддерживает улучшение клинической симптоматики при длительном лечении у пациентов с исходной положительной реакцией на препарат.

— препарат Заласта Ку-таб показан для лечения умеренных или тяжелых эпизодов мании.

У пациентов с маниакальными эпизодами при хорошем эффекте терапии оланзапином препарат показан для профилактики рецидивов мании при биполярном расстройстве.

Относится к болезням:

- Биполярное расстройство
- Шизофрения

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к оланзапину или другим компонентам препарата;

— закрытоугольная глаукома;

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

— период лактации.

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 корригированного интервала QT (QTc) 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; фенилкетонурия, иммобилизация, беременность.

Способ применения и дозы:

Таблетки для рассасывания Заласта Ку-таб быстро растворяются в ротовой полости под действием слюны, после чего легко проглатываются. Поскольку таблетки хрупкие, после извлечения из блистера их следует принять незамедлительно. В качестве альтернативы, непосредственно перед приемом таблетку можно растворить в полном стакане воды. Таблетки для рассасывания Заласта Ку-таб биоэквивалентны простым таблеткам Заласта, скорость и степень всасывания, дозы и режим дозирования так же эквивалентны. Заласта Ку-таб могут применяться в качестве альтернативы таблеткам Заласта.

Т.к. пища не влияет на всасывание препарата, таблетки для рассасывания Заласта Ку-таб можно принимать независимо от приема пищи. В случае отмены препарата рекомендуется постепенное снижение дозы.

Шизофрения: рекомендуемая начальная доза препарата - 10 мг в сутки.

Эпизод мании: начальная доза составляет 15 мг в один прием при монотерапии или 10 мг в сутки в составе комбинированной терапии.

Профилактика рецидивов при биполярном расстройстве: рекомендуемая начальная доза препарата в состоянии ремиссии - 10 мг в сутки. Для пациентов, уже получающих препарат Заласта Ку-таб для лечения эпизода мании, поддерживающая терапия проводится в тех же дозах. На фоне терапии препаратом Заласта Ку-таб 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/сутки, 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 часов.

Особые группы пациентов:

У **пожилых пациентов** снижение начальной дозы (до 5 мг в сутки) обычно не рекомендуется, но возможно у пациентов старше 65 лет при наличии факторов риска (см. раздел «Особые указания»).

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 (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами») 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 >1/10000 до < 1/1000

очень редко от < 1/10000, включая отдельные сообщения.

Со стороны центральной (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 (см. раздел «Особые указания»), 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 QTc на ЭКГ (см. раздел «Особые указания»), желудочковая тахикардия/фибрилляция и внезапная смерть (см. раздел «Особые указания»), тромбоэмболии (включая эмболию легочных артерий и тромбоз глубоких вен).

Со стороны ЖКТ: часто - транзиторные антихолинергические эффекты, в т.ч. запоры и сухость во рту; очень редко - панкреатит.

Нарушения метаболизма и питания: очень часто - прибавка веса; часто - повышение аппетита; очень редко - гипергликемия и/или декомпенсация сахарного диабета, иногда проявляющаяся кетоацидозом или комой, включая фатальный исход; гипертритлицеридемия, гиперхолестеринемия, гипотермия.

Гепато-билиарные нарушения: часто - транзиторное, бессимптомное повышение уровня «печеночных» трансаминаз (аланинаминотрансферазы (АЛТ), аспартатаминотрансферазы (АСТ)), особенно в начале лечения (см. «Особые указания»); редко - гепатит (в т.ч. гепатоклеточное, холестатическое или смешанное поражение печени).

Со стороны органов кроветворения и лимфатической системы: часто - зозинофилия; редко - лейкопения; очень редко - тромбоцитопения, нейтропения.

Со стороны органов опорно-двигательного аппарата: очень редко - рабдомиолиз.

Со стороны органов 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 параметры: очень часто - гиперпролактинемия, но клинические проявления (например, гинекомастия, галакторея и увеличение молочных желез) редко. У большинства пациентов уровень пролактина спонтанно нормализовывался без отмены терапии. Нечасто - повышение уровня креатинфосфокиназы (КФК); очень редко - повышение уровня щелочной фосфатазы (ЩФ) и общего билирубина.

У пожилых пациентов с деменцией зарегистрирована в исследованиях большая частота смертей и цереброваскулярных нарушений (инсульт, транзиторные ишемические атаки). Очень частыми у этой категории пациентов были 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 дофамина) 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, повышения аппетита и прибавки веса. Также часто регистрировались нарушения речи (от 1 до 10%). В первые 6 недель комбинированной терапии с литием увеличивается частота развития прибавки веса. 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, артериальная гипертензия или гипотензия, 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 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 третьем 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:

Потенциальные лекарственные взаимодействия, влияющие на метаболизм оланзапина: 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 площади под кривой 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.

Лекарственные взаимодействия, влияющие/не влияющие на биодоступность оланзапина: активированный уголь снижает абсорбцию оланзапина при пероральном приеме на 50-60%, поэтому его следует принимать не менее чем за 2 часа до или после приема оланзапина.

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

Потенциальная способность оланзапина влиять на другие лекарственные средства

Оланзапин может ослаблять действие прямых и непрямых агонистов дофамина. 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 за содержанием вальпроевой кислоты в плазме показал, что при одновременном назначении с оланзапином изменений доз вальпроевой кислоты не требуется (см. раздел «Побочное действие»).

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 сопровождавшиеся развитием кетоацидоза или кетоацидотической комы, в том числе есть сообщения о нескольких фатальных случаях. В некоторых случаях отмечалось предшествующее декомпенсации увеличение массы тела, которое могло стать предрасполагающим фактором. Пациентам, страдающим сахарным диабетом, или с 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.

Антихолинергическая активность. 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 дофаминомиметиков. Оланзапин не рекомендован для лечения психозов при болезни Паркинсона, вызванных приемом дофаминомиметиков. 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.

Нарушения функции печени. 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 том числе гепатоклеточного, холестатического или смешанного) оланзапин необходимо отменить.

Гематологические изменения. 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 (см. раздел «Побочное действие»).

Злокачественный нейролептический синдром (ЗНС). 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.

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

Поздняя дискинезия. 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.

Общая активность в отношении ЦНС. Следует соблюдать осторожность при одновременном применении других лекарственных средств центрального действия и алкоголя.

Цереброваскулярные нежелательные явления, включая инсульт у пожилых пациентов с деменцией. 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 QTc, 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 Ку-таб содержат аспартам - источник фенилаланина. Препарат может быть небезопасен для людей, страдающих фенилкетонурией.

Влияние на способность управлять автомобилем и другими механическими средствами:

Поскольку оланзапин может вызывать сонливость и головокружение, пациентам следует проявлять осторожность при работе с техническими устройствами, в т.ч. при управлении автомобилем.

При нарушениях функции почек

Принимать с осторожностью пациентам, страдающим почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

Принимать с осторожностью пациентам, страдающим печеночной недостаточностью.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Хранить при температуре не выше 25°C, в оригинальной упаковке. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Zalasta_Ku-Tab