



ИНСТРУКЦИЯ

(информация для специалистов)

по медицинскому применению лекарственного средства

КЕТОТИФЕН

Торговое название: Кетотифен.

Международное непатентованное название: Ketotifen.

Форма выпуска: таблетки.

Описание: таблетки белого или почти белого цвета, двояковыпуклые.

Состав: каждая таблетка содержит: *активное вещество* – кетотифен (в виде кетотифена фумарата) – 1 мг; *вспомогательные вещества* – целлюлоза микрокристаллическая, кроскармеллоза натрия, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный, лактоза моногидрат.

Фармакотерапевтическая группа: Антигистаминные средства для системного применения.

Код АТС: R06AX17.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Фармакологическое действие – мембраностабилизирующее, противоаллергическое, антигистаминное, противоастматическое. Тормозит высвобождение гистамина и других медиаторов (таких как медленно реагирующая субстанция анафилаксии, лимфокины) из тучных клеток и базофилов. Неконкурентно блокирует H_1 -гистаминовые рецепторы, ингибирует фосфодиэстеразу, повышает уровень циклического аденозинмонофосфата в клетках, блокирует кальциевые каналы клеток, является функциональным антагонистом лейкотриенов. Подавляет сенсibilизацию эозинофилов цитокинами, препятствует эозинофильной инфильтрации в местах аллергического воспаления в дыхательных путях. Предотвращает развитие симптомов гиперреактивности дыхательных путей, обусловленной фактором активации тромбоцитов или воздействием аллергенов. Предупреждает развитие бронхоспазма (не оказывает бронхорасширяющего действия). Оказывает угнетающее действие на центральную нервную систему.

Фармакокинетика

Всасываемость – практически полная, биодоступность – около 50% (из-за наличия эффекта «первого прохождения» через печень). Одновременный прием пищи не влияет на степень абсорбции (биодоступность) кетотифена. Время достижения максимальной концентрации в плазме – 2-4 ч, связь с белками плазмы – 75%. Проходит через гематоэнцефалический барьер. Проникает в грудное молоко. Метаболизируется в печени. Выводится почками в виде метаболитов (главный метаболит – кетотифен N-глюкуронид фармакологически неактивен). В течение 48 ч почками выводится основная часть принятой дозы (1% – в неизмененном виде и 60-70% – в виде метаболитов). Выведение – двухфазное: время полувыведения первой фазы – 3-5 ч, второй – 21 ч.

Особенности фармакокинетики у детей. Метаболизм кетотифена у детей такой же, как у взрослых, но клиренс выше у детей. Поэтому для детей старше 3 лет требуется такая же суточная доза, как и для взрослых.

Особенности фармакокинетики у пациентов с нарушениями функции печени. Специальных исследований фармакокинетики кетотифена у данной группы лиц не проводилось. Поскольку кетотифен метаболизируется в печени путем глюкуронирования, у лиц с тяжелыми нарушениями функции печени возможно замедление метаболизма и повышение концентрации кетотифена в крови.

Особенности фармакокинетики у пациентов с нарушениями функции почек. Специальных исследований фармакокинетики кетотифена у данной группы лиц не проводилось. Учитывая, что 60-70% препарата выводится с мочой в виде метаболитов, тяжелые нарушения функции почек могут сопровождаться увеличением концентрации метаболитов в крови и возрастанием риска развития их нежелательных эффектов.

Показания к применению

Профилактика и лечение мультисистемных аллергических заболеваний:

- хроническая идиопатическая крапивница (например, холодовая крапивница);
- аллергический ринит с сопутствующей бронхиальной астмой или без нее;
- аллергический конъюнктивит;
- атопический дерматит.

Применение Кетотифена не заменяет лечения кортикостероидами (ингаляционными или системными), если кортикостероиды показаны для лечения бронхиальной астмы.

Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь во время еды.

Взрослым назначают по 1 мг (1 таблетка) два раза в день (утром и вечером).

У пациентов, склонных к седации, рекомендуется медленное повышение дозы в течение первой недели. Рекомендуется начинать прием по 1 таблетке один раз в день вечером и увеличивать дозу в течение 5 дней до полной суточной дозы. При необходимости суточную дозу можно увеличить до 4 мг (4 таблетки) и разделить на два приема. При использовании более высоких доз можно ожидать более быстрого наступления эффекта.

Детям в возрасте старше 3 лет назначают по 1 мг (1 таблетка) два раза в день (утром и вечером). Учитывая, что при исследовании фармакокинетики была установлена высокая скорость метаболизма кетотифена, у детей может потребоваться назначение более высоких доз лекарственного средства в пересчете на килограмм массы тела для достижения оптимального эффекта. При этом переносимость таких доз остается хорошей.

Одновременный прием бронхолитиков. При приеме кетотифена частота приема бронхолитических средств может быть снижена.

Применение у пожилых людей. При назначении кетотифена пожилым лицам коррекции дозы не требуется.

Продолжительность терапии

Для достижения полного терапевтического эффекта кетотифена требуется несколько недель. В случае, если в течение нескольких недель у пациента не отмечена реакция на прием кетотифена, его дальнейшее применение для достижения стойкого эффекта должно продолжаться не менее 2-3 месяцев. Отмена кетотифена должна проводиться постепенно в течение 2-4 недель, при этом возможно обострение симптомов аллергического заболевания.

Побочное действие

Частота развития побочных эффектов приведена в следующей градации: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); неизвестно (по имеющимся данным определить частоту встречаемости не представляется возможным).

Со стороны центральной нервной системы: нечасто – головокружение, замедление скорости реакции (исчезают через несколько дней терапии), седативный эффект,

ощущение усталости; редко – беспокойство, нарушения сна, нервозность (особенно у детей); неизвестно – судороги, сонливость, головная боль.

Со стороны иммунной системы: очень редко – мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, тяжелые кожные реакции.

Со стороны кожи: неизвестно – сыпь, крапивница.

Со стороны системы кроветворения: очень редко – тромбоцитопения.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто – повышение аппетита, сухость слизистой оболочки полости рта; редко – диспептические явления; неизвестно – тошнота, рвота, запоры, диарея.

Со стороны печени: очень редко – гепатит, повышение уровня печеночных ферментов.

Со стороны обмена веществ: редко – увеличение веса.

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто – дизурия, цистит.

Противопоказания

Гиперчувствительность к любому из компонентов препарата, беременность, период лактации (при необходимости применения препарата следует прекратить грудное вскармливание), детский возраст до 3 лет, эпилепсия и судороги в анамнезе.

С осторожностью: печеночная недостаточность.

Передозировка

Симптомы: сонливость, нистагм, спутанность сознания, дезориентация, бради- или тахикардия, снижение артериального давления, одышка, цианоз, судороги, повышенная возбудимость (особенно у детей), возможно развитие комы.

Лечение: индукция рвоты, промывание желудка (если прошло немного времени с момента приема), назначение активированного угля, солевых слабительных; симптоматическое лечение, при развитии судорожного синдрома – барбитураты короткого действия и бензодиазепины. Диализ неэффективен.

Меры предосторожности

Нежелательна резкая отмена предшествовавшего лечения бета-адреностимуляторами, глюкокортикостероидами, препаратами адренокортикотропного гормона у больных бронхиальной астмой и бронхоспастическим синдромом после присоединения к терапии кетотифена, отмену проводят в течение минимум 2 недель, постепенно снижая дозы.

Лечение прекращают постепенно, в течение 2-4 недель (возможен рецидив астматических симптомов).

Лицам, чувствительным к седативному действию, в первые 2 недели препарат назначают малыми дозами.

Не предназначен для купирования приступа бронхиальной астмы.

У пациентов, одновременно получающих пероральные гипогликемические лекарственные средства, следует контролировать число тромбоцитов в периферической крови.

Во время лечения кетотифеном крайне редко возможно возникновение судорог. Поскольку кетотифен может снизить порог судорожной готовности, он противопоказан пациентам с эпилепсией (см. раздел «Противопоказания»).

У пациентов с хронической идиопатической крапивницей не проводилось исследований эффективности и длительного (свыше 4 недель) приема кетотифена.

В случае интеркуррентных инфекций терапия кетотифеном должна быть дополнена антибактериальным лечением.

Таблетки Кетотифен содержат лактозу. Пациентам с редкой наследственной непереносимостью галактозы, тяжелой недостаточностью лактазы или мальабсорбцией глюкозо-галактозы не следует принимать кетотифен.

Применение во время беременности и в период лактации. Хотя нет никаких доказательств тератогенного эффекта, принимать кетотифен во время беременности не рекомендуется. Кетотифен выделяется с грудным молоком, поэтому матери, получающие кетотифен, не должны кормить ребенка грудью.

Влияние на способность к управлению автотранспортом и другими потенциально опасными механизмами. Кетотифен может ослабить ответную реакцию пациента. В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Усиливает действие седативных, снотворных, антигистаминных лекарственных средств, этанола.

При совместном приеме кетотифена и пероральных гипогликемических лекарственных средств необходимо контролировать содержание тромбоцитов в связи с увеличением вероятности развития тромбоцитопении.

Условия хранения

В защищенном от влаги и света месте при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Упаковка

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой. По одной, три контурных упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку.

Условия отпуска

Без рецепта.

Производитель:

РУП "Белмедпрепараты",
Республика Беларусь, 220007, г. Минск,
ул. Фабрициуса, 30, т./ф.: (+375 17) 220 37 16,
e-mail: medic@belmedpreparaty.com

