

І Н С Т Р У К Ц І Я

для медичного застосування препарату

КЕТОТИФЕН СОФАРМА (KETOTIFEN SOPHARMA)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: кетотифен; 10-Н-бензо[4,5] циклогепта [1,2-*b*] тіофен-10-он 4,9-дигідро-4-(1-метил-4-піперидиніліден)-гідрофумарат;

основні фізико-хімічні властивості: круглі плоскі таблетки з фаскою, з розподільною рискою з одного боку, діаметром 7 мм, від білого до білого з сірим відтінком кольору;

склад: 1 таблетка містить кетотифену гідрофумарату 1,38 мг, еквівалентного 1 мг кетотифену;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, кальцію гідрофосфат безводний, крохмаль пшеничний, магнію стеарат.

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування. Код АТС R06AX17.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.* Кетотифен належить до групи циклогептатіофенонів і має виражений антигістамінний ефект. Він належить до групи небронходилатуючих протиастматичних засобів. Механізм його дії пов'язаний з гальмуванням вивільнення гістаміну та інших медіаторів з опасистих клітин, з блокуванням гістамінних Н₁-рецепторів і пригніченням ферменту фосфодіестерази, у результаті чого підвищується рівень цАМФ в опасистих клітинах. Пригнічує ефекти ТАФ (тромбоцито-активуючого фактора). При самостійному застосуванні не купірує напади бронхіальної астми, а попереджує їх появу і призводить до скорочення їх тривалості та інтенсивності, при чому у деяких випадках вони повністю зникають.

Фармакокінетика. Резорбція: характеризується майже повною резорбцією зі шлунково-кишкового тракту. Максимальний плазмовий рівень досягається через 2 – 4 години. Рівноважний стан досягається після прийому мінімальної добової дози, яка складає 2 мг.

Розподілення: зв'язується з плазмовими білками приблизно на 75 %. Об'єм розподілу – 2,7 л/кг.

Метаболізм: близько 60 % прийнятої дози метаболізується в печінці трьома шляхами: деметилування, N-окислення, N-глюкурокон'югація, до таких метаболітів: кетотифен- N-глюкуронід (фармакологічно неактивний), нор-кетотифен (з фармакологічною активністю, подібною до активності незміненого кетотифену), N-оксид кетотифен і 10-гідрокси кетотифен (з невідомою фармакологічною активністю).

Екскреція: на 70 % елімінується через нирки у вигляді неактивних метаболітів і на 0,8 % – у незміненому вигляді. При елімінації період напіввиведення з плазми кетотифену становить близько 21 години.

Показання для застосування.

Як додатковий засіб при тривалому лікуванні атопічної бронхіальної астми.

При симптоматичному лікуванні алергічних станів, включаючи алергічний риніт і кон'юнктивіт.

Спосіб застосування та дози. Таблетки приймають внутрішньо під час їжі, запиваючи водою.

Дозування:

Дорослі: по 1 таблетці (1 мг) 2 рази на день, вранці та ввечері, під час їжі. Для пацієнтів, у яких спостерігається значний седативний ефект, рекомендується повільне підвищення дози протягом першого тижня, починаючи з 0,5 мг ввечері перед сном до поступового досягнення терапевтичної дози.

Діти, старше 3 років: по 1 таблетці (1 мг) 2 рази на день, вранці та ввечері, під час їжі.

Діти віком від 6 місяців до 3 років: препарат у формі таблеток не призначають дітям до 3-річного віку. Рекомендується лікування кетотифен сиропом.

Тривалість лікування

Лікування є тривалим, причому терапевтичний ефект досягається після декількох тижнів терапії. Лікування має тривати не менше 2-3 місяців, особливо у пацієнтів, у яких не спостерігалось покращання самопочуття у перші тижні.

Припинення терапії

Припинити лікування кетотифеном слід поступово, протягом 2 - 4 тижнів, щоб уникнути ризику рецидивів астматичних симптомів.

Побічна дія. Під час лікування кетотифеном можливе виникнення таких побічних реакцій: найчастіше – сонливість, сухість у роті, запаморочення, відчуття стомлюваності, нудота, блювання, біль у животі, констипація, які звичайно спонтанно зникають під час лікування. Можливе збільшення ваги через підвищення апетиту. Зрідка спостерігаються: підвищена чутливість, симптоми збудження, роздратованість, безсоння і неспокій, судоми, особливо у дітей. Дуже рідко: цистит, темна сеча, гепатит, підвищення показників рівня ферментів печінки, жовтяниця.

У поодиноких випадках повідомляється про складні реакції шкіри – мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона.

Протипоказання. Підвищена чутливість до діючої або допоміжних речовин препарату.

Перший триместр вагітності, період годування груддю.

Передозування. Симптоми передозування: сонливість, запаморочення, гіпотензія, нудота, блювання, а у дітей можлива поява судом.

Лікування передозування: загальні заходи для усунення нерезорбованої кількості лікарського засобу (промивання шлунка), форсований діурез і симптоматичні засоби.

Особливості застосування. Кетотифен не застосовують для купірування астматичних нападів.

На початку лікування кетотифеном не можна раптово припинити лікування іншими протиастматичними препаратами, особливо системними кортикостероїдами. У пацієнтів із стероїдною залежністю може спостерігатись розвиток надниркової залозної недостатності.

У випадку інтеркурентної інфекції необхідно проводити специфічну протиінфекційну терапію.

Кетотифен знижує судомний поріг, тому його слід призначати з особливою обережністю пацієнтам з анамнестичними даними про судоми.

Допоміжна речовина – пшеничний крохмаль – може бути небезпечною для пацієнтів з целиакією (глютеновою ентеропатією).

Вагітність і годування груддю.

Під час досліджень на тваринах не встановлено ембріотоксичної і тератогенної дії кетотифену. Контрольовані клінічні дослідження вагітних жінок не проводились. У період вагітності кетотифен слід призначати лише після суворої оцінки наявності прямих показань, у випадках, коли очікувана користь від лікування перевищує потенційний ризик для плоду.

Кетотифен проникає в молоко матері. Тому жінкам у період лактації слід припинити годування груддю.

Керування автомобілем і робота з автоматизованими механізмами.

На початку лікування препарат Кетотифен Софарма може уповільнити швидкість реакцій, що вимагає від хворого підвищеної обережності під час керування транспортними засобами та роботи з автоматизованими механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. При одночасному застосуванні кетотифену і пероральних протидіабетичних засобів існує ризик розвитку оборотної тромбоцитопенії. Таким хворим рекомендується слідкувати за кількістю тромбоцитів.

При одночасному застосуванні атропіну, засобів з атропіноподібною дією і кетотифену, підвищується ризик виникнення побічних дій, таких як затримка сечі, констипація, сухість у роті.

Кетотифен може потенціювати ефекти інших лікарських засобів, які пригнічують центральну нервову систему (седативні, снодійні).

Одночасне застосування кетотифену з іншими антигістамінними засобами може призвести до взаємного потенціювання їхніх ефектів.

Під час лікування кетотифеном не слід вживати алкоголь, оскільки він посилює депресивний ефект кетотифену на центральну нервову систему.

Умови та термін зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці, у недоступному для дітей, сухому і захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С. Термін придатності – 4 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. 10 (десять) таблеток у блистері зеленої ПВХ/алюмінієвої фольги, по 3 (три) блистери в картонній коробці.

Виробник. АТ „Софарма”.

Адреса. Болгарія, 1220, м. Софія, Ілієнське шосе, 16.