ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

КЕТОТИФЕН

Склад:

діюча речовина: ketotifen;

1 таблетка містить кетотифену фумарат у перерахуванні на кетотифен 1 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, магнію стеарат, тальк, кремнію діоксид колоїдний безводний.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого зі злегка сіруватим відтінком кольору.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні препарати для системного застосування. Код АТХ R06A X17.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Кетотифен належить до групи циклогептотіофенонів і має виражений антигістамінний ефект. Він належить до групи небронходилатуючих протиастматичних засобів. Механізм його дії пов'язаний з гальмуванням вивільнення гістаміну та інших медіаторів мастацитами, з блокуванням гістамінових H_1-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 цьому у деяких випадках вони повністю зникають.

Фармакокінетика. Майже повністю всмоктується з травного тракту. Максимальний плазмовий рівень досягається через 2-4 години. Рівноважний стан досягається після прийому мінімальної добової дози, яка становить 2 мг. Зв'язується з білками плазми крові приблизно на 75 %.

Об'єм розподілу – 2,7 л/кг.

Близько 60 % прийнятої дози метаболізується у печінці трьома шляхами (деметилювання, N-окислення, N-глюкурокон'югація) до таких метаболітів: кетотифен-N-глюкуронід (фармакологічно неактивний), норкетотифен (з фармакологічною активністю, подібною до активності незміненого кетотифену), N-оксид кетотифен і 10-гідроксикетотифен (з невідомою

фармакологічною активністю).

Виводиться біфазно, з коротким періодом напіввиведення від 3 до 5 годин і тривалішим – 21 година. Близько 1 % виділяється у незміненому стані з сечею протягом 48 годин, 60-70 % – у формі метаболітів.

Клінічні характеристики.

Показання. Профілактичне лікування бронхіальної астми, особливо атопічної.

Симптоматичне лікування алергічних станів, включаючи алергічний риніт і кон'юнктивіт.

Протипоказання. Підвищена чутливість до кетотифену або до інших компонентів препарату.

Уникати одночасного застосування кетотифену і пероральних протидіабетичних засобів (ризик розвитку оборотної тромбоцитопенії) до того часу, поки цей феномен не буде достатньо вивчений.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. При одночасному застосуванні кетотифену і пероральних протидіабетичних засобів існує ризик розвитку оборотної тромбоцитопенії, тому такої комбінації лікарських засобів слід уникати.

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.

Етанол посилює депресивний ефект кетотифену на центральну нервову систему.

Особливості застосування. Препарат неефективний при лікуванні гострої алергічної реакції та нападів ядухи при астмі.

Максимальний терапевтичний ефект препарату настає після кількох тижнів систематичного прийому.

Нормалізація функції гіпофіз-надниркововозалозної системи може тривати до 1 року. Тому у перші тижні застосування кетотифену попереднє лікування рекомендується

продовжувати і відміняти його поступово та тривалий час.

На початку тривалого лікування кетотифеном не можна раптово припиняти лікування іншими протиастматичними препаратами, особливо кортикостероїдами. У пацієнтів зі стероїдною залежністю може спостерігатися розвиток адренокортикальної недостатності.

У випадку інтеркурентної інфекції необхідно проводити специфічну протиінфекційну терапію.

У дуже рідкісних випадках під час лікування кетотифеном є повідомлення про появу судом. Оскільки кетотифен знижує судомний поріг, його слід застосовувати з особливою обережністю пацієнтам з судомами в анамнезі. При лікуванні препаратом необхідно перебувати під наглядом лікаря, враховуючи можливість виникнення судом.

Кетотифен слід обережно призначати пацієнтам з епілепсією в анамнезі через можливість зниження судомного порога при лікуванні препаратом.

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

Слід припинити прийом препарату за 10-14 днів до проведення шкірних тестів для визначення алергії.

Якщо необхідно припинити лікування кетотифеном, дозу поступово слід зменшувати протягом 2-4 тижнів, щоб запобігти повторному виникненню симптомів астми.

Слід додержуватися обережності при застосуванні кетотифену пацієнтам із порушенням функції печінки.

Враховуючи, що одночасне застосування з пероральними гіпоглікемічними препаратами може спричинити тромбоцитопенію, слід уникати такої комбінації препаратів або ретельно контролювати рівень тромбоцитів, якщо рекомендовано саме таке лікування.

Якщо у пацієнта встановлена непереносимість деяких цукрів, необхідно проконсультуватися з лікарем, перш ніж приймати цей лікарський засіб.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Хоча немає ніяких доказів будь-якої тератогенної дії, рекомендації для застосування препарату у період вагітності не можуть бути надані. Кетотифен проникає у грудне молоко, тому матерям, які отримують препарат, не слід годувати груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. На початку лікування препарат може уповільнити швидкість реакцій, що вимагає від хворого підвищеної обережності під час керування транспортними засобами та роботи з автоматизованими механізмами.

Спосіб застосування та дози. Таблетки приймати внутрішньо під час їди, запиваючи водою.

Дозування. Дорослим: по 1 таблетці (1 мг) 2 рази на добу, вранці та ввечері під час їди. Пацієнтам, у яких спостерігається значний седативний ефект, що настає у перші дні застосування препарату, слід приймати Кетотифен по 1 таблетці на добу тільки ввечері.

У разі необхідності добову дозу можна збільшити до 4 мг, тобто по 2 таблетки 2 рази на добу. При застосуванні більш високої дози можна очікувати швидшого настання терапевтичного ефекту.

Діти віком від 3 років: по 1 таблетці (1 мг) 2 рази на добу, вранці та ввечері, під час їди.

Пацієнти літнього віку: немає особливих рекомендацій для пацієнтів літнього віку.

Тривалість лікування. Лікування є тривалим, при цьому терапевтичний ефект отримується після кількох тижнів терапії. Лікування має тривати не менше 2-3 місяців, особливо у пацієнтів, у яких не спостерігалося покращання самопочуття у перші тижні.

Супроводжувальна бронходилататорна терапія: застосування кетотифену одночасно із бронходилататорами може зменшити частоту застосування бронходилататорів.

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

Діти. Застосовувати дітям віком від 3 років.

Результати клінічних спостережень підтверджують фармакокінетичні особливості кетотифену і показують, що дітям може бути необхідною більш висока доза у мг/кг, ніж дорослим пацієнтам. Більш високі дози переносяться так само добре, як і низькі.

Передозування. *Симптоми:* можливі значні порушення психомоторної реакції, сонливість до вираженої седації, головний біль, дезорієнтація, тахікардія, зниження артеріального тиску, кома (особливо у дітей), симптоми збудження нервової системи, у тому числі судоми.

Також спостерігаються брадикардія, аритмія, пригнічення функції центру дихання, ністагм.

У випадку виникнення вищезазначених симптомів пацієнта слід ретельно обстежити.

Лікування: загальні заходи для усунення нерезорбованої кількості лікарського засобу з травного тракту: викликати блювання, промити шлунок. Застосування активованого вугілля може мати сприятливу дію. У разі необхідності рекомендується проведення симптоматичного лікування і моніторинг серцево-судинної та дихальної систем. При станах збудження можна застосовувати барбітурати короткої дії або бензодіазепини.

Побічні реакції. *Інфекції та інвазії:* цистит.

З боку імунної системи: шкірні висипання, тяжкі шкірні реакції, мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона.

Метаболічні порушення: збільшення маси тіла через підвищення апетиту.

Психічні порушення: психомоторне збудження, дратівливість, безсоння, неспокій, нервозність, дезорієнтація, сонливість.

З боку нервової системи: запаморочення, седативний ефект, судоми.

З боку травного тракту: сухість у роті, біль у шлунку, запор, нудота, блювання, диспептичні розлади.

З боку гепатобіліарної системи: підвищення рівня печінкових ферментів, гепатит.

З боку сечовидільної системи: дизурія.

На початку лікування можуть з’явитися сухість у роті і запаморочення, але вони зазвичай проходять спонтанно у ході лікування. Рідко спостерігаються симптоми стимуляції ЦНС, такі як збудження, дратівливість, безсоння і занепокоєння, особливо у дітей.

Термін придатності. 4 роки.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °С в оригінальній упаковці.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. Таблетки № 30 у контейнерах; № 10×3 у блістерах у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Товариство з обмеженою відповідальністю «Дослідний завод «ГНЦЛС», або

ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ «КОРПОРАЦІЯ «ЗДОРОВ’Я», або

Товариство з обмеженою відповідальністю «ФАРМЕКС ГРУП».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, Харківська обл., місто Харків, вулиця Воробйова, будинок 8.

(Товариство з обмеженою відповідальністю «Дослідний завод «ГНЦЛС»)

Україна, 61013, Харківська обл., місто Харків, вулиця Шевченка, будинок 22.

(ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ «КОРПОРАЦІЯ «ЗДОРОВ'Я»)

Україна, 08301, Київська обл., м. Бориспіль, вул. Шевченка, буд. 100.

(Товариство з обмеженою відповідальністю «ФАРМЕКС ГРУП»)