
Состав и форма выпуска

Таблетки розового цвета с гравировкой "A-008" и "10" на одной стороне.

1 таблетка содержит:

Активное вещество: арипипразол 10 мг.

Вспомогательные компоненты:

Для всех дозировок: крахмал кукурузный, моногидрат лактозы, стеарат магния, гидроксипропилцеллюлоза, микрокристаллическая целлюлоза, оксид железа красный.

Фармакологическое действие

Абилифай – нейролептический препарат. В состав препарата Абилифай входит арипипразол – вещество, обладающее высокой аффинностью к D3- и D2-дофаминовым рецепторам, серотониновым рецепторам 5HT1a и 5HT2a, а также умеренной аффинностью к серотониновым рецепторам 5HT2c и 5HT7, D4-дофаминовым рецепторам, H1 рецепторам гистамина и альфа1-адренорецепторам (согласно исследованиям in vitro).

Терапевтический эффект препарата Абилифай при шизофрении реализуется за счет агонистического влияния арипипразола на 5HT1a рецепторы серотонина и D2-дофаминовые рецепторы, а также антагонистического влияния на 5HT2 рецепторы серотонина. Некоторые эффекты арипипразола реализуются за счет сродства не только к дофаминовым и серотониновым рецепторам.

Также для препарата характерна некоторая аффинность к участкам, регулирующим обратный захват серотонина. Арипипразол не имеет сродства к мускариновым рецепторам.

В ходе экспериментов на животных установлен агонизм препарата к дофаминергической гипоактивности и антагонизм к дофаминергической гиперактивности.

Фармакокинетический профиль таблеток Абилифай:

В ЖКТ арипипразол хорошо всасывается и достигает пиковых уровней в сыворотке за 3-5 часов. Показатель абсолютной биодоступности – 87% (вне зависимости от пищи). Порядка 99% арипипразола участвуют в связи с белками сыворотки, пресистемный метаболизм выражен слабо, превращение происходит в печени при участии CYP2 D6 и CYP3 A4 с образованием активного производного.

Равновесные уровни действующего вещества и его активного производного в сыворотке устанавливаются на 14 день, после достижения равновесных концентраций практически не

отмечается суточных колебаний уровня препарата. При многократном приеме кумуляция предсказуема.

Среднее время полувыведения – 75 часов.

Экскреция с мочой и калом составляет 27% и 60% соответственно, при этом в неизменном виде выводится не более 1% и 18% соответственно (согласно данным исследований с использованием меченого арипипразола). Общий клиренс вещества 0,7 мл/мин/кг (в основном за счет выведения тканями печени).

Показания к применению

Абилифай применяют в терапии пациентов с приступами (острыми) шизофрении. Препарат также может применяться для поддерживающего лечения у лиц с шизофренией.

Таблетки Абилифай могут быть рекомендованы для лечения острых форм маниакальных эпизодов, развившихся при биполярном расстройстве первого типа. Также Абилифай может использоваться как поддерживающее лечение при биполярном расстройстве первого типа после перенесенного смешанного или маниакального эпизода.

Способ применения

Абилифай принимают перорально, вне зависимости от пищи. В связи с возможными нарушениями памяти, рекомендуется контролировать прием препарата Абилифай пациентом.

Дозирование определяют в зависимости от характера заболевания, сопутствующих заболеваний и проводимой терапии. Пациентам, которым более 65 лет, а также пациентам с нарушенными функциями печени и почек коррекция дозы не требуется.

Дозирование при шизофрении:

Абилифай назначают в начальном количестве 10-15 мг/сутки (принимают арипипразол 1 раз в сутки). Поддерживающая (средняя) доза - 15 мг/сутки. Доза может быть скорректирована врачом, в клинических исследованиях подтверждена эффективность арипипразола в диапазоне доз 10-30 мг/сутки.

Дозирование при маниакальных эпизодах на фоне биполярных расстройств:

Абилифай назначают в начальной дозе 15-30 мг/сутки (принимают арипипразол 1 раз в сутки). Изменение дозы можно проводить с интервалами от 24 часов. Доза может титроваться врачом, в исследованиях подтверждена эффективность в пределах доз 15-30 мг/сутки при курсовом приеме продолжительностью 3-12 недель. Эффективность и безопасность доз свыше 30 мг/сутки не оценивалась в клинических исследованиях.

Если у пациентов с биполярным расстройством первого типа, а также смешанными эпизодами или маниакальными эпизодами на фоне 6 недельного курса приема препарата Абилифай (15-30 мг/сутки) не отмечалось симптомов, такую поддерживающую терапию считают эффективной. Необходимо периодически проводить диагностику для определения

целесообразности дальнейшей поддерживающей терапии.

Побочные действия

При терапии таблетками Абилифай возможно такое нежелательное влияние на:

ССС: тахикардия или брадикардия, гипотензия (в том числе ортостатическая), атриовентрикулярная блокада, ишемия сердечной мышцы, флебит, экстрасистола, ощущение сердцебиения, увеличение QT-интервала, кровоизлияния, недостаточность сердца, тромбоз глубоких вен, фибрилляция предсердий, остановка сердца. В редких случаях: потеря сознания, ишемия головного мозга, трепетание предсердий, вазовагальный синдром, тромбофлебит.

ЖКТ: изменение аппетита, затруднение глотания, кариес, метеоризм, гастрит, гастроэнтерит, гастроэзофагеальный рефлюкс, гингивит, кровотечения ЖКТ, геморрой, слабость анального сфинктера, колит, стоматит, изъязвление слизистых, оральная кандидоз, отрыжка, отек языка, фекалома, желчнокаменная болезнь, холецистит, рвота, нарушения стула. В редких случаях: повышенная активность АЛТ и АСТ, панкреатит, эзофагит, рвота с кровью, кровоточивость десен, хейлит, перфорация стенки ЖКТ, увеличение печени, гепатит.

Опорно-двигательную систему: рабдомиолиз, увеличение активности креатинфосфокиназы, ревматоидный артрит, тендинит, артрит, тендобурсит, миопатия, боль в мышцах, мышечная слабость, судороги и подергивания мышц, боль в костях и суставах.

ЦНС: экстрапирамидные состояния, головокружение, нарушение психомоторной активности, нервозность, депрессивные состояния, тремор, гиперсаливация, маниакальные и суицидальные мысли, нарушения походки, спутанность сознания, враждебность, бессонница, акатизия, сонливость. В редких случаях: галлюцинации, буккогlossальный синдром, эйфория, снижение рефлексов, навязчивые мысли, дистония, нейролептический злокачественный синдром, парестезии, снижение памяти и концентрации, изменения либидо, ступор, амнезия, гиперактивность, панические реакции. Кроме того, возможно появление синдрома беспокойных ног, деперсонализации, гиперрефлексии, миоклонуса, повышения чувствительности к раздражителям.

Дыхательную систему: одышка, бронхоспазм, носовое кровотечение, ларингит, икота, пневмония. В редких случаях: кашель с кровью, усиление выделения мокроты, аспирационная пневмония, сухость слизистой носа, гипоксия, легочная эмболия, недостаточность дыхания, отек легких, апноэ.

Органы чувств: боль в ушах, конъюнктивит, слезотечение, изменение вкуса, отит, катаракта, боль в глазах, частое моргание, глухота, глазные кровоизлияния, диплопия, звон в ушах, светобоязнь.

Мочеполовую систему: лейкорей, нарушения мочеиспускания, гематурия, цистит, задержка мочеиспускания, аменорея, дизурия, влагалищные кровотечения, преждевременная эякуляция, кандидоз, меноррагия, камни в почках, почечная недостаточность, полиурия,

никтурия, недержание мочи. В редких случаях: цервицит, боль в молочных железах, аноргазмия, галакторея, жжение в области внешних половых органов, болезненная эрекция, гинекомастия, гликозурия, мочекаменная болезнь.

Реакции аллергического характера: крапивница, макулопапулезная сыпь, экзема, эксфолиативный дерматит, зуд, гипергидроз, сухость кожи, облысение, акне, везикулобуллезная сыпь, себорея, псориаз, анафилаксия, отек Квинке.

Прочие негативные явления: импотенция, гриппоподобный синдром, боль в шее и груди, скованность в горле, вздутие живота, слабость, скованность челюстей, головная боль, боль в районе таза, периферические отеки, отечность лица, напряжение в груди. Кроме того, возможны гипергликемия или гипогликемия, гиперлипидемия, гипербилирубинемия, гиперкреатининемия, гиперурикемия, гиперхолестеринемия, увеличение или снижения уровня калия и натрия в сыворотке, получение кислой пробы мочи.

Регистрировалось также развитие подагры, цианоза, обезвоживания, жажды, железодефицитной анемии, ожирения.

Отдельные негативные явления на фоне терапии:

Суицидальные попытки:

Мысли о суициде и суицидальные попытки характерны для пациентов с психозами, при терапии таких пациентов рекомендуется использовать минимальные дозы арипипразола и контролировать состояние и поведение пациента. Медикаментозную терапию следует проводить одновременно с психотерапией.

Поздняя дискинезия:

При увеличении продолжительности терапии нейролептиками повышается риск появления поздней дискинезии. При появлении симптомов данного состояния необходимо снизить дозу арипипразола или отменить его прием. После отмены препарата Абилифай существует вероятность усиления признаков поздней дискинезии, у отдельных пациентов симптомы появляются впервые после прекращения приема таблеток Абилифай.

Нейролептический злокачественный синдром:

У пациентов, получавших лечение нейролептиками, включая арипипразол, описаны случаи возникновения нейролептического злокачественного синдрома, который сопровождается ригидностью мышц, нарушениями психики, гиперпирексией, нерегулярным давлением и пульсом, а также потливостью, рабдомиолизом, острой недостаточностью почек и повышением активности креатининфосфокиназы. Если у пациента возникают симптомы нейролептического злокачественного синдрома необходимо отменить прием нейролептиков.

Гипергликемия:

У пациентов, получавших атипичные нейролептики, в некоторых случаях развивалась гипергликемия (которая может быть связана с кетоацидозом) и гиперосмолярная кома (иногда с летальным исходом). Прямая связь между лечением атипичными нейролептиками

и нарушением гликемического типа точно не установлена, однако пациенты, у которых выявлен сахарный диабет, должны проводить мониторинг уровня глюкозы. Необходимость контроля уровня глюкозы также касается лиц с риском диабета.

Противопоказания

Абилифай не назначают при непереносимости арипипразола.

В педиатрии не применяют Абилифай.

Следует с осторожностью применять Абилифай у пациентов с сахарным диабетом, а также при наличии факторов риска возникновения диабета (включая излишний вес и случаи диабета в семейном анамнезе).

Кроме того, Абилифай можно назначать исключительно после оценки рисков/пользы пациентам с:

- ИБС, недостаточностью сердца, инфарктом в анамнезе, нарушениями проводимости.
- Состояниями, при которых повышен риск гипотензии (включая дегидратацию, прием гипотензивных средств и гиповолемию), а также цереброваскулярными заболеваниями (у таких пациентов повышен риск ортостатической гипотензии).
- Судорожными припадками и состояниями, при которых снижен судорожный порог.
- Повышенным риском гипертермии (в том числе при физических нагрузках, терапии антихолинергическими препаратами, гиповолемии, перегревании).
- Высоким риском аспирационной пневмонии (в связи с вероятностью нарушения моторики пищевода и аспирации).

При назначении препарата Абилифай необходимо порекомендовать пациенту отказаться от вождения автомобиля.

Беременность

Клинических исследований препарата Абилифай у беременных не проводилось. Следует проводить тщательную оценку рисков и пользы при необходимости назначения арипипразола беременным.

В исследованиях на животных арипипразол определялся в молоке крыс, аналогичных исследований у человека не проводилось. Абилифай не следует назначать кормящим женщинам.

Лекарственное взаимодействие

Фамотидин не оказывает значительного влияния на фармакокинетический профиль арипипразола.

Сильные ингибиторы CYP2 D6 и CYP3 A4 в ходе исследований уменьшали клиренс арипипразола. При необходимости сочетанного применения препарата Абилифай с ингибиторами данных изоферментов необходима коррекция (снижение) дозы арипипразола.

Абилифай не приводит к значительному изменению фармакокинетики субстратов CYP2 D6 и CYP3 A4.

В ходе исследований арипипразол не вытеснял варфарин из связей с белками.

Передозировка

В исследованиях арипипразола есть информация о разовом приеме дозы 1080 мг, который сопровождался развитием передозировки и имел благополучный исход.

При интоксикации арипипразолом у пациентов наблюдалось развитие сонливости, рвоты, слабости и диареи. У пациентов, которые были госпитализированы в связи с передозировкой препарата Абилифай, не отмечалось изменений ЭКГ, лабораторных и физиологических показателей.

При постмаркетинговых исследованиях регистрировались случаи приема взрослыми больными до 450 мг арипипразола, после которых развивалась тахикардия. У детей при передозировке (разовый прием до 195 мг) развиваются потенциально опасные эффекты, включая потерю сознания и экстрапирамидные симптомы.

Лечение передозировки препарата Абилифай включает симптоматические средства, поддерживающие мероприятия (в том числе обеспечение нормальной проходимости дыхательных путей, ИВЛ, оксигенизация).

При лечении передозировки необходимо учитывать клинические симптомы и контролировать функцию ССС с регистрацией ЭКГ (для своевременного выявления нарушений ритма).

Применение сорбентов (в частности активированного угля) на протяжении часа после приема таблеток Абилифай перорально снижает пиковые уровни арипипразола и AUC на 41% и 51% соответственно.

Эффективность гемодиализа при интоксикации арипипразолом не изучена, но теоретически (учитывая степень связи с альбуминами и характер экскреции) гемодиализ не приводит к значительному снижению сывороточных уровней данного препарата.

Условия хранения

Абилифай необходимо хранить в местах, к которым не имеют доступа дети, при комнатной температуре.

Срок годности

Таблетки Абилифай годны 3 года после выпуска.

Категория отпуска

По рецепту.