ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

КЕТОТИФЕН СОФАРМА
(KETOTIFEN SOPHARMA)

Склад:
діюча речовина: кетотифену гідрофумарат;
1 таблетка містить кетотифену гідрофумарату 1,38 мг, що еквівалентно кетотифену 1 мг;
допоміжні речовини: кальцію гідрофосфат безводний, целюлоза мікрокристалічна, крохмаль пшеничний, магнію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.
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; без запаху.

Фармакотерапевтична група.
Антигістамінні засоби 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 пригніченням виділення гістаміну та інших медіаторів з тучних клітин, з блокуванням гістамінових H_1-рецепторів і пригніченням ферменту фосфодіестерази, у результаті чого підвищується рівень цАМФ у тучних клітинах. Пригнічує ефекти PAF (*platelet-activating factor* – 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. Сприятливо впливає на виділення мокроти.
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 становить 2 мг.
Розподіл: зв'язується з білками плазми крові приблизно на 75 %. Об'єм розподілу – 2,7 л/кг.
Метаболізм: близько 60 % прийнятої дози метаболізується у печінці трьома шляхами: деметилювання, 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).
Метаболізм у дітей не відрізняється від такого ж у дорослих, за винятком більш швидкого кліренсу.
Виведення: виводиться біфазно, з коротким періодом напіввиведення від 3 до 5 годин і більш тривалим – 21 година. Близько 1 % речовини виділяється у незміненому вигляді з сечею в межах 48 годин, а 60-70 % – у формі метаболітів.

Клінічні характеристики.

Показання.

- Профілактичне лікування бронхіальної астми, особливо атопічної.
- При симптоматичному лікуванні алергічних станів, включаючи алергічний риніт і кон'юнктивіт.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до діючої речовини або до будь-якої з допоміжних речовин препарату.

Уникати одночасного застосування кетотифену і пероральних протидіабетичних засобів (ризик розвитку оборотної тромбоцитопенії) до того часу, доки 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 зворотної тромбоцитопенії. Таким хворим рекомендується слідкувати за кількістю тромбоцитів.

При одночасному застосуванні атропіну, засобів з атропіноподібною дією і кетотифену підвищується ризик виникнення побічних реакцій, таких як затримка сечі, закреп, 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 слід уникати вживання алкоголю, оскільки етанол посилює депресивний ефект кетотифену на центральну нервову систему.

Особливості застосування.

Препарат неефективний при лікуванні гострої алергічної реакції та не застосовується для купірування нападів ядухи при астмі (астматичних нападів).

Максимальний терапевтичний ефект препарату настає після кількох тижнів систематичного застосування.

Нормалізація функції гіпофіз-надниркової системи може тривати до одного 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 порогу 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 зменшувати протягом 2-4 тижнів, щоб запобігти повторному виникненню симптомів астми.

Слід бути обережним 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.

Пшеничний крохмаль у складі таблетки може містити тільки сліди глютену і вважається безпечним для пацієнтів, хворих на целіакію.

Застосування у період вагітності або годування груддю.
Під час досліджень на тваринах не встановлено ембріотоксичної і тератогенної дії кетотифену. Контрольованих клінічних досліджень у вагітних жінок не проводили. У період вагітності кетотифен протипоказаний для застосування в I триместрі вагітності. У II та III триместрі вагітності його слід призначати лише після суворої оцінки наявності прямих показань, у випадках, коли очікувана користь від лікування перевищує потенційний ризик для плода.
Кетотифен проникає у молоко матері, тому жінкам у випадку необхідності застосування препарату слід припинити годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими 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.

Спосіб застосування та дози.
Таблетки приймати внутрішньо під час їди, запиваючи водою.
Дозування
Дорослі: по 1 таблетці (1 мг) 2 рази на добу, вранці та ввечері під час їди. Для пацієнтів, у яких спостерігається значний седативний ефект, рекомендується повільне підвищення дози протягом першого тижня, починаючи з 0,5 мг 2 рази на добу, і поступово збільшуючи її до досягнення терапевтичної дози. У разі необхідності добову дозу можна збільшувати до 4 мг (4 таблетки) по 2 таблетки 2 рази на добу. При застосуванні більш високої дози можна очікувати швидшого настання терапевтичного ефекту.
Діти:
Діти від 6 місяців до 3-річного віку: застосовувати кетотифен в іншій лікарській формі (сироп).
Діти віком від 3 років: по 1 таблетці (1 мг) 2 рази на добу, вранці та ввечері, під час їди.
Тривалість лікування
Лікування тривале, при цьому терапевтичний ефект досягається після кількох тижнів терапії. Лікування має тривати не менше 2-3 місяців, особливо у пацієнтів, у яких не спостерігалося покращання самопочуття у перші тижні.
Супроводжуюча 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.
Пацієнти літнього віку.
Немає особливих вимог для пацієнтів літнього віку.

Діти.
Застосовувати дітям віком від 3 років.
Результати клінічних спостережень підтверджують фармакокінетичні особливості і показують, що дітям може бути необхідна більш висока доза у мг/кг, ніж дорослим, для отримання оптимальних результатів. Більш високі дози переносяться так само добре, як і нижчі.

Передозування.

Симптоми: можливі значні порушення психомоторної реакції, сонливість до вираженої седації, сплутаність свідомості, головний біль, дезорієнтація, тахікардія, зниження артеріального тиску, у дітей – гіперзбудливість або судоми, зворотна кома. Також спостерігаються брадикардія, аритмія, пригнічення функції центру дихання, ністагм.
У випадку виникнення вищезазначених симптомів пацієнта слід ретельно обстежити.
Лікування: загальні заходи з вилучення 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 бензодіазепіни.

Побічні реакції.
Нижчеописані побічні реакції класифіковані за органами і системами та за частотою. Побічні реакції класифікуються за частотою наступним чином: дуже часто (≥ 1/10), часто (≥ 1/100 і <1/10), нечасто (≥ 1/1 000 і <1/100), рідко (≥ 1/10 000 і <1/1 000), дуже рідко (<1/10 000), з невідомою частотою (на підставі існуючих даних не можна зробити оцінку).
Інфекції та інвазії:
нечасто – цистит.
З боку імунної системи:
дуже рідко – тяжкі шкірні реакції, мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона; з невідомою частотою – шкірні висипання.
З боку обміну речовин та харчування:
рідко – збільшення маси тіла внаслідок підвищення апетиту.
Психічні порушення:
часто – психомоторне збудження, дратівливість, безсоння, неспокій, нервозність; з невідомою частотою – дезорієнтація, сонливість.
З боку нервової системи:
нечасто – запаморочення; рідко – седативний ефект; дуже рідко – судоми.
З боку шлунково-кишкового тракту:
нечасто – сухість у роті; з невідомою частотою – біль у шлунку, закреп, нудота, блювання, диспепсичні розлади.

З боку гепатобіліарної системи:
дуже рідко – підвищення рівня печінкових ферментів, гепатит.
З боку нирок та сечовивідних шляхів:
з невідомою частотою – 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. 3 роки.

Умови зберігання.
Зберігати у недоступному для дітей місці.
Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка.
По 10 таблеток у блістері з ПВХ плівки/алюмінієвої фольги, по 3 блістери в картонній пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробники.
АТ «Софарма».
АТ «ВІТАМІНИ».

Місцезнаходження виробників та адреси місця провадження їхньої діяльності.
АТ «Софарма»
вул. Ілієнське шосе, 16, Софія, 1220, Болгарія.
АТ «ВІТАМІНИ»
Україна, 20300, Черкаська обл., м. Умань, вул. Успенська, 31.