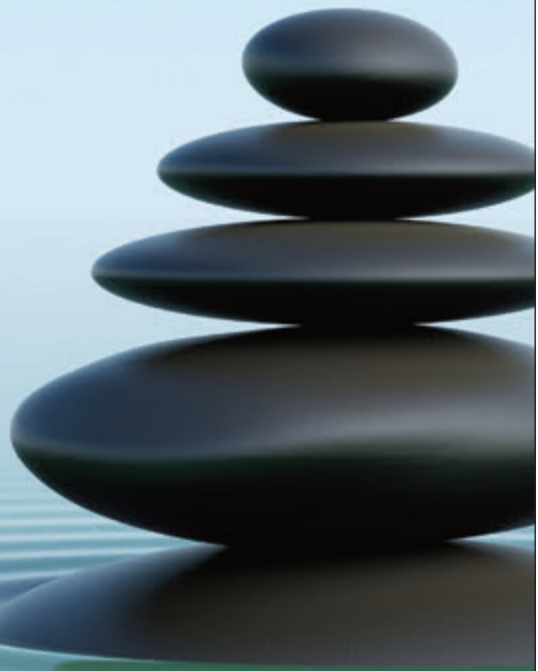


# Кетилепт® Ретард

кветіапін



## ПРАГНЕННЯ ДОСКОНАЛОСТІ

Склад та форма випуску:  
табл. пролонг. дії, в/плів.  
50 мг білістер, № 60  
табл. пролонг. дії, в/плів.  
200 мг білістер, № 60



табл. пролонг. дії, в/плів.  
300 мг білістер, № 60  
табл. пролонг. дії, в/плів.  
400 мг білістер, № 60

### Показання

- Лікування шизофренії, включаючи профілактику рецидивів у пацієнтів із стабільним перебігом шизофренії, які отримували підтримуючу терапію кветіапіном
- Лікування біполярного розладу, зокрема:
  - для лікування помірних та тяжких маніакальних епізодів при біполярному розладі
  - для лікування тяжких депресивних епізодів при біполярному розладі
  - для профілактики рецидивів захворювання у пацієнтів із біполярним розладом, у пацієнтів із маніакальними чи депресивними епізодами при яких кветіапін є ефективним
- Додаткова терапія при тяжких депресивних епізодах у пацієнтів із тяжким депресивним розладом (ТДР), у яких зафіксовано субоптимальну відповідь на монотерапію антидепресантами

**Протипоказання.** Підвищена чутливість до діючої речовини чи будь-якого компонента препарату. Протипоказане одночасне застосування інгібіторів цитохрому Р450 3А4. **Побічні реакції.** Сонливість, запаморочення, сухість у роті, запор, помірна астения, тахікардія, ортостатична гіпотензія та диспепсія. **Категорія відпуску.** Відпускається за рецептом лікаря. РЛ №UA/8157/02/01-03-04-05. **Виробник.** ЗАТ Фармацевтичний завод ЕПС, Угорщина.

Інформація для професійної діяльності лікарів та фармацевтів, а також для розповсюдження на конференціях, семінарах, симпозиумах з медичної тематики. Детальна інформація міститься в інструкції для медичного застосування.

Контакти представника виробника в Україні:  
04119, Київ, вул. Дегтярівська, 27-Т.  
Тел.: +38 (044) 496 05 39, факс: +38 (044) 496 05 38



# Диференційний підхід у терапії пролонгованими антипсихотичними засобами

Цьогоріч влітку за підтримки Асоціації неврологів, психіатрів і наркологів України та Інституту неврології, психіатрії та наркології НАМН України було організовано науково-практичну онлайн-конференцію з міжнародною участю «Оптимізація психофармакологічних підходів до лікування психічних та поведінкових розладів». У науковому заході взяли участь лікарі-психіатри, наркологи, неврологи, психологи, психотерапевти та інші фахівці у галузі охорони здоров'я. Основні наукові напрями конференції включали: психічні та поведінкові розлади під час пандемії COVID-19, організацію психіатричної допомоги в умовах реформування медичної галузі, персоніфікацію підходів до лікування психічних і поведінкових розладів, інноваційні моделі діагностики, терапії та реабілітації, а також визначення ролі психотерапії та психоосвіти у таких пацієнтів, зокрема з шизофренією, сучасні принципи надання допомоги особам із депресією, біполярними афективними, соціально-стресовими розладами тощо. Лікар-психіатр, завідувач відділення первинного психотичного епізоду Харківської обласної клінічної психіатричної лікарні № 3, к. мед. н. Дмитро Олександрович Мангубі поділився широким досвідом вибору антипсихотичних препаратів залежно від профілю пацієнта, терапевтичних мішеней, класичної відповіді на лікування та профілю безпеки.

Як зауважив спікер, широкий перелік доступних варіантів медикаментозної терапії формує потребу в індивідуалізованому підході до вибору препарату та його лікарської форми. Наприклад, для пацієнта, який порушує режим лікування, оптимальними є пролонговані форми, оскільки їхнє приймання:

- потребує меншої частоти застосування, що підвищує прихильність пацієнта до терапії;
- забезпечує зниження флуктуації концентрації препарату в плазмі (максимальна концентрація поступово досягається через 6 год, на відміну від 1 год при застосуванні звичайної форми; оболонка засобу остаточно розчиняється протягом ~20 год), що сприяє сталості терапевтичного ефекту та зниженню частоти й інтенсивності небажаних ефектів;
- є оптимальним на початку терапії та при виникненні гострого стану, а також за потреби підбору дози;
- рекомендовано пацієнтам похилого віку з нирковою та печінковою недостатністю.

Проте відносними недоліками пролонгованих форм є неможливість регулювання дози після введення, складність прогнозування ефекту, компенсація побічних проявів. Економічна недоступність ін'єкційних атипичних антипсихотиків пролонгованої дії змушує обирати типові конвекційні препарати. Своєю чергою засоби пролонгованої дії в таблетованій формі доступні та оптимальні для застосування відповідно до переваг, зазначених вище.

У межах доповіді Д.О. Мангубі здійснив порівняння впливу різних представників антипсихотиків на рецептори головного мозку (табл. 1). Відповідно до кількості рецепторних мішеней, на які діють ті чи інші антипсихотики, можна судити про їхній клінічний ефект. Однак лектор зазначив, що вплив на конкретну кількість рецепторних систем не є однозначним. Слід бути особливо уважним щодо цього, оскільки деякі антипсихотики є частковими антагоністами, натомість інші – частковими агоністами однойменних рецепторів (наприклад, дофамінових, серотонінових, мускаринових, гістамінових), що кардинальним чином змінює вплив препарату.

Доповідач детально розглянув один із найперспективніших з практичного погляду варіант – застосування препарату **Кетилепт ретард** (кветіапін пролонгованої дії). Цей лікарський засіб, відповідно до впливу на конкретні рецептори (див. табл. 1), має дозозалежний ефект:

1. При використанні малих доз (50–100 мг) препарат чинить протитривожний ефект за рахунок блокади гістамінових (H<sub>1</sub>), адренергічних α<sub>1</sub>- та α<sub>2</sub>-, серотонінових 5HT<sub>2A</sub>- та 5HT<sub>1A</sub>-рецепторів. Це дозволяє успішно призначати Кетилепт ретард за тривожних симптомів та розладів сну (безсоння).

2. У середніх дозах (100–300 мг) Кетилепт ретард додатково блокує зворотне захоплення норадреналіну,



Д.О. Мангубі

а отже, здатний ефективно зменшувати депресивну симптоматику. Завдяки цій властивості кветіапін ухвалений Управлінням з контролю за харчовими продуктами та лікарськими засобами США (FDA) як засіб ад'ювантної (додаткової) терапії для лікування депресії, особливо у разі резистентних випадків та з метою аугментації (посилення) дії антидепресантів.

Порівняння особливостей застосування кветіапіну негайного вивільнення (**Кетилепт**) та пролонгованої дії (**Кетилепт ретард**) сформульоване в таблиці 2. Як можна побачити, початкові, терапевтичні та максимальні дози даних препаратів суттєво відрізняються. Проте в будь-якому разі остаточне рішення про індивідуалізований підбір дози покладається на лікаря-практика. Доповідач зазначив, що слід пам'ятати про відмінність початкової дози Кетилепту та Кетилепту ретард: призначення пролонгованої форми в дозі 300 мг/добу протягом наступних 20 год забезпечує надходження в організм невеликої дози кветіапіну; оптимальним та безпечним є підвищення дози Кетилепту ретард до 600 і навіть до 800 мг максимум за 2–3 дні.

Практичний досвід доктора Д.О. Мангубі дозволяє сформулювати якісну відмінність у лікуванні психозів адекватними дозами Кетилепту ретард. Так, досягти терапевтичної дози (400–800 мг) кветіапіну негайного вивільнення у монотерапії майже неможливо, оскільки виникають тривала седація, скутість (фізична, а не екстрапірамідна) та інші побічні прояви. Саме тому зазвичай використовують 200 мг кветіапіну разом із додатковою терапією.

Своєю чергою, чим вища доза Кетилепту ретард, тим виразніша блокада дофамінових D<sub>2</sub>-рецепторів, що забезпечує успішне й якісне нівелювання психотичної та маніакальної симптоматики. До того ж швидке нарощування дози протягом двох днів дозволяє застосовувати Кетилепт ретард у дозі 600–800 мг за гострої симптоматики та «великих психозів»,

Табл. 1. Порівняльна характеристика антипсихотиків відповідно до переважно блокувальної дії на рецептори головного мозку

Дія	Антидисфорична, антидепресивна	Седативна	Антипсихотична, протиманіакальна	Антихолінергічна	Вплив на судини (постуральна гіпотензія)
Оланзапін	5HT <sub>2A</sub> , 5HT <sub>2C</sub>	H <sub>1</sub>	D <sub>2</sub>	M <sub>3</sub>	
Азенапін	5HT <sub>2A</sub> , 5HT <sub>2C</sub> , 5HT <sub>1A</sub> , 5HT <sub>1B/D</sub> , 5HT <sub>7</sub> , α <sub>2</sub>	H <sub>1</sub>	D <sub>2</sub>		
Клозапін	5HT <sub>2A</sub>	H <sub>1</sub>	D <sub>2</sub>	M <sub>1</sub> , M <sub>3</sub>	α <sub>1</sub>
Луразидон	5HT <sub>2A</sub> , 5HT <sub>7</sub> , 5HT <sub>1A</sub>		D <sub>2</sub>		
Рисперидон	5HT <sub>2A</sub>		D <sub>2</sub>		α <sub>1</sub>
Паліперидон	5HT <sub>2A</sub> , α <sub>2</sub>		D <sub>2</sub>		
Зипразидон	5HT <sub>2A</sub> , 5HT <sub>2C</sub> , 5HT <sub>1A</sub> , 5HT <sub>1B/D</sub> , 5HT <sub>7</sub> , α <sub>2</sub>		D <sub>2</sub>		
Амісульприд	D <sub>3</sub> (при використанні у низькій дозі ≤400 мг на добу)		D <sub>2</sub>		
Арипіразол	5HT <sub>2A</sub> , 5HT <sub>7</sub> , 5HT <sub>1A</sub> , AP		D <sub>2</sub> , AP		
Брексспіразол	5HT <sub>2A</sub> , 5HT <sub>7</sub> , 5HT <sub>1A</sub> , AP		D <sub>2</sub> , AP		
Каріпразин	5HT <sub>2A</sub> , D <sub>3</sub> , AP, 5HT <sub>1A</sub> , AP		D <sub>2</sub> , AP		
Кветіапін	5HT <sub>2A</sub> , 5HT <sub>1A</sub> , 5HT <sub>2C</sub> , α <sub>2</sub>	H <sub>1</sub>	D <sub>2</sub>	M <sub>1</sub> , M <sub>3</sub>	α <sub>1</sub>

Примітки: AP – антагоніст рецепторів.  
Адаптовано за S.M. Stahl, 2013.

однак не психомоторного збудження (для даного стану використовують максимально швидкодіючі препарати).

Таким чином, Кетилепт ретард можна успішно призначати у клінічних випадках за наявності:

- галюцинаторно-параноїдного синдрому;
- афективного синдрому;
- сенесто-іпохондричного синдрому;
- астено-депресивного синдрому;
- вторинної негативної симптоматики.

Щодо останнього пункту Д.О. Мангубі зазначив, що, за даними літератури та результатами останніх досліджень, негативна симптоматика у пацієнтів із формуванням шизофренічного дефекту може бути дещо скорегована призначенням кветіапіну пролонгованої дії. Втім практичний досвід є амбівалентним, що потребує особливо детального аналізу конкретного клінічного випадку для остаточного розв'язання питання про доцільність призначення препарату Кетилепт ретард пацієнтам даної підгрупи.

Іншою беззаперечною перевагою цього лікарського засобу є можливість індивідуалізовано підбирати дозу для пацієнта, оскільки компанія Egis забезпечила доступність широкого спектра дозувань: 50, 200, 300 та 400 мг. Це дозволяє не ділити таблетку й не пошкоджувати оболонку, яка забезпечує властивість ретардної форми – поступове та повільне вивільнення протягом 20 год. Пошкодження оболонки ретардної форми має наслідком переведення медикаменту

Табл. 2. Порівняльна характеристика таблетованих форм кветіапіну, які відрізняються за вивільненням діючої речовини

Кетилепт	Кетилепт ретард
Приймання двічі на день	Приймання один раз на день натще, не допускається порушення цілісності оболонки таблетки
Особливості титрування: • 1-й день – 50 мг • 2-й день – 100 мг • 3-й день – 200 мг • 4-й день – 300 мг Починаючи з 4-ї доби дозу підвищують до досягнення необхідного клінічного ефекту (в межах 300-450 мг/добу)	Особливості титрування: • 1-й день – 300 мг • 2-й день – 600 мг За умов клінічної обґрунтованості максимальна доза може бути підвищена до 800 мг/добу
Залежно від клінічної ефективності та переносимості добова доза може становити 150-750 мг	Залежно від клінічної ефективності та переносимості добова доза може становити 400-800 мг

в форму негайного вивільнення. Таким чином, компанія Egis створила можливість безпечно та зручно формувати необхідні комбінації ретардної форми кветіапіну з огляду на відповідь пацієнта та його мульти-системний профіль.

Також лектор наголосив на наявності інших важливих переваг кветіапіну пролонгованого вивільнення (Кетилепту ретард), як-от:

- хороша переносимість препарату пацієнтами;
- відсутність дистонічних реакцій;
- наявність м'яких седативних властивостей на тлі поліпшення когнітивних функцій (увага, здатність до навчання, пам'ять, візуально-моторні навички) без посилення анергії;
- реалізація антидефіцитарної дії, зокрема вплив на первинну негативну симптоматику;
- антидисфоричні та антидепресивні властивості;
- відсутність ризику розвитку гіперпролактинемії;
- препарат є варіантом вибору для коморбідних пацієнтів із високим ризиком розвитку неврологічних побічних ефектів за використання інших лікарських засобів.

Таким чином, кветіапін характеризується унікальним впливом на конкретні рецепторні мішені головного мозку, що зумовлює його оптимальну дію на широкий спектр розладів поведінки та психічного статусу. Ретардні, тобто пролонговані форми лікарських засобів є, беззаперечно, бажаними при терапії пацієнтів із психічними розладами, особливо при комбінації даних порушень зі зниженим комплаєнсом, активним ритмом життя або похилим віком та за наявності поліорганної патології. Стабільна та оптимальна концентрація таргетної діючої речовини – це запорука адекватної корекції поведінки і стану хворого, відсутності добових коливань та, відповідно, безпеки терапії.

Кетилепт ретард – препарат компанії Egis із добре вивченою дією, який, за словами лікаря-психіатра Д.О. Мангубі, є одним із найоптимальніших таблетованих антипсихотичних засобів пролонгованої дії з можливістю призначення індивідуалізованої дози та чіткого відстеження позитивного терапевтичного ефекту без ризику ятрогенії та без потреби у поліпрагмазії.

### Довідка «ЗУ»

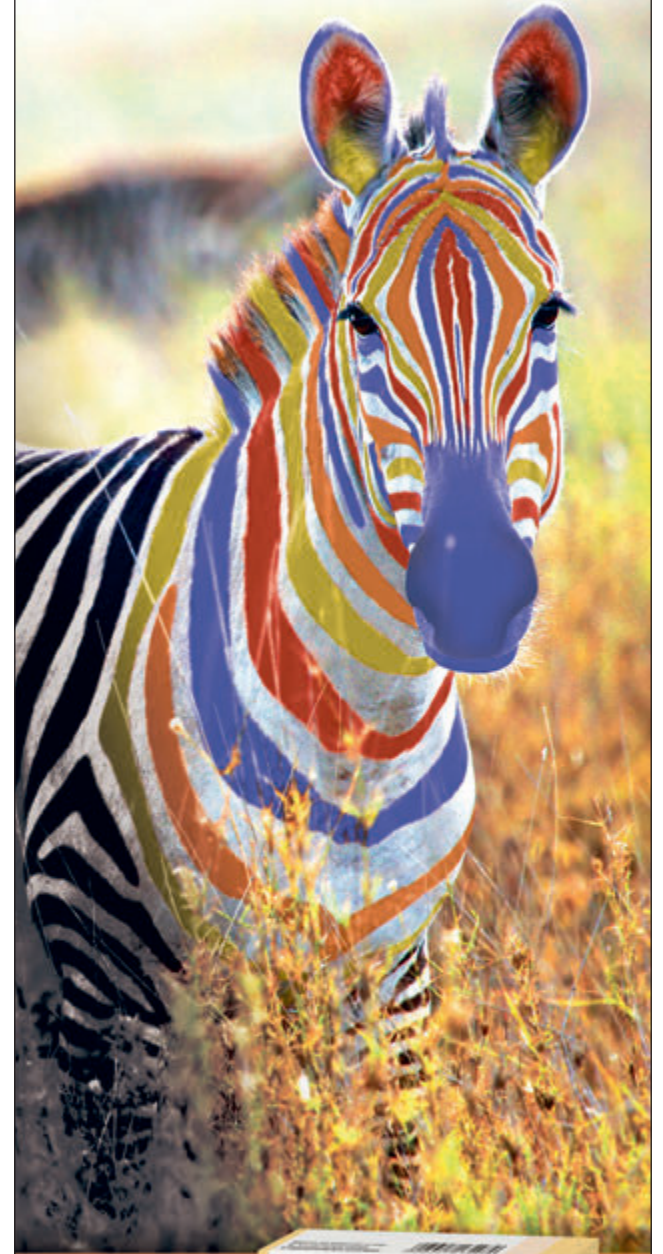
Компанія «EGIS» (Угорщина) представляє на українському фармацевтичному ринку максимально повну палітру форм кветіапіну: **Кетилепт** (у вигляді таблеток, вкритих плівковою оболонкою) у дозуванні 25, 100 та 200 мг № 30, а також **Кетилепт Ретард** (таблетки, вкриті оболонкою, пролонгованої дії) у дозуванні 50, 200, 300 та 400 мг по 60 таблеток в упаковці.

Підготувала **Маргарита Марчук**

# Еголанза

оланзапін

## ЖИТТЯ БЕЗ ЧОРНИХ СМУГ



Склад та форма випуску:  
табл. в/плів. оболонкою 5 мг блістер, № 28  
табл. в/плів. оболонкою 10 мг блістер, № 28

### Показання

- Лікування шизофренії
- Підтримка досягнутого клінічного ефекту при тривалій терапії у пацієнтів, у яких спостерігалася відповідь на початкову терапію
- Лікування маніакальних епізодів помірного та тяжкого ступеня
- Профілактика повторних нападів у пацієнтів з біполярними розладами, у яких було отримано позитивну відповідь при лікуванні оланзапіном манії

**Протипоказання.** Підвищена чутливість до діючої речовини або будь-якої з допоміжних речовин препарату; відомий ризик закритокутової глаукоми.

**Побічні реакції.** Сонливість, збільшення маси тіла, підвищення рівня пролактину, холестерину, глюкози і тригліцеридів в крові, підвищення апетиту, запаморочення, астенія, стомлюваність та інші. Категорія відпуску. Відпускається за рецептом лікаря. Р.Л. № 11344/01/01, №11344/01/03.

Виробник. ЗАТ Фармацевтичний завод ЕГІС, Угорщина.

Контакти представника виробника в Україні:  
04119, Київ, вул. Дегтярівська, 27-Т.  
Тел: +38 (044) 496 05 39, факс: +38 (044) 496 05 38

