ЛСР-006439/08-190219

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ЧАМПИКС®

таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 0,5 мг, 1 мг

Р-Фарм Германия ГмбХ, Германия

Изменение № 1

Дата внесения Изменения «____» 190219 20___ г.

Старая редакция	Новая редакция
Фармакодинамика Варениклин с высокой аффинностью и селективностью связывается с α4β2 никотиновыми ацетилхолиновыми рецепторами головного мозга, в отношении которых он является, как частичным агонистом (но в меньшей степени, чем никотин), так и антагонистом в присутствии никотина. Электрофизиологические исследования *in vitro* и нейрохимические исследования *in vivo* показали, что варениклин связывается с α4β2 никотиновыми ацетилхолиновыми рецепторами и стимулирует их, но в значительно меньшей степени, чем никотин. Никотин конкурентно связывается	**Фармакодинамика** Варениклин с высокой аффинностью и селективностью связывается с α4β2 никотиновыми ацетилхолиновыми рецепторами головного мозга, в отношении которых он является, как частичным агонистом (но в меньшей степени, чем никотин), так и антагонистом в присутствии никотина. Электрофизиологические исследования *in vitro* и нейрохимические исследования *in vivo* показали, что варениклин связывается с α4β2 никотиновыми ацетилхолиновыми рецепторами и стимулирует их, но в значительно меньшей степени, чем никотин. Никотин конкурентно связывается

116581

ЛСР-006439/08-190219

с тем же участком рецептора, к которому вареникlин обладает более высоким сродством. Таким образом, вареникlин эффективно блокирует способность никотина стимулировать рецепторы и активировать мезолимбическую дофаминовую систему – нейрональный механизм, который лежит в основе реализации механизмов формирования никотиновой зависимости (получение удовольствия от курения). Вареникlин обладает высокой селективностью и в большей степени связывается с подтипом α4β2 рецептора, чем с другими никотиновыми подтипами рецепторов (α3β4, α7, α1βγδ) или другими рецепторами и транспортными белками. Эффективность вареникlина как средства для лечения никотиновой зависимости обусловлена его частичным агонизмом в отношении α4β2 никотиновых рецепторов, связывание с которыми уменьшает тягу к курению и облегчает проявление синдрома «отмены», одновременно приводя к снижению чувства удовольствия от курения (антагонизм в присутствии никотина). При применении у взрослых пациентов вареникlин продемонстрировал снижение тяги к курению и проявлений синдрома отмены. Увеличение длительности приема вареникlина до 24 недель (дополнительно 12 недель к стандартному курсу) приводило к увеличению его эффективности. Вареникlин был также эффективен для	с тем же участком рецептора, к которому вареникlин обладает более высоким сродством. Таким образом, вареникlин эффективно блокирует способность никотина стимулировать рецепторы и активировать мезолимбическую дофаминовую систему – нейрональный механизм, который лежит в основе реализации механизмов формирования никотиновой зависимости (получение удовольствия от курения). Вареникlин обладает высокой селективностью и в большей степени связывается с подтипом α4β2 рецептора, чем с другими никотиновыми подтипами рецепторов (α3β4, α7, α1βγδ) или другими рецепторами и транспортными белками. Эффективность вареникlина как средства для лечения никотиновой зависимости обусловлена его частичным агонизмом в отношении α4β2 никотиновых рецепторов, связывание с которыми уменьшает тягу к курению и облегчает проявление синдрома «отмены», одновременно приводя к снижению чувства удовольствия от курения (антагонизм в присутствии никотина). При применении у взрослых пациентов вареникlин продемонстрировал снижение тяги к курению и проявлений синдрома отмены. Увеличение длительности приема вареникlина до 24 недель (дополнительно 12 недель к стандартному курсу) приводило к увеличению его эффективности. Вареникlин был также эффективен для

116581

ЛСР-006439/08-190219

отказа от курения при повторном применении у пациентов, которые ранее прекращали курить с помощью варениклина. Варениклин также был эффективен при выборе пациентом собственной даты прекращения курения («гибкий» курс приема). Варениклин был эффективен для отказа от курения у пациентов с хронической обструктивной болезнью легких, в том числе и при длительном наблюдении (52 недели от начала лечения), у кардиологических пациентов с острыми и хроническими сердечно-сосудистыми заболеваниями (включая госпитализированных в стационар с острым коронарным синдромом – нестабильной стенокардией и инфарктом миокарда с подъемом и без подъема сегмента ST), как для полного прекращения курения, так и для снижения числа выкуриваемых сигарет. Продемонстрирована эффективность и безопасность применения варениклина для отказа от курения у пациентов с психиатрическими заболеваниями в анамнезе.	отказа от курения при повторном применении у пациентов, которые ранее прекращали курить с помощью варениклина. Варениклин также был эффективен при выборе пациентом собственной даты прекращения курения («гибкий» курс приема). Варениклин был эффективен для отказа от курения у пациентов с хронической обструктивной болезнью легких, в том числе и при длительном наблюдении (52 недели от начала лечения), у кардиологических пациентов с острыми и хроническими сердечно-сосудистыми заболеваниями (включая госпитализированных в стационар с острым коронарным синдромом – нестабильной стенокардией и инфарктом миокарда с подъемом и без подъема сегмента ST), как для полного прекращения курения, так и для снижения числа выкуриваемых сигарет. Продемонстрирована эффективность и безопасность применения варениклина для отказа от курения у пациентов с психиатрическими заболеваниями в анамнезе. *Дети и подростки* При применении у детей и подростков с 12-летнего возраста при стандартном 12-недельном курсе лечения как в стандартной (1 мг), так и уменьшенной дозировке (до 0,5 мг), в зависимости от массы тела (≤55 кг и> 55 кг) и возраста (от 12 до 16 лет и от 17 до

116581

ЛСР-006439/08-190219

<table>
<tr><td></td><td>19 лет), было показано, что терапия варениклином не приводила к увеличению частоты продолжительного воздержания от курения с 9 по 12 недели лечения по сравнению с плацебо. Профиль безопасности варениклина в этом исследовании соответствует показателям исследований во взрослой группе (см. раздел «Побочные эффекты»).</td></tr>
<tr><td>Способ применения и дозы
Вероятность успешной терапии препаратом для прекращения курения повышается у пациентов, мотивированных на отказ от курения, которым предоставляется дополнительная консультативная помощь и поддержка.
Чампикс® принимают внутрь, проглатывая таблетки целиком и запивая водой вне зависимости от приема пищи. Рекомендуемая доза препарата составляет 1 мг два раза в сутки с титрацией дозы по следующей схеме:
<table><tr><td>Дни 1 – 3</td><td>0,5 мг один раз в сутки</td></tr><tr><td>Дни 4 – 7</td><td>0,5 мг два раза в сутки</td></tr><tr><td>День 8 – конец лечения</td><td>1 мг два раза в сутки</td></tr></table>Вначале пациент должен выбрать дату прекращения курения. Лечение препаратом Чампикс® обычно следует начинать за 1-2 недели до выбранной даты. Общая продолжительность препаратом Чампикс® лечения должна составить 12 недель.</td><td>Способ применения и дозы
Вероятность успешной терапии препаратом для прекращения курения повышается у пациентов, мотивированных на отказ от курения, которым предоставляется дополнительная консультативная помощь и поддержка.
Чампикс® принимают внутрь, проглатывая таблетки целиком и запивая водой вне зависимости от приема пищи. Рекомендуемая доза препарата составляет 1 мг два раза в сутки с титрацией дозы по следующей схеме:
<table><tr><td>Дни 1 – 3</td><td>0,5 мг один раз в сутки</td></tr><tr><td>Дни 4 – 7</td><td>0,5 мг два раза в сутки</td></tr><tr><td>День 8 – конец лечения</td><td>1 мг два раза в сутки</td></tr></table>Вначале пациент должен выбрать дату прекращения курения. Лечение препаратом Чампикс® обычно следует начинать за 1-2 недели до выбранной даты. Общая продолжительность препаратом Чампикс® лечения должна составить 12 недель.</td></tr>
</table>

116581

ЛСР-006439/08-190219

Пациентам, успешно отказавшимся от курения к концу 12-ой недели лечения, может быть рекомендован дополнительный 12-недельный курс терапии варениклином в дозе 1 мг два раза в сутки для поддержания отказа от курения. Для пациентов, которые не могут или не хотят резко отказываться от курения, может быть рассмотрен постепенный подход с терапией варениклином. В этом случае следует уменьшить интенсивность курения в течение первых 12 недель терапии с полным прекращением курения к концу этого периода. После этого пациентам следует принимать варениклин еще 12 недель, чтобы общий период лечения составил 24 недели. Пациенты с соответствующей мотивацией, но которым не удалось отказаться от курения в ходе предыдущего курса лечения варениклином, или у которых после успешного завершения лечения наступает рецидив, могут пройти повторный курс лечения варениклином, при условии, что были установлены причины неудачи первой попытки и предприняты меры для их устранения. Пациентам, которые плохо переносят прием препарата Чампикс® из-за нежелательных реакций, возможно снизить дозу до 0,5 мг два раза в сутки временно или постоянно. Риск рецидива курения повышен у лиц, недавно завершивших терапию с целью отказа от курения.	Пациентам, успешно отказавшимся от курения к концу 12-ой недели лечения, может быть рекомендован дополнительный 12-недельный курс терапии варениклином в дозе 1 мг два раза в сутки для поддержания отказа от курения. Для пациентов, которые не могут или не хотят резко отказываться от курения, может быть рассмотрен постепенный подход с терапией варениклином. В этом случае следует уменьшить интенсивность курения в течение первых 12 недель терапии с полным прекращением курения к концу этого периода. После этого пациентам следует принимать варениклин еще 12 недель, чтобы общий период лечения составил 24 недели. Пациенты с соответствующей мотивацией, но которым не удалось отказаться от курения в ходе предыдущего курса лечения варениклином, или у которых после успешного завершения лечения наступает рецидив, могут пройти повторный курс лечения варениклином, при условии, что были установлены причины неудачи первой попытки и предприняты меры для их устранения. Пациентам, которые плохо переносят прием препарата Чампикс® из-за нежелательных реакций, возможно снизить дозу до 0,5 мг два раза в сутки временно или постоянно. Риск рецидива курения повышен у лиц, недавно завершивших терапию с целью отказа от курения.

116581

ЛСР-006439/08-190219

Пожилые пациенты Коррекция дозы препарата Чампикс® у пожилых пациентов не требуется. У пожилых людей выше вероятность снижения функции почек, поэтому ее целесообразно оценить перед началом лечения.	*Пожилые пациенты* Коррекция дозы препарата Чампикс® у пожилых пациентов не требуется. У пожилых людей выше вероятность снижения функции почек, поэтому ее целесообразно оценить перед началом лечения.
Нарушение функции почек Изменение дозы препарата Чампикс® у пациентов с легкой степенью нарушения функции почек (клиренс креатинина > 50 мл/мин и ≤ 80 мл/мин) и умеренно выраженной почечной недостаточностью (клиренс креатинина > 30 мл/мин и ≤ 50 мл/мин) не требуется.	*Нарушение функции почек* Изменение дозы препарата Чампикс® у пациентов с легкой степенью нарушения функции почек (клиренс креатинина > 50 мл/мин и ≤ 80 мл/мин) и умеренно выраженной почечной недостаточностью (клиренс креатинина > 30 мл/мин и ≤ 50 мл/мин) не требуется.
У пациентов с умеренной почечной недостаточностью, которые не переносят нежелательные реакции на Чампикс®, суточная доза может быть снижена до 1 мг один раз в сутки.	У пациентов с умеренной почечной недостаточностью, которые не переносят нежелательные реакции на Чампикс®, суточная доза может быть снижена до 1 мг один раз в сутки.
У пациентов с тяжелым нарушением функции почек (клиренс креатинина < 30 мл/мин) рекомендуемая доза препарата Чампикс® составляет 1 мг один раз в сутки. Лечение начинают с дозы 0,5 мг один раз в сутки, которую через 3 дня увеличивают до 1 мг один раз в сутки.	У пациентов с тяжелым нарушением функции почек (клиренс креатинина < 30 мл/мин) рекомендуемая доза препарата Чампикс® составляет 1 мг один раз в сутки. Лечение начинают с дозы 0,5 мг один раз в сутки, которую через 3 дня увеличивают до 1 мг один раз в сутки.
Так как клинические данные по применению препарата Чампикс® у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности ограничены, препарат не рекомендуется назначать таким пациентам (см. раздел «Противопоказания»).	Так как клинические данные по применению препарата Чампикс® у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности ограничены, препарат не рекомендуется назначать таким пациентам (см. раздел «Противопоказания»).

116581

Нарушение функции печени Коррекция дозы препарата Чампикс® у пациентов с нарушением функции печени не требуется. *Дети* Чампикс® не рекомендуется назначать детям и подросткам до 18 лет, поскольку сведения о его безопасности и эффективности в этой возрастной группе недостаточны (см. раздел «Противопоказания»).	*Нарушение функции печени* Коррекция дозы препарата Чампикс® у пациентов с нарушением функции печени не требуется. *Дети и подростки* Чампикс® не рекомендуется назначать детям и подросткам до 18 лет, поскольку его эффективность для отказа от курения в данной возрастной группе не была подтверждена (см. раздел «Противопоказания»).

Руководитель отдела регистрации
ООО «Пфайзер Инновации» С. А. Осипова

Общество с ограниченной ответственностью «Пфайзер Инновации» ОТДЕЛ РЕГИСТРАЦИИ для документов * МОСКВА *

МЗ РФ ФГБУ ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 1 4 НЦЭСМП

116581