АДЕПРЕСС (ADEPRESS)

PAROXETINE

зарегистрировано и произведено
ВЕРОФАРМ ОАО (Россия)

ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА, СОСТАВ И УПАКОВКА

Таблетки, покрытые оболочкой (пленочной) белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
пароксетина гидрохлорида гемигидрат	22.2 мг,
что соответствует содержанию пароксетина	20 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат (кальция фосфат двузамещенный) – 207.8 мг, крахмал кукурузный – 134.8 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (примогель) – 11.4 мг, магния стеарат – 3.8 мг.
Состав оболочки: Opadry II (гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), лактозы моногидрат, макрогол (полиэтиленгликоль 3350, полиэтиленгликоль 4000), титана диоксид) – 10 мг.
10 шт. – упаковки ячейковые контурные (3) – пачки картонные.

Номер и дата регистрации: ЛС-002455 от 21.03.12

Код АТХ: N06AB05

Клинико-фармакологическая группа:
Антидепрессант

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКОЕ ДЕЙСТВИЕ

Антидепрессант. Является селективным ингибитором обратного захвата серотонина (5-гидрокситриптамина, 5-НТ) нейронами головного мозга, что определяет его антидепрессивное действие и эффективность при лечении обсессивно-компульсивного (ОКР) и панического расстройства.
При метаболизме пароксетина не нарушается обусловленный его действием селективный захват 5-НТ нейронами.
Пароксетин обладает низким аффинитетом к м-холинорецепторам.
Обладая селективным действием, в отличии от трициклических антидепрессантов, пароксетин показал низкий аффинитет к α_1-, α_2-, β-адренорецепторам, а также к допаминовым, $5HT_1$-подобным, $5HT_2$-подобным и гистаминовым H_1-рецепторам.
Пароксетин не нарушает психомоторные функции и не потенцирует угнетающие действие на них этанола.
По данным исследования поведения и ЭЭГ у пароксетина выявляются слабые активирующие свойства, когда он назначается в дозах выше тех, которые необходимы для ингибирования захвата 5-НТ. У здоровых добровольцев он не вызывает значительного изменения уровня АД,ЧСС и ЭЭГ.

ФАРМАКОКИНЕТИКА

Всасывание
Пароксетин хорошо всасывается после приема внутрь и подвергается метаболизму "первого прохождения" через печень.
Распределение
Равновесное состояние достигается через 7-14 сут после начала терапии, в дальнейшем фармакокинетика при длительной терапии не изменяется. Клинические эффекты пароксетина (побочное действие и эффективность) не коррелируют с его концентрацией в плазме.
Поскольку пароксетин подвергается эффекту "первого прохождения" через печень, его количество, определяемое в системной циркуляции меньше того, которое абсорбируется из ЖКТ. При увеличении дозы пароксетина или при многократном дозировании происходит частичное поглощение эффекта "первого прохождения" через печень и снижение плазменного клиренса пароксетина. В результате этого возможно повышение концентрации пароксетина в плазме и колебания фармакокинетических параметров, что может наблюдаться только у тех пациентов, у которых при приеме препарата в низких дозах достигаются низкие уровни пароксетина в плазме.
Пароксетин экстенсивно распределяется в тканях, и фармакокинетические расчеты показывают, что только 1% его присутствует в плазме, причем в терапевтических концентрациях 95% связано с белками плазмы.
Метаболизм
Основные метаболиты пароксетина представляют собой полярные и конъюгированные продукты окисления и метилирования, которые быстро выводятся из организма, обладают слабой фармакологической активностью и не влияют на его терапевтическое действие.
Выведение
Выведение из организма метаболитов пароксетина бифазное, сначала в результате "первого прохождения" через печень, а затем оно контролируется системной элиминацией. $T_{1/2}$ пароксетина варьирует, но обычно составляет около 1 дня.
Выделение неизмененного пароксетина с мочой обычно составляет менее 2% от дозы, причем метаболиты составляют около 64% от дозы. Кишечник экскретирует около 36% от дозы, вероятно, через желчь, в которой неизмененный пароксетин составляет менее 1% от дозы. Таким образом, пароксетин выводится преимущественно в виде метаболитов.

Фармакокинетика в особых клинических случаях
Концентрация пароксетина в плазме крови возрастает при нарушении функции печени и почек, а также у лиц пожилого возраста, при этом диапазон плазменных концентраций почти совпадает с диапазоном концентраций у здоровых взрослых добровольцев.

ПОКАЗАНИЯ
- депрессия всех типов, включая реактивную, тяжелую эндогенную депрессию и депрессию, сопровождающуюся тревогой;
- обсессивно-компульсивное расстройство (ОКР);
- паническое расстройство, в т.ч. с агорафобией;
- социальное тревожное расстройство/социальная фобия;
- генерализованное тревожное расстройство;
- посттравматическое стрессовое расстройство.

РЕЖИМ ДОЗИРОВАНИЯ
Таблетки следует принимать 1 раз/сут, утром, во время еды, не разжевывая, запивая водой.
Доза подбирается индивидуально в течение первых 2-3 недель после начала терапии и впоследствии при необходимости корректируется. Эффект в большинстве случаев развивается постепенно.
При *депрессии* рекомендуемая доза составляет 20 мг 1 раз/сут. В случае необходимости дозу постепенно увеличивают на 10 мг с интервалом в 1 неделю до достижения терапевтического эффекта, максимальная суточная доза не должна превышать 50 мг/сут.
При *обсессивно-компульсивных расстройствах* начальная терапевтическая доза составляет 20 мг/сут с последующим еженедельным увеличением на 10 мг до достижения терапевтического ответа. Рекомендуемая средняя терапевтическая доза – 40 мг/сут, при необходимости доза может быть увеличена до 60 мг/сут.
При *панических расстройствах* начальная доза – 10 мг/сут (для снижения возможного риска развития обострения панической симптоматики) с последующим еженедельным увеличением на 10 мг. Средняя терапевтическая доза – 40 мг/сут. Максимальная суточная доза не должна превышать 60 мг/сут.
При *социально-тревожных расстройствах/социофобиях* начальная доза составляет 20 мг/сут, при отсутствии эффекта в течение как минимум 2 недель возможно увеличение дозы максимально до 50 мг/сут. Дозу следует увеличивать на 10 мг с интервалами не менее недели в соответствии с клиническим эффектом.
При *посттравматическом стрессовом расстройстве* для большинства пациентов начальная и терапевтическая дозы составляют 20 мг/сут. В некоторых случаях рекомендуется увеличение дозы максимально до 50 мг/сут. Дозу следует увеличивать на 10 мг каждую неделю в соответствии с клиническим эффектом.
При *генерализованных тревожных расстройствах* начальная и терапевтическая дозы составляют 20 мг/сут.
При **почечной и/или печеночной недостаточности** рекомендуемая доза составляет 20 мг/сут.
Для **пожилых пациентов** суточная доза не должна превышать 40 мг.
Для предотвращения рецидивов необходимо проводить поддерживающую терапию. После исчезновения симптомов депрессии этот курс может составлять 4-6 мес, а при обсессивных и панических расстройствах – более 4-6 мес.
Следует избегать резкой отмены препарата.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ
Со стороны нервной системы: часто – сонливость или бессонница, тремор, астения, головокружение, тревога; иногда – спутанность сознания, галлюцинации, экстрапирамидные расстройства, парестезии, снижение способности к концентрации внимания; в отдельных случаях – судороги, мании, серотониновый синдром (ажитация, гиперрефлексия, диарея), панические расстройства.
Со стороны органа зрения: в отдельных случаях – нарушение зрения, мидриаз.
Со стороны костно-мышечной системы: в отдельных случаях – миастения, миоклония, артралгия, миалгия.
Со стороны мочевыделительной системы: учащенное мочеиспускание; в отдельных случаях – задержка мочи.
Со стороны половой системы: расстройства эякуляции, расстройства либидо; в отдельных случаях – гиперпролактинемия/галакторея, аноргазмия.
Со стороны пищеварительной системы: снижение аппетита, тошнота, рвота, сухость во рту; иногда – запоры или диарея; в отдельных случаях – гепатит.
Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия.
Аллергические реакции: в отдельных случаях – сыпь, крапивница, экхиматозы, зуд, ангионевротический отек.
Прочие: повышенное потоотделение; в единичных случаях – гипонатриемия, нарушение секреции антидиуретического гормона.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ
- одновременный прием ингибиторов МАО и период 14 дней после их отмены;
- нестабильная эпилепсия;
- беременность;
- период лактации (грудного вскармливания);
- повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при печеночной недостаточности, почечной недостаточности, закрытоугольной глаукоме, гиперплазии предстательной железы, мании, патологии сердца, эпилепсии, судорожных состояниях, одновременном назначении электроимпульсной терапии, одновременном приеме препаратов, повышающих риск кровотечения, наличии факторов риска повышенной кровоточивости и заболеваниях, повышающих риск кровоточивости, а также пациентам пожилого возраста.

БЕРЕМЕННОСТЬ И ЛАКТАЦИЯ

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Во избежание развития злокачественного нейролептического синдрома с осторожностью следует назначать Адепресс пациентам, принимающим нейролептики.

Лечение Адепрессом назначают через 2 недели после отмены ингибиторов МАО.

У пациентов пожилого возраста на фоне приема Адепресса возможна гипонатриемия.

В некоторых случаях требуется коррекция дозы одновременно применяемых инсулина и/или пероральных гипогликемических препаратов.

При развитии судорог лечение Адепрессом прекращают.

При первых признаках мании следует отменить терапию Адепрессом.

В течение первых нескольких недель терапии Адепрессом следует тщательно наблюдать за состоянием пациента в связи с возможными суицидальными попытками.

Во время терапии Адепрессом следует воздерживаться от приема алкоголя в связи с усилением его токсического эффекта.

Использование в педиатрии

Применение Адепресса у детей не рекомендуется, поскольку его безопасность и эффективность у этой группы пациентов не установлены.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Несмотря на то, что пароксетин не ухудшает когнитивные и психомоторные функции, пациенты должны воздерживаться или соблюдать предельную осторожность при управлении автомобилем и при занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы: тошнота, расширение зрачков, лихорадка, изменения АД, головная боль, непроизвольные мышечные сокращения, ажитация, тревожность,тахикардия. В очень редких случаях, при одновременном приеме с другими психотропными средствами и/или этанолом (алкоголем), возможны изменения на ЭКГ, кома.

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля. При необходимости проводят симптоматическую терапию. Специфического антидота нет.

ЛЕКАРСТВЕННОЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ

Одновременный прием пищи и антацидных средств не влияет на всасывание и фармакокинетические параметры Адепресса.

Не следует принимать Адепресс одновременно с ингибиторами МАО и в течение 14 дней после их отмены.

Во время терапии Адепрессом следует воздерживаться от приема алкоголя в связи с усилением токсического эффекта этанола.

В связи ингибированием пароксетином цитохрома Р450 возможно усиление эффекта барбитуратов, фенитоина, непрямых антикоагулянтов, трициклических антидепрессантов, фенотиазиновых нейролептиков и антиаритмиков класса 1 С, метопролола и повышение риска развития побочных эффектов при одновременном назначении этих лекарственных средств.

При одновременном назначении с препаратами, ингибирующими ферменты печени, может потребоваться снижение дозы Адепресса.

Пароксетин увеличивает время кровотечения на фоне приема варфарина при неизменном протромбиновом времени.

При одновременном назначении Адепресса с атипичными нейролептиками, трициклическими антидепрессантами, препаратами фенотиазинового ряда, ацетилсалициловой кислотой, НПВС возможно нарушение процесса свертывания крови.

Одновременное назначение Адепресса с серотонинергическими препаратами (трамадол, суматриптан) может привести к усилению серотонинергического эффекта.

Отмечено взаимное усиление действия триптофана, препаратов лития и пароксетина.

При одновременном назначении Адепресса с фенитоином и другими противосудорожными препаратами возможно снижение концентрации пароксетина в плазме и увеличение частоты побочных эффектов.

Пароксетин намного слабее подавляет антигипертензивные эффекты гуанетидина по сравнению с антидепрессантами, ингибирующими захват норадреналина.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ И СРОКИ ГОДНОСТИ

Список Б. Препарат следует хранить в сухом, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Срок годности – 2 года.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

Препарат отпускается по рецепту.

ВЕРОФАРМ ОАО
107023 Москва, Барабанный пер. 3
Тел.: (495) 792-53-30; Факс: (495) 792-53-28