Актапароксетин



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с одной стороны и надписью "P20" - с другой.

	1 таб.
пароксетина гидрохлорид	22.22 мг,
что соответствует содержанию пароксетина	20 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат 2255 - 4.5 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 6 мг, маннитол DC - 133.64 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 133.64 мг, сополимер метилметакрилата, диметиламиноэтилметакрилата и бутилметакрилата (эудрагит E100) - 1.8 мг, опадрай AMB белый (водный раствор): поливиниловый спирт частично гидролизованный - 5.46 мг, титана диоксид (E171) - 3.84 мг, тальк - 2.4 мг, лецитин соевый (E322) - 0.24 мг, ксантановая камедь (E415) - 0.06 мг.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой голубого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне и надписью "P30" - на другой.

	1 таб.
пароксетина гидрохлорид	33.33 мг,
что соответствует содержанию пароксетина	30 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат 2255 - 6.75 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 9 мг, маннитол DC - 200.46 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 200.46 мг, сополимер метилметакрилата, диметиламиноэтилметакрилата и бутилметакрилата (эудрагит E100) - 2.7 мг, опадрай AMB синий (водный раствор): поливиниловый спирт частично гидролизованный - 8.19 мг, титана диоксид (E171) - 4.93 мг, тальк - 3.6 мг, индигокармин (E132) - 0.83 мг, лецитин соевый (E322) - 0.36 мг, ксантановая камедь (E415) - 0.086 мг, краситель солнечный закат желтый (E110) - 0.002 мг, краситель хинолиновый желтый (E104) - 0.002 мг.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с одной стороны и надписью "P20" - с другой.

	1 таб.
пароксетина гидрохлорид	22.22 мг,
что соответствует содержанию пароксетина	20 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат 2255 - 4.5 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 6 мг, маннитол DC - 133.64 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 133.64 мг, сополимер метилметакрилата, диметиламиноэтилметакрилата и бутилметакрилата (эудрагит E100) - 1.8 мг, опадрай AMB белый (водный раствор): поливиниловый спирт частично гидролизованный - 5.46 мг, титана диоксид (E171) - 3.84 мг, тальк - 2.4 мг, лецитин соевый (E322) - 0.24 мг, ксантановая камедь (E415) - 0.06 мг.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой голубого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне

и надписью "P30" - на другой.

	1 таб.
пароксетина гидрохлорид	33.33 мг,
что соответствует содержанию пароксетина	30 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат 2255 - 6.75 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 9 мг, маннитол DC - 200.46 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 200.46 мг, сополимер метилметакрилата, диметиламиноэтилметакрилата и бутилметакрилата (эудрагит E100) - 2.7 мг, опадрай AMB синий (водный раствор): поливиниловый спирт частично гидролизованный - 8.19 мг, титана диоксид (E171) - 4.93 мг, тальк - 3.6 мг, индигокармин (E132) - 0.83 мг, лецитин соевый (E322) - 0.36 мг, ксантановая камедь (E415) - 0.086 мг, краситель солнечный закат желтый (E110) - 0.002 мг, краситель хинолиновый желтый (E104) - 0.002 мг.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антидепрессант. Пароксетин является мощным и селективным ингибитором захвата серотонина (5-гидрокситриптамин, 5-НТ) нейронами головного мозга, что определяет его антидепрессивное действие и эффективность при лечении обсессивно-компульсивного и панического расстройства.

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 терапевтическое действие. При метаболизме пароксетина не нарушается обусловленный его действием селективный захват 5-НТ нейронами.

Пароксетин обладает низким аффинитетом к м-холинорецепторам. Обладая селективным действием, в отличие от трициклических антидепрессантов, пароксетин характеризуется низким аффинитетом к α_1-, α_2-, β-адренорецепторам, а также к допаминовым, 5-HT_1-подобным, 5-HT_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 пациентов, принимающих пароксетин, доказано, что при назначении в дозах выше тех, которые необходимы для ингибирования захвата 5-НТ, у пароксетина выявляются слабые активирующие свойства. У здоровых добровольцев он не вызывает значительного изменения уровня АД, ЧСС и ЭЭГ.

В отличие от антидепрессантов, которые ингибируют захват норадреналина, пароксетин намного слабее подавляет антигипертензивные эффекты гуанетидина.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь пароксетин хорошо всасывается из ЖКТ. Подвергается метаболизму при "первом прохождении" через печень.

Клинические эффекты пароксетина (побочное действие и эффективность) не коррелируют с его концентрацией в плазме.

Распределение

C_{ss} достигается к 7-14 дню после начала лечения, фармакокинетика во время длительного лечения не изменяется.

В терапевтических концентрациях связывание пароксетина с белками плазмы составляет 95%.

Пароксетин экстенсивно распределяется в тканях, и фармакокинетические расчеты показывают, что только 1% его присутствует в плазме.

Метаболизм

Поскольку метаболизм пароксетина включает эффект "первого прохождения" через печень, его количество, определяемое в системном кровотоке, меньше того, которое абсорбируется из ЖКТ. При увеличении дозы пароксетина или при многократном дозировании, когда возрастает нагрузка на организм, 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 концентрации пароксетина в плазме.

Выведение

$T_{1/2}$ варьирует, но обычно составляет около 1 сут. Выведение из организма метаболитов пароксетина бифазное,

сначала в результате метаболизма при первом прохождении через печень, а затем оно контролируется системной элиминацией.

Пароксетин выводится преимущественно в виде метаболитов: 64% метаболитов выводится с мочой и 36% с желчью через кишечник. В неизмененном виде выводится 2% с мочой и 1% с желчью.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов пожилого возраста, а также у пациентов с почечной и печеночной недостаточностью тяжелой степени, концентрация пароксетина в плазме повышена, а диапазон плазменных концентраций у них почти совпадает с диапазоном у здоровых взрослых добровольцев.

Показания к применению:

— депрессия всех типов (в т.ч. реактивная, тяжелая эндогенная депрессия и депрессия, сопровождающаяся тревогой);

— обсессивно-компульсивное расстройство;

— паническое расстройство, в т.ч. с агорафобией;

— социальное тревожное расстройство/социальная фобия;

— генерализованное тревожное расстройство;

— лечение посттравматического стрессового расстройства.

Относится к болезням:

- Депрессия
- Паническое расстройство
- Тревожное расстройство
- Фобия

Противопоказания:

— одновременный прием ингибиторов МАО и период до 14 дней после их отмены;

— одновременный прием тиоридазина;

— нестабильная эпилепсия;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

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

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь 1 раз/сут, утром, во время еды. Таблетку проглатывают целиком, запивая водой.

Дозу подбирают индивидуально в течение первых 2-3 недель после начала терапии и впоследствии при необходимости корректируют.

Для *лечения депрессий* назначают препарат в дозе 20 мг 1 раз/сут. В случае необходимости дозу постепенно увеличивают на 10 мг/сут, максимальная суточная доза - 50 мг.

При *обсессивно-компульсивных расстройствах* начальная терапевтическая доза составляет 20 мг/сут, с последующим еженедельным увеличением ее на 10 мг. Рекомендуемая средняя терапевтическая доза - 40 мг/сут, при необходимости доза может быть увеличена до 60 мг/сут.

При *панических расстройствах* Актапароксетин назначают в начальной дозе 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 доза - 50 мг/сут.

При *социально-тревожных расстройствах/социофобии* 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 1 недели в соответствии с клиническим эффектом.

При *посттравматических нарушениях психики* 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 рекомендуемая дозы - 20 мг/сут.

При **почечной и/или печеночной недостаточности** рекомендуемая суточная доза составляет 20 мг.

Для **пациентов пожилого возраста** суточная доза не должна превышать 40 мг. В целях предупреждения развития синдрома отмены прекращение приема препарата проводится постепенно.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: сонливость, тремор, астения, бессонница, головокружение, утомляемость, судороги, экстрапирамидные расстройства, серотониновый синдром, галлюцинации, мания, спутанность сознания, ажитация, тревога, деперсонализация, приступы паники, повышенная нервная возбудимость, парестезии, снижение способности к концентрации внимания.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия, миастения, миоклония, миопатический синдром.

Со стороны органов чувств: нарушения зрения, изменения вкуса.

Со стороны половой системы: нарушения половой функции (в т.ч. импотенция и расстройства эякуляции), гиперпролактинемия/галакторея, аноргазмия.

Со стороны мочевыделительной системы: задержка мочи, учащение мочеиспускания.

Со стороны пищеварительной системы: снижение аппетита, тошнота, рвота, сухость во рту, запоры или диарея; очень редко - гепатит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия.

Аллергические реакции: сыпь, крапивница, экхимозы, зуд, ангионевротический отек.

Прочие: повышенное потоотделение, гипонатриемия, нарушение секреции АДГ, синдром отмены при резкой отмене препарата, ринит.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, расширение зрачков, лихорадка, повышение АД, головная боль, непроизвольные мышечные сокращения, ажитация, тревожность, синусовая тахикардия, брадикардия, узловой ритм; очень редко - угнетение сознания вплоть до комы (при одновременном приеме с другими психотропными средствами и/или алкоголем).

Лечение: промывание желудка, активированный уголь, симптоматическая терапия. Специфического антидота нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Актапароксетин противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Прием пищи и антацидных средств не влияет на всасывание и фармакокинетические параметры препарата.

Пароксетин несовместим с ингибиторами МАО.

При одновременном назначении с пароксетином увеличивается концентрация прециклидина.

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

В связи с ингибированием пароксетином изоферментов цитохрома Р450 возможно усиление действия барбитуратов, фенитоина, непрямых антикоагулянтов, трициклических антидепрессантов, фенотиазиновых нейролептиков, антиаритмиков класса I 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 пароксетина.

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

При одновременном назначении пароксетина с атипичными антипсихотическими средствами, фенотиазинами, трициклическими антидепрессантами, ацетилсалициловой кислотой, НПВС рекомендуется соблюдать осторожность в связи с возможными нарушениями свертываемости крови.

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

Отмечено взаимное усиление действия триптофана, препаратов лития и пароксетина.

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

Особые указания и меры предосторожности:

Во избежание развития ЗНС пациентам, принимающим нейролептики, препарат назначают с осторожностью.

Лечение пароксетином назначают через 2 недели после отмены ингибиторов МАО.

У пациентов пожилого возраста во время приема препарата возможна гипонатриемия.

В некоторых случаях при одновременном применении Актапароксетина с инсулином и/или пероральными гипогликемическими препаратами требуется коррекция дозы последних.

При развитии судорог лечение пароксетином следует прекратить.

При первых признаках мании следует отменить терапию пароксетином.

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

Пациент должен быть информирован, что в период лечения следует воздерживаться от употребления алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пароксетин не ухудшает когнитивные и психомоторные функции. Тем не менее, как и при лечении другими психотропными препаратами, пациенты должны соблюдать осторожность при управлении автомобилем и движущимися механизмами. В период лечения пациент должен воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При почечной недостаточности препарат Актапароксетин назначают с осторожностью. Рекомендуемая суточная доза составляет 20 мг.

При нарушениях функции печени

При печеночной недостаточности Актапароксетин назначают с осторожностью. Рекомендуемая суточная доза составляет 20 мг.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказано: детский и подростковый возраст до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Aktaparoksetin