Апо-Пароксетин



Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антидепрессант, селективный ингибитор обратного захвата серотонина. Обладает бициклической структурой, отличной от структуры других известных антидепрессантов.

Оказывает антидепрессивное и анксиолитическое действие при достаточно выраженном стимулирующем (активизирующем) эффекте.

Антидепрессивное (тимоаналептическое) действие связано со способностью пароксетина избирательно блокировать обратный захват серотонина пресинаптической мембраной, чем обусловлено повышение свободного содержания этого нейромедиатора в синаптической щели и усиление его активности в ЦНС.

Влияние на м-холинорецепторы, α- и β-адренорецепторы незначительно, что определяет крайне слабую выраженность соответствующих побочных эффектов.

Фармакокинетика

После приема внутрь пароксетин хорошо абсорбируется из ЖКТ. Прием пищи не влияет на абсорбцию. C_{ss} устанавливается к 7-14 дню с момента начала терапии.

Основными метаболитами пароксетина являются полярные и конъюгированные продукты окисления и метилирования. Ввиду низкой фармакологической активности метаболитов их влияние на терапевтическую эффективность маловероятно.

$T_{1/2}$ в среднем составляет 16-24 ч. Менее, чем 2% выводится с мочой в неизмененном виде, остальная часть - в виде метаболитов либо с мочой (64%), либо с желчью.

Выведение пароксетина носит двухфазный характер.

При длительном непрерывном приеме фармакокинетические параметры не меняются.

Показания к применению:

Эндогенные, невротические и реактивные депрессии.

Относится к болезням:

- Депрессия
- Неврит
- Неврозы

Противопоказания:

Одновременный прием ингибиторов МАО и период до 14 дней после их отмены, повышенная чувствительность к пароксетину.

Способ применения и дозы:

При приеме внутрь начальная доза составляет 10-20 мг/сут. При необходимости, в зависимости от показаний, дозу повышают до 40-60 мг/сут. Увеличение дозы проводят постепенно - на 10 мг с интервалом в 1 неделю. Частота приема - 1 раз/сут. Лечение длительное. Эффективность терапии оценивается через 6-8 недель.

Для пожилых и ослабленных больных, а также при нарушениях функции почек и печени начальная доза - 10 мг/сут; максимальная доза - 40 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: редко (при применении в дозах более 20 мг/сут) - сонливость, тремор, астения, бессонница.

Со стороны пищеварительной системы: редко (при применении в дозах более 20 мг/сут) - тошнота, сухость во рту; в отдельных случаях - запоры.

Прочие: редко (при применении в дозах более 20 мг/сут) - усиление потоотделения, нарушения эякуляции.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с пароксетином возможно повышение концентраций в плазме крови средств, метаболизирующихся при участии изофермента CYP2D6 системы цитохрома P_{450} (антидепрессантов, антипсихотических средств производных фенотиазина, антиаритмических препаратов IC класса).

При одновременном применении средств, индуцирующих или ингибирующих белковый метаболизм, возможны изменения метаболизма и фармакокинетических параметров пароксетина.

При одновременном применении усиливается действие алпразолама вследствие уменьшения его метаболизма в связи с ингибированием изоферментов CYP3A системы цитохрома P_{450} под влиянием пароксетина.

При одновременном применении с варфарином, пероральными антикоагулянтами возможно увеличение времени кровотечения при неизмененном протромбиновом времени.

При одновременном применении с декстрометорфаном, дигидроэрготамином описаны случаи серотонинового синдрома.

При одновременном применении с интерфероном возможно изменение антидепрессивного действия пароксетина.

Одновременное применение триптофана может вызвать развитие серотонинового синдрома, проявляющегося ажитацией, беспокойством, расстройствами со стороны ЖКТ, включая диарею.

При одновременном применении с перфеназином усиливает побочные эффекты со стороны ЦНС вследствие ингибирования метаболизма перфеназина под влиянием пароксетина.

При одновременном применении повышается концентрация в плазме крови трициклических антидепрессантов, возникает риск развития серотонинового синдрома.

Одновременный прием циметидина повышает концентрацию пароксетина в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

Прекращение применения пароксетина следует проводить, постепенно уменьшая дозу, во избежание синдрома отмены, который проявляется головокружением, тошнотой, рвотой, бессонницей, спутанностью сознания, повышенным потоотделением.

В период лечения пароксетином противопоказано употребление алкоголя.

С осторожностью применять через 14 дней после отмены ингибиторов МАО, постепенно увеличивая дозу. Ингибиторы МАО не следует назначать в течение 2 недель после полной отмены пароксетина.

При одновременном применении с препаратами, ингибирующими метаболизм ферментов печени, пароксетин следует применять в наименьших рекомендуемых дозах. При одновременном применении с препаратами, индуцирующими метаболизм ферментов, не требуется изменения начальных доз пароксетина.

С осторожностью применять пароксетин с препаратами лития (рекомендуется контролировать концентрации лития в плазме крови), пероральными антикоагулянтами.

В *экспериментальных исследованиях* не установлено канцерогенных и мутагенных свойств пароксетина.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

С осторожностью применять у пациентов, деятельность которых связана с необходимостью высокой концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При нарушениях функции почек начальная доза - 10 мг/сут; максимальная доза - 40 мг/сут.

При нарушениях функции печени

При нарушениях функции печени начальная доза - 10 мг/сут; максимальная доза - 40 мг/сут.

Применение в пожилом возрасте

Для пожилых больных начальная доза - 10 мг/сут; максимальная доза - 40 мг/сут.

Источник: http://drugs.thead.ru/Apo-Paroksetin