Асентра



Код АТХ:

- N06AB06

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Сертралин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, со скошенными краями и насечкой с одной стороны; на изломе - белая шероховатая масса.

	1 таб.
сертралина гидрохлорид	55.95 мг,
что соответствует содержанию сертралина	50 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат, гидроксипропилцеллюлоза, натрия крахмала гликолат, кальция дигидрофосфат, целлюлоза микрокристаллическая, тальк.

Состав оболочки: Opadry 03H28758 (гипромеллоза, титана диоксид, тальк, пропиленгликоль).

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, со скошенными краями и насечкой с одной стороны; на изломе - белая шероховатая масса.

	1 таб.
сертралина гидрохлорид	111.9 мг,
что соответствует содержанию сертралина	100 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат, гидроксипропилцеллюлоза, натрия крахмала гликолат, кальция дигидрофосфат, целлюлоза микрокристаллическая, тальк.

Состав оболочки: Opadry 03H28758 (гипромеллоза, титана диоксид, тальк, пропиленгликоль).

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антидепрессант. Специфический ингибитор обратного захвата серотонина (5-НТ) в нейронах. На метаболизм норадреналина и допамина влияет незначительно. В терапевтических дозах сертралин блокирует захват серотонина в тромбоцитах человека. Препарат не оказывает стимулирующего, седативного или антихолинергического действия. Не обладает сродством к серотониновым, допаминовым, гистаминовым, бензодиазепиновым, GABA, холино- и адренорецепторам.

Антидепрессивный эффект отмечается к концу второй недели регулярного приема Асентры, тогда как максимальный эффект достигается только через 6 недель.

В отличие от трициклических антидепрессантов при назначении Асентры не происходит увеличения массы тела; в ряде случаев отмечено ее снижение.

Препарат не вызывает психической или физической лекарственной зависимости.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема препарата внутрь сертралин медленно абсорбируется из ЖКТ, C_{max} в плазме крови достигается через 4.5-8.4 ч.

Распределение

C_{ss} устанавливается в пределах недели при ежедневном приеме 1 раз/сут. Связывание сертралина с белками плазмы составляет 98%. V_d >20 л/кг.

Сертралин выделяется с грудным молоком. Данных о его способности проникать через плацентарный барьер нет.

Метаболизм и выведение

Сертралин подвергается интенсивной биотрансформации при "первом прохождении" через печень путем N-деметилирования. Основной метаболит – N-десметилсертралин - менее активен по сравнению с исходным соединением. Метаболиты выделяются с мочой и с калом в эквивалентных количествах. Около 0.2% сертралина выводится почками в неизмененном виде. $T_{1/2}$ препарата составляет 22-36 ч и не зависит от возраста или пола пациентов. Для N-десметилсертралина $T_{1/2}$ - 62-104 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

$T_{1/2}$ и AUC в плазме крови увеличиваются при нарушении функции печени.

Параметры фармакокинетики сертралина у больных как с легкими и умеренными нарушениями функции почек (КК 20-50 мл/мин), так и с выраженными нарушениями функции почек (КК<20мл/мин) не меняются при его постоянном применении.

Сертралин не выводится при диализе.

Показания к применению:

— лечение и профилактика депрессий различной этиологии;

— лечение обсессивно-компульсивных расстройств (ОКР);

— лечение панических расстройств;

— посттравматические стрессорные расстройства (ПТСР).

Относится к болезням:

- Депрессия
- Паническое расстройство

Противопоказания:

— одновременный прием ингибиторов МАО и в течение 14 дней после их отмены;

— одновременное применение триптофана или фенфлурамина;

— нестабильная эпилепсия;

— детский возраст до 6 лет;

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* назначают препарат при неврологических нарушениях (в т.ч. задержка умственного развития), маниакальных состояниях, эпилепсии, печеночной и/или почечной недостаточности, снижении массы тела, детям старше 6 лет.

Способ применения и дозы:

При *депрессии и ОКР* у **взрослых** средняя начальная доза составляет 50 мг 1 раз/сут, утром или вечером. Дневную дозу можно постепенно, не раньше чем через неделю увеличивать с 50 мг до максимальной суточной дозы 200 мг.

При *панических расстройствах и ПТСР* начальная доза Асентры составляет 25 мг 1 раз/сут, утром или вечером. Через неделю можно увеличить дозу до 50 мг 1 раз/сут, а затем постепенно, не раньше чем через неделю, повышать до максимальной суточной дозы 200 мг.

Начальная доза Асентры для **детей в возрасте от 6 до 12 лет** составляет 25 мг сертралина 1 раз/сут, утром или вечером. Через неделю можно увеличить дозу до 50 мг 1 раз/сут. Для **детей в возрасте от 12 до 17 лет** начальная доза составляет 50 мг 1 раз/сут утром или вечером. При необходимости суточную дозу можно постепенно, не раньше чем через неделю, повышать с 50 мг до максимальной суточной дозы 200 мг. Чтобы избежать передозировки следует принимать во внимание меньшую массу тела у детей по сравнению со взрослыми, и при увеличении дозы более 50 мг/сут необходимо тщательное наблюдение за этой категорией больных: при первых признаках передозировки следует отменить препарат.

Удовлетворительный терапевтический результат достигается обычно через 7 дней от начала лечения. Однако для достижения полного терапевтического эффекта требуется регулярный прием препарата в течение 2-4 недель. У пациентов с ОКР для достижения хорошего результата может потребоваться 8-12 недель. Минимальная доза, обеспечивающая лечебное действие, сохраняется в дальнейшем как поддерживающая.

У **пациентов пожилого возраста** нет необходимости специального подбора дозы.

При **нарушениях функции печени** препарат следует назначать с осторожностью. При **тяжелых нарушениях функции печени** дозу препарата следует уменьшить или же увеличить интервалы между приемами.

У **пациентов с нарушениями функции почек** специальной коррекции режима дозирования не требуется.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: сухость во рту, повышенное потоотделение, сонливость, головная боль, головокружение, тремор, тревога, ажитация, гипомания, мания, бессонница, снижение аппетита (редко - повышение), вплоть до анорексии, слабость, двигательное беспокойство.

Со стороны пищеварительной системы: метеоризм, тошнота, рвота, диарея, боль в животе; редко (0.8%) при длительном применении - асимптоматическое повышение активности трансаминаз в сыворотке крови (нормализующееся при отмене препарата).

Прочие: нарушения зрения, покраснение кожи, расстройства эякуляции, снижение либидо, снижение массы тела.

Со стороны лабораторных показателей: обратимая гипонатриемия (чаще у лиц пожилого возраста, а также при приеме диуретиков или ряда других препаратов), связанная с синдромом неадекватной секреции АДГ.

При применении препарата в единичных случаях были отмечены экстрапирамидные расстройства, дискинезии, тремор, судороги, нарушения менструального цикла, гиперпролактинемия, галакторея, кожная сыпь; изредка - многоформная эритема. Двигательные нарушения чаще отмечались у больных с указаниями на их наличие в анамнезе или при сопутствующем применении антипсихотических средств.

При прекращении применения препарата синдром отмены возникает редко. Возможны парестезии, гипестезии, симптомы депрессии, галлюцинации, агрессивные реакции, психомоторное возбуждение, беспокойство или симптомы психоза. Эти проявления тяжело дифференцировать от симптомов основного заболевания, и они могут возникать при применении и других антидепрессантов.

Передозировка:

Симптомы: возможно возникновение серотонинового синдрома с тошнотой, рвотой, сонливостью, тахикардией, ажитацией, головокружением, психомоторным возбуждением, диареей, повышенным потоотделением, миоклонусом, гиперрефлексией. Тяжелых симптомов не выявлено даже при применении препарата в высоких дозах. Однако при одновременном приеме с другими препаратами или этанолом может возникать тяжелое отравление, иногда со смертельным исходом.

Лечение: специфические антидоты отсутствуют. При необходимости - интенсивная поддерживающая терапия и контроль за состоянием жизненно важных функций организма. Введение активированного угля может быть более эффективным, чем промывание желудка, искусственную рвоту вызывать не рекомендуется. Необходимо поддерживать проходимость дыхательных путей. Форсированный диурез, проведение диализа, гемоперфузии или переливание крови могут оказаться безрезультатными (из-за большого объема распределения сертралина).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований по безопасности применения сертралина при беременности не проводилось. Назначение препарата возможно только в том случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Женщинам детородного возраста в период применения препарата следует рекомендовать пользоваться эффективными контрацептивными средствами.

Сертралин обнаруживается в грудном молоке. При необходимости назначения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание из-за отсутствия достоверных данных о безопасности применения сертралина в этот период.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении сертралина и ингибиторов МАО (включая избирательно действующие ингибиторы МАО с обратимым типом действия – селегилин и моклобемид) возможно развитие серотонинового синдрома: гипертермия, ригидность, миоклонус, лабильность вегетативной нервной системы (быстрые колебания параметров дыхательной и сердечно-сосудистой системы), изменения психического статуса, включая повышенную раздражительность, выраженное возбуждение, спутанность сознания, которое в некоторых случаях может перейти в делириозное состояние или кому (такая комбинация противопоказана). Аналогичные осложнения (иногда со смертельным исходом) возникают при назначении ингибиторов МАО на фоне лечения антидепрессантами, угнетающими нейрональный захват моноаминов или сразу после их отмены.

У здоровых добровольцев применение сертралина в дозе 200 мг/сут не влияет на действие этанола, карбамазепина или галоперидола, а также на умственную деятельность и психомоторную активность (тем не менее комбинированное назначение сертралина и лекарственных средств, угнетающих ЦНС, требует пристального внимания, а одновременное применение с этанолом и этанолсодержащими препаратами противопоказано).

При совместном назначении непрямых антикоагулянтов (производные кумарина) с сертралином отмечается значительное увеличение протромбинового времени (требуется контроль протромбинового времени в начале применения сертралина и после его отмены).

Фармакокинетическое взаимодействие

При совместном применении сертралин может взаимодействовать с другими препаратами, связывающимися с белками плазмы крови (диазепамом, толбутамидом и варфарином).

Одновременное применение препарата с циметидином в значительной степени снижает клиренс сертралина.

Длительный прием сертралина в дозе 50 мг/сут с дезипрамином (лекарственное средство, метаболизирующееся изоферментом CYP2D6) сопровождается увеличением концентрации дезипрамина в плазме крови.

В экспериментах in vitro установлено, что осуществляемое изоферментом CYP3A3/4 бетагидроксилирование эндогенного кортизола, а также метаболизм карбамазепина и терфенадина при длительном назначении сертралина в дозе 200 мг/сут не изменяются.

Концентрация в плазме крови толбутамида, фенитоина и варфарина при длительном назначении сертралина в дозе 200 мг/сут не изменяется, следовательно, можно сделать заключение, что сертралин не угнетает изофермент CYP2C9.

Сертралин не влияет на концентрацию диазепама в сыворотке крови, что говорит об отсутствии ингибирования изофермента CYP2C19.

По данным исследований in vitro сертралин практически не влияет или минимально угнетает изофермент CYP1A2.

Фармакокинетика лития статистически значимо не изменяется при сопутствующем введении сертралина; но тремор наблюдается чаще, что предполагает возможность фармакодинамического взаимодействия (такая комбинация требует осторожности). Также с осторожностью следует назначать сертралин с другими препаратами, влияющими на серотонинергическую передачу.

При замене одного ингибитора нейронального захвата на другой нет необходимости в "периоде отмывания". Однако требуется осторожность при изменении курса лечения. Следует избегать совместного назначения триптофана или фенфлурамина с сертралином.

В клинических исследованиях показано, что сертралин вызывает минимальную индукцию ферментов печени. Одновременное назначение сертралина в дозе 200 мг и антипирина приводит к достоверному уменьшению $T_{1/2}$ антипирина (данное изменение выявляется всего в 5% наблюдений).

При совместном введении сертралин не влияет на бета-адреноблокирующее действие атенолола.

При введении сертралина в суточной дозе 200 мг лекарственного взаимодействия с глибенкламидом и дигоксином не выявлено.

Особые указания и меры предосторожности:

По данным клинических исследований препарат сертралин эффективен и безопасен в лечении депрессий у пациентов, перенесших инфаркт миокарда, и у больных нестабильной стенокардией. Плацебо-контролируемые исследования показали эффективность и безопасность сертралина у больных сахарным диабетом.

Сертралин не назначают совместно с ингибиторами МАО, а также в течение 14 дней после прекращения лечения ингибиторами МАО; после отмены сертралина в течение 14 дней не назначают ингибиторы МАО.

Пациенты с депрессией являются группой риска в отношении суицидальных попыток. Эта опасность сохраняется до развития ремиссии. Поэтому от начала лечения и до достижения оптимального клинического эффекта следует установить постоянное медицинское наблюдение за пациентом.

В настоящее время отсутствует достаточный опыт применения сертралина у больных, подвергающихся электросудорожной терапии. Возможный успех или риск подобного комбинированного лечения не изучен.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Назначение сертралина не сопровождается нарушением психомоторных функций. Однако его применение одновременно с другими препаратами может привести к нарушению внимания и координации движений. Поэтому во время терапии сертралином управлять транспортными средствами или заниматься деятельностью, связанной с повышенным риском не рекомендуется.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* назначают препарат при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

При **нарушениях функции печени** препарат следует назначать с осторожностью. При **тяжелых нарушениях функции печени** дозу препарата следует уменьшить или же увеличить интервалы между приемами.

Применение в пожилом возрасте

У **пациентов пожилого возраста** нет необходимости специального подбора дозы.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст до 6 лет. Детям младше 6 лет препарат назначают с осторожностью (см. Режим

дозирования).

Условия хранения:

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

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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