Депрефолт



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 оболочкой белого или почти белого цвета, овальные, двояковыпуклые, с риской с одной стороны, с боковыми рисками и с гравировкой "50" с другой стороны.

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

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный, целлюлоза микрокристаллическая, натрия кроскармеллоза, коповидон, лактозы моногидрат, магния стеарат, опадрай белый Y-5-7068, гипромеллоза 3cP, гидроксипропилцеллюлоза, титана диоксид, полиэтиленгликоль (макрогол 400), гипромеллоза 50cP.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой белого или почти белого цвета, овальные, двояковыпуклые, с риской с одной стороны, с боковыми рисками и с гравировкой "100" с другой стороны.

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

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный, целлюлоза микрокристаллическая, натрия кроскармеллоза, коповидон, лактозы моногидрат, магния стеарат, опадрай белый Y-5-7068, гипромеллоза 3cP, гидроксипропилцеллюлоза, титана диоксид, полиэтиленгликоль (макрогол 400), гипромеллоза 50cP.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антидепрессант. Селективный ингибитор обратного захвата серотонина (5-НТ). На обратный захват норадреналина и допамина влияет незначительно. В терапевтических дозах сертралин блокирует также захват серотонина в тромбоцитах человека.

Не оказывает стимулирующего, седативного и антихолинергического действия. Препарат не обладает сродством к м-холинорецепторам, серотониновым, допаминовым, гистаминовым, бензодиазепиновым, GABA- и адренорецепторам.

Антидепрессивный эффект отмечается к концу второй недели регулярного приема препарата, максимальный эффект

достигается через 6 недель.

В отличие от трициклических антидепрессантов при назначении Депрефолта не происходит увеличения массы тела.

Препарат не вызывает психической или физической лекарственной зависимости.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь в значительной степени, но медленно абсорбируется из ЖКТ, C_{max} в плазме крови достигается через 4.5-8.4 ч. Биодоступность при одновременном приеме с пищей повышается на 25%, время достижения C_{max} при этом уменьшается.

Распределение

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

V_d составляет более 20 л/кг. Сертралин выделяется с грудным молоком; неизвестно, проникает ли сертралин через плацентарный барьер.

Метаболизм

Сертралин подвергается интенсивной биотрансформации при первом прохождении через печень путем N-деметилирования. Основной метаболит – N-десметилсертралин менее активен по сравнению с исходным соединением.

Выведение

Метаболиты выделяются с мочой и калом в равных количествах. Около 0.2% сертралина выводится с мочой 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.

Независимо от выраженности почечной недостаточности фармакокинетика сертралина при его постоянном применении не изменяется.

Сертралин не выводится при диализе.

Показания к применению:

— депрессии различной этиологии (лечение и профилактика);

— обсессивно-компульсивные расстройства (ОКР);

— панические расстройства (с агорафобией или без);

— посттравматические стрессорные расстройства (ПТСР).

Относится к болезням:

- Депрессия
- Паническое расстройство

Противопоказания:

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

— одновременное применение триптофана или фенфлурамина;

— нестабильная эпилепсия;

— детский возраст до 6 лет;

— повышенная чувствительность к сертралину и другим компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов с органическими заболеваниями головного мозга (в т.ч. при задержке умственного развития), при маниакальных состояниях, эпилепсии, печеночной и/или почечной недостаточности, снижении массы тела, а также у детей старше 6 лет.

Способ применения и дозы:

При *депрессии* и *обсессивно-компульсивных расстройствах* начальная доза для **взрослых** составляет 50 мг 1 раз/сут утром или вечером. При необходимости дозу можно постепенно (на 50 мг 1 раз в неделю) повышать до максимальной суточной дозы 200 мг.

Для **детей в возрасте от 6 до 12 лет** начальная доза составляет 25 мг 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 дозу можно постепенно (1 раз в неделю) повышать до максимальной суточной дозы 200 мг.

При *панических расстройствах и посттравматических стрессорных расстройствах* начальная доза составляет 25 мг 1 раз/сут утром или вечером. Через неделю можно увеличить дозу до 50 мг 1 раз/сут, а затем постепенно (1 раз в неделю) повышать до максимальной суточной дозы 200 мг.

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 обсессивно-компульсивными расстройствами для достижения терапевтического эффекта может потребоваться 8-12 недель. Минимальная доза, обеспечивающая лечебное действие, сохраняется в дальнейшем как поддерживающая.

Пациентам пожилого возраста не требуется коррекции режима дозирования.

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: головокружение, сонливость, головная боль, бессонница, слабость, тремор, гипомания, мания, экстрапирамидные расстройства, тревога, ажитация, нарушения зрения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - гиперемия кожи лица с ощущением жара или тепла, ощущение сердцебиения.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, снижение аппетита, метеоризм, тошнота, рвота, диарея, боль в животе.

Со стороны эндокринной системы: гиперпролактинемия, галакторея; редко - нарушения менструального цикла.

Со стороны половой системы: редко - расстройства эякуляции, снижение либидо.

Аллергические реакции: редко - кожная сыпь, крапивница, зуд, многоформная эритема.

Прочие: повышенное потоотделение, снижение массы тела; редко - повышение температуры тела.

Передозировка:

Тяжелых симптомов не выявлено даже при применении препарата в высоких дозах. Однако при одновременном приеме с другими препаратами или этанолом может возникать тяжелое отравление.

Симптомы: возможно возникновение серотонинового синдрома с тошнотой, рвотой, сонливостью, тахикардией, ажитацией, головокружением, психомоторным возбуждением, диареей, повышенным потоотделением, миоклонусом, гиперрефлексией.

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

Применение при беременности и кормлении грудью:

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

Сертралин выделяется с грудным молоком. Применение препарата в период лактации не рекомендуется. При необходимости приема препарата в этот период грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Депрефолта и ингибиторов МАО (включая избирательно действующие ингибиторы МАО - селегилин и ингибиторы МАО с обратимым типом действия – моклобемид) отмечаются тяжелые осложнения, 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.

При совместном приеме с Депрефолтом непрямых антикоагулянтов 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 при участии изофермента CYP2D6) сопровождается увеличением концентрации дезипрамина в плазме крови.

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

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

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

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

Фармакокинетика лития не изменяется при сопутствующем введении сертралина, однако тремор наблюдается чаще при их совместном применении, что предполагает возможность фармакодинамического взаимодействия (такая комбинация требует осторожности).

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:

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.

При прекращении применения препарата возможно (редко) развитие синдрома отмены. Могут появляться

парестезии, гипестезии, симптомы депрессии, галлюцинации, агрессивные реакции, психомоторное возбуждение, беспокойство или симптомы психоза. Эти проявления тяжело дифференцировать от симптомов основного заболевания.

При назначении препарата следует учитывать отсутствие достаточного опыта по применению сертралина у пациентов, получавших электросудорожную терапию. Возможный результат или риск подобного комбинированного лечения не изучен.

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.

При длительном применении в редких случаях (0.8% наблюдений) возникает асимптоматическое повышение активности трансаминаз в сыворотке крови. Отмена препарата приводит к нормализации активности ферментов печени.

Во время лечения Депрефолтом может возникать транзиторная гипонатриемия. Это чаще развивается у пожилых пациентов, а также при приеме диуретиков или ряда других препаратов. Подобный побочный эффект связывают с синдромом неадекватной секреции АДГ.

Комбинированное назначение Депрефолта и лекарственных средств, угнетающих ЦНС, требует пристального внимания, а одновременное применение с этанолом и этанолосодержащими препаратами противопоказано.

При замене одного ингибитора нейронального захвата серотонина на другой нет необходимости в перерыве между окончанием приема одного и началом приема другого, однако требуется соблюдать осторожность при изменениях курса лечения. Следует избегать совместного назначения триптофана или фенфлурамина с сертралином.

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 в период приема Депрефолта не рекомендуется выполнять работу, требующую повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

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

С *осторожностью* следует применять препарат при почечной недостаточности

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять препарат при печеночной недостаточности

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

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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