Эфевелон



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Венлафаксин

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 оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые, с маркировкой "V1" с одной стороны.

	1 таб.
венлафаксина гидрохлорид	28.28 мг,
что соответствует содержанию венлафаксина	25 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 18.33 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 45.89 мг, кроскармеллоза натрия - 3 мг, повидон K30 - 4 мг, магния стеарат - 0.5 мг.

Состав оболочки: опадрай 03B23319 оранжевый (гипромеллоза - 1.875 мг, титана диоксид - 0.908 мг, полиэтиленгликоль 400 (макрогол) - 0.188 мг, краситель закатный желтый FCF - 0.03 мг) - 3 мг.

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

Таблетки, покрытые оболочкой оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые, с маркировкой "V2" с одной стороны.

	1 таб.
венлафаксина гидрохлорид	42.42 мг,
что соответствует содержанию венлафаксина	37.5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 27.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 68.83 мг, натрия кроскармеллоза - 4.5 мг, повидон K30 - 6 мг, магния стеарат - 0.75 мг.

Состав оболочки: опадрай 03B23319 оранжевый (гипромеллоза - 2.813 мг, титана диоксид - 1.362 мг, полиэтиленгликоль 400 (макрогол) - 0.282 мг, краситель закатный желтый FCF - 0.045 мг) - 4.5 мг.

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

Таблетки, покрытые оболочкой оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые, с маркировкой "V3" с одной стороны.

	1 таб.
венлафаксина гидрохлорид	56.56 мг,
что соответствует содержанию венлафаксина	50 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 36.67 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 91.77 мг, кроскармеллоза натрия - 6 мг, повидон K30 - 8 мг, магния стеарат - 1 мг.

Состав оболочки: опадрай 03B23319 оранжевый (гипромеллоза - 3.75 мг, титана диоксид - 1.815 мг, полиэтиленгликоль 400 (макрогол) - 0.375 мг, краситель закатный желтый FCF - 0.06 мг) - 6 мг.

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

Таблетки, покрытые оболочкой оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые, с рисками с обеих сторон, боковыми рисками и маркировкой "V" с одной стороны риски и "4" с другой стороны риски.

	1 таб.
венлафаксина гидрохлорид	84.84 мг,
что соответствует содержанию венлафаксина	75 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 55 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 137.66 мг, натрия кроскармеллоза - 9 мг, повидон K30 - 12 мг, магния стеарат - 1.5 мг.

Состав оболочки: опадрай 03B23319 оранжевый (гипромеллоза - 5.625 мг, титана диоксид - 2.725 мг, полиэтиленгликоль 400 (макрогол) - 0.563 мг, краситель закатный желтый FCF - 0.09 мг) - 9 мг.

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антидепрессант, химически не относящийся ни к одному классу антидепрессантов (трициклические, тетрациклические или другие), является смесью двух активных энантиомеров.

Механизм антидепрессивного действия препарата связан с его способностью потенцировать передачу нервного импульса в ЦНС. Венлафаксин и его основной метаболит О-десметилвенлафаксин (ОДВ) являются сильными ингибиторами обратного захвата серотонина и норадреналина и слабыми ингибиторами обратного захвата допамина. Кроме того, венлафаксин и ОДВ снижают бета-адренергическую реактивность как после однократного введения, так и при постоянном приеме. Венлафаксин и ОДВ одинаково эффективно влияют на обратный захват нейротрансмиттеров.

Венлафаксин не обладает сродством к м-холинорецепторам, гистаминовым H_1-рецепторам и α_1-адренорецепторам головного мозга. Венлафаксин не подавляет активность МАО. Не обладает сродством к опиоидным, бензодиазепиновым, фенциклидиновым или NMDA-рецепторам.

Фармакокинетика

Всасывание

Венлафаксин хорошо всасывается из ЖКТ. После однократного приема венлафаксина в дозе 25-150 мг C_{max} в плазме крови достигает 33-172 нг/мл в течение приблизительно 2.4 ч. Подвергается интенсивному метаболизму при первом прохождении через печень. Его основной метаболит - О-десметилвенлафаксин (ОДВ). C_{max} ОДВ в плазме крови 61-325 нг/мл достигается приблизительно через 4.3 ч после применения. После приема препарата во время еды, время достижения C_{max} в плазме крови увеличивается на 20-30 минут, однако величины C_{max} и абсорбции не изменяются.

Распределение и метаболизм

Связывание с белками плазмы крови венлафаксина и ОВД составляет 27% и 30% соответственно.

При многократном введении C_{ss} венлафаксина и ОДВ достигаются в течение 3 дней. В диапазоне суточных доз 75-450 мг, венлафаксин и ОДВ имеют линейную кинетику.

Венлафаксин подвергается интенсивному метаболизму в печени.

Выведение

$T_{1/2}$ венлафаксина и ОДВ составляет соответственно 5 и 11 ч. ОДВ и другие метаболиты, а также неметаболизированный венлафаксин, выводятся с мочой.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У больных с циррозом печени концентрации в плазме крови венлафаксина и ОДВ повышены, а скорость их выведения снижена.

При умеренной или тяжелой почечной недостаточности общий клиренс венлафаксина и ОДВ снижается, а $T_{1/2}$ удлиняется. Снижение общего клиренса, в основном, наблюдается у пациентов с КК ниже 30 мл/мин.

Возраст и пол пациента не влияют на фармакокинетику препарата.

Показания к применению:

— лечение депрессий;

— профилактика рецидивов депрессий.

Относится к болезням:

- Депрессия

Противопоказания:

— одновременный прием ингибиторов МАО;

— тяжелые нарушения функции почек (СКФ<10 мл/мин);

— тяжелые нарушения функции печени;

— детский и подростковый возраст до 18 лет (безопасность и эффективность не доказаны);

— установленная или предполагаемая беременность;

— период лактации;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат в случае недавно перенесенного инфаркта миокарда, при нестабильной стенокардии, артериальной гипертензии, тахикардии, судорожном синдроме в анамнезе, повышении внутриглазного давления, закрытоугольной глаукоме, маниакальном состоянии в анамнезе, предрасположенности к кровоточивости кожных покровов и слизистых оболочек, при исходно сниженной массе тела.

Способ применения и дозы:

Препарат следует принимать внутрь, желательно в одно и то же время суток, во время приема пищи. Таблетки не разжевывают, запивают жидкостью.

Рекомендуемая начальная доза составляет 75 мг (по 37.5 мг 2 раза/сут) ежедневно.

При *депрессии средней степени тяжести* рекомендуемая суточная доза составляет 225 мг (по 75 мг 3 раза/сут). При необходимости дозу можно увеличивать с интервалами не менее 4 дней на 75 мг/сут. Если после нескольких недель лечения не наблюдается значительного улучшения, суточную дозу можно увеличить до 150 мг (по 75 мг 2 раза/сут).

При необходимости применения препарата в более высокой дозе - *тяжелое депрессивное расстройство или другие состояния, требующие стационарного лечения,* - можно сразу назначить препарат в суточной дозе 150 мг (по 75 мг 2 раза/сут). После этого суточную дозу можно увеличивать на 75 мг каждые 2-3 дня до достижения желаемого терапевтического эффекта.

Максимальная суточная доза препарата Эфевелон составляет 375 мг. После достижения необходимого терапевтического эффекта суточная доза может быть постепенно снижена до минимального эффективного уровня.

Поддерживающая терапия и профилактика рецидивов продолжается в течение 6 мес и более. Препарат назначают в минимальной эффективной дозе, применявшейся при лечении депрессивного эпизода.

При **почечной недостаточности легкой степени тяжести (скорость клубочковой фильтрации /СКФ/ более 30 мл/мин)** коррекции режима дозирования не требуется. При **почечной недостаточности средней степени тяжести (СКФ 10-30 мл/мин)** дозу следует снизить на 25-50%. В связи с удлинением $T_{1/2}$ венлафаксина и его активного метаболита (ОДВ), таким пациентам следует принимать всю дозу 1 раз/сут. При **почечной недостаточности тяжелой степени (СКФ менее 10 мл/мин)** применение венлафаксина не рекомендуется, поскольку опыт такой терапии ограничен. **Пациенты, находящиеся на гемодиализе,** могут получать 50% обычной суточной дозы венлафаксина после завершения гемодиализа.

При **легкой печеночной недостаточности (протромбиновое время /ПВ/ менее 14 сек)** коррекции режима дозирования не требуется. При **умеренной печеночной недостаточности (ПВ от 14 до 18 сек**) дозу следует уменьшить на 50%. При **тяжелой печеночной недостаточности** применение Эфевелона не рекомендуется, поскольку опыт такой терапии ограничен.

Пациентам пожилого возраста коррекция дозы не требуется, однако (как и при назначении других лекарственных препаратов) при лечении требуется осторожность, например, в связи с возможностью нарушения функции почек. У пациентов пожилого возраста препарат следует назначать в наименьшей эффективной дозе. При повышении дозы пациент должен находиться под тщательным медицинским наблюдением.

По *окончании приема препарата* Эфевелон дозу рекомендуется снижать постепенно, по крайней мере, в течение недели и наблюдать за состоянием пациента для того, чтобы свести к минимуму риск, связанный с отменой препарата. Период, требуемый для полного прекращения приема препарата, зависит от его дозы, длительности курса лечения и индивидуальных особенностей пациента.

Побочное действие:

Большинство перечисленных ниже побочных эффектов зависят от дозы. При длительном лечении тяжесть и частота большинства этих эффектов снижается, причем не возникает необходимость отмены терапии.

Определение частоты побочных эффектов: часто (≥ 1%), нечасто (≥ 0.1%, < 1%), редко (≥ 0.01%, < 0.1%), очень редко (< 0.01%).

Со стороны организма в целом: часто - слабость, повышенная утомляемость.

Со стороны пищеварительной системы: часто - снижение аппетита, запор, тошнота, рвота, сухость во рту; нечасто - изменение лабораторных проб функции печени; редко - гепатит.

Со стороны обмена веществ: часто - повышение уровня холестерина в крови, снижение массы тела; нечасто - гипонатриемия, синдром неадекватной секреции АДГ.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - артериальная гипертензия, гиперемия кожных покровов; нечасто - постуральная гипотензия, тахикардия.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: часто - необычные сновидения, головокружение, бессонница, повышенная возбудимость, ступор, повышение мышечного тонуса, парестезии, тремор; нечасто - апатия, галлюцинации, спазмы мышц, серотониновый синдром; редко - эпилептические припадки, маниакальные реакции, а также симптомы, напоминающие ЗНС.

Со стороны органов чувств: часто - нарушения аккомодации, мидриаз, нарушение зрения; нечасто - нарушение вкусовых ощущений.

Со стороны мочевыделительной системы: часто - дизурия (в основном - затруднения в начале мочеиспускания); нечасто - задержка мочи.

Со стороны половой системы: часто - нарушения эякуляции, эрекции, аноргазмия; нечасто - снижение либидо, меноррагия.

Со стороны системы кроветворения: нечасто - кровоизлияния в кожу (экхимозы) и слизистые оболочки, тромбоцитопения; редко - удлинение времени кровотечения.

Дерматологические реакции: часто - повышенное потоотделение; нечасто - фотосенсибилизация; редко - многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона.

Аллергические реакции: нечасто - кожная сыпь; очень редко - анафилаксия.

После резкой отмены препарата или снижения его дозы возможны утомляемость, сонливость, головная боль, тошнота, рвота, анорексия, сухость во рту, головокружение, диарея, бессонница, тревога, повышенная раздражительность, дезориентация, гипомания, парестезии, потливость. Эти симптомы обычно слабо выражены и проходят без лечения. Из-за вероятности возникновения этих симптомов очень важно постепенно снижать дозу препарата.

Передозировка:

Симптомы: изменения ЭКГ (удлинение интервала QT, блокада ножки пучка Гиса, расширение комплекса QRS), синусовая или желудочковая тахикардия, брадикардия, гипотензия, судорожные состояния, изменение сознания (снижение уровня бодрствования). При передозировке венлафаксина при одновременном приеме с алкоголем и/или другими психотропными препаратами, сообщалось о летальном исходе.

Лечение: проводят симптоматическую терапию. Специфические антидоты неизвестны. Рекомендуется непрерывный контроль жизненно важных функций (дыхания и кровообращения). Показано назначение активированного угля для снижения всасывания препарата. Не рекомендуется вызывать рвоту в связи с опасностью аспирации. Венлафаксин и ОДВ не выводятся при диализе.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения венлафаксина при беременности не доказана, поэтому применение при беременности (или

предполагаемой беременности) возможно только в том случае, если потенциальная польза для матери превосходит возможный риск для плода.

Если лечение матери было завершено незадолго до родов, у новорожденного могут возникнуть симптомы отмены препарата.

Женщины детородного возраста должны применять соответствующие методы контрацепции во время приема венлафаксина. В случае наступления беременности или планирования беременности в период лечения препаратом женщины детородного возраста должны быть предупреждены о том, что следует немедленно обратиться к врачу.

Венлафаксин и его метаболит ОДВ выделяются в грудное молоко. Безопасность этих веществ для новорожденных детей не доказана, поэтому прием венлафаксина во время грудного вскармливания не рекомендуется.

При необходимости приема препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение ингибиторов МАО и венлафаксина противопоказано. Прием препарата Эфевелон можно начинать не менее чем через 14 дней после окончания терапии ингибиторами МАО. Если применялся обратимый ингибитор МАО (моклобемид), этот интервал может быть короче (24 часа). Терапию ингибиторами МАО можно начинать не менее чем через 7 дней после отмены препарата Эфевелон.

Венлафаксин не влияет на фармакокинетику лития.

При одновременном применении с имипрамином фармакокинетика венлафаксина и его метаболита ОДВ не изменяется.

При одновременном применении с галоперидолом повышается концентрация последнего в плазме крови и усиливаются его эффекты.

При одновременном применении препарата Эфевелон с диазепамом фармакокинетика обоих активных веществ и их основных метаболитов, существенно не изменяется. Также не обнаружено влияния на психомоторные и психометрические эффекты диазепама.

При одновременном применении с клозапином может наблюдаться повышение его уровня в плазме крови и развитие побочных эффектов (например, судорожных припадков).

При одновременном применении с рисперидоном (несмотря на увеличение AUC рисперидона) фармакокинетика суммы активных компонентов (рисперидона и его активного метаболита) существенно не изменялась.

Эфевелон усиливает влияние алкоголя на психомоторные реакции.

CYP2D6 преобразует венлафаксин в активный метаболит ОДВ. В отличие от многих других антидепрессантов, дозу венлафаксина можно не снижать при одновременном введении с ингибиторами изофермента CYP2D6, или у пациентов с генетически обусловленным снижением активности изофермента CYP2D6, поскольку суммарная концентрация активного вещества и метаболита (венлафаксина и ОДВ) при этом не изменится. Основной путь выведения венлафаксина включает метаболизм с участием изоферментов CYP2D6 и CYP3A4. Поэтому следует соблюдать особую осторожность при назначении препарата Эфевелон в сочетании с ингибиторами этих изоферментов. Такое лекарственное взаимодействие еще не исследовано.

Венлафаксин - относительно слабый ингибитор изофермента CYP2D6 и не подавляет активность изоферментов CYP1A2, CYP2C9 и CYP3A4; поэтому не следует ожидать его взаимодействия с другими препаратами, в метаболизме которых участвуют эти изоферменты.

Циметидин подавляет метаболизм венлафаксина при "первом прохождении" через печень и не оказывает влияния на фармакокинетику ОДВ. У большинства пациентов ожидается лишь незначительное повышение общей фармакологической активности венлафаксина и ОДВ (более выражено у пожилых пациентов и при нарушении функции печени).

Клинически значимое взаимодействие венлафаксина с антигипертензивными (в т.ч. бета-адреноблокаторами, ингибиторами АПФ и диуретиками) и гипогликемическими препаратами не обнаружено.

Эфевелон не влияет на концентрацию лекарственных средств в плазме крови, обладающих высокой степенью связывания с белками.

При одновременном применении с варфарином возможно усиление антикоагулянтного действия последнего.

При одновременном приеме с индинавиром изменяется фармакокинетика последнего (уменьшение AUC на 28% и C_{max} - на 36%), а фармакокинетика венлафаксина и ОДВ не изменяется. Клиническое значение данных изменений неизвестно.

Особые указания и меры предосторожности:

Как и при лечении другими антидепрессантами, резкое прекращение терапии венлафаксином, особенно после применения в высоких дозах, может вызвать симптомы отмены, в связи с чем рекомендуется перед отменой препарата постепенно снизить его дозу. Длительность периода, необходимого для снижения дозы, зависит от величины дозы, продолжительности терапии, а также индивидуальной чувствительности пациента.

При назначении препарата Эфевелон больным с непереносимостью лактозы следует учитывать содержание лактозы (56.62 мг в каждой таблетке 25 мг, 84.93 мг в каждой таблетке 37.5 мг, 113.24 мг в каждой таблетке 50 мг, 169.86 мг в каждой таблетке 75 мг).

У больных с депрессивными расстройствами перед началом любой лекарственной терапии следует учитывать вероятность суицидальных попыток. Поэтому для снижения риска передозировки начальная доза препарата должна быть по возможности низкой, а пациент должен находиться под тщательным медицинским наблюдением.

У пациентов с аффективными расстройствами при лечении антидепрессантами, в т.ч. венлафаксином, могут возникать гипоманиакальные или маниакальные состояния. Как и другие антидепрессанты, венлафаксин должен назначаться с осторожностью больным с манией в анамнезе. Такие пациенты нуждаются в медицинском наблюдении.

Как и другие антидепрессанты, венлафаксин должен назначаться с осторожностью больным с эпилептическими припадками в анамнезе. Лечение венлафаксином должно быть прервано при возникновении эпилептических припадков.

На фоне приема Эфевелона следует соблюдать особую осторожность при электросудорожной терапии, т.к. опыт применения венлафаксина в этих условиях отсутствует.

Пациентов следует предупредить о необходимости немедленно обратиться к врачу при возникновении сыпи, крапивницы или других аллергических реакций.

У некоторых больных во время приема венлафаксина отмечено дозозависимое повышение АД, в связи с чем, рекомендуется регулярный контроль АД, особенно в период уточнения или повышения дозировки.

Может произойти повышение ЧСС, особенно во время приема высоких доз. Рекомендуется осторожность при тахиаритмии.

Пациенты, особенно пожилые, должны быть предупреждены о возможности возникновения головокружения и нарушения чувства равновесия.

Как и другие ингибиторы обратного захвата серотонина, венлафаксин может повысить риск кровоизлияний в кожу и слизистые оболочки. При лечении больных, предрасположенных к таким состояниям, необходима осторожность.

Во время приема препарата может наблюдаться мидриаз, в связи с чем рекомендуется контроль внутриглазного давления у больных, склонных к его повышению или страдающих закрытоугольной глаукомой.

Нет достаточного количества данных о применении венлафаксина у пациентов, недавно перенесших инфаркт миокарда и страдающих декомпенсированной сердечной недостаточностью. Таким больным препарат следует назначать с осторожностью.

Проведенные до настоящего времени клинические испытания не выявили толерантности к венлафаксину или зависимости от него. Несмотря на это, как и при лечении другими препаратами, действующими на ЦНС, врач должен установить тщательное наблюдение за пациентами для выявления признаков злоупотребления препаратом. Тщательный контроль и наблюдение необходимы для пациентов, имеющих в анамнезе такие симптомы.

Несмотря на то, что венлафаксин не влияет на психомоторные и когнитивные функции, следует учитывать, что любая лекарственная терапия психоактивными препаратами может снизить способность вынесения суждений, мышления или выполнения двигательных функций. Об этом следует предупредить пациента перед началом лечения. При возникновении таких эффектов степень и длительность ограничений должны быть установлены врачом. Также не рекомендован прием алкоголя.

При нарушениях функции почек

При **почечной недостаточности легкой степени тяжести (скорость клубочковой фильтрации более 30 мл/мин)** коррекции режима дозирования не требуется. При **почечной недостаточности средней степени тяжести (скорость клубочковой фильтрации 10-30 мл/мин)** дозу следует снизить на 25-50%. В связи с удлинением $T_{1/2}$ венлафаксина и его активного метаболита (ОДВ), таким пациентам следует принимать всю дозу 1 раз/сут. При **почечной недостаточности тяжелой степени (скорость клубочковой фильтрации менее 10 мл/мин)** применение венлафаксина не рекомендуется, поскольку опыт такой терапии ограничен. **Пациенты, находящиеся на гемодиализе,** могут получать 50% обычной суточной дозы венлафаксина после завершения гемодиализа.

При нарушениях функции печени

При **легкой печеночной недостаточности (протромбиновое время /ПВ/ менее 14 сек)** коррекции режима дозирования не требуется. При **умеренной печеночной недостаточности (ПВ от 14 до 18 сек**) дозу следует уменьшить на 50%. При **тяжелой печеночной недостаточности** применение Эфевелона не рекомендуется, поскольку опыт такой терапии ограничен.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста коррекция дозы не требуется, однако (как и при назначении других лекарственных препаратов) при лечении требуется осторожность, например, в связи с возможностью нарушения функции почек. У пациентов пожилого возраста препарат следует назначать в наименьшей эффективной дозе. При повышении дозы пациент должен находиться под тщательным медицинским наблюдением.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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