Эфевелон Ретард



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, с гравировкой "V5" с одной стороны, овальные, двояковыпуклые; на изломе - ядро белого или почти белого цвета, покрытое непрерывным слоем белой оболочки.

	1 таб.
венлафаксин (в форме гидрохлорида)	150 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный - 6.04 мг, магния стеарат 5712 - 20 мг, кальция гидрофосфата дигидрат - 64 мг, коллидон SR (поливинилацетат - 409.82 мг, повидон 97.34 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.024 мг, натрия лаурилсульфат - 4.098 мг).

Состав оболочки: макрогол 6000 - 1.9%, титана диоксид - 2.21%, тальк - 4.42%, сополимер этилакрилата, метилметакрилата и триметиламмониоэтилметакрилата (1:2:0.1) (Эудрагит RS30) - 53%.

5 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, с гравировкой "V4" с одной стороны; на изломе - ядро белого или почти белого цвета, покрытое непрерывным слоем белой оболочки.

	1 таб.
венлафаксин (в форме гидрохлорида)	75 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный - 3.02 мг, магния стеарат 5712 - 10 мг, кальция гидрофосфата дигидрат - 32 мг, коллидон SR (поливинилацетат - 204.91 мг, повидон - 48.67 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.512 мг, натрия лаурилсульфат - 2.049 мг).

Состав пленочной оболочки: макрогол 6000 - 1.9%, титана диоксид - 2.21%, тальк - 4.42%, сополимер этилакрилата, метилметакрилата и триметиламмониоэтилметакрилата (1:2:0.1) (Эудрагит RS30) - 53%.

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

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой белого илли почти белого цвета, с гравировкой "V3" с одной стороны, круглые, двояковыпуклые; на изломе - ядро белого или почти белого цвета, покрытое непрерывным слоем белой оболочки.

	1 таб.
венлафаксин (в форме гидрохлорида)	37.5 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный - 1.51 мг, магния стеарат 5712 - 5 мг, кальция гидрофосфата дигидрат - 16 мг, коллидон SR (поливинилацетат - 102.46 мг, повидон - 24.33 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.256 мг, натрия лаурилсульфат - 1.025 мг).

Состав оболочки: макрогол 6000 - 1.9%, титана диоксид - 2.21%, тальк - 4.42%, сополимер этилакрилата, метилметакрилата и триметиламмониоэтилметакрилата (1:2:0.1) (Эудрагит RS30) - 53%.

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 усилением нейротрансмиттерной активности в ЦНС. Венлафаксин и его основной метаболит О-десметилвенлафаксин (ОДВ) являются мощными ингибиторами обратного захвата серотонина и норадреналина и слабыми ингибиторами обратного захвата допамина нейронами. Венлафаксин и ОДВ одинаково эффективно влияют на обратный захват нейротрансмиттеров. Венлафаксин и ОДВ снижают бета-адренергические реакции.

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 25-150 мг C_{max} в плазме крови венлафаксина и его основного метаболита ОДВ достигаются через 6 ч и 9 ч соответственно.

Распределение и метаболизм

Связывание с белками плазмы крови венлафаксина и его основного метаболита - 27% и 30% соответственно.

Венлафаксин подвергается экстенсивному метаболизму в печени, преимущественно при участии изофермента CYP2D6, до основного метаболита - ОДВ. Венлафаксин также метаболизируется до N-десметилвенлафаксина, преимущественно при участии изофермента CYP3A3/4.

Выведение

$T_{1/2}$ венлафаксина составляет 15 ч. Венлафаксин, ОДВ и другие метаболиты выводятся почками. Около 87% принятой дозы выводится с мочой через 48 ч после приема препарата.

Показания к применению:

— лечение депрессий (в т.ч. при наличии тревоги);

— профилактика и лечение рецидивов депрессий.

Относится к болезням:

- Депрессия

Противопоказания:

— одновременный прием ингибиторов МАО;

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

— тяжелые нарушения функции печени (ПВ более 18 сек);

— 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, гипонатриемии, гиповолемии, обезвоживании, одновременном приеме диуретиков, суицидальных наклонностях, предрасположенности к кровоточивости кожных покровов и слизистых оболочек, почечной и/или печеночной недостаточности, 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.

Суточную дозу препарата Эфевелон ретард следует принимать за один прием.

При *депрессии* рекомендуемая начальная доза - 75 мг 1 раз/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 1 раз/сут. Впоследствии суточную дозу можно увеличивать на 75 мг с интервалом 2 недели или больше (но не чаще чем через 4 дня) до достижения желаемого терапевтического эффекта. Максимальная суточная доза - 350 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. При стабилизирующей терапии, а также применении с целью профилактики рецидивов или новых эпизодов депрессии, препарат обычно назначают в установленных эффективных дозах. Следует регулярно (не менее 1 раза в 3 месяца) контролировать эффективность длительной терапии препаратом Эфевелон ретард.

При **почечной недостаточности легкой степени тяжести (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 50%. При **почечной недостаточности тяжелой степени (СКФ менее 10 мл/мин)** применение препарата не рекомендуется, поскольку опыт такой терапии ограничен. **Пациентам, находящимся на гемодиализе,** можно назначать 50% обычной суточной дозы венлафаксина после завершения гемодиализа.

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

Пациентам пожилого возраста при применении препарата в форме таблеток обычной продолжительности действия и при применении Эфевелона ретард 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.

Отмена препарата

По окончании приема препарата дозу рекомендуется снижать постепенно, по крайней мере, в течение недели при отмене препарата в форме таблеток обычной продолжительности действия. При применении препарата Эфевелон ретард в высокой дозе в течение более 6 недель, рекомендуется ее снижать в течение не менее 2 недель. Во время периода снижения дозы следует наблюдать за состоянием пациента для того, чтобы свести к минимуму риск, связанный с отменой препарата. Длительность периода, необходимого для снижения дозы зависит от ее величины, продолжительности терапии, а также от 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 (<1/10 и >1/100), нечасто (<1/100 и > 1/1000), редко (<1/1000), очень редко (<1/10 000).

Со стороны пищеварительной системы: часто - снижение аппетита, запор, тошнота, рвота, сухость во рту; нечасто - бруксизм, обратимое повышение активности печеночных трансаминаз; редко - гепатит.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: часто - головокружение, астения, бессонница, необычные сновидения, повышенная нервная возбудимость, тревога, ступор, повышение мышечного тонуса, парестезии, тремор, седативный эффект; нечасто - апатия, галлюцинации, миоклонус, обморок, спазмы мышц, серотониновый синдром; редко - мания или гипомания, симптомы, напоминающие ЗНС.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - артериальная гипертензия, гиперемия кожных покровов; нечасто - снижение АД, постуральная гипотензия, тахикардия; очень редко - удлинение интервала QT, фибрилляция желудочков, желудочковая тахикардия (в т.ч. мерцание желудочков).

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

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

Дерматологические реакции: часто - повышенное потоотделение; нечасто - фотосенсибилизация.

Аллергические реакции: иногда - кожная сыпь; очень редко - многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, анафилаксия.

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

Со стороны половой системы: нарушения эякуляции, эрекции, аноргазмия; нечасто - снижение либидо, меноррагия, нарушение оргазма у женщин.

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

Прочие: часто - слабость, повышенная утомляемость.

После резкой отмены препарата или снижения его дозы возможны утомляемость, нарушения сна (изменение характера сновидений, сонливость или бессонница, затруднение засыпания), головная боль, астения, тошнота, рвота, снижение аппетита, сухость во рту, головокружение, диарея, тревога, гипомания, повышенная нервная возбудимость, спутанность сознания, парестезии, потливость. Эти симптомы обычно слабо выражены и проходят без лечения. Из-за вероятности возникновения этих симптомов очень важно постепенно снижать дозу препарата, особенно после приема в высоких дозах.

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) противопоказано.

Женщины детородного возраста должны применять соответствующие методы контрацепции во время приема венлафаксина.

Венлафаксин и его метаболит ОДВ выделяются с грудным молоком. 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.

При одновременном применении с варфарином возможно усиление антикоагулянтного действия последнего, при этом удлиняется протромбиновое время и повышается МНО.

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

Венлафаксин не влияет на фармакокинетику лития.

При одновременном применении с имипрамином фармакокинетика венлафаксина и его метаболита ОДВ не изменяется. Также совместный прием не оказывает влияния на фармакокинетику имипрамина и 2-ОН-имипрамина, однако общий почечный клиренс 2-ОН-дезипрамина уменьшается, а показатели AUC и C_{max} дезипрамина возрастают на 35%.

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 этанола 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).

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.

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.

Особые указания и меры предосторожности:

При депрессии возрастает риск суицидальных мыслей и суицидальных попыток. Этот риск сохраняется до наступления стойкой ремиссии. Поэтому пациенты должны находиться под постоянным медицинским наблюдением и им следует выдавать лишь небольшое количество таблеток препарата, чтобы снизить риск возможного злоупотребления и/или передозировки.

Сообщалось об агрессивном поведении во время приема венлафаксина (особенно в начале курса лечения и после отмены препарата).

Как и все антидепрессанты, венлафаксин следует назначать с осторожностью пациентам с манией и/или гипоманией в анамнезе, т.к. препарат может вызвать усиление их признаков. В этих случаях необходимо медицинское наблюдение.

Следует соблюдать осторожность при лечении пациентов с судорожными припадками в анамнезе. При возникновении судорожных припадков или повышении их частоты лечение венлафаксином следует прервать.

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 начале курса лечения или при повышении дозы.

Во время приема венлафаксина описаны отдельные случаи ортостатической гипотензии.

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

Венлафаксин может вызвать повышение ЧСС, особенно во время приема высоких доз. Следует соблюдать особую осторожность при назначении препарата пациентам с тахиаритмией.

Не проведено достаточных исследований применения венлафаксина у пациентов, недавно перенесших инфаркт миокарда или страдающих декомпенсированной сердечной недостаточностью, поэтому применять данный в таких случаях следует с осторожностью.

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

Во время приема венлафаксина, особенно в условиях дегидратации или снижения ОЦК (в т.ч. у пациентов пожилого возраста и больных, принимающих диуретики), может наблюдаться гипонатриемия и/или синдром неадекватной секреции АДГ.

Во время приема венлафаксина отмечены случаи мидриаза, поэтому пациенты с предрасположенностью к повышению внутриглазного давления или имеющие риск закрытоугольной глаукомы, нуждаются в тщательном медицинском наблюдении.

При почечной и печеночной недостаточности необходима особая осторожность. В некоторых случаях требуется снижение дозы.

Безопасность и эффективность применения венлафаксина со средствами, снижающими массу тела, в т.ч. с фентермином, не установлены, поэтому их одновременное применение (как и применение венлафаксина в качестве монотерапии для снижения массы тела) не рекомендуется.

Клинически значимое повышение уровня холестерина сыворотки крови отмечено у некоторых пациентов, получающих венлафаксин на протяжении не менее 3 месяцев. Поэтому при длительном приеме препарата целесообразно проводить контроль уровня холестерина сыворотки.

После прекращения приема препарата, особенно внезапного, часто возникают симптомы отмены. Риск возникновения симптомов отмены может зависеть от нескольких факторов, в т.ч. от длительности курса и дозы, а также скорости снижения дозы.

Симптомы отмены, такие как головокружение, сенсорные нарушения (в т.ч. парестезии и ощущения прохождения электрического тока), нарушения сна (в т.ч. бессонница и необычные сновидения), возбуждение или тревога, тошнота и/или рвота, тремор, потливость, головная боль, диарея, учащенное и усиленное сердцебиение и эмоциональная неустойчивость обычно имеют небольшую или среднюю выраженность, однако у некоторых пациентов они могут быть тяжелыми. Данные симптомы обычно наблюдаются в первые дни после отмены препарата, хотя были отдельные сообщения о возникновении таких симптомов у пациентов, случайно пропустивших одну дозу. Обычно эти явления проходят самостоятельно в течение 2 недель; однако у некоторых пациентов они могут быть более продолжительными (2-3 месяца или больше). Поэтому перед отменой венлафаксина рекомендуется постепенно снизить его дозу в течение нескольких недель или месяцев в зависимости от состояния пациента.

В период лечения Эфевелоном пациентам не рекомендуется употребление алкоголя.

При назначении препарата Эфевелон пациентам с непереносимостью лактозы следует учитывать, что в 1 таб. обычной продолжительности действия 37.5 мг содержится 84.93 мг лактозы, 75 мг - 169.86 мг лактозы.

Использование в педиатрии

Безопасность и эффективность применения препарата Эфевелон у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не установлены.

Эфевелон не следует применять при лечении детей и подростков моложе 18 лет. Повышение вероятности суицидального поведения (попытка суицида и суицидальные мысли), а также враждебности, в клинических испытаниях чаще наблюдается среди детей и подростков, получающих антидепрессанты, по сравнению группами, получающими плацебо.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

У здоровых добровольцев препарат практически не влияет на скорость психомоторных реакций, познавательные способности и комплексные поведенческие реакции. Однако, учитывая возможность появления клинически значимых побочных эффектов со стороны ЦНС, в период лечения пациенты должны соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

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 при применении препарата в форме таблеток обычной продолжительности действия и при применении Эфевелона ретард 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_Retard