Флуоксетин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Флуоксетин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы твердые желатиновые, №4, с корпусом белого цвета и голубым колпачком; содержимое капсул - гранулы белого или почти белого цвета.

	1 капс.
флуоксетина гидрохлорид	11.2 мг,
что соответствует содержанию флуоксетина	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) - 30.8 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 16.1 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 150 мкг, магния стеарат - 600 мкг, тальк - 1.15 мг.

Состав оболочки капсулы: желатин - 36.44 мг, титана диоксид - 1.52 мг, индигокармин - 40 мкг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.

Капсулы твердые желатиновые, с корпусом белого цвета и крышечкой синего цвета; содержимое капсул - порошок белого или почти белого цвета.

	1 капс.
флуоксетина гидрохлорид	22.4 мг,
что соответствует содержанию флуоксетина	20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) - 61.6 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 32.2 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 300 мкг, магния стеарат - 1.2 мг, тальк - 2.3 мг.

Состав оболочки капсулы: желатин - 36.44 мг, титана диоксид - 1.52 мг, краситель азорубин - 30 мкг, краситель пунцовый [Понсо 4R] - 10 мкг, краситель синий патентованный - 50 мкг, краситель бриллиантовый черный - 60 мкг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антидепрессант группы селективных ингибиторов обратного захвата серотонина. Обладает тимоаналептическим и стимулирующим действием.

Избирательно блокирует обратный нейрональный захват серотонина (5НТ) в синапсах нейронов центральной нервной системы. Ингибирование обратного захвата серотонина приводит к повышению концентрации этого нейромедиатора в синаптической щели, усиливает и пролонгирует его действие на постсинаптические рецепторныеучастки. Повышая серотонинергическую передачу, по механизму отрицательной мембранной связи флуоксетин ингибирует обмен нейромедиатора. При длительном применении флуоксетин угнетает активность 5-НТ1-рецепторов. Слабо влияет на обратный захват норадреналина и дофамина. Не оказывает прямого действия на серотониновые, м-холинергические, Н1-гистаминовые и альфа-адренорецепторы. В отличие от большинства антидепрессантов не вызывает снижения активности постсинаптических бета-адренорецепторов.

Эффективен при эндогенных депрессиях и обсессивно-компульсивных расстройствах. Оказывает анорексигенное действие, может вызывать потерю массы тела. Не вызывает ортостатической гипотензии, седативного эффекта, некардиотоксичен. Стойкий клинический эффект наступает через 1-2 недели лечения.

Фармакокинетика

При приеме внутрь препарат хорошо всасывается из ЖКТ (до 95% принятой дозы), применение с пищей незначительно тормозит всасывание флуоксетина. C_{max} в плазме крови достигаются через 6-8 ч. Биодоступность флуоксетина после приема внутрь составляет более 60%. Препарат хорошо накапливается в тканях, легко проникает через гематоэнцефалический барьер, связывание с белками плазмы крови составляет более 90%. Метаболизируется в печени путем деметилирования до активного метаболита норфлуоксетина и ряда не идентифицированных метаболитов. Выводится почками в виде метаболитов (80%) и кишечником (15%), преимущественно в виде глюкуронидов. $T_{1/2}$ флуоксетина после достижения равновесной концентрации в плазме крови составляет около 4-6 суток. $T_{1/2}$ активного метаболита норфлуоксетина при однократном приеме и после достижения равновесной концентрации в плазме крови составляет от 4 до 16 суток. У больных с недостаточностью печени период полувыведения флуоксетина и норфлуоксетина удлиняется.

Показания к применению:

— депрессии различного генеза;

— обсессивно-компульсивные расстройства;

— булимический невроз.

Относится к болезням:

- Депрессия
- Неврит
- Неврозы

Противопоказания:

— одновременный приtм с ингибиторами МАО (и в течение 14 дней после их отмены);

— одновременный прием тиоридазина (и в течение 5 недель после отмены флуоксетина), пимозида;

— беременность;

— период грудного вскармливания;

— тяжелые нарушения функции почек (клиренс креатинина менее 10 мл/мин);

— печеночная недостаточность;

— дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к препарату.

С *осторожностью*

Суицидальный риск: при депрессиях существует вероятность суицидальных попыток, которые могут сохраняться до наступления стойкой ремиссии. Отдельные случаи суицидальных мыслей и суицидального поведения описаны на фоне терапии или вскоре после ее окончания, подобно действию других препаратов близкого фармакологического действия (антидепрессантов). Необходимо тщательное наблюдение за пациентами, относящимися к группе риска. Врачам следует убедить пациентов незамедлительно сообщать о любых мыслях и чувствах, причиняющих беспокойство.

Эпилептическиеприпадки: флоуксетин следует с осторожностью назначать больным, у которых отмечались эпилептические припадки.

Гипонатриемия: отмечались случаи гипонатриемии. В основном подобные случаи отмечались у больных пожилого возраста и у больных, принимавших диуретики, вследствие уменьшения объема циркулирующей крови.

Сахарный диабет: гликемический контроль у больных диабетом вовремя лечения флуоксетином показывал гипогликемию, после отмены препарата развивалась гипергликемия. В начале или после лечения флуоксетином может потребоваться корректировка доз инсулина и/или гипогликемических препаратов для приема внутрь.

Почечная/печеночная недостаточность: флуоксетин подвергается метаболизму в печени и выводится почками и через желудочно-кишечный тракт. Пациентами с выраженными нарушениями функции печени рекомендуется назначать более низкие дозы флуоксетина, либо назначать препарат через день. При приеме флуоксетина в дозе 20 мг/сут на протяжении двух месяцев не было выявлено отличий концентрации флуоксетина и норфлуоксетина в плазме крови здоровых лиц, имеющих нормальную функцию почек, и пациентов с выраженными нарушениями функции почек (клиренс креатинина 10 мл/мин), нуждающимися в гемодиализе.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, в любое время независимо от приема пищи.

Депрессивное состояние

Начальная доза составляет 20 мг 1 раз/сут в первой половине дня, независимо от приема пищи. При необходимости доза может быть увеличена до 40-60 мг/сут, разделенных на 2-3 приема (на 20 мг/сут еженедельно). Максимальная суточная доза - 80 мг в 2-3 приема.

Клинический эффект развивается через 1-2 недели после начала лечения, у некоторых пациентов он может достигаться позже.

Обсессивно-компульсивные расстройства

Рекомендованная доза составляет 20-60 мг/сут.

Булимический невроз

Препарат применяется в суточной дозе 60 мг, разделенных на 2-3 приема.

Применение препарата пациентами различного возраста

Не существует данных об изменении доз в зависимости от возраста. Начинать лечение **пациентов пожилого возраста** следует с дозы 20 мг/сут.

Сопутствующие заболевания

Назначать флуоксетин **пациентам с нарушениями функции печени или почек** рекомендуется с применение низких доз и удлинение интервала между приемами.

Побочное действие:

При применении флуоксетина как и в случаях применения препаратов группы селективных ингибиторов обратного захвата серотонина, отмечаются следующие нежелательные явления.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто (≥ 1% - ≤10%) - трепетание предсердий, приливы жара; нечасто (≥ 0.1% - ≤1%) - гипотензия; редко (≤ 0.1%) - васкулит, вазолидация.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто (≥ 10%) - диарея, тошнота; часто (≥ 1% - ≤10%) - сухость во рту, диспепсия, рвота; нечасто (≥ 0.1% - ≤1%) - дисфагия, извращение вкуса; редко (≤ 0.1%) - боли по ходу пищевода.

Со стороны гепатобилиарной системы: редко (≤ 0.1%) - идиосинкразический гепатит.

Со стороны иммунной системы: очень редко (≤ 0.1%) - анафилактические реакции, сывороточная болезнь.

Нарушения метаболизма и питания: часто (≥ 1% - ≤10%) - анорексия (включая потерю массы) тела.

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто (≥ 0.1% - ≤1%) - мышечные подергивания.

Со стороны ЦНС: очень часто (≥ 10%) - головная боль; часто (≥ 1% - ≤10%) - нарушение внимания, головокружение, летаргия, сонливость (в том числе гиперсонливость, седация), тремор; нечасто (≥ 0.1% - ≤1%) - психомоторное возбуждение, гиперактивность, атаксия, нарушение координации, бруксизм, дискинезия, миоклонус; редко (≤ 0.1%) - букко-глоссальный синдром, судороги, серотониновый синдром.

Психические расстройства: очень часто (≥ 10%) - бессонница (включая раннее утреннее пробуждение, начальную и среднюю бессонницу); часто (≥ 1% - ≤ 10%) - необычные сновидения (в т.ч. кошмары), нервозность, напряженность, снижение либидо (включая отсутствие либидо), эйфория, расстройство сна; нечасто (≥ 0.1% - ≤1%) - деперсонализация, гипертимия, нарушение оргазма (включая аноргазмию), нарушения мышления; редко (≤ 0.1%) - маниакальные расстройства.

Со стороны кожных покровов: часто (≥ 1% - ≤10%) - гипергидроз, кожный зуд, полиморфная кожная сыпь, крапивница; нечасто (≥ 0.1% - ≤1%) - экхимоз, склонность к появлению синяков, алопеция, холодный пот; редко (≤ 0.1%) - ангионевротический отек, реакции фоточувствительности.

Со стороны органов чувств: часто (≥ 1% - ≤10%) - нечеткость зрения; нечасто (≥ 0.1% - ≤1%) - мидриаз.

Со стороны мочеполовой системы: часто (≥ 1% - ≤10%) - учащенной мочеиспускание (включая поллакиурию), нарушение эякуляции (в т.ч. отсутствие эякуляции, дисфункциональная эякуляция, ранняя эякуляция, задержка эякуляции, ретроградная эякуляция), эректильная дисфункция, гинекологические кровотечения (в т.ч. кровотечение из шейки матки, дисфункциональное маточное кровотечение, кровотечение из половых путей, менометроррагия, меноррагия, метроррагия, полименорея, кровотечение в постменопаузе, маточное кровотечение, вагинальное кровотечение); нечасто (≥ 0.1% - ≤1%) - дизурия; редко (≤ 0.1%) - сексуальная дисфункция, приапизм.

Постмаркетинговые сообщения

Со стороны эндокринной системы отмечались случаи недостаточности антидиуретического гормона.

Указанные побочные эффекты чаще возникают в начале терапии флуоксетином или при повышении дозы препарата.

Передозировка:

Симптомы: психомоторное возбуждение, судорожные припадки, сонливость, нарушения сердечного ритма, тахикардия, тошнота, рвота.

Другие серьезные симптомы передозировки флуоксетина (как при изолированном приеме флуоксетина, так и при одновременном приеме с другими препаратами) включали кому, делирий, удлинение интервала QT и желудочковую тахиаритмию, в том числе мерцание – трепетание желудочков и остановку сердца, снижение артериального давления, обморок, манию, пирексию, ступор и состояние, подобное злокачественному нейролептическому синдрому

Лечение: специфические антагонисты к флуоксетину не найдены. Проводится симптоматическая терапия, промывание желудка с назначением активированного угля, при судорогах - диазепам, поддержание дыхания, сердечной деятельности, температуры тела.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Флуоксетин и его основной метаболит норфлуоксетин имеют длительные периоды полувыведения, что необходимо учитывать при сочетании флуоксетина с другими препаратами, а также при его замене на другой антидепрессант.

Нельзя применять препарат одновременно с ингибиторами МАО, в т.ч. антидепрессантами - ингибиторами МАО; *фуразолидоном, прокарбазином, селегилином, а также триптофаном* (предшественник серотонина), так как возможно развитие серотонинергического синдрома, проявляющегося в спутанности сознания, гипоманиакальном состоянии, психомоторном возбуждении, судорогах, дизартрии, гипертонических кризах, ознобе, треморе, тошноте, рвоте, диарее.

После применения ингибиторов МАО назначение флуоксетина допускается не ранее 14 дней. Не следует применять ингибиторы МАО ранее, чем через 5 недель после отмены флуоксетина.

Одновременный прием лекарственных препаратов, метаболизируемых с участием изофермента CYP2D6 (*карбамазепин, диазепам, пропафенон)* с флуоксетином следует осуществлять с применением минимальных терапевтических доз. Флуоксетин блокирует метаболизм трициклических и тетрациклических аитидепрессивных средств *тразодона, метопролола, терфенадина,* что приводит к увеличению их концентрации в сыворотке крови, усиливая их действие и увеличивая частоту осложнений.

У пациентов, стабильно принимавших поддерживающие дозы *фенитоина*, концентрации фенитоина в плазме существенно увеличились и появились симптомы фенитоиновой интоксикации (нистагм, диплопия, атаксия и угнетение ЦНС) после начала сопутствующего лечения флуоксетином.

Сочетанное применение флуоксетина и *солей лития*, требует тщательного контроля за концентрацией лития в крови, т.к. возможно её повышение.

Флуоксетин усиливает действие *гипогликемических препаратов*.

При одновременном применении с препаратами, обладающими высокой степенью связывания с белками, особенно с *антикоагулянтами и дигитоксином*, возможно повышение концентрации в плазме свободных (несвязанных) лекарственных средств и увеличение риска развития неблагоприятных эффектов.

Особые указания и меры предосторожности:

Требуется тщательное наблюдение за больными с суицидальными наклонностями, особенно в начале лечения. Наиболее высок риск суицида у больных, ранее принимавших другие антидепрессанты, и пациентов, у которых на фоне лечения флуоксетином отмечается чрезмерное утомление, гиперсомния или двигательное беспокойство. До наступления значительного улучшения в лечении такие больные должны находиться под наблюдением врача.

У детей, подростков и молодых людей (младше 24 лет) с депрессией, другими психическими нарушениями антидепрессанты, по сравнению с плацебо, повышают риск возникновения суицидальных мыслей и суицидального поведения. Поэтому при назначении флуоксетина или любых др. антидепрессантов у детей, подростков и молодых людей (младше 24 лет) следует соотнести риск суицида и пользу от их применения. В краткосрочных исследованиях у людей старше 24 лет риск суицида не повышался, а у людей старше 65 лет несколько снижался. Любое депрессивное расстройство само по себе увеличивает риск суицида. Поэтому во время лечения антидепрессантами за всеми пациентами должно быть установлено наблюдение с целью раннего выявления нарушений или изменений поведения, а также суицидальных наклонностей.

На фоне проведения электросудорожной терапии возможно развитие продолжительных эпилептических припадков.

Интервал между окончанием терапии ингибиторами МАО и началом лечения флуоксетином должен составлять как минимум 14 дней; между окончанием лечения флуоксетином и началом терапии ингибиторами МАО - не менее 5 недель.

После отмены препарата его терапевтическая концентрация в сыворотке крови может сохраняться в течение нескольких недель.

У больных с сахарным диабетом возможно развитие гипогликемии во время терапии флуоксетином и гипергликемии после его отмены. В начале или после лечения флуоксетином может потребоваться корректировка доз инсулина и/или гипогликемических препаратов для приема внутрь.

При лечении больных с дефицитом массы тела следует учитывать анорексигенные эффекты (возможна прогрессирующая потеря массы тела).

Во время приема флуоксетина следует воздержаться от приема алкоголя, т.к. препарат усиливает действие алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Приём флуоксетина может негативно сказываться на выполнении работы, требующей высокой скорости психических и физических реакций (управление механическими

При нарушениях функции почек

Флуоксетин подвергается метаболизму в печени и выводится почками и через ЖКТ. При приеме флуоксетина в дозе 20 мг/сут на протяжении двух месяцев не было выявлено отличий концентрации флуоксетина и норфлуоксетина в плазме крови здоровых лиц, имеющих нормальную функцию почек, и пациентов с выраженными нарушениями функции почек (клиренс креатинина 10 мл/мин), нуждающимися в гемодиализе.

При нарушениях функции печени

Флуоксетин подвергается метаболизму в печени и выводится почками и через ЖКТ. Пациентами с выраженными нарушениями функции печени рекомендуется назначать более низкие дозы флуоксетина, либо назначать препарат через день.

Применение в пожилом возрасте

Не существует данных об изменении доз в зависимости от возраста. Начинать лечение **пациентов пожилого возраста** следует с дозы 20 мг/сут.

Применение в детском возрасте

У детей и подростков с депрессией, другими психическими нарушениями антидепрессанты, по сравнению с плацебо, повышают риск возникновения суицидальных мыслей и суицидального поведения. Поэтому при назначении флуоксетина или любых др. антидепрессантов данной категории пациентов следует соотнести риск суицида и пользу от их применения.

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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