Флюанксол

Код АТХ:

- N05AF01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Флупентиксол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой (сахарной) коричневато-желтого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
флупентиксола дигидрохлорид	584 мкг,
что соответствует содержанию флупентиксола	500 мкг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 27.7 мг, крахмал картофельный - 55.4 мг, желатин - 2.4 мг, тальк - 6.3 мг, магния стеарат - 0.45 мг.

Состав оболочки: желатин - 0.371 мг, сахароза - 35.9 мг, сахароза порошок - 20.5 мг, железа оксид желтый (E172) - 0.25 мг, полирующий воск Capol 1295 (смесь воска пчелиного и воска карнаубского) - q.s.

50 шт. - контейнеры пластиковые (1) - пачки картонные.
100 шт. - контейнеры пластиковые (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой (сахарной) коричневато-желтого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
флупентиксола дигидрохлорид	1.168 мг,
что соответствует содержанию флупентиксола	1 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 37 мг, крахмал картофельный - 73.5 мг, желатин - 2.76 мг, тальк - 8.4 мг, магния стеарат - 0.6 мг.

Состав оболочки: желатин - 0.558 мг, сахароза - 50 мг, сахароза порошок - 16.2 мг, железа оксид желтый (E172) - 0.25

мг, полирующий воск Capol 1295 (смесь пчелиного воска белого и карнаубского воска) - q.s.

50 шт. - контейнеры пластиковые (1) - пачки картонные.
100 шт. - контейнеры пластиковые (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой (сахарной) коричневато-желтого цвета, овальные, двояковыпуклые.

	1 таб.
флупентиксола дигидрохлорид	5.84 мг,
что соответствует содержанию флупентиксола	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 38 мг, крахмал картофельный - 77 мг, желатин - 3.32 мг, тальк - 9.1 мг, магния стеарат - 0.65 мг.

Состав оболочки: желатин - 0.558 мг, сахароза - 60.9 мг, сахароза порошок - 49.2 мг, железа оксид желтый (E172) - 0.3 мг, полирующий воск Capol 1295 (смесь пчелиного воска белого и карнаубского воска) - q.s.

100 шт. - контейнеры пластиковые (1) - пачки картонные.

Раствор для в/м введения масляный прозрачный, от бесцветного до слегка желтоватого цвета, практически свободный от частиц.

	1 мл
цис(Z)-флупентиксола деканоат	20 мг

Вспомогательные вещества: триглицериды с цепями средней величины.

1 мл - ампулы (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антипсихотическое средство (нейролептик), производное тиоксантена с выраженным антипсихотическим, активирующим и анксиолитическим действием. Антипсихотическое действие нейролептиков связывают с блокадой допаминовых рецепторов, но, возможно, и с блокадой серотониновых 5-HT-рецепторов.

Флюанксол редуцирует основные симптомы психоза, в т.ч. галлюцинации, параноидный бред и нарушения мышления.

Антипсихотическое действие Флюанксола начинает проявляться при применении препарата внутрь в дозе 3 мг/сут; интенсивность действия возрастает с увеличением дозы как при приеме внутрь, так и при в/м введении.

Флюанксол обладает растормаживающими (антиаутистическим и активирующим) свойствами, а также ослабляет вторичные расстройства настроения, что способствует активизации больных с депрессивной симптоматикой, повышает их коммуникабельность и облегчает социальную адаптацию.

В малых и средних дозах (до 25 мг/сут при приеме внутрь и до 100 мг в/м 1 раз в 2 недели) препарат не оказывает седативного действия, однако в высоких дозах может вызывать неспецифический седативный эффект.

При приеме внутрь в малых дозах (до 3 мг/сут) препарат оказывает антидепрессивное действие.

Флюанксол раствор для в/м введения масляный предназначается для депо-инъекций, являясь депонированной формой флупентиксола. В данной лекарственной форме препарат имеет значительно большую продолжительность действия, чем Флюанксол в форме таблеток, и позволяет проводить непрерывную антипсихотическую терапию, что особенно важно для лечения пациентов, не выполняющих врачебные предписания. Применение Флюанксола в форме раствора для в/м введения предотвращает частые рецидивы, связанные с произвольным прерыванием лечения пациентами при приеме препарата внутрь. Инъекции Флюанксола можно проводить с интервалами в 2-4 недели.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь C_{max} флупентиксола в плазме достигается через 3-6 ч. Биодоступность составляет около 40%.

После в/м введения цис(Z)-флупентиксола деканоат подвергается ферментативному расщеплению на активный компонент цис(Z)-флупентиксол и декановую кислоту. C_{max} цис(Z)-флупентиксола в сыворотке достигается к концу первой недели после инъекции.

Распределение

Кажущийся V_d составляет около 14.1 л/кг. Связывание с белками плазмы составляет около 99%. При в/м введении раствора для инъекций C_{ss} достигается через 3 месяца применения препарата.

Флупентиксол и цис(Z)-флупентиксол незначительно проникают через плацентарный барьер, в небольших количествах выделяются с грудным молоком.

Метаболизм

Метаболиты не обладают нейролептической активностью.

Выведение

При в/м введении раствора для инъекций кривая концентрации в сыворотке снижается экспоненциально с $T_{1/2}$, равным примерно 3 неделям, что отражает скорость высвобождения флупентиксола из депо.

Метаболиты флупентиксола не обладают нейролептической активностью. Выводятся в основном с калом и, частично, с мочой. $T_{1/2}$ составляет примерно 35 ч.

Фармакокинетически доза Флюанксола 40 мг при в/м введении 1 раз в 2 недели эквивалентна дозе Флуанксола 10 мг/сут при приеме внутрь в течение 2 недель.

Показания к применению:

Для приема внутрь в дозе до 3 мг/сут

— депрессия легкой и средней степени с тревогой, астенией и отсутствием инициативы;

— хронические невротические расстройства с тревогой, депрессией и апатией;

— психосоматические нарушения с астеническими реакциями.

Для приема внутрь в дозе 3 мг/сут и более

— шизофрения и шизофреноподобные психозы с преобладанием галлюцинаторной симптоматики, бреда, нарушений мышления, сопровождающиеся также апатией, анергией, снижением настроения и аутизмом.

Для в/м введения

— шизофрения и другие психотические состояния, протекающие с галлюцинациями, бредом и нарушениями мышления, сопровождающиеся апатией, анергией, снижением настроения и аутизмом.

Относится к болезням:

- Астения
- Депрессия
- Неврит
- Неврозы
- Шизофрения

Противопоказания:

— сосудистый коллапс;

— угнетение сознания любого происхождения (в т.ч. вызванное приемом алкоголя, барбитуратов или опиоидных анальгетиков);

— кома;

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность к фенотиазинам;

— наследственная непереносимость галактозы и/или фруктозы; недостаточность лактазы Iapp; недостаточность сахаразы и изомальтазы; нарушение абсорбции глюкозы и галактозы (при приеме таблеток).

С *осторожностью* применять у пациентов с органическими заболеваниями головного мозга, судорожными расстройствами, в т.ч. с эпилепсией (в результате снижения порога судорожной готовности возможно учащение

припадков); с тяжелой печеночной недостаточностью; с гипокалиемией, гипомагниемией; сердечно-сосудистыми заболеваниями в анамнезе (риск транзиторного снижения АД), в т.ч. с удлинением интервала QT, брадикардией менее 50 уд./мин, с недавно перенесенным острым инфарктом миокарда, при некомпенсируемой сердечной недостаточности, при аритмии; с факторами риска развития инсульта; с глаукомой (и предрасположенностью к ней); с язвенной болезнью желудка и двенадцатиперстной кишки; с алкоголизмом (возможно усиление угнетающего действия на ЦНС); с феохромоцитомой; с лейкопенией; нарушением дыхания, связанным с острыми инфекционными заболеваниями, бронхиальной астмой или эмфиземой легких; при болезни Паркинсона (усиление экстрапирамидных эффектов); с задержкой мочи, гиперплазией предстательной железы с клиническими проявлениями (риск задержки мочи); с синдромом Рейе (повышение риска развития гепатотоксического действия); при беременности, в период лактации (грудного вскармливания).

Не рекомендуется назначать Флюанксол в дозе до 25 мг/сут пациентам в состоянии психомоторного возбуждения, т.к. активирующее действие Флюанксола в небольших дозах (при приеме внутрь до 3 мг/сут или при в/м введении 10-20 мг 1 раз в 2 недели) может привести к обострению этой симптоматики.

Способ применения и дозы:

Для приема внутрь в дозе до 3 мг/сут

При *депрессии легкой и средней степени с тревогой, астенией и отсутствием инициативы; хронических невротических расстройствах с тревогой, депрессией и апатией; психосоматических нарушениях с астеническими реакциями* начальная доза препарата 1 мг 1 раз/сут утром или по 500 мкг 2 раза/сут. При отсутствии удовлетворительного терапевтического эффекта через 1 неделю доза может быть увеличена до 2 мг/сут. Суточную дозу, составляющую от 2 мг до 3 мг, следует разделить на несколько приемов. Для **пациентов пожилого возраста** рекомендуемая суточная доза составляет 0.5-1.5 мг.

Терапевтический эффект обычно проявляется в течение 2-3 дней. Если при приеме максимальной дозы 3 мг/сут эффект не наблюдается в течение недели, то препарат следует отменить.

Для приема внутрь в дозе 3 мг/сут и более

При терапии *психотических состояний* дозу устанавливают индивидуально, в зависимости от состояния пациента. В начале лечения рекомендуется применять препарат в невысоких дозах, которые затем, в зависимости от реакции пациента на лечение, быстро увеличивают до достижения оптимального клинического эффекта.

Начальная суточная доза составляет 3-15 мг в 2-3 приема. При необходимости дозу можно увеличить до 20-30 мг/сут. Максимальная суточная доза составляет 40 мг. Для поддерживающей терапии препарат применяют в дозе 5-20 мг/сут.

Для в/м введения

Раствор для в/м введения вводят глубоко в/м в верхний наружный квадрант ягодицы. В другие мышцы вводить не рекомендуется. Если необходимый объем раствора превышает 2 мл, рекомендуется разделить его на 2 части и сделать 2 инъекции.

Препарат в форме раствора для в/м введения 20 мг/мл обычно вводят в дозе 20-40 мг (1-2 мл) каждые 2-4 недели. Некоторым пациентам могут быть необходимы более высокие дозы или более короткие интервалы между инъекциями. При *обострении или остром рецидиве заболевания* может потребоваться введение препарата в дозе вплоть до 400 мг одномоментно с интервалами в 2 или даже 1 неделю.

Переход с Флюанксола для приема внутрь на в/м введение

Суточная доза (мг) препарата для приема внутрь x 4 = разовая доза (мг) раствора для в/м введения каждые 2 недели.

При этом в течение 1-й недели после 1-й инъекции следует продолжать прием препарата внутрь, но в уменьшенной дозе.

Последующие дозы и интервалы между инъекциями устанавливают в соответствии с клиническим эффектом. Максимальная доза Флюанксола при в/м введении составляет 400 мг одномоментно с интервалом между инъекциями в 1 неделю.

Пациенты, которых переводят с терапии депо-формами других препаратов, должны получать Флюанксол с учетом следующих соотношений: 40 мг флупентиксола деканоата эквивалентно 25 мг флуфеназина деканоата, 200 мг зуклопентиксола деканоата или 50 мг галоперидола деканоата.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: сонливость, головная боль, тремор, акатизия, паркинсонизм, гипокинезия, дистония,

расстройства речи, депрессия, бессонница, нервозность, ажитация; иногда - головокружение, нарушения внимания, экстрапирамидные расстройства (в основном мышечная ригидность и гиперкинез), дискинезия, амнезия, судорожные расстройства, агрессия, снижение либидо, спутанность сознания; редко - поздняя дистония.

Следует иметь в виду, что при применении нейролептиков, в т.ч. флупентиксола, в редких случаях возможно развитие ЗНС. Основными симптомами ЗНС являются: гипертермия, мышечная ригидность и нарушение сознания в сочетании с дисфункцией вегетативной нервной системы (лабильное АД, тахикардия, усиление потоотделения). При появлении указанных симптомов необходима срочная отмена нейролептика и назначение симптоматической и поддерживающей терапии.

При длительном лечении препаратом возможно развитие поздней дискинезии. Противопаркинсонические препараты не устраняют ее симптомы и могут усугубить их. Рекомендуется снижение дозы или, по возможности, прекращение лечения.

При персистирующей актатизии могут быть эффективны бензодиазепины или пропранолол.

В первые несколько дней после инъекции и на ранних стадиях лечения могут возникать нарушения моторики. В большинстве случаев такие эффекты контролируются путем снижения дозы и/или противопаркинсоническими препаратами. Однако рутинное применение противопаркинсонических средств для профилактики побочных эффектов не рекомендуется.

Транзиторная бессонница или чувство тревоги могут наблюдаться особенно, если пациенты ранее принимали нейролептики, обладающие седативным эффектом.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: иногда - ортостатическая гипотензия, тахикардия; в редких случаях (как и при приеме других нейролептиков) - удлинение интервала QT, желудочковая аритмия (фибрилляция желудочков, желудочковая тахикардия, развитие пароксизмов желудочковой тахикардии типа "пируэт", внезапная смерть).

Со стороны системы кроветворения: редко - гранулоцитопения, агранулоцитоз (более вероятен между 4 и 10 неделями лечения), лейкопения, гемолитическая анемия.

Со стороны органа зрения: нарушение аккомодации, помутнение роговицы и/или хрусталика с возможным нарушением зрения; иногда - окулогирный криз, парез аккомодации.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, расстройства пищеварения (в т.ч. запор, диарея, диспепсия, тошнота), повышенное слюноотделение, дисфагия, рвота, холестатическая желтуха (более вероятна между 2 и 4 неделями лечения), снижение аппетита; в единичных случаях - незначительные преходящие изменения показателей функциональных печеночных проб.

Со стороны эндокринной системы: галакторея, гинекомастия, дисменорея, импотенция, снижение либидо, повышение аппетита, увеличение массы тела, приливы, изменение углеводного обмена.

Со стороны мочевыделительной системы: иногда - задержка мочи, болезненное мочеиспускание.

Со стороны костно-мышечной системы: иногда - артралгия.

Со стороны половой системы: иногда - эректильная дисфункция.

Аллергические реакции: иногда - зуд, кожная сыпь, дерматит, фотосенсибилизация, повышенное потоотделение.

Местные реакции: редко - эритема, отек, воспаление или абсцесс.

Прочие: слабость, астения.

Передозировка:

Симптомы: возможны сонливость, гипер- или гипотермия, экстрапирамидные расстройства, судороги, шок, кома.

При одновременном приеме с препаратами, оказывающими влияние на сердечную деятельность, были зарегистрированы изменения на ЭКГ, удлинение интервала QT, желудочковые аритмии, в т.ч. аритмия типа "пируэт", остановка сердца.

Лечение: проводят симптоматическую и поддерживающую терапию. В случае приема препарата внутрь необходимо как можно быстрее промыть желудок, рекомендуется прием сорбента. Следует принять меры, направленные на поддержание деятельности дыхательной и сердечно-сосудистой систем. Не следует применять эпинефрин (адреналин), т.к. это может привести к последующему понижению АД. Судороги можно купировать диазепамом, а экстрапирамидные симптомы - бипериденом.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение Флюанксола при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) возможно только в случаях, если предполагаемая польза терапии для матери превышает потенциальный риск для плода.

У новорожденных, чьи матери принимали нейролептики в III триместре беременности или во время родов, могут наблюдаться признаки интоксикации, такие как летаргия, тремор, чрезмерная возбудимость. Кроме того, у таких новорожденных отмечается низкий балл по шкале Апгар.

Во время лечения Флюанксолом допускается грудное вскармливание, если это признано клинически необходимым. В таких случаях рекомендуется наблюдать за состоянием новорожденного, особенно в первые 4 недели после рождения.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Флюанксол может усиливать седативное действие этанола, барбитуратов и других средств, оказывающих угнетающее действие на ЦНС.

Флюанксол не следует применять совместно с гуанетидином и средствами с аналогичным действием, т.к. нейролептики могут ослаблять их гипотензивное действие.

Трициклические антидепрессанты и нейролептики (в т.ч. Флюанксол) взаимно ингибируют метаболизм.

Одновременное применение нейролептиков и лития повышает риск нейротоксичности.

При одновременном применении Флюанксол может снижать эффективность леводопы и действие адренергических средств.

При одновременном применении Флюанксола с метоклопрамидом и пиперазином увеличивается риск развития экстрапирамидных расстройств.

Пролонгирование интервала QT, характерное для терапии антипсихотическими средствами, может увеличиться при одновременном приеме препаратов, оказывающих такое же действие, в т.ч. антиаритмиков I A и III классов (хинидин, амиодарон, соталол, дофетилид), некоторых антипсихотических средств (тиоридазин), некоторых антибиотиков группы макролидов (эритромицин) и антибиотиков хинолонового ряда (гатифлоксацин, моксифлоксацин), некоторых антигистаминных средств (терфенадин, астемизол), цизаприда, препаратов лития. Следует избегать одновременного приема Флюанксола и перечисленных препаратов.

При одновременном применении с препаратами, вызывающими электролитные нарушения (тиазидные и тиазидоподобные диуретики) и препаратами, способными повышать концентрацию флупентиксола или флупентиксола деканоата в плазме крови, возможно увеличение риска удлинения интервала QT и возникновения опасных для жизни аритмий.

Фармацевтическое взаимодействие

Флюанксол в форме раствора для в/м инъекций не должен смешиваться с депонированными формами на основе кунжутного масла, т.к. это может оказать значительное влияние на фармакокинетику вводимых препаратов.

Особые указания и меры предосторожности:

В случае предшествующего лечения нейролептиками или транквилизаторами с седативным действием их прием следует прекращать постепенно.

При длительной терапии, особенно с применением Флюанксола в высоких дозах, необходимо проводить тщательный контроль и периодическую оценку состояния пациентов с целью своевременной коррекции поддерживающей дозы.

При сопутствующем лечении диабета назначение Флюанксола может потребовать коррекции дозы инсулина.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения пациент должен избегать занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции печени

С осторожностью назначают препарат пациентам с печеночной недостаточностью.

Применение в пожилом возрасте

Для **пациентов пожилого возраста** рекомендуемая суточная доза для приема внутрь составляет 0.5-1.5 мг.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 18 лет.

Условия хранения:

Список Б. Таблетки следует хранить при температуре не выше 30°С.

Раствор для в/м введения масляный следует хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Срок годности - 4 года.

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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