Ленуксин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Эсциталопрам

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 пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, с гравировкой "№53" на одной стороне; на поперечном разрезе белого или почти белого цвета.

	1 таб.
эсциталопрама оксалат	6.3875 мг,
что соответствует содержанию эсциталопрама	5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 16.4125 мг, кроскармеллоза натрия - 3.125 мг, тальк - 0.625 мг, целлюлоза микрокристаллическая силицинизированная 90 (Prosolv 90) - 17.6625 мг, целлюлоза микрокристаллическая силиконизированная HD90 (Prosolv HD90) - 17.6625 мг, магния стеарат - 0.625 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II белый 33G28523 - 1.25 мг (гипромеллоза 6cP (2910) - 40%, титана диоксид (E171) - 25%, лактозы моногидрат - 21%, макрогол 3350 - 8%, глицерола триацетат (триацетин) - 6%).

14 шт. - флаконы полипропиленовые (1) - пачки картонные.
28 шт. - флаконы полипропиленовые (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, с гравировкой "№54" на одной стороне и риской на другой стороне; на поперечном разрезе белого или почти белого цвета.

	1 таб.
эсциталопрама оксалат	12.775 мг,
что соответствует содержанию эсциталопрама	10 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 32.825 мг, кроскармеллоза натрия - 6.25 мг, тальк - 1.25 мг, целлюлоза микрокристаллическая силицинизированная 90 (Prosolv 90) - 35.325 мг, целлюлоза микрокристаллическая силиконизированная HD90 (Prosolv HD90) - 35.325 мг, магния стеарат 1.25 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II белый 33G28523 - 2.5 мг (гипромеллоза 6cP (2910) - 40%, титана диоксид (E171) - 25%, лактозы моногидрат - 21%, макрогол 3350 - 8%, глицерола триацетат (триацетин) - 6%).

14 шт. - флаконы полипропиленовые (1) - пачки картонные.
28 шт. - флаконы полипропиленовые (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, с гравировкой "№56" на одной стороне и риской на другой стороне; на поперечном разрезе белого или почти белого цвета.

	1 таб.
эсциталопрама оксалат	25.55 мг,
что соответствует содержанию эсциталопрама	20 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 65.65 мг, кроскармеллоза натрия - 12.5 мг, тальк - 2.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая силицинизированная 90 (Prosolv 90) - 70.65 мг, целлюлоза микрокристаллическая силиконизированная HD90 (Prosolv HD90) - 70.65 мг, магния стеарат - 2.5 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II белый 33G28523 - 5 мг (гипромеллоза 6cP (2910) - 40%, титана диоксид (E171) - 25%, лактозы моногидрат - 21%, макрогол 3350 - 8%, глицерола триацетат (триацетин) - 6%).

14 шт. - флаконы полипропиленовые (1) - пачки картонные.
28 шт. - флаконы полипропиленовые (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антидепрессант, селективный ингибитор обратного захвата серотонина (СИОЗС); повышает концентрацию нейромедиатора в синаптической щели, усиливает и пролонгирует действие серотонина на постсинаптические рецепторы. Эсциталопрам практически не связывается с серотониновыми (5-НТ), допаминовыми (D1 и D2), альфа-адренорецепторами, гистаминовыми, м-холинорецепторами, а также бензодиазепиновыми и опиоидными рецепторами.

Антидепрессивный эффект обычно развивается через 2-4 недели после начала приема. Максимальный терапевтический эффект лечения панических расстройств достигается примерно через 3 месяца после начала лечения.

Фармакокинетика

Всасывание

Всасывание не зависит от приема пищи. Кинетика эсциталопрама линейна при однократном и регулярном приеме в диапазоне доз от 10 до 30 мг/сут. Биодоступность - около 80%. Время достижения C_{max} в плазме крови - 4 ч.

Распределение

C_{ss} в плазме крови достигается через 1 неделю. Средняя величина C_{ss} составляет 50 нмоль/л (от 20 до 125 нмоль/л) при суточной дозе 10 мг. Средний V_d - от 12 до 26 л/кг. Связывание с белками плазмы - около 56%.

Метаболизм

Метаболизируется в печени до активных деметилированного и дидеметилированного метаболитов. При регулярном приеме препарата стационарная концентрация деметил- и дидеметилметаболитов составляет 28-31% и менее 5% соответственно от концентрации эсциталопрама. Метаболизм эсциталопрама в деметилированный метаболит происходит главным образом с помощью изоферментов цитохрома Р450: CYP2C19, CYP3A4 и CYP2D6.

Выведение

$T_{1/2}$ после многократного применения - 30 ч. У основных метаболитов эсциталопрама $T_{1/2}$ более продолжителен. Общий клиренс - 0.6 л/мин. Эсциталопрам и его основные метаболиты выводятся печенью и большая часть - почками, частично выводится в форме глюкуронидов.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При печеночной недостаточности клиренс эсциталопрама снижается на 37% и $T_{1/2}$ увеличивается вдвое.

У пациентов с низкой активностью изофермента CYP2C19 концентрация эсциталопрама может быть в 2 раза выше. Значительных изменений концентрации препарата при слабой активности изофермента CYP2D6 не отмечается.

При средней степени тяжести почечной недостаточности клиренс эсциталопрама снижается на 17%. Данные по фармакокинетике эсциталопрама у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК ниже 20 мл/мин) отсутствуют.

У пожилых (старше 65 лет) эсциталопрам выводится медленнее, чем у более молодых пациентов. AUC у пожилых повышается на 50%.

Показания к применению:

— депрессия средней или тяжелой степени;

— панические расстройства с агорафобией или без нее;

— социальное тревожное расстройство (социальная фобия);

— генерализованное тревожное расстройство.

Относится к болезням:

- Депрессия
- Паническое расстройство
- Тревожное расстройство
- Фобия

Противопоказания:

— детский и юношеский возраст до 18 лет;

— одновременный прием с ингибиторами МАО;

— дефицит сахаразы/изомальтазы, непереносимость фруктозы и глюкозо-галактозная мальабсорбция, поскольку препарат содержит сахарозу;

— повышенная чувствительность к препарату или его компонентам.

С *осторожностью:* почечная недостаточность (КК ниже 30 мл/мин), гипомания, мания, фармакологически неконтролируемая эпилепсия, депрессия с суицидальными попытками, сахарный диабет, пожилой возраст, цирроз печени, склонность к кровотечениям; одновременный прием с препаратами, снижающими порог судорожной готовности и вызывающими гипонатриемию, с этанолом, а также с препаратами, метаболизирующимися изоферментом CYP2C19.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь 1 раз/сут независимо от приема пищи.

Депрессия средней и тяжелой степени

Обычно назначают 10 мг 1 раз/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до максимальной - 20 мг/сут. Антидепрессивный эффект обычно развивается через 2-4 недели после начала лечения. После исчезновения симптомов депрессии необходимо продолжать терапию для закрепления полученного эффекта в течение как минимум 6 мес.

Панические расстройства с агорафобией или без нее

В течение первой недели лечения рекомендуется доза 5 мг/сут, которая затем увеличивается до 10 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до максимальной - 20 мг/сут. Максимальный терапевтический эффект достигается примерно через 3 месяца после начала лечения. Терапия длится несколько месяцев.

Социальное тревожное расстройство (социальная фобия)

Обычно назначают 10 мг 1 раз/сут. Ослабление симптомов обычно развивается через 2-4 недели после начала лечения. В зависимости от индивидуальной реакции пациента, доза впоследствии может быть уменьшена до 5 мг/сут или увеличена до максимальной - 20 мг/сут. Поскольку социальное тревожное расстройство является заболеванием с хроническим течением, минимальная рекомендуемая длительность терапевтического курса составляет 12 недель. Для предотвращения рецидивов заболевания может назначаться повторная терапия в течение 6 месяцев или дольше в зависимости от индивидуальной реакции пациента.

Перед назначением препарата необходимо дифференцировать социальную фобию с "обыденной" застенчивостью или робостью.

Генерализованное тревожное расстройство

Рекомендуемая начальная доза - 10 мг 1 раз/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до максимальной - 20 мг/сут. Допускается длительное назначение препарата (6 месяцев и дольше) в дозе 20 мг/сут.

Пожилым пациентам (старше 65 лет) рекомендуется назначать половину обычной рекомендуемой дозы - 5 мг/сут. Максимальная доза - 10 мг/сут.

При **средней степени тяжести почечной недостаточности** коррекции дозы не требуется. **Пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени (клиренс креатинина ниже 30 мл/мин)** препарат назначают с осторожностью.

При **легкой и умеренной печеночной недостаточности** рекомендуемая начальная доза в течение первых двух недель лечения составляет 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до 10 мг/сут. При **выраженной печеночной недостаточности** необходимо соблюдать осторожность при титровании.

Для пациентов с низкой активностью изофермента CYP2C19 рекомендуемая начальная доза в течение первых двух недель лечения составляет 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до 10 мг/сут.

При прекращении лечения доза должна постепенно снижаться в течение 1-2 недель во избежание возникновения синдрома отмены.

Побочное действие:

Побочные эффекты наиболее часто возникают на первой или второй неделе лечения препаратом и затем обычно становятся менее интенсивными и возникают реже при продолжении терапии.

Классификация ВОЗ нежелательных побочных реакций по частоте развития: очень частые - 1/10 назначений (>10%), частые - 1/100 назначений (>1% и <10%), нечастые - 1/1000 назначений (>0.1% и <1%), редкие - 1/10 000 назначений (>0.01% и <0.1%), очень редкие - 1/10 000 назначений (<0.01%).

Со стороны ЦНС: часто - головная боль, головокружение, слабость, бессонница или сонливость, судороги, тремор, двигательные нарушения, серотониновый синдром (ажитация, тремор, миоклонус, гипертермия); реже - галлюцинации, мания, спутанность сознания, ажитация, тревога, деперсонализация, панические атаки, повышенная раздражительность, расстройства зрения.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - тошнота, рвота; часто - диарея, сухость во рту, нарушения вкусовых ощущений, снижение аппетита или наоборот его повышение, запор.

Со стороны кожных покровов: часто - повышенная потливость, редко - кожная сыпь, зуд, экхимоз, пурпура, ангионевротический отек.

Со стороны репродуктивной системы: часто - нарушение эякуляции, импотенция, возможны нарушения менструального цикла.

Со стороны мочевыделительной системы: часто - задержка мочи.

Со стороны организма в целом: часто - слабость, редко - гипертермия.

Метаболические нарушения: редко - недостаточная секреция АДГ.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - ортостатическая гипотензия.

Лабораторные показатели: часто - изменение лабораторных показателей функции печени, гипонатриемия и изменения ЭКГ (удлинение интервала QT, расширение комплекса QRS, изменение сегмента ST и зубца T).

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - артралгия, миалгия.

Аллергические реакции: в отдельных случаях возможны анафилактические реакции.

Пациент должен быть информирован о том, что при усугублении любых из указанных в инструкции побочных эффектов или появлении любых других побочных эффектов, не указанных в инструкции, следует сообщать об этом врачу.

Передозировка:

Симптомы: головокружение, тремор, ажитация, сонливость, помрачение сознания, судороги, тахикардия, изменения

ЭКГ (изменение сегмента ST, зубца T, расширение комплекса QRS, удлинение интервала QT), аритмии, угнетение дыхания, рвота, рабдомиолиз, метаболический ацидоз, гипокалиемия.

Кома и летальные случаи передозировки эсциталопрамом являются крайне редкими, большинство из них включают одновременную передозировку с другими лекарственными средствами. Прием дозы в пределах 400-800 мг эсциталопрама не вызывал тяжелых симптомов.

Лечение: специфического антидота не существует. Проводят симптоматическое и поддерживающее лечение: промывание желудка, адекватная оксигенация. Проводят мониторинг функции сердечно-сосудистой и дыхательной систем. Исход благоприятный.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата при беременности не рекомендуется в связи недостаточностью данных по эффективности и безопасности.

Во время применения препарата грудное вскармливание следует отменить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Фармацевтическое взаимодействие

Серотонинергические препараты: одновременное применение с серотонинергическими препаратами (например, трамадолом, суматриптаном и другими триптанами) может привести к развитию серотонинового синдрома.

Лекарственные средства, снижающие порог судорожной готовности: эсциталопрам может снижать порог судорожной готовности. Требуется проявлять осторожность при одновременном применении других лекарственных средств, снижающих порог судорожной готовности (трициклических антидепрессантов, СИОЗС, нейролептиков - производных фенотиазина, тиоксантена и бутирофенона, - мефлохина и трамадола).

Литий и триптофан: при одновременном применении эсциталопрама и лития или триптофана зарегистрированы случаи усиления действия препарата.

Зверобой продырявленный (Hypericum perforatum): одновременное применение эсциталопрама и препаратов зверобоя может привести к увеличению числа побочных эффектов.

Антикоагулянты и другие средства, влияющие на свертывание крови: при одновременном применении эсциталопрама с непрямыми антикоагулянтами и другими средствами, влияющими на свертывание крови (например, атипичными нейролептиками и производными фенотиазина, большинством трициклических антидепрессантов, ацетилсалициловой кислотой и НПВС, тиклопидином и дипиридамолом), может возникнуть нарушение свертывания крови. В подобных случаях при начале или окончании терапии эсциталопрамом необходим регулярный мониторинг свертываемости крови.

Фармакокинетическое взаимодействие

Влияние других лекарственных препаратов на фармакокинетику эсциталопрама: одновременное применение эсциталопрама и омепразола (ингибитор изофермента CYP2C19) в дозе 30 мг 1 раз/сут приводит к умеренному (примерно 50%) повышению концентрации эсциталопрама в плазме крови.

Одновременное применение эсциталопрама и циметидина (ингибитора изоферментов CYP2D6, CYP3A4 и CYP1A2) в дозе 400 мг 2 раза/сут приводит к повышению (примерно 70%) концентрации эсциталопрама в плазме крови. Таким образом, следует назначать с осторожностью эсциталопрам одновременно с *ингибиторами изофермента CYP2C19* (например, омепразолом, эзомепразолом, флувоксамином, лансопразолом, тиклопидином) и циметидином. При одновременном применении эсциталопрама и вышеуказанных препаратов может потребоваться уменьшение дозы эсциталопрама на основе мониторинга побочных эффектов.

Влияние эсциталопрама на фармакокинетику других лекарственных препаратов: эсциталопрам является ингибитором изофермента CYP2D6. Необходимо проявлять осторожность при одновременном применении эсциталопрама и лекарственных средств, метаболизирующихся с помощью этого изофермента и имеющих малый терапевтический индекс, например, флекаинида, пропафенона и метопролола (в случаях применения при сердечной недостаточности) или лекарственных средств, в основном метаболизирующихся посредством изофермента CYP2D6 и действующих на ЦНС, например, антидепрессантов: дезипрамина, кломипрамина, нортриптилина, или нейролептиков: рисперидона, тиоридазина, галоперидола. В этих случаях может потребоваться коррекция дозы.

Одновременное применение *эсциталопрама и дезипрамина или метопролола* приводит к двукратному увеличению концентрации двух последних препаратов.

Эсциталопрам может незначительно ингибировать изофермент CYP2C19. Поэтому рекомендуется проявлять осторожность при одновременном применении *эсциталопрама и лекарственных средств, метаболизирующихся*

CYP2C19.

Особые указания и меры предосторожности:

Эсциталопрам нельзя назначать одновременно с ингибиторами МАО из-за риска развития серотонинового синдрома. Эсциталопрам может быть назначен через 14 дней после прекращения лечения необратимыми ингибиторами МАО и как минимум через 1 день после прекращения терапии обратимым ингибитором МАО типа А (моклобемид). Как минимум 7 дней должно пройти после окончания приема эсциталопрама, прежде чем можно начинать лечение неселективными ингибиторами МАО.

У детей, подростков и молодых людей (младше 24 лет) с депрессией и другими психическими нарушениями антидепрессанты, по сравнению с плацебо, повышают риск возникновения суицидальных мыслей и суицидального поведения. Поэтому при назначении препарата Ленуксин или любых других антидепрессантов детям, подросткам и молодым людям (младше 24 лет) следует соотнести риск суицида и пользы от их применения. В случае принятия решения о начале терапии антидепрессантами пациент должен находиться под тщательным наблюдением с целью раннего выявления нарушений или изменений поведения, а также суицидальных наклонностей.

При применении препаратов, принадлежащих к терапевтической группе СИОЗС, включая эсциталопрам, следует учитывать следующее: у некоторых пациентов с паническим расстройством в начале лечения СИОЗС может наблюдаться усиление тревоги. Подобная парадоксальная реакция обычно исчезает в течение первых двух недель лечения. Чтобы снизить вероятность возникновения анксиогенного эффекта рекомендуется использовать низкие начальные дозы.

Следует отменить препарат в случае развития судорожных припадков. Не рекомендуется применение у больных с нестабильной эпилепсией; при контролируемых припадках необходимо тщательное наблюдение. При увеличении частоты судорожных припадков СИОЗС, включая эсциталопрам, должны быть отменены.

Применение СИОЗС и СИОЗСН (селективных ингибиторов обратного захвата норадреналина) связано с развитием акатизии — состояния, которое характеризуется неприятным изнурительным ощущением беспокойства и гиперактивностью и часто сопровождается неспособностью сидеть или стоять на одном месте. Такое состояние наиболее вероятно возникает на протяжении первых нескольких недель терапии. Повышение дозы может навредить пациентам, у которых возникли такие симптомы.

Эсциталопрам должен с осторожностью применяться у больных с манией/гипоманией в анамнезе. При развитии маниакального состояния эсциталопрам должен быть отменен.

У пациентов с сахарным диабетом лечение эсциталопрамом может изменить уровень глюкозы в крови. Поэтому может потребоваться коррекция доз инсулина и/или пероральных гипогликемических препаратов.

Риск совершения самоубийства свойственен депрессии и может сохраняться до существенного улучшения состояния, наступившего спонтанно или вследствие проводимой терапии. Необходимо тщательное наблюдение за пациентами, находящимися на лечении антидепрессантами, особенно в начале лечения из-за возможности клинического ухудшения и/или появления суицидальных проявлений (мыслей и поведения). Эта предосторожность должна соблюдаться и при лечении других психических расстройств из-за возможности одновременного заболевания депрессивным эпизодом.

Гипонатриемия, возможно связанная с нарушением секреции АДГ, на фоне приема эсциталопрама возникает редко и обычно исчезает при отмене терапии. Осторожность должна проявляться при назначении эсциталопрама и других СИОЗС лицам, входящим в группу риска развития гипонатриемии: пожилым, больным с циррозом печени и принимающим препараты, способные вызывать гипонатриемию.

При приеме эсциталопрама возможно развитие кожных кровоизлияний (экхимоз и пурпура). Необходимо с осторожностью применять эсциталопрам у больных со склонностью к кровотечениям, а также принимающих пероральные антикоагулянты и лекарства, влияющие на свертываемость крови.

Поскольку клинический опыт одновременного применения эсциталопрама и ЭСТ (электросудорожная терапия) ограничен, то в подобных случаях должна соблюдаться осторожность.

У больных, принимающих эсциталопрам и другие СИОЗС одновременно с серотонинергическими препаратами, в редких случаях может развиваться серотониновый синдром. Необходимо с осторожностью применять эсциталопрам одновременно с лекарственными средствами, обладающими серотонинергическим действием.

В связи с ограниченным клиническим опытом рекомендуется соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов с ИБС.

После длительного применения резкое прекращение терапии эсциталопрамом у некоторых больных может привести к возникновению реакции отмены. Могут возникнуть такие нежелательные реакции, как головокружение, головные боли и тошнота. Выраженность этих реакций обычно незначительна, а продолжительность - ограничена. Чтобы избежать возникновения реакций отмены рекомендуется постепенная отмена препарата в течение 1-2 недель.

Взаимодействие с этанолом

Эсциталопрам не вступает с этанолом в фармакодинамическое или фармакокинетическое взаимодействие. Однако, как и в случае с другими антидепрессантами, следует воздержаться от употребления алкоголя в течение всего периода лечения препаратом.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При **средней степени тяжести почечной недостаточности** коррекции дозы не требуется. **Пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени (клиренс креатинина ниже 30 мл/мин)** препарат назначают с осторожностью.

При нарушениях функции печени

При **легкой и умеренной печеночной недостаточности** рекомендуемая начальная доза в течение первых двух недель лечения составляет 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до 10 мг/сут. При **выраженной печеночной недостаточности** необходимо соблюдать осторожность при титровании.

Для пациентов с низкой активностью изофермента CYP2C19 рекомендуемая начальная доза в течение первых двух недель лечения составляет 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до 10 мг/сут.

Применение в пожилом возрасте

Пожилым пациентам (старше 65 лет) рекомендуется назначать половину обычной рекомендуемой дозы - 5 мг/сут. Максимальная доза - 10 мг/сут.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 30°C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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