Пароксетин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Пароксетин

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 цвета, круглые, двояковыпуклые, покрытые оболочкой, с риской, с шероховатой поверхностью.

	1 таб.
пароксетина гидрохлорида гемигидрат	22.76 мг,
что соответствует содержанию пароксетина	20 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат, целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, коповидон, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, тальк.

Состав оболочки: гипромеллоза, макрогол 6000, тальк, титана диоксид.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской, с шероховатой поверхностью.

	1 таб.
пароксетина гидрохлорида гемигидрат	34.14 мг,
что соответствует содержанию пароксетина	30 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат, целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, коповидон, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, тальк.

Состав оболочки: гипромеллоза, макрогол 6000, тальк, титана диоксид.

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антидепрессант. Является селективным ингибитором обратного захвата серотонина (5-гидрокситриптамина, 5-НТ) нейронами головного мозга, что определяет его антидепрессивное действие и эффективность при лечении обсессивно-компульсивного (ОКР) и панического расстройства.

Пароксетин обладает низким аффинитетом к м-холинорецепторам (обладает слабым антихолинергическим действием), α_1-, α_2- и β-адренорецепторам, а также к допаминовым (D_2), $5HT_1$-подобным, $5HT_2$-подобным и

гистаминовым H_1-рецепторам. Пароксетин не нарушает психомоторные функции и не потенцирует угнетающие действие на них этанола.

По данным исследования поведения и ЭЭГ у пароксетина выявляются слабые активирующие свойства, когда он назначается в дозах выше тех, которые необходимы для ингибирования захвата серотонина. Не вызывает значительного изменения уровня АД, ЧСС и ЭЭГ.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь пароксетин хорошо абсорбируется из ЖКТ и подвергается метаболизму первого прохождения через печень.

Распределение

C_{ss} достигается через 7-14 сут после начала терапии. При увеличении дозы и/или продолжительности лечения наблюдается нелинейная зависимость фармакокинетических параметров от дозы.

Пароксетин экстенсивно распределяется в тканях, только 1% его присутствует в плазме.

Связывается с белками на 95%.

Метаболизм

Метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов. Является ингибитором изофермента CYP2D6.

Основные метаболиты пароксетина представляют собой полярные и конъюгированные продукты окисления и метилирования, которые быстро выводятся из организма, обладают слабой фармакологической активностью и не влияют на его терапевтическое действие. При метаболизме пароксетина не нарушается обусловленный его действием селективный захват серотонина нейронами.

Выведение

Около 64% пароксетина выводится с мочой (2% - в неизмененном виде, 64% - в виде метаболитов); примерно 36% выделяется с желчью через кишечник, в основном в виде метаболитов, менее 1% - в неизмененном виде.

Выведение метаболитов пароксетина двухфазное, сначала в результате метаболизма первого прохождения через печень, а затем оно контролируется системной элиминацией. $T_{1/2}$ пароксетина варьирует, но в среднем составляет 24 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Концентрация пароксетина в плазме крови возрастает при нарушении функции печени и почек , а также у лиц пожилого возраста.

Показания к применению:

— депрессия всех типов, включая реактивную, тяжелую эндогенную депрессию и депрессию, сопровождающуюся тревогой;

— обсессивно-компульсивное расстройство (ОКР);

— паническое расстройство, в т.ч. с агорафобией;

— социальное тревожное расстройство/социальная фобия;

— генерализованное тревожное расстройство.

Относится к болезням:

- Депрессия
- Паническое расстройство
- Тревожное расстройство
- Фобия

Противопоказания:

— одновременный прием ингибиторов МАО и период 14 дней после их отмены;

— нестабильная эпилепсия;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— детский возраст;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при печеночной недостаточности, почечной недостаточности, закрытоугольной глаукоме, гиперплазии предстательной железы, мании, патологии сердца, эпилепсии, судорожных состояниях, одновременном назначении электроимпульсной терапии, одновременном приеме препаратов, повышающих риск кровотечения, наличии факторов риска повышенной кровоточивости и заболеваниях, повышающих риск кровоточивости.

Способ применения и дозы:

Таблетки следует принимать внутрь, 1 раз/сут, утром, во время еды, проглатывая целиком, запивая водой.

Доза подбирается индивидуально в течение первых 2-3 недель после начала терапии и впоследствии при необходимости корректируется.

При *депрессии* рекомендуемая доза составляет 20 мг 1 раз/сут. В случае необходимости дозу постепенно увеличивают на 10 мг/сут, максимальная суточная доза не должна превышать 50 мг.

При*обсессивно-компульсивных расстройствах* начальная терапевтическая доза составляет 20 мг/сут с последующим еженедельным увеличением на 10 мг. Рекомендуемая средняя терапевтическая доза - 40 мг/сут, при необходимости доза может быть увеличена до 60 мг/сут.

При *панических расстройствах* начальная доза - 10 мг/сут (для снижения возможного риска развития обострения панической симптоматики) с последующим еженедельным увеличением на 10 мг. Средняя терапевтическая доза - 40 мг/сут. Максимальная доза - 50 мг/сут.

При *социально-тревожных расстройствах/социофобиях* начальная доза составляет 20 мг/сут, при отсутствии эффекта в течение как минимум 2 недель возможно увеличение дозы максимально до 50 мг/сут. Дозу следует увеличивать на 10 мг с интервалами не менее недели в соответствии с клиническим эффектом.

При *генерализованных тревожных расстройствах* начальная и терапевтическая дозы составляют 20 мг/сут.

При **почечной и/или печеночной недостаточности** рекомендуемая доза составляет 20 мг/сут.

Для **пожилых пациентов** суточная доза не должна превышать 40 мг.

В целях предупреждения развития синдрома отмены прекращение приема препарата следует проводить постепенно.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: сонливость, тремор, астения, бессонница, головокружение, утомляемость, судороги, экстрапирамидные расстройства, серотониновый синдром, галлюцинации, мания, спутанность сознания, ажитация, тревожность, деперсонализация, приступы паники, нервозность, амнезия, миоклония.

Со стороны органов чувств: нарушение зрения.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия, мышечная слабость, миопатия.

Со стороны мочевыделительной системы: задержка мочи, учащенное мочеиспускание.

Со стороны половой системы: нарушения половой функции, включая импотенцию и расстройства эякуляции, гиперпролактинемия/галакторея, аноргазмия.

Со стороны пищеварительной системы: снижение или повышение аппетита, изменение вкуса, тошнота, рвота, сухость во рту, запоры или диарея; в отдельных случаях - гепатит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия.

Аллергические реакции: сыпь, крапивница, экхимоз, зуд, ангионевротический отек.

Прочие: повышенное потоотделение, ринит, гипонатриемия, нарушение секреции антидиуретического гормона.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, тремор, мидриаз, сухость во рту, раздражительность, нистагм, ажитация, потливость, сонливость, синусовая тахикардия, судороги, брадикардия, повышение АД, узловой ритм. В очень редких случаях, при одновременном приеме с другими психотропными средствами и/или алкоголем возможны изменения на ЭКГ, кома. При выраженной передозировке - серотониновый синдром, редко - рабдомиолиз.

Лечение: промывание желудка, прием активированного уголя. При необходимости проводят симптоматическую терапию. Специфического антидота нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременный прием антацидных средств не влияет на всасывание и фармакокинетические параметры Пароксетина.

Противопоказано одновременное применение Пароксетина с ингибиторами МАО.

При одновременном назначении с Пароксетином увеличивается концентрация проциклидина.

В связи ингибированием пароксетином цитохрома P_{450} возможно усиление эффекта барбитуратов, фенитоина, непрямых антикоагулянтов, трициклических антидепрессантов, фенотиазиновых нейролептиков и антиаритмиков класса 1С, метопролола и повышение риска развития побочных эффектов при одновременном назначении этих лекарственных средств.

При одновременном назначении с препаратами, ингибирующими ферменты печени, может потребоваться снижение дозы Пароксетина.

Пароксетин увеличивает время кровотечения на фоне одновоременного приема варфарина (при неизмененном протромбиновом времени).

При одновременном назначении Пароксетина с атипичными нейролептиками, трициклическими антидепрессантами, препаратами фенотиазинового ряда, НПВС (в т.ч. ацетилсалициловой кислотой) возможно нарушение прооцесса свертывания крови.

Одновременное назначение Пароксетина с серотонинергическими препаратами (трамадол, суматриптан) может привести к усилению серотонинергического эффекта.

Отмечено взаимное усиление действия триптофана, препаратов лития и пароксетина.

При одновременном назначении Пароксетина с фенитоином и другими противосудорожными препаратами возможно увеличение частоты побочных эффектов.

Пароксетин намного слабее подавляет антигипертензивные эффекты гуанетидина по сравнению с антидепрессантами, ингибирующими захват норадреналина.

Особые указания и меры предосторожности:

Во избежание развития злокачественного нейролептического синдрома с осторожностью следует назначать Пароксетин пациентам, принимающим нейролептики.

Лечение Пароксетином назначают спустя 2 недели после отмены ингибиторов МАО.

У пациентов пожилого возраста на фоне приема Пароксетина возможна гипонатриемия.

В некоторых случаях требуется коррекции дозы одновременно применяемых инсулина и/или пероральных гипогликемических препаратов.

При развитии судорог лечение Пароксетином прекращают.

При первых признаках мании следует отменить терапию Пароксетином.

В течение первых нескольких недель терапии Пароксетином следует тщательно наблюдать за состоянием пациента в связи с возможными суицидальными попытками.

Во время терапии Пароксетином следует воздерживаться от приема алкоголя в связи с усилением его токсического эффекта.

Использование в педиатрии

Применение Пароксетина у детей не рекомендуется, поскольку его безопасность и эффективность у этой группы пациентов не установлены.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Несмотря на то, что пароксетин не ухудшает когнитивные и психомоторные функции, пациенты должны воздерживаться или соблюдать предельную осторожность при управлении автомобилем и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует назначать препарат при почечной недостаточности. При *почечной недостаточности* рекомендуемая доза составляет 20 мг/сут.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует назначать препарат при печеночной недостаточности. При *печеночной недостаточности* рекомендуемая доза составляет 20 мг/сут.

Применение в пожилом возрасте

Для **пожилых пациентов** суточная доза не должна превышать 40 мг.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан в детском возрасте.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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