Плизил



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 от желтого до оранжевого цвета, круглые, с гравировкой "РОТ 20" на одной стороне и риской на обеих сторонах.

	1 таб.
пароксетина мезилат	25.83 мг,
что соответствует содержанию пароксетина	20 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат безводный, карбоксиметилкрахмал натрия, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: лактозы моногидрат, гипромеллоза, титана диоксид (Е171), макрогол 4000, железа оксид желтый (Е172), железа оксид красный (Е172).

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

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

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 терапевтическое действие. При метаболизме пароксетина не нарушается обусловленный его действием селективный захват 5-НТ нейронами.

Пароксетин обладает низким аффинитетом к м-холинорецепторам.

Обладая селективным действием, в отличие от трициклических антидепрессантов, пароксетин характеризуется низким аффинитетом к α_1, α_2, β-адренорецепторам, а также к допаминовым, 5-HT_1-подобным, 5-HT_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 5-НТ. У здоровых добровольцев он не вызывает значительного изменения уровня АД, ЧСС и ЭЭГ.

В отличие от антидепрессантов, которые ингибируют захват норадреналина, пароксетин намного слабее подавляет антигипертензивные эффекты гуанетидина.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь пароксетин хорошо всасывается из ЖКТ. Подвергается метаболизму при "первом прохождении" через печень.

Распределение

C_{ss} достигается к 7-14 дню после начала лечения, фармакокинетика во время длительного лечения не изменяется.

Клинические эффекты пароксетина (побочное действие и эффективность) не коррелируют с его концентрацией в плазме.

Пароксетин экстенсивно распределяется в тканях, и фармакокинетические расчеты показывают, что только 1% его присутствует в плазме.

В терапевтических концентрациях связывание пароксетина с белками плазмы составляет 95%.

Метаболизм

Поскольку метаболизм пароксетина включает "первое прохождение" через печень, его количество, определяемое в системном кровотоке меньше того, которое абсорбируется из ЖКТ. При увеличении дозы пароксетина или при многократном приеме, когда возрастает нагрузка на организм, происходит частичное поглощение эффекта "первого прохождения" через печень и снижение плазменного клиренса пароксетина. В результате этого возможно повышение концентрации пароксетина в плазме и колебания фармакокинетических параметров, что может наблюдаться только у тех пациентов, у которых при приеме препарата в низких дозах достигаются низкие концентрации пароксетина в плазме.

Выведение

$T_{1/2}$ варьирует, но обычно составляет около 16-21 ч. Выведение из организма метаболитов пароксетина бифазное, сначала в результате метаболизма при первом прохождении через печень, а затем оно контролируется системной элиминацией.

Пароксетин выводится преимущественно в виде метаболитов: 64% метаболитов выводится с мочой и 36% - через кишечник, вероятно, с желчью. В неизмененном виде выводится менее 2% с мочой и менее 1% с желчью.

Показания к применению:

— депрессия всех типов (в т.ч. реактивная, тяжелая эндогенная депрессия и депрессия, сопровождающаяся тревогой);

— обсессивно-компульсивное расстройство;

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

— социальное тревожное расстройство/социальная фобия;

— генерализованное тревожное расстройство;

— посттравматическое стрессовое расстройство.

Относится к болезням:

- Депрессия
- Паническое расстройство
- Стрессовые расстройства
- Тревожное расстройство
- Фобия

Противопоказания:

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

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— дети и подростки в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлена);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при печеночной и почечной недостаточности, закрытоугольной глаукоме, гиперплазии предстательной железы, мании, патологии сердца, эпилепсии (при нестабильной эпилепсии следует избегать приема препарата), судорожных состояниях, при проведении электроимпульсной терапии, при приеме препаратов, повышающих риск кровотечения, при наличии факторов риска повышенной кровоточивости и заболеваниях, повышающих риск кровоточивости; пациентам пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь 1 раз/сут, утром, во время еды. Таблетку проглатывают целиком, запивая водой. Дозу подбирают индивидуально в течение первых 2-3 недель после начала терапии и впоследствии при необходимости корректируют.

При *депрессиях* препарат назначают в дозе 20 мг 1 раз/сут. В случае необходимости дозу постепенно увеличивают на 10 мг/сут, максимальная суточная доза - 50 мг, в зависимости от реакции пациента.

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* препарат назначают в начальной дозе 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.

Социально-тревожные расстройства/социофобия: 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 1 недели в соответствии с клиническим эффектом.

При *посттравматических нарушениях психики* для большинства пациентов начальная и терапевтическая дозы составляют 20 мг/сут. В некоторых случаях рекомендуется увеличение дозы пароксетина максимально до 50 мг/сут. Дозу следует увеличивать на 10 мг каждую неделю в соответствии с клиническим эффектом.

При *генерализованных тревожных расстройствах* начальная и рекомендуемая дозы - 20 мг/сут.

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

Для **пациентов пожилого возраста** суточная доза не должна превышать 40 мг.

Доза препарата должна оцениваться и при необходимости корректироваться в течение 2-3 недель в начале терапии, а затем по мере необходимости. Пациенты должны продолжать лечение в течение периода, достаточного для исчезновения симптомов, по крайней мере, 4-6 месяцев после выздоровления при депрессии и более - при наличии обсессивно-компульсивных и панических расстройств.

Как и для многих других психотропных препаратов, не рекомендуется резкая отмена препарата.

Применение пароксетина у **детей** не рекомендуется, поскольку его безопасность эффективность в этой популяции не установлены.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: сонливость, тремор, астения, бессонница, головокружение, утомляемость, судороги, экстрапирамидные расстройства, галлюцинации, мания, спутанность сознания, ажитация, тревожность, деперсонализация, приступы паники, нервозность, парестезии, снижение способности к концентрации внимания, серотониновый синдром.

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

Со стороны органов чувств: нарушения зрения, изменение вкуса.

Со стороны мочеполовой системы: задержка мочи, учащение мочеиспускания, нарушения половой функции, включая

импотенцию и расстройства эякуляции, снижение либидо, аноргазмия.

Со стороны пищеварительной системы: снижение аппетита, тошнота, рвота, сухость во рту, запоры или диарея; очень редко - гепатит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия.

Дерматологические реакции: экхимозы, повышенное потоотделение.

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

Прочие: нарушение секреции АДГ, гиперпролактинемия/галакторея, гипонатриемия, синдром отмены при резкой отмене препарата.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, тремор, сухость во рту, расширенные зрачки, лихорадка, изменения АД, головная боль, непроизвольные мышечные сокращения, ажитация, тревожность, синусовая тахикардия, потливость, сонливость, нистагм, брадикардия, узловой ритм.

В очень редких случаях, при одновременном приеме с другими психотропными средствами и/или алкоголем возможны изменения на ЭКГ, кома.

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля. При необходимости – проведение симптоматической терапии. Специфического антидота нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Прием пищи и антацидных средств не влияет на всасывание и фармакокинетические параметры препарата.

Пароксетин несовместим с ингибиторами МАО, тиоридазином.

При одновременном назначении с пароксетином увеличивается концентрация проциклидина.

В период лечения пациент должен воздерживаться от употребления алкоголя, в связи с возможым усилением токсического действия этанола.

При одновременном применении с индукторами/ингибиторами ферментов печени возможны изменения метаболизма и фармакокинетики пароксетина.

В связи ингибированием пароксетином изоферментов системы цитохрома Р450 возможно усиление эффекта барбитуратов, фенитоина, непрямых антикоагулянтов, трициклических антидепрессантов (нортриптилин, амитриптилин, имипрамин, дезипрамин и флуоксетин), фенотиазиновых нейролептиков (тиоридазин) и антиаритмиков класса 1 С (в т.ч. пропафенона), 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 приема варфарина, при этом протромбиновое время не меняется.

При одновременном назначении пароксетина с атипичными антипсихотическими средствами, фенотиазинами, трициклическими антидепрессантами, ацетилсалициловой кислотой, НПВС рекомендуется соблюдать осторожность в связи с возможными нарушениями свертываемости крови.

При одновременном назначении с серотонинергическими препаратами (трамадол, суматриптан) возможно усиление серотонинергического эффекта.

При одновременном применении отмечено взаимное усиление действия триптофана, препаратов лития и пароксетина (как и при назначении других селективных ингибиторов обратного захвата серотонина). Совместный прием с препаратами лития следует проводить под контролем их концентрации лития в плазме крови. Не рекомендуется совместное назначение с препаратами, содержащими триптофан.

При применении пароксетина (как и других селективных ингибиторов обратного захвата серотонина) с нейролептиками возможно развитие ЗНС.

При одновременном назначении пароксетина с фенитоином и другими противосудорожными средствами возможно снижение концентрации пароксетина в плазме и увеличение частоты побочных эффектов.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует назначать препарат пациентам, получающим антипсихотические препараты (нейролептики), во избежание развития ЗНС.

Препарат Плизил следует назначать не ранее, чем через 2 недели после отмены ингибиторов МАО.

В течение первых нескольких недель приема препарата следует тщательно контролировать состояние пациента в связи с возможными суицидальными попытками, т.к. в это время еще не достигается адекватное терапевтическое действие пароксетина.

Лечение Плизилом следует прекратить при развитии судорог, а также при первых симптомах мании.

В период лечения у пациентов с сахарным диабетом в некоторых случаях требуется коррекция дозы инсулина и/или пероральных гипогликемических препаратов.

У пациентов пожилого возраста возможна гипонатриемия.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Плизил не ухудшает когнитивные и психомоторные функции, тем не менее, как и при лечении другими психотропными препаратами, пациенты должны воздерживаться от управления автотранспортом и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

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

При нарушениях функции печени

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

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям и подросткам в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлена).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С. Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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