Сиростилл

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капли для приема внутрь прозрачные, бесцветные или слабо розового цвета с характерным вкусом аниса.

	1 мл
пароксетина гидрохлорид	11.11 мг,
что соответствует содержанию пароксетина	10 мг

Вспомогательные вещества: бетадекс (бетациклодекстрин), сахароза, ароматизатор анисовый (этанол, вода, природный анетол), натрия бензоат, вода очищенная.

30 мл - флаконы темного стекла (1) в комплекте с дозирующей крышкой-пипеткой - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антидепрессант.

Пароксетин является мощным селективным ингибитором захвата 5-гидроскитриптамина (5-НТ, серотонина) нейронами головного мозга, что определяет его антидепрессивное действие и эффективность при лечении обсессивно-компульсивного (ОКР) 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 его терапевтическое действие. При метаболизме пароксетина не нарушается обусловленный его действием селективный захват 5-НТ нейронами.

Пароксетин обладает низким аффинитетом к мускариновым холинергическим рецепторам. Обладая селективным действием, пароксетин показал низкий аффинитет к α_1-адренорецепторам, α_2-адренорецепторам, β-адренорецепторам, а также к допаминовым, 5-$НТ_1$-подобным, 5-$НТ_2$-подобным и гистаминовым $Н_1$-рецепторам.

Пароксетин не нарушает психомоторные функции и не потенцирует угнетающее действие на них этанола.

По данным исследования поведения и ЭЭГ у пароксетина выявляются слабые активирующие свойства, когда он назначается в дозах, превышающих необходимые для ингибирования захвата 5-НТ.

У здоровых добровольцев пароксетин не вызывает значительного изменения уровня АД, ЧСС и ЭЭГ.

В отличие от антидепрессантов, ингибирующих захват норадреналина, пароксетин намного слабее подавляет антигипертензивные свойства гуанетидина.

Фармакокинетика

Всасывание

Пароксетин хорошо всасывается из ЖКТ после приема внутрь. Устойчивые системные концентрации достигаются к 7-14 дню после начала лечения, и фармакокинетика во время длительного лечения не изменяется.

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

При увеличении дозы пароксетина или многократном приеме возрастает нагрузка на организм, происходит частичное поглощение эффекта "первого прохождения" через печень и снижение плазменного клиренса пароксетина. В результате чего возможно повышение концентрации пароксетина в плазме и колебание фармакокинетических параметров, наблюдающиеся только у тех пациентов, у которых при приеме в низких дозах был достигнут низкий уровень препарата в плазме.

Распределение

Пароксетин экстенсивно распределяется в тканях. Фармакокинетические расчеты показывают, что только 1% пароксетина присутствует в плазме, причем в терапевтических концентрациях 95% связано с белками плазмы крови.

Метаболизм

Подвергается метаболизму "первого прохождения" через печень: уменьшается количество пароксетина, определяемое в системной циркуляции по сравнению с количеством, абсорбировавшимся из ЖКТ.

Выведение

Выведение из организма метаболитов пароксетина 2-фазное: сначала в результате метаболизма "первого прохождения" через печень, затем контролирующееся системной элиминацией.

Выведение неизмененного пароксетина с мочой составляет <2% от дозы, причем метаболиты составляют 64%. Кишечник экскретирует около 36% от дозы, вероятно, с желчью, в которой неизмененный пароксетин составляет <1%. Таким образом, пароксетин выводится преимущественно в результате метаболизма.

$T_{1/2}$ варьирует, но обычно составляет около 1 сут.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У **пациентов пожилого возраста, а также при почечной и печеночной недостаточности тяжелой степени** концентрация пароксетина в плазме повышена, а диапазон плазменных концентраций практически совпадает с диапазоном у здоровых взрослых добровольцев.

Показания к применению:

— депрессия всех типов (в т.ч. 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.

Относится к болезням:

- Депрессия
- Паническое расстройство
- Тревожное расстройство
- Фобия

Противопоказания:

— нестабильная эпилепсия;

— одновременное применение и 14 дней после отмены ингибиторов МАО;

— беременность;

— период грудного вскармливания;

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата (в т.ч. к сахарозе).

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

Способ применения и дозы:

Капли следует разбавить водой и принимать внутрь 1 раз/сут, утром, во время приема пищи. Доза подбирается индивидуально в течение первых 2-3 недель после начала терапии и впоследствии при необходимости корректируется.

При *депрессиях* рекомендуется принимать по 20 мг 1 раз/сут. В случае необходимости дозу постепенно увеличивают на 10 мг/сут. Максимальная суточная доза не должна превышать 50 мг/сут.

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 составляет 10 мг/сут (для снижения возможного риска развития обострения панической симптоматики) с последующим еженедельным увеличением на 10 мг/сут. Средняя терапевтическая доза - 40 мг/сут. Максимальная доза - 60 мг/сут.

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

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

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

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

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

Флакон снабжен дозирующей крышкой-пипеткой, тарированной для извлечения 0.5 мл, 1 мл, 1.5 мл, 2 мл раствора, соответствующего 10, 20, 30, 40 каплям.

1 мл раствора соответствует 20 каплям, что эквивалентно 10 мг пароксетина; 1 капля соответствует 0.5 мг пароксетина.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: сонливость или бессонница, тремор, астения, головокружение, экстрапирамидные расстройства, серотониновый синдром, маниакальные расстройства, спутанность сознания, ажитация, тревога, деперсонализация, парестезии, повышенная нервная возбудимость; редко - галлюцинации, судороги.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия, миастения, миоклония, миопатический синдром.

Со стороны органов чувств: изменение вкуса, нарушение зрения.

Со стороны мочевыделительной системы: задержка мочи, учащение мочеиспускания.

Со стороны половой системы: импотенция, расстройства эякуляции, снижение либидо, аноргазмия.

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

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия.

Со стороны эндокринной системы: гиперпролактинемия, галакторея, повышенное потоотделение, нарушение секреции антидиуретического гормона.

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

Прочие: ринит, гипонатриемия, синдром отмены (головокружение, сенсорные нарушения /парестезии, ощущения, напоминающие воздействие электрического тока/, расстройство сна, психомоторное возбуждение, тревога, тошнота и потливость).

Передозировка:

Симптомы: тошнота, расширенные зрачки, лихорадка, изменение АД, головная боль, непроизвольные мышечные сокращения, ажитация, тревожность, тахикардия. В очень редких случаях при одновременном применении с другими психотропными средствами и/или алкоголем возможны изменения на ЭКГ, кома.

Лечение: промывание желудка, активированный уголь. При необходимости - симптоматическая терапия. Специфического антидота нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение Сиростилла при беременности и в период грудного вскармливания противопоказано.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

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

Пароксетин несовместим с ингибиторами МАО.

При одновременном применении с пароксетином увеличивается концентрация проциклидина.

Во время терапии пароксетином следует воздерживаться от приема этанола в связи с усилением токсического эффекта алкоголя.

В связи с ингибированием пароксетином изоферментов системы цитохрома P450 при одновременном применении возможно усиление эффектов барбитуратов, фенитоина, непрямых антикоагулянтов, трициклических антидепрессантов, фенотиазиновых нейролептиков и антиаритмических препаратов класса 1С, метопролола и повышение риска развития побочных эффектов.

При одновременном применении с препаратами, ингибирующими ферменты печени, может потребоваться снижение дозы пароксетина.

Пароксетин увеличивает время кровотечения на фоне применения варфарина, при неизменном протромбиновом времени.

При одновременном применении пароксетина с атипичными антипсихотическими средствами, фенотиазинами, трициклическими антидепрессантами, ацетилсалициловой кислотой, НПВС рекомендуется соблюдать осторожность в связи с возможным нарушением свертываемости крови.

Одновременное применение пароксетина с серотонинергическими препаратами (в т.ч. трамадол, суматриптан) может привести к усилению серотонинергического эффекта.

Отмечено взаимное усиление действия триптофана, препаратов лития и пароксетина.

При одновременном применении пароксетина с фенитоином и другими антиконвульсантами возможно снижение концентрации пароксетина в плазме и увеличение частоты побочных эффектов.

Особые указания и меры предосторожности:

Во избежание развития злокачественного нейролептического синдрома с осторожностью следует применять препарат у пациентов, принимающих нейролептики.

Лечение пароксетином следует назначать спустя 2 недели после отмены ингибиторов МАО.

У пациентов пожилого возраста при приеме пароксетина возможно развитие гипонатриемии.

В некоторых случаях у пациентов с сахарным диабетом требуется коррекция дозы инсулина и/или пероральных гипогликемических средств.

При развитии судорог лечение пароксетином прекращают.

При первых признаках мании следует отменить терапию пароксетином.

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

Использование в педиатрии

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пароксетин не ухудшает когнитивные и психомоторные функции, тем не менее пациентам следует соблюдать осторожность при управлении автомобилем и движущимися механизмами. В период лечения следует воздерживаться от употребления этанола и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять препарат при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять препарат при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

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

Применение в детском возрасте

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

Условия хранения:

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

Возможно хранить препарат в течение 15 суток после вскрытия флакона.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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