Стимулотон



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, овальной формы, двояковыпуклые, с гравировкой "E271" на одной стороне и риской - на другой, без запаха.

	1 таб.
сертралина гидрохлорид	55.95 мг,
что соответствует содержанию сертралина	50 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат, гипролоза (гидроксипропилцеллюлоза), натрия карбоксиметилкрахмал (тип А), кальция гидрофосфата дигидрат, целлюлоза микрокристаллическая.

Состав оболочки: макрогол 6000, титана диоксид, гипромеллоза.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, овальной формы, двояковыпуклые, с гравировкой "E272" на одной стороне и риской - на другой, без запаха.

	1 таб.
сертралина гидрохлорид	111.9 мг,
что соответствует содержанию сертралина	100 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат, гипролоза (гидроксипропилцеллюлоза), натрия карбоксиметилкрахмал (тип А), кальция гидрофосфата дигидрат, целлюлоза микрокристаллическая.

Состав оболочки: макрогол 6000, титана диоксид, гипромеллоза.

14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антидепрессант. Селективный ингибитор обратного захвата серотонина. Оказывает слабое влияние на обратный захват норадреналина и допамина. В терапевтических дозах сертралин блокирует также захват серотонина тромбоцитами крови человека.

Не оказывает стимулирующего, седативного или антихолинергического действия. Сертралин не обладает сродством к м-холино-, серотониновым, допаминовым, гистаминовым, адрено-, GABA- и бензодиазепиновым рецепторам.

При применении Стимулотона не происходит увеличения массы тела. Препарат не вызывает психической или физической лекарственной зависимости.

Антидепрессивный эффект отмечается к концу второй недели регулярного приема препарата, тогда как максимальный эффект достигается только через 6 недель.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь абсорбируется из ЖКТ медленно, но практически полностью. C_{max} достигается через 4.5-8.4 ч. При приеме препарата одновременно с приемом пищи биодоступность его увеличивается на 25%, C_{max} достигается быстрее.

Распределение

При ежедневном однократном приеме препарата C_{ss} обычно достигается через неделю. Связывание с белками плазмы крови составляет 98%. V_d - более 20 л/кг. Сертралин выделяется с грудным молоком. Данных о его способности проникать через плацентарный барьер нет.

Метаболизм

Сертралин подвергается интенсивному метаболизму при "первом прохождении" через печень, подвергаясь N-деметилированию. Его основной метаболит – N-десметилсертралин менее активен, чем сертралин.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет 22-36 ч и не зависит от возраста и пола пациентов. $T_{1/2}$ N-десметилсертралина составляет 62-104 ч.

Выводится в виде метаболитов с мочой и калом в равных количествах, 0.2% сертралина выводится с мочой в неизмененном виде.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

$T_{1/2}$ и AUC сертралина увеличиваются при нарушении функции печени. Фармакокинетические исследования с введением препарата в однократной дозе выявили увеличение $T_{1/2}$ и AUC сертралина у пациентов с циррозом печени.

Независимо от выраженности почечной недостаточности фармакокинетика сертралина при его постоянном применении не изменяется. Сертралин не выводится при гемодиализе.

Показания к применению:

— депрессии различной этиологии, в т.ч. сопровождающиеся чувством тревоги (лечение и профилактика);

— обсессивно-компульсивные расстройства, в т.ч. у детей старше 6 лет;

— панические расстройства (с агорафобией или без);

— посттравматические стрессовые расстройства.

Относится к болезням:

- Депрессия
- Паническое расстройство
- Стрессовые расстройства

Противопоказания:

— одновременное применение ингибиторов МАО и период 14 дней после их отмены;

— нестабильная эпилепсия;

— возраст до 18 лет (вследствие отсутствия достаточного клинического опыта применения), за исключением пациентов с обсессивно-компульсивными расстройствами;

— беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при органических заболеваниях головного мозга (в т.ч. при задержке умственного развития), маниакальных состояниях, эпилепсии, печеночной и/или почечной недостаточности, снижении массы тела, а также детям в возрасте старше 6 лет с ОКР.

Способ применения и дозы:

Препарат назначают внутрь, 1 раз/сут (утром или вечером).

Взрослым при *депрессиях* и *обсессивно-компульсивных расстройствах* препарат назначают в дозе 50 мг 1 раз/сут.

При *панических расстройствах* и *посттравматических стрессовых расстройствах* для снижения частоты и тяжести побочных эффектов рекомендуется начинать лечение с дозы 25 мг 1 раз/сут и через неделю увеличить ее до 50 мг 1 раз/сут.

При неудовлетворительном терапевтическом ответе и хорошей переносимости суточную дозу можно повышать по 50 мг в течение нескольких недель до максимальной суточной дозы 200 мг.

Терапевтический эффект достигается обычно в течение 7 дней. Однако для полного проявления антидепрессивного действия требуется регулярный прием препарата в течение 2-4 недель. При обсессивно-компульсивном расстройстве терапевтический эффект развивается еще медленнее. Для поддерживающей терапии следует назначать минимальную эффективную дозу.

При *обсессивно-компульсивных расстройствах* **детям в возрасте от 13 до 18 лет** препарат назначают в начальной дозе 50 мг 1 раз/сут. **Детям в возрасте от 6 до 12 лет** препарат назначают в начальной дозе 25 мг 1 раз/сут, через неделю суточную дозу можно увеличить до 50 мг. При неудовлетворительном терапевтическом ответе в дальнейшем дозу можно повышать еженедельно по 50 мг/сут до максимальной суточной дозы 200 мг. Во избежание передозировки при увеличении дозы более 50 мг/сут следует учитывать, что масса тела у детей меньше, чем у взрослых. При длительной поддерживающей терапии препарат следует назначать в минимальной эффективной дозе.

У **пациентов пожилого возраста** коррекции дозы препарата не требуется.

У **пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени** дозу препарата следует уменьшить или увеличить интервалы между приемами.

У **пациентов с нарушениями функции почек** специального подбора дозы не требуется.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: редко - сонливость, утомляемость, головокружение, головная боль, тремор, бессонница, раздражительность, акатизия, гипомания, мания.

Как и при лечении другими антидепрессантами, могут наблюдаться реакции, которые трудно дифференцировать от симптомов основного заболевания в т.ч. парестезия, гипестезия, депрессия, галлюцинации, возбуждение, агрессивность, ажитация, тревожность, психоз.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, снижение аппетита или повышение аппетита (возможно вследствие устранения депрессии); редко - анорексия, спазмы в желудке, животе, метеоризм или боли, неустойчивый стул, диарея, диспепсия, тошнота, рвота.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - сердцебиение.

Со стороны обмена веществ: снижение массы тела.

Со стороны системы кроветворения: кровотечения (в т.ч. носовое).

Со стороны органов чувств: редко - нарушения зрения (включая нечеткость зрения).

Со стороны половой системы: редко - дисменорея, нарушение половой функции (задержка эякуляции, снижение потенции и/или либидо, аноргазмия).

Дерматологические реакции: редко - гиперемия кожи или "приливы" крови к лицу, повышенное потоотделение.

Со стороны лабораторных показателей: в отдельных случаях (0.8%) - бессимптомное повышение АСТ и АЛТ (эти изменения наблюдались в течение первых 9 недель приема препарата и прекращались немедленно после его отмены); имеются сообщения об обратимой гипонатриемии (предположительно этот феномен связан с синдромом недостаточной секреции АДГ, поскольку наблюдался в основном у пациентов пожилого возраста, получающих одновременно сопутствующие диуретики или другие препараты).

Прочие: редко - аллергические реакции, зевота; в отдельных случаях прекращение приема препарата вызывает

синдром отмены.

Иногда (причинная связь с препаратом достоверно не установлена) - двигательные нарушения (экстрапирамидные симптомы и нарушения походки), судороги, нарушения менструального цикла, гиперпролактинемия, галакторея, кожная сыпь (редко - многоформная экссудативная эритема), зуд. В большинстве случаев двигательные нарушения наблюдались у пациентов, принимающих сопутствующие антипсихотические препараты (нейролептики), а также при наличии длительного анамнеза двигательных нарушений.

Передозировка:

Даже при назначении сертралина в высоких дозах тяжелых симптомов не выявлено. Однако введение сертралина в высоких дозах одновременно с другими препаратами или этанолом может привести к тяжелому отравлению.

Симптомы: серотониновый синдром с тошнотой, рвотой, сонливостью, тахикардией, ажитацией, головокружением, психомоторным возбуждением, диареей, повышенным потоотделением, миоклонусом и гиперрефлексией.

Лечение: специфические антидоты отсутствуют. Требуется интенсивная поддерживающая терапия и постоянное наблюдение за функциями жизненно важных органов. Вызывать рвоту не рекомендуется. Введение активированного угля может быть более эффективным, чем промывание желудка. Необходимо поддерживать проходимость дыхательных путей. У сертралина большой V_d, в связи с этим усиление диуреза, проведение диализа, гемоперфузии или переливания крови может оказаться безрезультатным.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Контролируемых результатов безопасности применения Стимулотонау беременных женщин нет, поэтому назначение при беременности противопоказано.

Женщинам репродуктивного возраста, которым предполагается назначать Стимулотон, следует рекомендовать пользоваться эффективными средствами контрацепции.

Сертралин выделяется с грудным молоком. Достоверных данных о безопасности его применения в период лактации нет. При необходимости назначения Стимулотона в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Стимулотона с ингибиторами МАО, в т.ч. с селегилином и обратимым ингибитором МАО моклобемидом, наблюдаются тяжелые осложнения. Возможно развитие серотонинового синдрома. Отмечены несколько случаев летального исхода при сочетании других антидепрессантов и ингибиторов МАО, а также при изолированном введении ингибиторов МАО, начатом немедленно после отмены других антидепрессантов. При сочетании избирательного блокатора обратного захвата серотонина и ингибитора МАО наблюдались гипертермия, ригидность, миоклония, вегетативная нестабильность (иногда с быстрыми изменениями функций дыхания и кровообращения), изменения психического состояния (например, спутанность сознания, раздражительность, иногда с крайней ажитацией, что могло привести к делирию или коме). Поэтому противопоказано применение Стимулотона в сочетании с ингибиторами МАО или в течение 14 дней после отмены ингибитора МАО, а также менее чем через 1 день после отмены обратимого ингибитора МАО. Аналогичным образом после отмены Стимулотона должно пройти не менее 14 дней до начала применения необратимого ингибитора МАО.

В исследованиях у здоровых добровольцев при ежедневном приеме Стимулотона в дозе 200 мг/сут не наблюдалось усиления влияния этанола, карбамазепина, галоперидола или фенитоина на когнитивные функции и психомоторные реакции. Однако во время приема сертралина препараты, оказывающие влияние на ЦНС, следует применять с особой осторожностью, от применения этанола на фоне лечения следует воздержаться.

Связывание сертралина с белками плазмы высокое, поэтому необходимо учитывать возможность его взаимодействия с другими препаратами, связывающимися с белками (например, диазепамом, толбутамидом и варфарином) плазмы.

При одновременном применении Стимулотона с циметидином в значительной степени снижается клиренс сертралина.

При одновременном применении Стимулотона с производными кумарина отмечается значительное увеличение протромбинового времени (в таких случаях рекомендуется контролировать протромбиновое время в начале лечения сертралином и после его отмены).

На фоне длительной терапии Стимулотоном в дозе 50 мг/сут применение препаратов, метаболизирующихся при участии изофермента CYP2D6, сопровождается повышением их концентраций в плазме крови.

В исследованиях лекарственного взаимодействия in vivo показано, что длительное введение сертралина в дозе 200 мг/сут не влияет на опосредованное изоферментами CYP3A3/4 эндогенное бета-гидроксилирование кортизола, на

метаболизм карбамазепина или терфенадина. Длительное введение сертралина в дозе 200 мг/сут не влияет на концентрации толбутамида, фенитоина и варфарина в плазме крови. Это означает, что сертралин не подавляет активность CYP2C9 в клинически значимой степени. Длительное введение сертралина в дозе 200 мг/сут не влияет и на концентрацию диазепама в плазме крови, в связи с чем клинически значимое угнетение активности изофермента CYP2C19 следует также исключить. Проведенные in vitro исследования показали, что сертралин не влияет или оказывает минимальный ингибирующий эффект на CYP1A2.

При одновременном применении Стимулотона и препаратов лития фармакокинетика последнего не изменяется. Однако при данной комбинации тремор наблюдается чаще. Также как и при назначении других избирательных ингибиторов обратного захвата серотонина, при комбинации Стимулотона с лекарственными средствами, влияющими на серотонинергическую передачу (в т.ч. с препаратами лития), требуется повышенная осторожность.

Время, необходимое для полного выведения из организма активного вещества перед переводом пациента с одного избирательного ингибитора обратного захвата серотонина на другой, не определено. Поэтому такой переход следует выполнять с чрезвычайной осторожностью.

При одновременном применении других серотонинергических веществ (например, триптофана или фенфлурамина) и сертралина требуется особая осторожность. По возможности таких сочетаний следует избегать.

В клинических исследованиях обнаружен лишь незначительный индуцирующий эффект сертралина на печеночные ферменты. При одновременном применении Стимулотона в дозе 200 мг/сут и феназона, сертралин вызывал небольшое (5%), но достоверное снижение $T_{1/2}$ феназона. Это небольшое уменьшение $T_{1/2}$ феназона было обусловлено клинически незначимым изменением метаболизма в печени.

При совместном применении сертралин не изменяет бета-блокирующий эффект атенолола.

При комбинации Стимулотона в дозе 200 мг/сут с глибенкламидом и дигоксином лекарственного взаимодействия не выявлено.

Особые указания и меры предосторожности:

Данные о возможном риске и преимуществе одновременного применения электросудорожной терапии и Стимулотона отсутствуют.

Как и другие антидепрессанты, Стимулотон в отдельных случаях (примерно в 0.4%) может вызвать манию или гипоманию.

Суицидальные мысли и попытки часто связаны с депрессией; они возможны в любое время до наступления ремиссии. Поэтому в начале курса лечения, до развития оптимального клинического эффекта, пациенты нуждаются в тщательном медицинском наблюдении.

В клинических испытаниях Стимулотона эпилептические припадки наблюдались у 0.08% больных депрессией (примерно 3/4000) и у 0.2% пациентов с обсессивно-компульсивными расстройствами (4/1800). Строгой связи эпилептических припадков с приемом Стимулотона не установлено. Отсутствуют данные о лечении Стимулотоном больных эпилепсией. Препарат нельзя назначать пациентам с нестабильной эпилепсией, а пациенты, не имеющие припадков, должны регулярно обследоваться. При возникновении припадков Стимулотон необходимо отменить.

Метаболизм сертралина в основном осуществляется в печени, поэтому необходима осторожность при назначении Стимулотона пациентам с заболеваниями печени.

Использование в педиатрии

Противопоказано применение Стимулотона для лечения **детей и подростков моложе 18 лет**, за исключением пациентов с обсессивно-компульсивным расстройством. Повышение вероятности суицида и суицидальные мысли, а также враждебности (в основном агрессии, непокорности и гнева), в клинических испытаниях чаще наблюдается среди детей и подростков, получающих антидепрессанты, по сравнению с группами, получающими плацебо. Если же по клиническим показаниям препарат назначен, следует установить наблюдение за пациентом для выявления суицидальных симптомов. Кроме того, отсутствуют данные долгосрочной безопасности у детей и подростков в отношении роста, созревания, а также развития когнитивной сферы и поведения.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Результаты клинических исследований показали, что монотерапия Стимулотоном не влияет на показатели психомоторной функции. Однако поскольку другие препараты, применяемые по аналогичным показаниям, могут отрицательно влиять на психомоторные реакции, способность к управлению транспортными средствами и механизмами следует определять индивидуально в зависимости от реакции пациента на лечение и применения сопутствующей терапии.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует назначать при почечной недостаточности. У **больных с нарушениями функции почек**

специально подбирать дозу не требуется.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует назначать при печеночной недостаточности. При **нарушениях функции печени** дозу препарата следует уменьшить или же увеличить интервалы между приемами.

Применение в пожилом возрасте

У **пациентов пожилого возраста** коррекции дозы препарата не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: возраст до 18 лет (вследствие отсутствия достаточного клинического опыта применения), за исключением пациентов с обсессивно-компульсивными расстройствами

С *осторожностью* следует назначать препарат детям в возрасте старше 6 лет с ОКР.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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