# Велаксин (таблетки)




## Код АТХ:

- N06AX16

## Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Венлафаксин

## Полезные ссылки:

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

## Форма выпуска:

***Таблетки*** белого или почти белого цвета, круглые, плоские, с фаской на одной стороне, с гравировкой "E741", без или почти без запаха.

| | **1 таб.** |
|---|---|
| венлафаксин (в форме гидрохлорида) | 37.5 мг |

*Вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат - 84.93 мг, целлюлоза микрокристаллическая, натрия крахмала гликолат (тип А), кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

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

***Таблетки*** белого или почти белого цвета, круглые, плоские, с фаской на одной стороне, с гравировкой "E743", без или почти без запаха.

| | **1 таб.** |
|---|---|
| венлафаксин (в форме гидрохлорида) | 75 мг |

*Вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат - 169.86 мг, целлюлоза микрокристаллическая, натрия крахмала гликолат (тип А), кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

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

## Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

## Фармакологические свойства:

***Фармакодинамика***

Антидепрессант. По химической структуре венлафаксин нельзя отнести ни к одному известному классу антидепрессантов (трициклические, тетрациклические или другие). Он является рацематом двух активных энантиомеров.

Механизм антидепрессивного действия препарата связан с его способностью потенциировать передачу нервного импульса в ЦНС. Венлафаксин и его основной метаболит О-десметилвенлафаксин (ОДВ) являются мощными ингибиторами обратного захвата серотонина и норадреналина и слабыми ингибиторами обратного захвата допамина. Кроме того, венлафаксин и ОДВ снижают бета-адренергическую активность как после однократного введения, так и при постоянном приеме. Венлафаксин и ОДВ одинаково эффективно влияют на обратный захват нейротрансмиттеров.

Венлафаксин не обладает сродством к м- и н-холинорецепторам, гистаминовым $H_1$-рецепторам и $\alpha_1$-адренорецепторам головного мозга. Венлафаксин не подавляет активность МАО. Не обладает сродством к опиоидным, бензодиазепиновым, фенциклидиновым или NMDA-рецепторам.

***Фармакокинетика***

*Всасывание*

После приема внутрь венлафаксин хорошо всасывается из ЖКТ. После однократного приема в дозах 25-150 мг $C_{max}$ в плазме крови достигается в течение приблизительно 2.4 ч и составляет 33-172 нг/мл. Венлафаксин подвергается интенсивному метаболизму при "первом прохождении" через печень.

$C_{max}$ ОДВ в плазме крови достигается приблизительно через 4.3 ч после приема и составляет 61-325 нг/мл.

В диапазоне суточных доз 75-450 мг венлафаксин и ОДВ имеют линейную кинетику. После приема препарата во время еды время достижения $C_{max}$ в плазме крови увеличивается на 20-30 мин, однако величины $C_{max}$ и абсорбции не изменяются.

*Распределение*

Связывание венлафаксина и ОДВ с белками плазмы крови составляет соответственно 27% и 30%.

При многократном приеме $C_{ss}$ венлафаксина и ОДВ достигаются в течение 3 дней.

*Метаболизм и выведение*

Основной метаболит - О-десметилвенлафаксин (ОДВ).

$T_{1/2}$ венлафаксина и ОДВ составляет соответственно 5 и 11 ч.

ОДВ и другие метаболиты, а также неизмененный венлафаксин выводятся почками.

*Фармакокинетика в особых клинических случаях*

У больных с циррозом печени концентрации в плазме крови венлафаксина и ОДВ повышены, а скорость их выведения снижена.

При умеренной или тяжелой почечной недостаточности общий клиренс венлафаксина и ОДВ снижается, а $T_{1/2}$ удлиняется. Снижение общего клиренса в основном наблюдается у пациентов со скоростью клубочковой фильтрации (СКФ) менее 30 мл/мин.

Возраст и пол пациента не влияют на фармакокинетику препарата.

## Показания к применению:

— депрессии различной этиологии (лечение и профилактика).

## Относится к болезням:

- Депрессия

## Противопоказания:

— тяжелые нарушения функции почек (СКФ < 10 мл/мин);

— тяжелые нарушения функции печени;

— одновременный прием ингибиторов МАО;

— детский и подростковый возраст до 18 лет (безопасность и эффективность для этой категории пациентов не доказана);

— установленная или предполагаемая беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при недавно перенесенном инфаркте миокарда, нестабильной стенокардии, артериальной гипертензии, тахикардии, судорогах в анамнезе, повышении внутриглазного давления, закрытоугольной глаукоме, маниакальных состояниях в анамнезе, предрасположенности к кровотечениям со стороны кожных покровов и слизистых оболочек, исходно сниженной массе тела.

## Способ применения и дозы:

Таблетки Велаксина рекомендуется принимать во время еды.

Рекомендуемая начальная доза составляет 75 мг в 2 приема (по 37.5 мг 2 раза/сут) ежедневно. Если после нескольких недель лечения не наблюдается значительного улучшения, суточную дозу можно повысить до 150 мг (по 75 мг 2 раза/сут). Если по мнению врача необходима более высокая доза (тяжелое депрессивное расстройство или другие состояния, требующие стационарного лечения), можно сразу назначить 150 мг в 2 приема (по 75 мг 2 раза/сут). После этого суточную дозу можно увеличивать на 75 мг каждые 2-3 дня до достижения желаемого терапевтического эффекта. Максимальная суточная доза препарата Велаксин составляет 375 мг. После достижения необходимого терапевтического эффекта суточная доза может быть постепенно снижена до минимального эффективного уровня.

*Поддерживающая терапия и профилактика рецидивов.* Поддерживающая терапия может продолжаться 6 мес и более. Препарат назначают в минимальных эффективных дозах, применявшихся при лечении депрессивного эпизода.

При **почечной недостаточности легкой степени тяжести (СКФ > 30 мл/мин)** коррекция режима дозирования не требуется. При **почечной недостаточности средней степени тяжести (СКФ 10-30 мл/мин)** дозу следует снизить на 25-50%. В связи с удлинением $T_{1/2}$ венлафаксина и его активного метаболита (ОДВ) таким пациентам следует принимать всю дозу 1 раз/сут. Не рекомендуется применять венлафаксин при **почечной недостаточности тяжелой степени (СКФ < 10 мл/мин)**, поскольку надежные данные о безопасности такой терапии отсутствуют.

**Пациенты, находящиеся на гемодиализе**, могут получать 50% обычной суточной дозы венлафаксина после завершения сеанса гемодиализа.

При **легкой печеночной недостаточности (протромбиновое время менее 14 сек)** коррекция режима дозирования не требуется. При **умеренной печеночной недостаточности (протромбиновое время от 14 до 18 сек)** дозу следует снизить на 50%. Не рекомендуется применять венлафаксин при **тяжелой печеночной недостаточности**, поскольку надежные данные о безопасности такой терапии отсутствуют.

У **пациентов пожилого возраста** препарат следует применять с осторожностью в связи с возможностью нарушения функции почек. Следует применять наименьшую эффективную дозу. При повышении дозы пациент должен находиться под тщательным медицинским наблюдением.

*Прекращение приема препарата*

По окончании приема Велаксина рекомендуется постепенно снижать дозировку препарата, по крайней мере, в течение недели и наблюдать за состоянием пациента, чтобы свести к минимуму риск, связанный с отменой препарата.

Период, необходимый для полного прекращения приема препарата, зависит от величины дозы, длительности курса лечения и индивидуальных особенностей пациента.

## Побочное действие:

Большинство побочных эффектов зависит от дозы. При длительном лечении тяжесть и частота большинства этих эффектов снижается, причем не возникает необходимость отмены терапии.

В порядке снижения частоты: часто (≥1%), нечасто (≥0.1% и <1%), редко (≥0.01% и <0.1%), очень редко (<0.01%).

*Со стороны пищеварительной системы:* снижение аппетита, запор, тошнота, рвота, сухость во рту; редко - гепатит.

*Со стороны обмена веществ:* повышение уровня холестерина сыворотки крови, снижение массы тела; нечасто - нарушение функциональных проб печени, гипонатриемия, синдром недостаточной секреции АДГ.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* артериальная гипертензия, гиперемия кожных покровов; нечасто - постуральная гипотензия, тахикардия.

*Со стороны ЦНС и периферической нервной системы:* необычные сновидения, головокружение, бессонница, нервная возбудимость, парестезии, ступор, повышение мышечного тонуса, тремор, зевота; нечасто - апатия, галлюцинации, спазмы мышц, серотонинергический синдром; редко - эпилептические припадки, маниакальные реакции, а также симптомы, напоминающие злокачественный нейролептический синдром.

*Со стороны мочевыделительной системы:* дизурия (в основном - затруднения в начале мочеиспускания); нечасто - задержка мочи.

*Со стороны половой системы:* нарушения эякуляции, эрекции, аноргазмия; нечасто - снижение либидо, меноррагия.

*Со стороны органов чувств:* нарушения аккомодации, мидриаз, нарушения зрения; нечасто - нарушение вкусовых ощущений.

*Дерматологические реакции:* потливость; нечасто - фотосенсибилизация.

*Со стороны системы кроветворения:* нечасто - кровоизлияния в кожу (экхимозы) и слизистые оболочки, тромбоцитопения; редко - удлинение времени кровотечения.

*Аллергические реакции:* нечасто - кожная сыпь; редко - многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона; очень редко - анафилактические реакции.

*Прочие:* слабость, повышенная утомляемость.

*После резкой отмены Велаксина или снижения дозы* возможны утомляемость, сонливость, головная боль, тошнота, рвота, анорексия, сухость во рту, головокружение, диарея, бессонница, беспокойство, тревога, нервная раздражительность, дезориентация, гипомания, парестезии, потливость. Эти симптомы обычно слабо выражены и проходят без лечения. Из-за вероятности возникновения этих симптомов очень важно постепенно снижать дозу препарата.

## Передозировка:

*Симптомы:* изменения ЭКГ (удлинение интервала QT, блокада ножки пучка Гиса, расширение комплекса QRS), синусовая или желудочковая тахикардия, брадикардия, гипотензия, судорожные состояния, изменение сознания (снижение уровня бодрствования). При передозировке венлафаксина при одновременном приеме с алкоголем и/или другими психотропными препаратами, сообщалось о смертельном исходе.

*Лечение:* проведение симптоматической терапии. Специфические антидоты неизвестны. Рекомендуется непрерывный контроль жизненно важных функций (дыхания и кровообращения). Назначение активированного угля для снижения всасывания препарата. Не рекомендуется вызывать рвоту в связи с опасностью аспирации. Венлафаксин и ОДВ не выводятся при диализе.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения Велаксина при беременности не доказана. Поэтому применение при беременности (или предполагаемой беременности) возможно только в том случае, если предполагаемая польза для матери превышает возможный риск для плода.

**Женщины детородного возраста** должны применять надежные методы контрацепции в период лечения препаратом и немедленно обратиться к врачу в случае наступления беременности или планирования беременности.

Венлафаксин и метаболит ОДВ выделяются с грудным молоком. Безопасность этих веществ для новорожденных детей не доказана, поэтому при необходимости приема препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания. Если лечение матери было завершено незадолго до родов, у новорожденного могут возникнуть симптомы отмены препарата.

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение Велаксина с ингибиторами МАО противопоказано. Прием Велаксина можно начинать не менее чем через 14 дней после окончания терапии ингибиторами МАО. Если применялся обратимый ингибитор МАО (моклобемид), этот интервал может быть короче (24 ч). Терапию ингибиторами МАО можно начинать не менее чем через 7 дней после отмены препарата Велаксин .

Венлафаксин не влияет на фармакокинетику лития.

При одновременном применении с имипрамином фармакокинетика венлафаксина и его метаболита ОДВ не меняется.

Возможно усиление эффектов галоперидола из-за повышения его концентрации в крови при совместном применении с Велаксином.

При одновременном применении с диазепамом фармакокинетика препаратов и их основных метаболитов существенно не изменяется. Также не обнаружено влияния на психомоторные и психометрические эффекты диазепама.

При одновременном применении с клозапином может наблюдаться повышение его уровня в плазме крови и развитие побочных эффектов (например, эпилептических припадков).

При одновременном применении с рисперидоном (несмотря на увеличение AUC рисперидона) фармакокинетика суммы активных компонентов (рисперидона и его активного метаболита) существенно не изменялась.

Усиливает влияние алкоголя на психомоторные реакции.

Метаболизм венлафаксина с образованием активного метаболита ОДВ происходит при участии изофермента CYP2D6. В отличие от многих других антидепрессантов, дозу венлафаксина можно не снижать при одновременном применении с ингибиторами CYP2D6, или у пациентов с генетически обусловленным снижением активности CYP2D6, поскольку суммарная концентрация активного вещества и метаболита (венлафаксина и ОДВ) при этом не меняется.

Основной путь выведения венлафаксина включает метаболизм с участием CYP2D6 и CYP3A4, поэтому следует соблюдать особую осторожность при назначении венлафаксина в сочетании с лекарственными препаратами, которые являются ингибиторами этих обоих ферментов. Характер данного взаимодействия еще не изучен.

Венлафаксин является относительно слабым ингибитором CYP2D6 и не подавляет активность изоферментов CYP1A2, CYP2C9 и CYP3A4; поэтому не следует ожидать его взаимодействия с другими препаратами, в метаболизме которых участвуют эти печеночные ферменты.

Циметидин подавляет метаболизм венлафаксина при "первом прохождении" через печень и не оказывает влияние на фармакокинетику ОДВ. У большинства пациентов ожидается лишь незначительное повышение общей фармакологической активности венлафаксина и ОДВ (более выражено у пожилых пациентов и при нарушении функции печени).

Не обнаружено клинически значимого взаимодействия венлафаксина с антигипертензивными (в т.ч. с бета-адреноблокаторами, ингибиторами АПФ и диуретиками) и гипогликемическими препаратами.

Поскольку связывание с белками плазмы венлафаксина и ОДВ составляет соответственно 27% и 30%, не предполагается лекарственного взаимодействия, обусловленного нарушением связывания с белками плазмы.

При одновременном приеме с варфарином возможно усиление антикоагулянтного эффекта последнего.

При одновременном приеме с индинавиром наблюдается уменьшение AUC индинавира на 28% и снижение его $C_{max}$ на 36%, при этом фармакокинетические параметры венлафаксина и ОДВ не изменяются. Клиническое значение данного эффекта неизвестно.

## Особые указания и меры предосторожности:

Резкое прекращение терапии Велаксином (как и другими антидепрессантами), особенно после применения в высоких дозах, может вызвать симптомы отмены, в связи с чем рекомендуется перед отменой препарата постепенно снизить его дозу. Длительность периода, необходимого для снижения дозы, зависит от величины дозы, продолжительности терапии, а также индивидуальной чувствительности пациента.

У больных с депрессивными расстройствами перед началом любой лекарственной терапии следует учитывать вероятность суицидальных попыток. Поэтому для снижения риска передозировки в начале лечения препарат следует по возможности применять в минимальной эффективной дозе, а пациент должен находиться под тщательным медицинским наблюдением.

У пациентов с аффективными расстройствами при лечении антидепрессантами (в т.ч. венлафаксином), могут возникать гипоманиакальные или маниакальные состояния. Как и другие антидепрессанты, венлафаксин следует назначать с осторожностью пациентам с манией в анамнезе. Такие пациенты нуждаются в медицинском наблюдении.

Велаксин (как и другие антидепрессанты) следует назначать с осторожностью больным с эпилептическими припадками в анамнезе. Лечение венлафаксином должно быть прервано при возникновении эпилептических припадков.

Пациентов следует предупредить о необходимости немедленно обратиться к врачу при возникновении сыпи, уртикарных элементов или других аллергических реакций.

У некоторых больных во время приема венлафаксина отмечено дозозависимое повышение АД, в связи с этим рекомендуется регулярный контроль АД, особенно в период уточнения или повышения дозы.

С осторожностью рекомендуется применять препарат у пациентов с тахиаритмией. На фоне лечения препаратом возможны повышение ЧСС, особенно во время приема в высоких дозах.

Пациентов, особенно пожилого возраста, следует предупредить о возможности возникновения головокружения и нарушения чувства равновесия.

Как и другие ингибиторы обратного захвата серотонина, венлафаксин может повышать риск кровоизлияний в кожу и слизистые оболочки. При лечении больных, предрасположенных к таким состояниям, необходима осторожность.

Во время приема венлафаксина, особенно в условиях дегидратации или снижения ОЦК (в т.ч. у пожилых пациентов и больных, принимающих диуретики), может наблюдаться гипонатриемия и/или синдром недостаточной секреции АДГ.

Во время приема препарата может наблюдаться мидриаз, в связи с чем рекомендуется контроль внутриглазного давления у больных, склонных к его повышению или страдающих закрытоугольной глаукомой.

С осторожностью следует назначать Велаксин пациентам, недавно перенесшим инфаркт миокарда и страдающим декомпенсированной сердечной недостаточностью, поскольку безопасность применения препарата у этой категории больных не изучена.

Проведенные до настоящего времени клинические испытания не выявили толерантности к венлафаксину или зависимости от него. Несмотря на это, как и при лечении другими препаратами, действующими на ЦНС, врач должен установить тщательное наблюдение за пациентами для выявления признаков злоупотребления препаратом. Тщательный контроль и наблюдение необходимы пациентам, имеющим в анамнезе указания на такие симптомы.

При назначении таблеток Велаксина больным с непереносимостью лактозы следует учитывать содержание лактозы (84.93 мг в каждой таблетке 37.5 мг; 169.86 мг в каждой таблетке 75 мг).

На фоне приема венлафаксина следует соблюдать особую осторожность при проведении электросудорожной терапии, т.к. опыт применения венлафаксина в этих условиях отсутствует.

В период лечения Велаксином следует избегать приема алкоголя.

*Использование в педиатрии*

Безопасность и эффективность применения препарата у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не изучены.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

Несмотря на то, что венлафаксин не влияет на психомоторные и когнитивные функции, следует учитывать, что любая лекарственная терапия психоактивными препаратами может снизить способность вынесения суждений, мышления или выполнения двигательных функций. Об этом следует предупредить пациента перед началом лечения. При возникновении такого рода нарушений степень и длительность ограничений должны быть установлены врачом.

***При нарушениях функции почек***

При **почечной недостаточности легкой степени тяжести (КК более 30 мл/мин)** коррекция режима дозирования не требуется. При **почечной недостаточности средней степени тяжести (КК 10-30 мл/мин)** дозу следует снизить на 25-50%. В связи с удлинением $T_{1/2}$ венлафаксина и его активного метаболита (ОДВ) таким пациентам следует принимать всю дозу 1 раз/сут. Не рекомендуется применять венлафаксин при **почечной недостаточности тяжелой степени (КК менее 10 мл/мин)**, поскольку надежные данные о безопасности такой терапии отсутствуют.

Пациенты, находящиеся на **гемодиализе**, могут получать 50% обычной суточной дозы венлафаксина после завершения сеанса гемодиализа.

***При нарушениях функции печени***

При **легкой печеночной недостаточности (протромбиновое время менее 14 сек)** коррекция режима дозирования не требуется. При **умеренной печеночной недостаточности (протромбиновое время от 14 до 18 сек)** дозу следует снизить на 50%. Не рекомендуется применять венлафаксин при **тяжелой печеночной недостаточности**, поскольку надежные данные о безопасности такой терапии отсутствуют.

***Применение в пожилом возрасте***

У **пациентов пожилого возраста** препарат следует применять с осторожностью в связи с возможностью нарушения

функции почек. Следует применять наименьшую эффективную дозу. При повышении дозы пациент должен находиться под тщательным медицинским наблюдением.

***Применение в детском возрасте***

Безопасность и эффективность применения препарата у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не изучены.

## Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом и недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С.

## Срок годности:

5 лет.

## Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

**Источник:** http://drugs.thead.ru/Velaksin_tabletki