



ЭСЦИЛЕКТ

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название препарата: Эсцилект.

Международное непатентованное название: эсциталопрам.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав: каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

эсциталопрама оксалат USP экв. эсциталопраму 10 мг.

Фармакотерапевтическая группа: Антидепрессанты. Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина. Эсциталопрам.

Код АТХ: N06AB10.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика:

Антидепрессант. Селективно ингибирует обратный захват серотонина; повышает концентрацию нейромедиатора в синаптической щели, усиливает и пролонгирует действие серотонина на постсинаптические рецепторы. Эсциталопрам практически не связывается с серотониновыми (5-HT), допаминовыми (D1 и D2) рецепторами, α -адрено-, м-холинорецепторами, а также с бензодиазепиновыми и опиоидными рецепторами. Антидепрессивный эффект обычно развивается через 2-4 недели после начала лечения. Максимальный терапевтический эффект лечения панических расстройств достигается примерно через 3 месяца после начала лечения.

Фармакокинетика:

Всасывание не зависит от приема пищи. Биодоступность - 80%. Время достижения С_{max} в плазме - 4 ч после многократного применения.

Кинетика эсциталопрама линейна. C_{ss} в плазме крови достигается через одну неделю. Средняя C_{ss} составляет 50 нмоль/л (от 20 до 125 нмоль/л) при суточной дозе 10 мг. Кажущийся V_d - от 12 до 26 л/кг. Связывание с белками плазмы - 80%.

Метаболизируется в печени до активных деметилированного и дидеметилированного метаболитов. После многократного применения средняя концентрация деметил- и дидеметил- метаболитов составляет 28-31% и менее 5% соответственно от концентрации эсциталопрама. Метаболизм эсциталопрама с образованием деметилированного метаболита происходит главным образом при участии изоферментов CYP2C19, CYP3A4 и CYP2D6. У лиц со слабой активностью изофермента CYP2C19 концентрация эсциталопрама может быть в 2 раза выше, чем у лиц с высокой активностью этого изофермента. Значительных изменений концентрации препарата при слабой активности изофермента CYP2D6 не отмечается.

T_{1/2} после многократного применения - 30 ч. У основных метаболитов эсциталопрама T_{1/2} более продолжителен. Клиренс - 0,6 л/мин. Эсциталопрам и его основные метаболиты выводятся печенью и большая часть - почками, частично выводится в форме глюкуронидов. **Печеночная недостаточность.** У пациентов со сниженной функцией печени клиренс эсциталопрама снижается на 37% и T_{1/2} увеличивается вдвое. У пациентов с низкой активностью изофермента CYP2C19 концентрация эсциталопрама может быть в два раза выше, чем в случаях с высокой активностью этого изофермента. Значительных изменений концентрации препарата в случаях со слабой активностью изофермента CYP2D6 не отмечается.

Почечная недостаточность. При средней степени тяжести почечной недостаточности клиренс эсциталопрама снижается на 17%. Данные по фармакокинетике эсциталопрама у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (С_r креатинина ниже 20 мл/мин) отсутствуют.

Пожилые пациенты. У пожилых (старше 65 лет) эсциталопрам выводится медленнее, чем у более молодых пациентов. Количество эсциталопрама, находящегося в системном кровотоке (AUC), и T_{1/2} у пожилых пациентов увеличиваются примерно на 50%.

Показания к применению:

Депрессивные эпизоды любой степени тяжести, панические расстройства с/без агорафобии, социальное тревожное расстройство (социальная фобия), генерализованное тревожное расстройство, обсессивно-компульсивное расстройство.

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к эсциталопраму, одновременный прием ингибиторов MAO, детский и подростковый возраст до 18 лет, беременность, период лактации.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Применение при нарушениях функции печени:

С осторожностью следует применять при циррозе печени.

Применение при нарушениях функции почек:

С осторожностью следует применять у пациентов с почечной недостаточностью (КК менее 30 мл/мин).

Применение у детей:

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Применение у пожилых пациентов:

С осторожностью следует применять у пациентов пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь, независимо от приема пищи.

Депрессивные эпизоды: обычно назначают 10 мг 1 раз в сутки. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до максимальной — 20 мг/сут. Антидепрессивный эффект обычно развивается через 2-4 недели после начала лечения. После исчезновения симптомов депрессии как минимум еще в течение 6 месяцев необходимо продолжать терапию для закрепления полученного эффекта.

Паническое расстройство с/без агорафобии: в течение первой недели лечения рекомендуется доза 5 мг/сут, которая затем увеличивается до 10 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до максимальной — 20 мг/сут. Максимальный терапевтический эффект достигается примерно через 3 месяца после начала лечения. Терапия длится несколько месяцев.

Обсессивно-компульсивное расстройство: обычно назначают 10 мг 1 раз в сутки. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза впоследствии может быть увеличена до максимальной — 20 мг/сут. Поскольку обсессивно-компульсивное расстройство является заболеванием с хроническим течением, курс лечения должен быть достаточно длительным для обеспечения полного излечения от симптомов и длиться по меньшей мере 6 месяцев. Для предотвращения рецидивов рекомендуется лечение не менее 1 года.

При прекращении лечения доза должна постепенно снижаться в течение 1-2 нед. для того, чтобы избежать возникновения синдрома "отмены".

Для пациентов пожилого возраста (старше 65 лет) рекомендуемая доза - 5 мг/сут, максимальная суточная доза - 10 мг.

При нарушениях функции печени рекомендуемая начальная в течение первых 2 нед. лечения составляет 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции доза может быть увеличена до 10 мг/сут.

Для пациентов со слабой активностью изофермента CYP2C19 рекомендуемая начальная доза в течение первых 2 нед. лечения - 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции доза может быть увеличена до 10 мг/сут.

Побочные действия:

Побочные эффекты наиболее часто развиваются на первой или второй неделе лечения и затем обычно становятся менее интенсивными и возникают реже при продолжении терапии.

Частота побочных эффектов, приведенных ниже, определялась соответственно классификации ВОЗ: очень часто (>1/10); часто (от >1/100 до <1/10); нечасто (от >1/1000 до <1/100); редко (от >1/10000 до <1/1000); очень редко (<1/10000); частота неизвестна (частоту возникновения нельзя оценить на основании существующих данных).

Со стороны крови и лимфатической системы: частота неизвестна — тромбоцитопения.

Со стороны иммунной системы: редко — анафилактические реакции.

Со стороны эндокринной системы: частота неизвестна — недостаточная секреция АДГ.

Метаболические нарушения и расстройства питания: часто — снижение аппетита, повышение аппетита, увеличение веса; нечасто — снижение веса; частота неизвестна — гипонатриемия, анорексия.

Со стороны психики: часто — тревога, беспокойство, необычные сновидения, снижение либидо, аноргазмия (у женщин); нечасто — бруксизм, ажитация, нервозность, панические атаки, спутанность сознания; редко — агрессия, деперсонализация, галлюцинации; частота неизвестна — мания, суицидальные мысли, суицидальное поведение. Случаи появления суицидальных мыслей и поведения были отмечены при приеме эсциталопрама и сразу после отмены терапии.

Со стороны нервной системы: часто — бессонница, сонливость, головокружение, парестезии, тремор; нечасто — нарушение вкусовых ощущений, нарушение сна, синкопальные состояния; редко — серотониновый синдром; частота неизвестна — дискинезия, двигательные нарушения, судорожные расстройства, психомоторное возбуждение/апатия.

Со стороны органа зрения: нечасто — мириаза (расширение зрачка), нарушения зрения; частота неизвестна — закрытоугольная глаукома.

Со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: нечасто — тиннитус (шум в ушах).

Со стороны ССС: нечасто — тахикардия; редко — брадикардия; частота неизвестна — удлинение интервала QT на ЭКГ.

Были отмечены случаи удлинения интервала QT и вентрикулярной аритмии, включая желудочковую тахикардию типа "пируэт", преимущественно у пациентов женского пола, с гипокалиемией или ранее существовавшими удлинением интервала QT или другими сердечно-сосудистыми заболеваниями. В двойных слепых плацебо-контролируемых исследованиях ЭКГ у здоровых добровольцев изменение от базового значения QTc (коррекция по формуле Фридрича) составило 4,3 мс при дозе 10 мг/сут и 10,7 мс — при 30 мг/сут.

Со стороны сосудов: частота неизвестна — ортостатическая гипотензия.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: часто — синусит, зевота; нечасто — носовое кровотечение.

Со стороны ЖКТ: очень часто — тошнота; часто — диарея, запоры, рвота, сухость во рту; нечасто — желудочно-кишечное кровотечение (в т.ч. ректальное).

Со стороны печени и желчевыводящих путей: частота неизвестна — гепатит, изменения функциональных показателей печени.

Со стороны кожи и подкожных тканей: часто — повышенная потливость; нечасто — крапивница, алопеция, сыпь, зуд; частота неизвестна — экхимоз, ангионевротический отек.

Со стороны скелетно-мышечной системы и соединительной ткани: часто — артралгия, миалгия.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: частота неизвестна — задержка мочи.

Со стороны репродуктивной системы и молочной железы: часто — импотенция, нарушение эякуляции; нечасто — метроррагия (маточное кровотечение), меноррагия; частота неизвестна — галакторея, приапизм, послеродовое кровотечение***.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: часто — слабость, гипертермия; нечасто — отеки.

Влияние на результаты лабораторных и инструментальных исследований: часто — изменение лабораторных показателей функции печени, гипонатриемия и изменения ЭКГ (удлинение интервала QT, расширение комплекса QRS, изменение сегмента S-T и зубца T).

Прочие: синдром "отмены" (головокружение, головные боли и тошнота).

Передозировка:

Симптомы: при передозировке эсциталопрама в основном возникают симптомы со стороны ЦНС (от головокружения, тремора и ажитации до редких случаев развития серотонинового синдрома, судорожных расстройств и комы), со стороны ЖКТ (тошнота/рвота), ССС (гипотензия, тахикардия, удлинение интервала QT и аритмия) и нарушения электролитного баланса (гипокалиемия, гипонатриемия).

Ккома или летальные случаи передозировки эсциталопрама являются крайне редкими, большинство из них включают одновременную передозировку других ЛС. Прием дозы в пределах 400-800 мг эсциталопрама не вызывал тяжелых симптомов.

Лечение: специфического антидота не существует. Проводят симптоматическое и поддерживающее лечение — промывание желудка, назначение энтеросорбентов (в частности активированного угля), обеспечение постоянного притока свежего воздуха, поддержка функции внешнего дыхания, адекватная оксигенация легких. Проводят мониторинг функции сердечно-сосудистой и дыхательной систем наряду с общим симптоматическим и поддерживающим лечением. Форсированный диурез, гемодиализ и гемосорбция неэффективны. Исход благоприятный.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с ингибиторами MAO повышается риск развития серотонинового синдрома и серьезных побочных реакций.

Совместное применение с серотонинергическими средствами (в т.ч. с трамадолом, триптанами) может привести к развитию серотонинового синдрома.

При одновременном применении с препаратами, снижающими порог судорожной готовности, повышает риск развития судорог.

Эсциталопрам усиливает эффекты триптофана и препаратов лития, повышает токсичность препаратов зверобоя, эффекты лекарственных средств, влияющих на свертывание крови (необходим контроль показателей свертывания крови).

Препараты, метаболизирующиеся с участием изофермента CYP2C19 (в т.ч. омепразол), а также являющиеся сильными ингибиторами CYP3A4 и CYP2D6 (в т.ч. флекаинид, пропранолол, метопролол, дезипрамин, кломипрамин, нортриптилин, рisperидон, тиоридазин, галоперидол), повышают концентрацию эсциталопрама в плазме крови.

Эсциталопрам повышает концентрацию в плазме дезипрамина и метопролола в 2 раза.

Эсциталопрам не вступает с этанолом в фармакодинамическое или фармакокинетическое взаимодействие. Однако, как и в случае с другими психотропными ЛС, одновременное применение эсциталопрама и алкоголя не рекомендуется.

Особые указания:

С осторожностью следует применять у пациентов с почечной недостаточностью (КК менее 30 мл/мин), гипонатриемией, манией, при приеме эсциталопрама неконтролируемой эпилепсии, при депрессии, суицидальными попытками, сахарном диабете, у пациентов пожилого возраста, при циррозе печени, при склонности к кровотечениям, одновременно с приемом лекарственных средств, снижающих порог судорожной готовности, вызывающих гипонатриемию, с этанолом, с препаратами, метаболизирующимися с участием изоферментов системы CYP2C19.

Эсциталопрам следует назначать только через 2 нед. после отмены необратимых ингибиторов MAO и через 24 ч после прекращения терапии обратимыми ингибиторами MAO. Неселективные ингибиторы MAO можно назначать не ранее чем через 7 дней после отмены эсциталопрама.

У некоторых пациентов с паническим расстройством в начале лечения эсциталопрамом может наблюдаться усиление тревоги, которая исчезает обычно в течение последующих 2 нед. лечения. Чтобы уменьшить вероятность возникновения тревоги, рекомендуется использовать низкие начальные дозы.

Следует отменить эсциталопрам в случае развития эпилептических приступов или их усугубления при фармакологически неконтролируемой эпилепсии.

При развитии маниакального состояния эсциталопрам следует отменить.

Эсциталопрам способен повышать концентрацию глюкозы в крови при сахарном диабете, что может потребовать коррекции доз гипогликемических препаратов.

Клинический опыт применения эсциталопрама свидетельствует о возможном увеличении риска реализации суицидальных попыток в первые недели терапии, в связи с чем очень важно осуществлять тщательное наблюдение за пациентами в этот период.

Гипонатриемия, связанная со снижением секреции АДГ, на фоне приема эсциталопрама возникает редко и обычно исчезает при его отмене.

При развитии серотонинового синдрома эсциталопрам следует немедленно отменить и назначить симптоматическое лечение.

В связи с ограниченным клиническим опытом рекомендуется соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов с ИБС.

При применении эсциталопрама были установлены случаи дозозависимого удлинения интервала QT и развития желудочковой аритмии, включая двунправленную тахикардию; такие случаи были зарегистрированы преимущественно у пациентов женского пола, с гипокалиемией или уже с существующими удлинением интервала QT или другими сердечно-сосудистыми заболеваниями. Рекомендуется проявлять осторожность при назначении препарата пациентам с сильной брадикардией, недавно перенесенного острого инфаркта миокарда или с некомпенсированной сердечной недостаточностью. Электролитные нарушения, такие как гипокалиемия и гипомagnesия, увеличивают риск развития аритмии. Если эсциталопрам назначается пациентам с хроническим заболеванием сердца, перед началом лечения следует сделать ЭКГ.

Если во время лечения эсциталопрамом проявляются признаки сердечной аритмии, следует отменить лечение и сделать ЭКГ.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами:

В период лечения пациентам следует избегать вождения автотранспорта и другой деятельности, требующей высокой концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

Форма выпуска:

14 таблеток, покрытых пленочной оболочкой, в каждом блистере. 2 блистера вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска: По рецепту врача.

Произведено для:

Vegapharm LLP

Лондон, Великобритания

Производитель:

High-Q Pharmaceuticals

Plot No. 224 & 225/1, Sector 23, Korangi

Industrial Area, Karachi, Пакистан



Vegapharm