ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
АКТАПАРОКСЕТИН

Регистрационный номер:
Торговое название препарата: АКТАПАРОКСЕТИН
Международное непатентованное название: пароксетин
Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.
Состав:
активное вещество - пароксетина гидрохлорид 22,22 мг или 33,33 мг, соответствующий пароксетину 20,00 мг или 30,00 мг.
вспомогательные вещества: магния стеарат 2255, карбоксиметилкрахмал натрия, маннитол DC, целлюлоза микрокристаллическая; метилметакрилата, диметиламиноэтилметакрилата и бутилметакрилата сополимер (Эудрагит Е 100); *Опадрай АМВ белый* (водный раствор): поливиниловый спирт частично гидролизованный, титана диоксид (Е 171), тальк, лецитин соевый (Е 322), ксантановая камедь (Е 415) – для таблеток 20 мг; *Опадрай АМВ синий* (водный раствор): поливиниловый спирт частично гидролизованный, титана диоксид (Е 171), тальк, индигокармин (Е 132), лецитин соевый (Е 322), ксантановая камедь (Е 415); краситель солнечный закат желтый (Е 110), краситель хинолиновый желтый (Е 104) - для таблеток 30 мг).
Описание:
Таблетки 20 мг: круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета с риской с обеих сторон и боковыми рисками, надписью «Р» с одной стороны и надписью «20» с другой стороны.
Таблетки 30 мг: круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой голубого цвета с риской с одной стороны и надписью «Р30» с другой стороны.
Фармакологическая группа: антидепрессант
Код АТХ N06AB05
Фармакологические свойства
Пароксетин является мощным и селективным ингибитором захвата 5-гидрокситриптамина (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, в отличии от трициклических антидепрессантов, пароксетин показал низкий аффинитет к α-1, α-2, ß-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 артериального давления, частоты сердечных сокращений и ЭЭГ.
В отличие от антидепрессантов, которые ингибируют захват норадреналина, пароксетин намного слабее подавляет антигипертензивные эффекты гуанитидина.

Фармакокинетика

Пароксетин хорошо всасывается после приема внутрь и подвергается метаболизму первого прохождения через печень. Выделение неизмененного пароксетина с мочой обычно составляет менее 2% от дозы, причем метаболиты составляют около 64% от дозы. Кишечник экскретирует около 36% через желчь, в которой неизмененный пароксетин составляет менее 1% от дозы. Таким образом, пароксетин выводится преимущественно в результате метаболизма.

Выведение из организма метаболитов пароксетина бифазное, сначала в результате метаболизма первого прохождения через печень, а затем оно контролируется системной элиминацией. Период полувыведения варьирует, но обычно составляет около одного дня.

Устойчивые системные уровни 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.

Поскольку метаболизм пароксетина включает стадию первого прохождения через печень, его количество, определяемое в системной циркуляции меньше того, которое абсорбируется из желудочно - кишечного тракта. При увеличении дозы пароксетина или при многократном дозировании, 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, которые при приеме низких доз достигают низких уровней препарата в плазме.

Пароксетин экстенсивно распределяется в тканях, и фармакокинетические расчеты показывают, что только 1% его присутствует в плазме, причем в терапевтических концентрациях 95% связано с белками плазмы.

У пожилых пациентов, а также у тех, кто страдает тяжелой почечной и печеночной недостаточностью, концентрация пароксетина в плазме повышена, а диапазон плазменных концентраций у них почти совпадает с диапазоном здоровых взрослых добровольцев.

Показания к применению

- депрессия всех типов, включая реактивную, тяжелую эндогенную депрессию и депрессию, сопровождающуюся тревогой;
- обсессивно-компульсивное расстройство (ОКР);
- паническое расстройство, в том числе с агорафобией;
- социальное тревожное расстройство / социальная фобия;
- генерализованное тревожное расстройство;
- лечение посттравматического стрессового расстройства

Противопоказания

- гиперчувствительность к компонентам препарата;
- одновременный прием с ингибиторами МАО и в течение 14 дней после их отмены;
- одновременный прием тиоридазина;
- нестабильная эпилепсия;
- беременность и период лактации;
- детский возраст (до 18 лет);

С осторожностью: печеночная недостаточность; почечная недостаточность; закрытоугольная глаукома; гиперплазия предстательной железы; мания; патология сердца; эпилепсия; судорожные состояния; назначение электроимпульсной терапии; прием препаратов, повышающих риск кровотечения; наличие факторов риска повышенной кровоточивости и заболевания, повышающие риск кровоточивости, пожилой возраст.

Способ применения и дозы

Внутрь, 1 раз в сутки, утром, во время еды. Таблетку проглатывают целиком, запивая водой. Доза подбирается индивидуально в течение первых двух-трех недель после начала терапии и впоследствии при необходимости корректируется.

При депрессиях - 20 мг 1 раз в сутки. В случае необходимости дозу постепенно увеличивают на 10 мг/сут, максимальная суточная доза не должна превышать 50 мг.

При обсессивно-компульсивных расстройствах начальная терапевтическая доза – 20 мг/сутки 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 - 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 в сутки, при отсутствии эффекта в течение как минимум двух недель возможно увеличение дозы максимально до 50 мг в сутки. Дозу следует увеличивать на 10 мг с интервалами не менее недели в соответствии с клиническим эффектом.

Посттравматические нарушения психики: для большинства пациентов начальная и терапевтическая дозы составляют 20 мг в сутки. В некоторых случаях рекомендуется увеличение дозы пароксетина максимально до 50 мг в сутки. Дозу следует увеличивать на 10 мг каждую неделю в соответствии с клиническим эффектом.

Генерализованные тревожные расстройства: начальная и рекомендуемая дозы – 20 мг в сутки.

При почечной и/или печеночной недостаточности рекомендуемая доза составляет 20 мг в сутки.

Для пожилых пациентов суточная доза не должна превышать 40 мг.

В целях предупреждения развития синдрома отмены прекращение приема препарата проводится постепенно.

Передозировка

Симптомы: тошнота, расширенные зрачки, лихорадка, повышение артериального давления, головная боль, непроизвольные мышечные сокращения, ажитация, тревожность, синусовая тахикардия, брадикардия, узловой ритм.

В очень редких случаях, при одновременном приеме с другими психотропными средствами и/или алкоголем возможно угнетение сознания вплоть до комы.

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

Побочное действие

Со стороны нервной системы: сонливость, тремор, астения, бессонница, головокружение, утомляемость, судороги, экстрапирамидные расстройства, серотониновый синдром, галлюцинации, мания, спутанность сознания, ажитация, тревога, деперсонализация, приступы паники, повышенная нервная возбудимость, парестезии, снижение способности к концентрации внимания.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: артралгия, миалгия, миастения, миоклония, миопатический синдром.

Со стороны органов чувств: нарушения зрения, изменение вкуса.

Со стороны мочеполовой системы: нарушения половой функции, включая импотенцию и расстройства эякуляции, задержка мочи, гиперпролактинемия/галакторея, аноргазмия, учащение мочеиспускания.

Со стороны пищеварительной системы: снижение аппетита, тошнота, рвота, сухость во рту, запоры или диарея, в очень редких случаях – гепатит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия.

Прочие: повышенное потоотделение, аллергические реакции (сыпь, крапивница, экхиматозы, зуд, ангионевротический отек), гипонатриемия, нарушение секреции антидиуретического гормона, синдром отмены при резкой отмене препарата, ринит.

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 назначении с пароксетином увеличивается концентрация проциклидина.

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

В связи ингибированием пароксетином цитохрома Р450 возможно усиление эффекта барбитуратов, фенитоина, непрямых антикоагулянтов, трициклических антидепрессантов, фенотиазиновых нейролептиков и антиаритмиков класса 1С, 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 неизменном протромбиновом времени.

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

Одновременное назначение с серотонинергическими препаратами (трамадол, суматриптан) может привести к усилению серотонинергического эффекта.

Отмечено взаимное усиление действия триптофана, препаратов лития и пароксетина.

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

Особые указания

Во избежание развития злокачественного нейролептического синдрома с осторожностью назначают пациентам, принимающим нейролептики.

Пароксетин не ухудшает когнитивные и психомоторные функции, тем не менее, как и при лечении другими психотропными препаратами, пациенты должны соблюдать осторожность при управлении автомобилем и движущимися механизмами.

В период лечения следует воздерживаться от употребления этанола и от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Лечение пароксетином назначают спустя 2 недели после отмены ингибиторов МАО.

У пациентов пожилого возраста возможна гипонатриемия.

В некоторых случаях требуется коррекции дозы инсулина и/или оральных гипогликемических препаратов.

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.

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 20 мг и 30 мг.

Таблетки 20 мг: по 6, 7 или 10 таблеток в блистеры Алюминиевая фольга/ПВХ/Алюминиевая фольга. 1 или 2 блистера по 6 таблеток, 1, 2, 4, 8 или 14 блистеров по 7 таблеток или 1, 2, 3, 5, 6 или 10 блистеров по 10 таблеток вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.

Таблетки 30 мг: по 6, 7 или 10 таблеток в блистеры Алюминиевая фольга/ПВХ/Алюминиевая фольга. 1 блистер по 6 таблеток, 2 или 4 блистера по 7 таблеток или 1, 3 или 10 блистеров по 10 таблеток вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.

По 20, 40, 60, 100 блистеров вместе с инструкциями по применению в картонную коробку (для стационаров).

Условия хранения

При температуре не выше 25°С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности
3 года. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек
По рецепту

Производитель:

АО «АКТАВИС»,
Рейкьявикурвегур 76-78,
220 Хафнарфьердур, Исландия.

Претензии потребителей предъявлять по адресу:
Представительство АО «Актавис» в г. Москве
127018, г. Москва, ул. Сущевский Вал, д. 18,
Тел.: 644-44-14, Факс: 644-44-24

И. о. директора ИДКЭЛС А. Н. Васильев

Представитель фирмы Н. А. Кулинченко