ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
СИРЕСТИЛЛ
(SERESTILL)

Регистрационный номер:
Торговое название препарата: Сиpестилл.
Международное непатентованное название: пароксетин.
Лекарственная форма: капли для приема внутрь.

Состав:
1 мл раствора содержит:
Активное вещество: пароксетина гидрохлорид – 11,11 мг (эквивалент свободному основанию пароксетина - 10 мг).
Вспомогательные вещества: бетадекс (бетациклодекстрин), сахароза, ароматизатор анисовый (этиловый спирт, вода, природный анетол), натрия бензоат, вода очищенная – до 1 мл.

Описание:
Прозрачный, бесцветный или слабо розовый раствор с характерным вкусом аниса.

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

Выведение из организма метаболитов пароксетина 2-х фазное, 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 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.
Поскольку метаболизм пароксетина включает стадию первого прохождения через печень, его количество, определяемое в системной циркуляции меньше того, которое абсорбируется из жедудочно - 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 при тяжелой почечной и печеночной недостаточности, концентрация пароксетина в плазме повышена, а диапазон плазменных концентраций практически совпадает с диапазоном у 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;

Противопоказания
- гиперчувствительность к компонентам препарата, в том числе к сахарозе;
- одновременный прием с ингибиторами МАО и в течение 14 дней после их отмены;
- 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.

Способ применения и дозы
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, соответственно.
1 мл раствора соответствует 20 каплям, что эквивалентно 10 мг пароксетина.
Одна капля соответствует 0,5 мг пароксетина.

Капли принимают внутрь, 1 раз в сутки, утром, во время еды. Капли следует разбавлять 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 - 60 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 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.

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.

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

Побочное действие

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

Со стороны органов чувств: изменение вкуса, нарушение зрения.

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

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

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия.

Прочие: ринит, повышенное потоотделение, аллергические реакции (сыпь, крапивница, экхиматозные высыпания, зуд, ангионевротический отек), гипонатриемия, нарушение секреции антидиуретического гормона, синдром отмены при резкой отмене препарата (головокружение, сенсорные нарушения (парестезии, ощущения, напоминающие воздействие электрического тока), расстройство сна, психомоторное возбуждение, тревога, тошнота и/или рвота, лабильность).

Передозировка

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

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

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 прециклидина.

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

В связи с 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:

Капли для приёма внутрь 10 мг/мл во флаконе темного стекла типа III с алюминиевым наворачивающимся колпачком, покрытым изнутри полиэтиленом. Каждый флакон 30 мл, в комплекте с дозирующей крышкой-пипеткой, наворачивающейся после удаления алюминиевого колпачка, и инструкцией по применению в картонной пачке. Дозирующая

пипетка из прозрачного стекла типа III тарирована для извлечения 0,5 мл, 1 мл, 1,5 мл, 2 мл раствора, соответствующего 10, 20, 30, 40 каплям, соответственно.

Условия хранения:
Хранить при температуре не выше 25 ^{0}С, в защищенном от света месте.
Хранить 15 суток после первого вскрытия флакона.
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:
3 года.
Не следует использовать препарат с истекшим сроком годности.

Условия отпуска из аптек:
По рецепту.

Производитель:
Италфармако С..А., Испания
28108, Аламобендас, Мадрид, Сан Рафаель, 3.

Фирма-заявитель регистрационного удостоверения:
Италфармако С.п.А., Италия
20126, Милан, Вьяле Фульвио Тести, 330.

Претензии потребителей по качеству препарата принимает:
Представительство АО «Италфармако», Россия:
119002, г. Москва, Глазовский пер., д. 7, офис 12
www.it[illegible].ru

Глава представительства
АО "Италфармако" Л.И.Никова

И.о. директора ИДКЭЛС А.Н.Васильев