МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения
Санципам (Suncipam)

Регистрационный номер:
Торговое название препарата: Санципам
Международное непатентованное название: эсциталопрам
Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

СОСТАВ

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой содержит:
активное вещество – эсциталопрам 5 мг, 10 мг или 20 мг (в виде эсциталопрама оксалата 6,40 мг, 12,77 мг или 25,54 мг);
вспомогательные вещества – лактоза – 47,65 мг / 85,88 мг / 181,76 мг, целлюлоза микрокристаллическая – 5,00 мг / 10,00 мг / 20,00 мг, крахмал кукурузный – 10,00 мг / 20,00 мг / 40,00 мг, коповидон – 1,50 мг / 3,00 мг / 6,00 мг, тальк – 1,50 мг / 3,00 мг / 6,00 мг, магния стеарат – 0,75 мг / 1,50 мг / 3,00 мг, кремния диоксид коллоидный – 0,40 мг / 0,75 мг / 1,50 мг, кроскармеллоза натрия – 2,70 мг / 5,00 мг / 10,00 мг, краситель железа оксид желтый (Е172) – 0,10 мг / 0,10 мг / 0,20 мг;
состав оболочки – гипромеллоза-2910 – 1,25 мг / 2,50 мг / 5,00 мг, макрогол-6000 – 0,25 мг / 0,50 мг / 1,00 мг, титана диоксид (Е171) – 0,10 мг / 0,25 мг / 0,50 мг, краситель железа оксид желтый (Е172) – 0,20 мг / 0,20 мг / 0,20 мг, тальк – 0,40 мг / 0,75 мг / 1,50 мг.

ОПИСАНИЕ

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, желтого цвета, с риской на одной стороне.

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА

Антидепрессант.
Код АТХ: N06AB10

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика:
Антидепрессант, селективный ингибитор обратного захвата серотонина (СИОЗС). Ингибирование обратного захвата серотонина приводит к повышению концентрации этого нейромедиатора в синаптической щели, усиливает и пролонгирует его действие на постсинаптические рецепторные участки.
Эсциталопрам не имеет совсем или имеет очень слабую способность связываться с рядом рецепторов, включая: серотониновые 5-HT_{1A}-, 5-HT_2-рецепторы, допаминовые D_1- и D_2-рецепторы, α_1-, α_2-, β-адренорецепторы, гистаминовые H_1-рецепторы, мускариновые холинорецепторы, бензодиазепиновые и опиоидные рецепторы.

Фармакокинетика

Всасывание

Всасывание не зависит от приема пищи. Биодоступность эсциталопрама составляет около 80%. Среднее время достижения максимальной концентрации в плазме крови (T_{max}) составляет около 4 ч после многократного применения.

7 1 5 0 0

Распределение

Связывание эсциталопрама и его основных метаболитов с белками плазмы крови ниже 80%. Кажущийся объем распределения ($V_{d,\beta}/F$) после перорального применения составляет от 12 до 26 л/кг.

Метаболизм

Эсциталопрам метаболизируется в печени до деметилированного и дидеметилированного метаболитов, которые являются фармакологически активными. Основное вещество и его метаболиты частично выделяются в форме глюкуронидов.

После многократного применения средняя концентрация деметил- и дидеметил-метаболитов обычно составляет 28-31% и менее 5% соответственно от концентрации эсциталопрама. Биотрансформация эсциталопрама в деметилированный метаболит происходит главным образом при участии изофермента CYP2C19. Возможно некоторое участие изоферментов CYP3A4 и CYP2D6.

Выведение

Период полувыведения ($T_{1/2}$) после многократного применения составляет около 30 ч. Клиренс при пероральном применении (Cl_{oral}) составляет около 0.6 л/мин. У основных метаболитов эсциталопрама $T_{1/2}$ более продолжителен. Эсциталопрам и его основные метаболиты выводятся печенью (метаболический путь) и почками. Большая часть выводится в виде метаболитов с мочой.

Кинетика эсциталопрама линейна. Равновесная концентрация (C_{ss}) достигается примерно через 1 неделю. Средняя C_{ss} 50 нмоль/л (от 20 до 125 нмоль/л) достигается при суточной дозе 10 мг.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пожилых пациентов (старше 65 лет)

У лиц пожилого возраста (старше 65 лет) эсциталопрам выводится медленнее, чем у более молодых пациентов. Количество вещества, находящегося в системном кровотоке, рассчитанное с помощью фармакокинетического показателя "площадь под кривой» (AUC) у пожилых на 50% больше, чем у молодых здоровых добровольцев (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Сниженная функция печени

У пациентов с легкой или умеренной дисфункцией печени (критерии Child-Pugh A и B), период полувыведения эсциталопрама примерно в два раза длиннее, а AUC примерно на 60% выше, чем у пациентов с нормальной функцией печени (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Сниженная функция почек

У пациентов со сниженной функцией почек (клиренс креатинина (CL_{cr} 10-53 мл/мин)) наблюдается удлинение периода полувыведения и незначительное повышение AUC, по сравнению с рацемическим циталопрамом. Концентрация метаболитов в плазме крови не определялось, но, вероятно, она также может повышаться (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Пациенты со слабой активностью изофермента CYP2C19

У лиц со слабой активностью CYP2C19 концентрация эсциталопрама в 2 раза выше, чем в случаях с высокой активностью этого изофермента. Значительных изменений концентрации препарата в случаях со слабой активностью изофермента CYP2D6 обнаружено не было.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- Депрессивные расстройства любой степени тяжести;
- Панические расстройства (в т.ч. с агорафобией);
- Социальное тревожное расстройство (социальная фобия);
- Генерализованное тревожное расстройство.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Повышенная чувствительность к препарату или его компонентам, детский возраст, беременность, период кормления грудью, дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция, одновременный прием ингибиторов моноаминоксидазы (МАО), суматриптаном и другими серотонинергическими лекарственными средствами.

С осторожностью

Наличие лекарственной зависимости (в т.ч. в анамнезе), печеночная и/или почечная недостаточность, маниакальные расстройства, судорожные расстройства, беременность, период лактации, пожилой возраст, детский возраст (эффективность и безопасность применения не установлены); фармакологически неконтролируемая эпилепсия, депрессия с суицидальными попытками, сахарный диабет, склонность к кровотечениям; одновременный прием с лекарственными средствами, снижающими порог судорожной готовности, вызывающими гипонатриемию; эталоном; лекарственными средствами, метаболизирующимися с участием системы изофермента CYP2C19.

Применение препарата при беременности и кормлении грудью

На сегодняшний день нет информации по применению эсциталопрама во время беременности и кормлении грудью.

По этой причине, препарат может быть назначен беременным только в случае крайней необходимости после тщательного анализа соотношения риск/польза. Эсциталопрам проникает в грудное молоко. Эсциталопрам не следует назначать кормящим матерям и в случае наступления периода кормления грудью препарат следует немедленно отменить.

На фоне применения эсциталопрама может возникнуть риск развития легочной гипертония у новорожденных, чьи матери принимали эсциталопрам на поздних сроках беременности.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь, вне зависимости от приема пищи.

Депрессивные расстройства: по 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, необходимо продолжать терапию для закрепления полученного эффекта в течение 6 мес.

Панические расстройства (в т.ч. с агорафобией): по 5 мг/сут в течение первой недели лечения, затем по 10-20 мг/сут. Максимальная суточная доза - 20 мг. Максимальный терапевтический эффект достигается примерно через 3 месяца после начала лечения. Длительность лечения - несколько месяцев.

При *социальном тревожном расстройстве (социальной фобии)* назначают 10 мг 1 раз/сут. Ослабление симптомов обычно развивается через 2-4 недели после начала лечения. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза впоследствии может быть уменьшена до 5 мг/сут или увеличена до максимальной - 20 мг/сут.

Поскольку социальное тревожное расстройство является заболеванием с хроническим течением, минимальная рекомендуемая длительность терапевтического курса составляет 12 недель. Для предотвращения рецидивов заболевания препарат может назначаться в течение 6 мес или дольше в зависимости от индивидуальной реакции пациента.

При *генерализованном тревожном расстройстве* рекомендуемая начальная доза - 10 мг 1 раз/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до максимальной - 20 мг/сут. Допускается длительное назначение препарата (6 мес и дольше) в дозе 20 мг/сут.

У пациентов пожилого возраста (старше 65 лет) рекомендуется применять половину обычно рекомендуемой дозы (т.е. всего 5 мг/сут) и более низкую максимальную дозу (10 мг/сут).

При *почечной недостаточности легкой и средней степени тяжести* коррекции дозы не требуется. *Пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК<30 мл/мин)* препарат следует назначать с минимальных доз, постепенно их увеличивая с учетом переносимости и эффективности.

При *легкой и умеренной печеночной недостаточности* рекомендуемая начальная доза в течение первых 2 недель лечения составляет 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции на лечение доза может быть увеличена до 10 мг/сут.

При сниженной активности изофермента CYP2C19 рекомендуемая начальная доза в течение первых 2 недель лечения составляет 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции на лечение доза может быть увеличена до 10 мг/сут.

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

ПОБОЧНЫЕ ДЕЙСТВИЯ

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

Со стороны центральной нервной системы: редко – астения, чрезмерная утомляемость, бессонница или сонливость, беспокойство, тремор, ажитация, амнезия, апатия, экстрапирамидные расстройства, изменение настроения, агрессивное поведение, галлюцинации, деперсонализация, эмоциональная лабильность, эйфория, маниакальные расстройства, паника, психотические расстройства, серотониновый синдром (ажитация, спутанность сознания, диарея, гипертермия, гиперрефлексия, атаксия, тремор, повышенное потоотделение, возбуждение, неконтролируемое поведение).

Со стороны пищеварительной системы: редко - тошнота, рвота, сухость во рту, гиперсаливация, метеоризм, анорексия, диарея, боль в животе.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко – брадикардия, снижение артериального давления, ортостатическая гипотензия, аритмия.

Со стороны органов кроветворения: редко – тромбоцитопения, кровотечения.

Со стороны органов чувств: редко – мидриаз, парез аккомодации, нарушение вкуса.

Со стороны репродуктивной системы: нарушение сексуальной функции – нарушение эякуляции, снижение либидо, импотенция; нарушения менструального цикла.

Аллергические реакции: кожная сыпь, редко - токсический эпидермальный некролиз, ринит, синусит.

Прочие: редко - гипертермия, полиурия, мастодиния, галакторея, гипонатриемия, нарушение мочеиспускания, артралгия, миалгия, зевота, скрежет зубами, увеличение или снижение массы тела, диспноэ.

Кроме того, после длительного применения резкое прекращение терапии эсциталопрамом у некоторых больных может привести к возникновению «синдрома отмены». При резком прекращении приема эсциталопрама могут возникать такие нежелательные реакции, как головокружение, головные боли и тошнота, выраженность которых незначительна, а продолжительность - ограничена.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы: головокружение, тремор, ажитация, усиление потоотделения, сонливость, угнетение сознания различной степени тяжести, судороги, синусовая тахикардия, изменения ЭКГ (изменение сегмента ST и зубца Т, расширение комплекса QRS, удлинение QT интервала), аритмия, желудочковая аритмия, цианоз, угнетение дыхательной деятельности, рвота, рабдомиолиз, метаболический ацидоз, гипокалиемия, редко – острая почечная недостаточность.

Лечение: специфического антидота не существует. Лечение симптоматическое и поддерживающее - промывание желудка, адекватная оксигенация. Мониторирование функции сердечно-сосудистой и дыхательной систем.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Ингибиторы моноаминооксидазы (МАО)

У пациентов, принимающих селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (СИОЗС) совместно с ингибиторами моноаминооксидазы (МАО), или у пациентов, начинающих прием ингибиторов МАО непосредственно после терапии СИОЗС, а также у пациентов, принимающих СИОЗС после ингибиторов МАО повышается уровень побочных реакций, характерных для группы ингибиторов МАО: серотониновый синдром, эйфория и т.д. Эсциталопрам не следует назначать совместно с ингибиторами МАО. Лечение эсциталопрамом следует начинать спустя 14 дней после отмены курса необратимых ингибиторов МАО и, как минимум через 1 день после прекращения терапии обратимым ингибитором МАО типа А – моклобемидом. Лечение эсциталопрамом должно быть прекращено за 7 дней до начала лечения ингибиторами МАО.

Комбинация лекарственных средств, требующие осторожного назначения:

Серотонинергические лекарственные средства

Совместное применение эсциталопрама с серотонинергическими препаратами (например, трамадолом, суматриптаном и другими триптанами) может привести к развитию серотонинового синдрома.

Лекарственные средства, снижающие порог судорожной готовности

Эсциталопрам может снижать порог судорожной готовности. Необходима осторожность при одновременном назначении эсциталопрама и других препаратов, снижающих порог судорожной готовности (трициклических антидепрессантов, СИОЗС, нейролептиков (фенотиазинов, тиоксантенов и бутирофенонов, мефлохина, бупропиона и трамадола).

Литий, триптофан

Эсциталопрам усиливает фармакологические эффекты триптофана (усиление серотонинергического эффекта) и токсические эффекты препаратов лития.

Hypericum perforatum

Одновременное назначение эсциталопрама и препаратов, содержащих зверобой (Hypericum perforatum), может привести к увеличению числа побочных эффектов.

Антикоагулянты и другие лекарственные средства, влияющие на свертываемость крови.

Нарушение свертываемости крови может возникнуть при одновременном назначении эсциталопрама с пероральными антикоагулянтами и другими лекарственными средствами, влияющими на свертываемость крови (например, атипичными антипсихотическими средствами и фенотиазинами, большинством трициклических антидепрессантов, ацетилсалициловой кислотой и нестероидными противовоспалительными средствами, тиклопидином и дипиридамолом). В подобных случаях необходим контроль показателей свертывания крови.

Алкоголь (этанол)
При одновременном приеме алкоголя эсциталопрам не вступает в фармакодинамическое или фармакокинетическое взаимодействие. Однако, как и в случае с другими психотропными средствами, одновременное применение эсциталопрама и алкоголя не рекомендуется.

Фармакокинетические взаимодействия
Влияние других лекарственных средств на фармакокинетику эсциталопрама
Главным образом эсциталопрам метаболизируется с участием изоферментов CYP2C19, CYP3A4, CYP2D6. Следует соблюдать осторожность при совместном назначении с ингибиторами CYP2C19 (омепразол, эзомепразол, флувоксамин, лансопразол, тиклопидин) или с циметидином. Совместное применение эсциталопрама с омепразолом (ингибитор изофермента CYP2C19) при однократной суточной дозе в 30 мг приводило к повышению (около 50%) концентрации эсциталопрама в плазме крови. Также с осторожностью следует назначать высокие дозы эсциталопрама одновременно с высокими дозами циметидина, являющегося сильным ингибитором изоферментов CYP2D6, CYP3A4, CYP1A2. Может потребоваться уменьшение дозы эсциталопрама в зависимости от побочных реакций.
Влияние эсциталопрама на фармакокинетику других лекарственных средств.
Эсциталопрам является ингибитором изофермента CYP2D6. Необходимо проявлять осторожность при одновременном назначении эсциталопрама и лекарственных средств, метаболизирующихся с помощью этого изофермента и имеющих малый терапевтический индекс, например, флекаинида, пропафенона и метопролола (в случаях применения при сердечной недостаточности) или препаратов, в основном метаболизирующихся посредством изофермента CYP2D6 и действующих на ЦНС, например антидепрессантов дезипрамина, кломипрамина, нортриптилина или антипсихотических средств - рисперидона, тиоридазина, галоперидола. В этих случаях может потребоваться коррекция дозы, так как увеличивается концентрация эсциталопрама в плазме крови.
Одновременное назначение эсциталопрама и дезипрамина или метопролола приводит к двукратному увеличению концентрации двух последних препаратов, что следует учитывать при выборе доз.
Эсциталопрам может незначительно ингибировать изофермент CYP2C19. Поэтому рекомендуется проявлять осторожность при одновременном использовании эсциталопрама и препаратов, метаболизирующихся при участии данного изофермента.
Несовместимость.
Не выявлена.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ
Применение антидепрессантов, в т.ч. эсциталопрама, особенно у детей, подростков и молодых людей младше 24 лет, может привести к усилению суицидального поведения. По этой причине, особенно в начале курса лечения и в течение первых месяцев лечения, при смене дозы препарата, как в сторону увеличения, так и в сторону уменьшения, или при отмене препарата, за пациентами следует тщательно наблюдать на предмет выявления суицидального поведения или других изменений, таких как ажитация и/или раздражительность.
Парадоксальная тревога
У некоторых пациентов с паническими расстройствами в начале лечения антидепрессантами могут наблюдаться проявления тревоги. В большинстве случаев, эти парадоксальные реакции проходят в течение 2 недель после начала терапии. Для снижения вероятности возникновения анксиогенного эффекта рекомендуется использовать низкие начальные дозы.

71500

Судорожная готовность

В случае развития судорожных припадков препарат следует немедленно отменить. СИОЗС не следует назначать больным с неконтролируемой эпилепсией; при контролируемых припадках необходимо тщательное наблюдение. При увеличении частоты судорожных СИОЗС, включая эсциталопрам, должны быть отменены.

Мания

СИОЗС должны с осторожностью применяться у больных с маниакальными расстройствами в анамнезе. При развитии маниакального состояния эсциталопрам должен быть отменен.

Сахарный диабет

У пациентов с сахарным диабетом лечение СИОЗС может изменить содержание глюкозы в крови. Поэтому может потребоваться коррекция доз инсулина и/или пероральных гипогликемических препаратов.

Гипонатриемия

При применении СИОЗС отмечались случаи развития гипонатриемии, которая возможно связана с нарушением секреции антидиуретического гормона (АДГ). По этой причине, СИОЗС следует с осторожностью назначать лицам, входящим в группу риска развития гипонатриемии: пожилым, больным циррозом печени и принимающим препараты, способные вызывать гипонатриемию.

Акатизия

При применении СИОЗС отмечались случаи развития акатизии, характеризующейся постоянным или периодически возникающим чувством внутреннего двигательного беспокойства и проявляющейся в неспособности больного долго находиться в одной позе или долго оставаться без движения. В большинстве случаев, эти симптомы развиваются в течение нескольких недель после начала терапии. Увеличение дозы в этом случае не желательно.

Кровоизлияния

При применении СИОЗС наблюдались случаи развития кожных кровоизлияний: экхимоз и пурпура. Необходимо с осторожностью применять СИОЗС у больных со склонностью к кровотечениям, а также принимающих пероральные антикоагулянты и лекарства, влияющие на свертываемость крови (например, атипичные антипсихотические средства и фенотиазин, большинство трициклических антидепрессантов, ацетилсалициловую кислоту и НПВП – нестероидные противовоспалительные препараты).

ЭСТ (электросудорожная терапия)

Поскольку клинический опыт одновременного применения СИОЗС и ЭСТ ограничен, то в подобных случаях должна соблюдаться осторожность.

Обратимые, селективные ингибиторы МАО типа А

Сочетать эсциталопрам и ингибиторы МАО типа А не рекомендуется из-за риска развития серотонинового синдрома.

Смотрите раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами» для более подробной информации по совместному приему эсциталопрама с ингибиторами МАО.

Ишемическая болезнь сердца

Пациентам с ишемической болезнью сердца препарат следует принимать с осторожностью.

Серотониновый синдром

Следует соблюдать осторожность при совместном назначении эсциталопрама и серотонинергических препаратов, таких как суматриптан, другие вещества группы триптанов, трамадол и триптофан. Однако, развитие серотонинового синдрома у пациентов, получающих одновременно серотонинергические препараты и СИОЗС, отмечалось крайне редко. На развитие этого синдрома могут указывать такие признаки как ажитация, тремор, миоклонус и гипертермия. В этом случае, следует немедленно прекратить одновременный прием СИОЗС и серотонинергического препарата и начать симптоматическую терапию.

Применение у детей
Применение препарата у детей не рекомендуется, так как его эффективность и безопасность у детей до конца не изучены.

Влияние на способность управлять автомобилем или механизмами
Хотя эсциталопрам не влияет на психомоторную активность, в период лечения не рекомендуется управлять автомобилем или механизмами.

ФОРМА ВЫПУСКА
Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 5 мг, 10 мг, 20 мг.
По 10 таблеток в блистер, изготовленный из ПВХ и алюминиевой фольги. По 1, 2, 3 или 5 блистеров вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

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

СРОК ГОДНОСТИ
2 года. Не использовать после истечения срока годности.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК
По рецепту.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ
«Сан Фармасьютикал Индастриз Лтд.» Индия
«Sun Pharmaceutical Industries Ltd.», India
Сёвей № 214, Плот № 20,
Джи.Ай.Эй. Фейз - II,
Пипария, Сильвасса – 396 230,
Ю.Т. ов Дадра энд Нагар Хавели,
Индия
Survey No. 214, Plot No. 20,
G.I.A. Phase - II, Piparia,
Silvassa – 396 230,
U.T. of Dadra & Nagar Haveli,
India

Адрес представительства в РФ для предъявления претензий:
Представительство компании «Сан Фармасьютикал Индастриз Лтд.»
117420, г. Москва, ул. Профсоюзная, 57, офис 722
Тел: (495) 334 28 77

Глава Представительства К.Каннипутур

"Сан Фармасьютикал Индастриз Лимитед" Индия "Sun Pharmaceutical Industries Limited" India * МОСКВА *

ФГБУ МЗ РФ ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА 0 0 0 0 0 0 0 0 0 8

71500