МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ЛП 001063 - 250413

СОГЛАСОВАНО

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ЭЙСИПИ

Торговое название

ЭЙСИПИ

Международное непатентованное название

эсциталопрам

Лекарственная форма

таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав на одну таблетку

Активное вещество:

Эсциталопрама оксалат	6,39 мг	12,77 мг	25,54 мг
в пересчете на эсциталопрам	5 мг	10 мг	20 мг

Вспомогательные вещества:	*для получения таблетки-ядра массой*		
	90 мг	*125 мг*	*250 мг*
Кроскармеллоза натрия (вивасол)	3,24 мг	4,5 мг	9,0 мг
Просолв SMCC 90 [Целлюлоза микрокристаллическая Кремния диоксид коллоидный]	77,67 мг	103,98 мг	207,96 мг
Магния стеарат	0,9 мг	1,25 мг	2,5 мг
Тальк	1,8 мг	2,5 мг	5,0 мг

Вспомогательные вещества:	*для получения таблетки, покрытой пленочной оболочкой, массой*		
	92,25 мг	*128,12 мг*	*255,02 мг*
Опадрай II белый [Гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза)	2,25 мг 0,63 мг	3,12 мг 0,87 мг	5,02 мг 1,41 мг
Лактозы моногидрат	0,81 мг	1,12 мг	1,81 мг
Макрогол (полиэтиленгликоль 4000)	0,225 мг	0,312 мг	0,5 мг
Титана диоксид (Е 171)]	0,585 мг	0,818 мг	1,3 мг

Описание

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые без риски (дозировка 5 мг) и с риской (дозировки 10 мг и 20 мг).

Фармакотерапевтическая группа

антидепрессант

Код АТХ: [N06AB10]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Антидепрессант, селективно ингибирует обратный захват серотонина (СИОЗС); повышает концентрацию этого нейромедиатора в синаптической щели, усиливает и пролонгирует действие серотонина на постсинаптические рецепторы. Эсциталопрам не имеет совсем или имеет очень слабую способность связываться с рядом рецепторов, включая: серотониновые 5-HT_{1A}, 5-HT_2 рецепторы, дофаминовые D1 и D2 рецепторы, α_1-, α_2-, β-адренергические рецепторы, гистаминовые H_1, мускариновые холинергические, бензодиазепиновые и опиоидные рецепторы.

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 максимальной концентрации в плазме крови (TCmax) - 4 ч. Кинетика эсциталопрама линейна. Равновесная концентрация (Css) достигается через 1 неделю. Средняя Css 50 нмоль/л (от 20 до 125 нмоль/л) достигается при суточной дозе 10 мг. Кажущийся объем распределения - от 12 до 26 л/кг. Связь с белками ниже 80%.

Метаболизируется в печени до активных деметилированного и дидеметилированного метаболитов. После многократного применения средняя концентрация деметил- и дидеметилметаболитов составляет 28-31% и менее 5% соответственно от концентрации эсциталопрама. Метаболизм эсциталопрама в деметилированный метаболит происходит главным образом с помощью изоферментов цитохрома P_{450}: 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. Период полувыведения (T1/2) после многократного применения - 30 ч. У основных метаболитов эсциталопрама T1/2 более продолжителен. Клиренс – 0,6 л/мин.

Эсциталопрам и его основные метаболиты выводятся печенью и большая часть - почками, частично выводится в форме глюкуронидов. T1/2 и площадь под кривой «концентрация – время» (AUC) увеличивается у пожилых (старше 65 лет) пациентов.

Показания к применению

- Депрессивные эпизоды любой степени тяжести;
- Панические расстройства с/без агорафобии;
- Обсессивно-компульсивное расстройство.

Противопоказания

Гиперчувствительность к эсциталопраму и вспомогательным компонентам препарата, дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция; детский, юношеский возраст (до 18 лет), одновременный приём с ингибиторами моноаминооксидазы (МАО). Беременность, период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

ЭЙСИПИ назначают перорально один раз в сутки вне зависимости от приема пищи.

Депрессивные эпизоды. Обычно назначают 10 мг один 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.

Панические расстройства 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 один 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 избавления от симптомов и длиться, по меньшей мере, 6 месяцев. Для предотвращения рецидивов рекомендуется лечение не менее 1 года.

Пожилые пациенты (старше 65 лет). Рекомендуется применять половину обычно рекомендуемой дозы (т.е. всего 5 мг/сут) и более низкую максимальную дозу (10 мг/сут).

Дети и подростки в возрасте до 18 лет. Антидепрессанты не следует назначать детям и подросткам в возрасте до 18 лет из-за повышенного риска возникновения суицидального поведения (суицидальных попыток и мыслей), враждебности (с преобладанием агрессивного поведения, склонности к конфронтации и раздражения). В случае принятия решения о начале терапии антидепрессантами пациент должен находиться под тщательным наблюдением.

Сниженная функция почек. При легкой и умеренной почечной недостаточности корректировки доз не требуется. Пациентам с выраженной почечной недостаточностью (клиренс креатинина CL_{CR} ниже 30 мл/мин) следует назначать препарат ЭЙСИПИ с осторожностью.

Сниженная функция печени. Рекомендуемая начальная доза в течение первых двух недель лечения составляет 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до 10 мг/сут. При выраженной печеночной недостаточности необходимо соблюдать осторожность при титровании.

Сниженная активность цитохрома $P_{450}2C19$. Для пациентов со слабой активностью изофермента $P_{450}2C19$ рекомендуемая начальная доза в течение первых двух недель лечения составляет 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до 10 мг/сут.

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

Меры предосторожности при применении

Эсциталопрам следует назначать только через 2 недели после отмены необратимых ингибиторов моноаминооксидазы (МАО) и через 24 ч после прекращения терапии обратимым ингибитором МАО. Неселективные ингибиторы МАО можно назначить не ранее чем через 7 дней после отмены эсциталопрама. У некоторых пациентов с паническим расстройством в начале лечения СИОЗС может наблюдаться усиление тревоги, которая исчезает обычно в течение последующих 2 недель лечения. Чтобы снизить вероятность возникновения тревоги, рекомендуется применять низкие начальные дозы.

Следует отменить препарат в случае развития судорожных припадков. Не рекомендуется применение у пациентов с нестабильной эпилепсией; при контролируемых припадках

необходимо тщательное наблюдение. При увеличении частоты судорожных припадков препарат должен быть отменен.

Эсциталопрам должен с осторожностью применяться у пациентов с манией/гипоманией в анамнезе. При развитии маниакального состояния эсциталопрам должен быть отменен.

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

Риск совершения самоубийства свойственен депрессии и может сохраняться до существенного улучшение состояния, наступившего спонтанно или вследствие проводимой терапии. Необходимо тщательное наблюдение за пациентами, находящимися на лечении антидепрессантами, особенно в начале лечения из-за возможности клинического ухудшения и/или появления суицидальных проявлений (мыслей и поведения). Эта предосторожность должна соблюдаться и при лечении других психических расстройств из-за возможности одновременного заболевания депрессивным эпизодом.

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

При приеме эсциталопрама возможно развитие кожных проявлений: экхимозов, пурпуры. Необходимо соблюдать осторожность при назначении препарата пациентам, склонным к кровотечениям или принимающих антикоагулянты.

Не рекомендуется одновременный прием эсциталопрама и ингибиторов МАО типа А, из-за риска развития серотонинового синдрома. Необходимо проявлять осторожность при одновременном применении с препаратами, обладающими серотонинергическим действием. Комбинация таких симптомов как ажитация, тремор, миоклонус, гипертермия, может указывать на развитие серотонинового синдрома. В этом случае следует прекратить одновременный прием СИОЗС и серотонинергических препаратов и начать симптоматическое лечение.

Передозировка

Симптомы. Головокружение, тремор, ажитация, сонливость, помрачение сознания, судорожные припадки, тахикардия, изменения электрокардиограммы (ЭКГ) (изменение ST-T, расширение комплекса QRS, удлинение интервала QT), аритмии, угнетение дыхательной деятельности, рвота, рабдомиолиз, метаболический ацидоз, гипокалиемия.

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

Побочное действие

Со стороны центральной нервной системы: головокружение, слабость, бессонница или сонливость, судороги, тремор, двигательные нарушения, серотониновый синдром (ажитация, тремор, миоклонус, гипертермия), расстройства зрения.

Со стороны психики: галлюцинации, мания, спутанность сознания, ажитация, тревога, деперсонализация, панические атаки, повышенная раздражительность,

Со стороны дыхательной системы: синуситы, зевота.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, сухость во рту, нарушения вкусовых ощущений, снижение аппетита, диарея, запор.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия.

Со стороны эндокринной системы: снижение секреции антидиуретического гормона (АДГ).

Со стороны мочеполовой системы: задержка мочи.

Со стороны органов зрения: нарушения зрения.

Со стороны репродуктивной системы: галакторея, снижение либидо, импотенция, нарушение эякуляции, аноргазмия (у женщин).

Со стороны кожных покровов: кожная сыпь, зуд, экхимозы, пурпура, ангионевротический отек, повышенное потоотделение.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия.

Лабораторные показатели: гипонатриемия, изменение лабораторных показателей функции печени.

Прочие: гипертермия, анафилактические реакции.

При резком прекращении приема препарата может возникнуть синдром "отмены" (головокружение, головные боли и тошнота). Чтобы избежать возникновения синдрома отмены рекомендуется постепенная отмена препарата в течение 1-2 недель.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

При одновременном приеме с ингибиторами МАО, а также в начале приема ингибиторов МАО у пациентов, незадолго до этого принимавших эсциталопрам, повышается риск развития серотонинового синдрома.

Совместное применение с серотонинергическими лекарственными препаратами (в т.ч. с трамадолом, суматриптаном и др. триптанами) может привести к развитию серотонинового синдрома.

Одновременный прием с препаратами, снижающими порог судорожной готовности (трициклическими антидепрессантами, СИОЗС, антипсихотиками - фенотиазинами, тиоксантенами, бутирофенонами) повышает риск развития судорог.

Усиливает эффект триптофана и препаратов лития (Li+).

Повышает токсичность препаратов зверобоя.

При одновременном применении с пероральными антикоагулянтами и препаратами, влияющими на свертываемость крови (например, атипичными антипсихотиками и фенотиазинами, большинством трициклических антидепрессантов, ацетилсалициловой кислотой, нестероидными противовоспалительными препаратами, тиклопидином, дипиридамолом) возможно нарушение свертываемости крови, необходим тщательный контроль соответствующих показателей.

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

Препараты, метаболизирующиеся с участием системы CYP2C19 (в т.ч. омепразол, эзомепразол, флувоксамин, лансопразол, тиклопидин), циметидин а также препараты, являющиеся ингибиторами CYP3A4 и CYP2D6 (в т.ч. флекаинид, пропафенон, метопролол, дезипрамин, кломипрамин, нортриптилин, рисперидон, тиоридазин, галоперидол), увеличивают концентрацию эсциталопрама в плазме крови пациентов.

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

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Эсциталопрам противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Применение СИОЗС в III триместре беременности может негативно сказаться на психофизическом развитии новорожденного. Зарегистрированы следующие нарушения у новорожденных, чьи матери принимали СИОЗС вплоть до родов: раздражительность, тремор, гипертензия, повышенный мышечный тонус, постоянный плач, трудности сосания, плохой сон. Нарушения могут свидетельствовать о серотонинергических эффектах или о возникновении синдрома отмены. В случае применения СИОЗС при беременности их прием не должен резко прерываться.

Влияние на способность управлять автомобилем и работу с механизмами

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

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 5мг, 10 мг и 20 мг. По 7 или 14 таблеток в контурную ячейковую упаковку. По 14 или 28 таблеток в банку из полимерных материалов. Каждую банку, 1 или 2 контурные ячейковые упаковки по 14 таблеток, или 2 или 4 контурные ячейковые упаковки по 7 таблеток вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 ^{0}С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель:

ОАО «ВЕРОФАРМ»

Юридический адрес 107023, г. Москва, Барабанный пер., д.3.

Адрес производства и принятия претензий: 308013, г. Белгород, ул. Рабочая, д.14.

Тел. (4722) 21-32-26; 21-34-71

Начальник
Медицинского управления Е.В. Кривошеева