

Торговое название: ПРОЗАК®

Международное непатентованное название: Флуоксетин

Химическое рациональное название: (±)N-метил-3-фенил-3[(α,α,α-трифтор-р-толил)окси]пропиламина гидрохлорид

Лекарственная форма: Капсулы

Состав

Каждая капсула содержит:

Активное вещество: флуоксетина гидрохлорид, эквивалентный 20 мг флуоксетина;

Вспомогательные вещества:

содержимое капсулы: крахмал, диметикон;

состав оболочки капсулы: краситель патентный голубой V, краситель железа оксид жёлтый, титана диоксид, желатин, пищевые чернила (для нанесения идентификационной печати).

Описание

Капсулы: непрозрачные зелёные/кремовые, твёрдые желатиновые (размер 3), с нанесёнными на них логотипом LILLY и идентификационным кодом 3105.

Содержимое капсулы: порошок белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: Антидепрессант.

Код АТХ N06AB03.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Прозак® является антидепрессантом, селективным ингибитором обратного захвата серотонина, что определяет его механизм действия. Флуоксетин практически не обладает сродством к другим рецепторам, например к α1-, α2- и β-адренергическим, серотонинергическим, дофаминергическим, гистаминергическим¹, мускариновым и ГАМК-рецепторам.

Фармакокинетика

Всасываемость и распределение. При приёме внутрь флуоксетин хорошо всасывается. Пик концентрации в плазме достигается через 6-8 часов. Флуоксетин в значительной степени связывается с белками плазмы и имеет высокий объем распределения (20-40 л/кг). Значение *St_{ах}* - 15-55 нг/мл. Равновесные концентрации в плазме достигаются после приёма препарата в течение нескольких недель. Равновесные концентрации после продолжительного приёма препарата аналогичны концентрациям, наблюдаемым на 4-5 неделе приёма препарата.

Метаболизм и выведение. Флуоксетин в значительной степени метаболизируется в печени до норфлуоксетина и ряда других неидентифицированных метаболитов, которые выводятся с мочой. Период полувыведения флуоксетина составляет от 4 до 6 дней, а его активного метаболита составляет от 4 до 16 дней.

Показания к применению

- Депрессии различной этиологии

- Нервная булимия
- Обсессивно-компульсивное расстройство
- Предменструальное дисфорическое расстройство

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к препарату
- Детский и подростковый возраст до 18 лет
- Одновременный прием ингибиторов МАО и период до 14 дней после их отмены
- Одновременный прием пимозиды
- Одновременный прием тиоридазина и период до 5 недель после его отмены

С осторожностью

Суицидальный риск: при депрессиях существует вероятность суицидальных попыток, которые могут сохраняться до наступления стойкой ремиссии. Отдельные случаи суицидальных мыслей и суицидального поведения были описаны на фоне терапии флуоксетином или вскоре после её окончания, подобно действию других препаратов близкого фармакологического действия (антидепрессантов).

Необходимо тщательное наблюдение за пациентами, относящимися к группе риска. Врачам следует убедить пациентов незамедлительно сообщать о любых мыслях и чувствах, причиняющих беспокойство; Несмотря на то, что влияние флуоксетина на возникновение подобных случаев не было установлено, данные объединённых исследований применения антидепрессантов при психических расстройствах выявили повышенный риск возникновения суицидальных мыслей и/или суицидального поведения у пациентов молодого возраста (моложе 25 лет) по сравнению с плацебо.

Лекарственная терапия пациентов с высоким риском должна сопровождаться контролем со стороны лечащего врача. Врачи должны поощрять пациентов разных возрастов сообщать о любых неприятных мыслях и чувствах, возникающих в любой момент терапии.

В ходе исследований на взрослых пациентах с большим депрессивным расстройством в обеих группах, принимающих плацебо и флуоксетин, были установлены следующие факторы риска суицида.

До лечения:

- более выраженная тяжесть депрессии,
- наличие мыслей о смерти.

Во время лечения:

- утяжеление депрессии,
- развитие бессоницы.

В ходе лечения флуоксетином фактором риска также явилось развитие тяжёлого психомоторного возбуждения (например, ажитации, акатизии, паники). Наличие или возникновение этих состояний до или во время терапии является основанием усилить клинический контроль или скорректировать проводимое лечение.

Кожная сыпь: сообщается о возникновении кожной сыпи, анафилактических реакций и прогрессирующих системных нарушений, иногда серьёзных с вовлечением в патологический процесс кожи, почек, печени и лёгких у больных, принимавших флуоксетин. При появлении кожной сыпи или других возможных аллергических реакций, этиология которых не может быть

определена, приём флуоксетина следует отменить.

Эпилептические припадки: как и в случае других антидепрессантов, флуоксетин следует с осторожностью назначать больным, у которых ранее отмечались эпилептические припадки.

Гипонатриемия: отмечались случаи гипонатриемии (в отдельных случаях концентрация натрия в сыворотке крови была менее 110 ммоль/л). В основном подобные случаи отмечались у пожилых больных и у больных, получавших диуретики вследствие уменьшения объёма циркулирующей крови.

Гликемический контроль: у больных сахарным диабетом во время лечения флуоксетином отмечалась гипогликемия, а после отмены препарата развивалась гипергликемия. В начале или после окончания лечения флуоксетином может потребоваться коррекция доз инсулина и/или гипогликемических препаратов для приёма внутрь.

Печёночная/почечная недостаточность: флуоксетин подвергается интенсивному метаболизму в печени и выводится почками. Пациентам с выраженными нарушениями функции печени рекомендуется назначать более низкие дозы флуоксетина, либо назначать препарат через день. При приёме флуоксетина в дозе 20 мг/сут на протяжении двух месяцев пациентами с выраженными нарушениями функции почек (КК <10 мл/мин), нуждающимися в гемодиализе, не было выявлено отличий концентрации флуоксетина и норфлуоксетина в плазме крови от здоровых лиц, имеющих нормальную функцию почек.

Применение в период беременности и грудного вскармливания

Беременность: известно о 2072 случаях беременности, протекавшей на фоне приема флуоксетина в первом триместре. Имеющиеся данные свидетельствуют об отсутствии нежелательного воздействия на протекание беременности или на развитие плода или новорожденного. Однако следует проявлять осторожность, особенно на поздних сроках беременности, поскольку имеются редкие сообщения о развитии синдрома отмены у новорожденного (кратковременное двигательное беспокойство, трудности при кормлении, учащенное дыхание и раздражимость), если мать принимала препарат незадолго до родов. Флуоксетин может применяться во время беременности при условии, что предполагаемая польза превышает возможный риск.

Грудное вскармливание: флуоксетин выводится с грудным молоком, следовательно, следует проявлять осторожность при назначении флуоксетина кормящим матерям.

Роды: влияние флуоксетина на процесс родов у человека не известно.

Способ применения и дозы

Депрессия. Начальная рекомендованная доза составляет 20 мг в сутки.

Булимия. Рекомендованная доза составляет 60 мг в сутки.

Обсессивно-компульсивные расстройства. Рекомендованная доза составляет 20-60 мг в сутки.

Предменструальные дисфорические расстройства. Рекомендованная доза составляет 20 мг в сутки.

Все показания. Рекомендованная доза может быть снижена или увеличена. Дозы более 80 мг/сутки систематически не изучались.

Возраст. Не существует данных о необходимости изменения доз в зависимости только от возраста.

Приём пищи. Флуоксетин можно принимать в любое время независимо от приёма пищи.

Сопутствующие заболевания и/или сопутствующее лечение. У больных с нарушениями функции печени, сопутствующими заболеваниями или принимающих другие лекарства, следует уменьшить дозы и снизить частоту приёма.

Побочное действие

Как и в случае применения других препаратов группы Селективных ингибиторов обратного захвата серотонина, на фоне использования флуоксетина отмечаются следующие нежелательные явления.

Сердечно-сосудистая система:

Часто ($\geq 1\%$ - $< 10\%$): трепетание предсердий, приливы («приливы» жара).

Нечасто ($\geq 0.1\%$ - $< 1\%$): гипотензия.

Редко ($< 0.1\%$): васкулит, вазодилатация.

Пищеварительная система:

Очень часто ($\geq 10\%$): диарея, тошнота.

Часто ($\geq 1\%$ - $< 10\%$): сухость во рту, диспепсия, рвота, анорексия (включая потерю веса).

Нечасто ($\geq 0.1\%$ - $< 1\%$): дисфагия, извращение вкуса.

Редко ($< 0.1\%$): боли по ходу пищевода.

Общее влияние на организм:

Очень часто ($\geq 10\%$): слабость (включая астению).

Часто ($\geq 1\%$ - $< 10\%$): озноб, приступы тревоги, беспокойства, зевота.

Редко ($\geq 0.1\%$ - $< 1\%$): ощущение жара, ощущение холода, недомогание, дискомфорт.

Иммунная система:

Очень редко ($< 0.1\%$): анафилактические реакции, сывороточная болезнь.

Нарушения метаболизма и питания:

Часто ($\geq 1\%$ - $< 10\%$): анорексия (включая потерю веса).

Скелетно-мышечная система:

Нечасто ($\geq 0.1\%$ - $< 1\%$): мышечные подергивания.

Нервная система:

Очень часто ($\geq 10\%$): головная боль.

Часто ($\geq 1\%$ - $< 10\%$): нарушение внимания, головокружение, летаргия, сонливость (в том числе гипер сонливость, седация), тремор.

Нечасто ($\geq 0.1\%$ - $< 1\%$): психомоторная гиперактивность, атаксия, нарушение координации, бруксизм, дискинезия, миоклонус.

Редко ($< 0.1\%$): букко-глоссальный синдром, судороги.

Психические расстройства:

Очень часто ($\geq 10\%$): бессонница (включая раннее утреннее пробуждение, начальную и среднюю бессонницу).

Часто ($\geq 1\%$ - $< 10\%$): необычные сновидения (в том числе кошмары), нервозность, напряжённость, снижение либидо (включая отсутствие либидо), эйфория, расстройство сна.

Нечасто ($\geq 0.1\%$ - $< 1\%$): деперсонализация, гипертимия, нарушение оргазма (включая аноргазмию), нарушение мышления.

Редко (<0.1%): мания, гипомания.

Кожа:

Часто (≥1% - <10%): гипергидроз, кожный зуд, сыпь (в том числе эксфолиативная, гипертермическая, эритематозная, фолликулярная, генерализованная, макулезная, макулезнопапулезная, кореподобная, папулезная, зудящая, везикулезная, эритема с пупковидным вдавлением в центре; эритема), крапивница.

Нечасто (≥0.1% - <1%): экхимоз, склонность к появлению синяков, аллопеция, холодный пот.

Редко (<0.1%): ангионевротический отёк, реакции фоточувствительности.

Органы чувств:

Часто (≥1% - <10%): нечёткость зрения.

Нечасто (≥0.1% - <1%): мидриаз.

Мочеполовая система:

Часто (≥1% - <10%): учащенное мочеиспускание (включая поллакиурию), нарушения эякуляции (в том числе отсутствие эякуляции, дисфункциональная эякуляция, ранняя эякуляция, задержка эякуляции, ретроградная эякуляция), эректильная дисфункция, гинекологические кровотечения (в том числе кровотечение из шейки матки, дисфункциональное маточное кровотечение, кровотечение из половых путей, менометроррагия, меноррагия, метроррагия, полименорея, кровотечение в пост-менопаузе, маточное кровотечение, вагинальное кровотечение).

Нечасто (≥0.1% - <1%): дизурия.

Редко (<0.1%): сексуальная дисфункция.

Спонтанные (постмаркетинговые) сообщения

Эндокринная система:

Недостаточная секреция антидиуретического гормона.

Гепатобилиарная система:

Редко (<0.1%): Идиосинкразический гепатит.

Нервная система:

Серотониновый синдром.

Мочеполовая система: приапизм.

Передозировка

Известно о 633 случаях передозировки флуоксетина у взрослых пациентов, из которых 378 полностью выздоровели; у 15 сохранялись симптомы нарушения аккомодации, походки, спутанности сознания, недоступности контакту, нервозности, нарушения функции дыхательной системы, вертиго, тремора, повышения артериального давления, нарушения потенции у мужчин, двигательных расстройств и гипомании; у 34 имелся летальный исход; сведения об остальных 206 пациентах не известны. Максимальная известная доза флуоксетина, которая принималась человеком внутрь, составляет 8 г.; данный случай передозировки завершился полным выздоровлением. Минимальная известная доза флуоксетина, прием которой сопровождался летальным исходом, однако без четко установленной причинно-следственной связи, составляет 520 мг.

Основные проявления передозировки включали судороги, сонливость, тошноту, тахикардию и рвоту.

Другие серьезные проявления, о которых сообщалось при передозировке флуоксетина (как изолированной, так и в сочетании с другими препаратами), включали кому, делирий, удлинение интервала QT и желудочковую тахикардию, в том числе мерцание-трепетание желудочков и остановку сердца, снижение артериального давления, обморок, манию,

пирексию, ступор и состояние, подобное злокачественному нейролептическому синдрому.
Лечение. Рекомендуется контролировать общее состояние и сердечную деятельность, наряду с проведением общих симптоматических и поддерживающих мероприятий/Специфический антидот неизвестен. Усиление Диуреза, диализ, гемоперфузия и перекрёстная трансфузия вряд ли принесут пользу. При лечении передозировки следует учитывать возможность применения нескольких лекарственных препаратов.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Флуоксетин и его основной метаболит норфлуоксетин имеют длительные периоды полувыведения, что необходимо учитывать при сочетании флуоксетина с другими препаратами, а также при его замене на другой антидепрессант.

Фенитоин. Были выявлены изменения концентрации фенитоина в крови при сочетании его с флуоксетином. В отдельных случаях отмечались проявления интоксикации. Увеличение дозы фенитоина или флуоксетина при их одновременном назначении следует проводить с осторожностью и под контролем клинической динамики состояния.

Серотонинергические препараты. Одновременный прием серотонинергических препаратов (например, трамадола и триптанов) способствует повышению вероятности развития серотонинового синдрома. Одновременный прием триптанов способствует также повышению вероятности развития сужения коронарных сосудов и артериальной гипертензии.

Бензодиазепины. При одновременном применении флуоксетина и бензодиазепинов возможно увеличение периода полувыведения последних. При совместном приеме алпразолама и флуоксетина наблюдалось повышение концентрации алпразолама в крови и усиление его седативного действия.

Литий и триптофан. Известно о случаях развития серотонинового синдрома при одновременном приеме СИОЗС и лития, либо триптофана, в связи с чем одновременное назначение флуоксетина с этими препаратами следует проводить с осторожностью. При одновременном приеме флуоксетина и лития необходим более частый и тщательный контроль клинического состояния.

Лекарственные препараты, метаболизируемые с участием изофермента CYP2D6 (пропафенон, карбамазепин, трициклические антидепрессанты). Следует учитывать, что метаболизм флуоксетина (как и трициклических антидепрессантов, а также селективных серотонинергических антидепрессантов) осуществляется при участии изофермента CYP2D6 системы цитохромов печени. Одновременный прием препаратов, основным путем биотрансформации которых является метаболизм при участии изофермента CYP2D6, и имеющих малый интервал терапевтических доз (такие как пропафенон, карбамазепин, трициклические антидепрессанты), следует проводить с использованием минимальных терапевтических доз. Вышеизложенное применимо также в том случае, если прошло менее 5 недель после отмены флуоксетина.

Антикоагулянты для перорального приема и другие препараты, влияющие на свертывающую систему крови (НПВП, ацетилсалициловая кислота). Известно об изменении антикоагулянтного действия (по лабораторным показателям и/или клиническим проявлениям) без какой-либо общей характерной тенденции, но с вероятностью усиления кровотечений при одновременном приеме флуоксетина и оральных антикоагулянтов. Функциональное состояние свертывающей системы крови у пациентов, получающих варфарин, должно

тщательно контролироваться при назначении и отмене флуоксетина.

Электросудорожная терапия (ЭСТ). Имеются редкие сообщения об увеличении продолжительности судорог у пациентов, принимающих флуоксетин и получающих ЭСТ, в связи с этим рекомендуется соблюдать осторожность.

Алкоголь. В экспериментальных исследованиях флуоксетин не способствовал увеличению концентрации алкоголя в крови, а также усилению эффектов алкоголя. Однако одновременный прием СИОЗС и алкоголя не рекомендуется.

Средства на основе растения Hypericum perforatum. Как применительно и к другим СИОЗС, возможно развитие фармакодинамического взаимодействия между флуоксетином и средствами на основе растения Hypericum perforatum, что может приводить к усилению нежелательного действия.

Форма выпуска: Капсулы 20 мг. Упаковка: по 14 капсул в блистер из ПВХ/фольги алюминиевой. По 1 или 2 блистера вместе с инструкцией по применению помещают в пачку картонную.

Условия хранения: Список Б. Хранить при температуре 15-30°C в защищенном от света месте. Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности: 3 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек: По рецепту.

Название и адрес производителя: «Эли Лилли Восток С.А.», Швейцария, произведено «Патеон Франс С.А.С.», Франция
Patheon France S.A.S., 40, boulevard de Champaret - 38300 Bourgoin-Jallieu
Патеон Франс С.А.С., 40 бульвар дэ Шампаре - 38300 Буржуан-Жалье

Представительство в России: Московское представительство, АО «Эли Лилли Восток С.А.», Швейцария
123317, Москва, Пресненская наб., д. 10

Проект Лекарствие (lekarstvie.ru) желает Вам здоровья!