

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
СЕЛЕКТРА

Регистрационный номер: ЛСР-008205/09

Торговое название: СЕЛЕКТРА

Международное непатентованное название: эсциталопрам

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав:

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, 5 мг содержит:

активное вещество: эсциталопрама оксалат 6,39 мг, соответствующий 5 мг эсциталопрама основания;

вспомогательные вещества: Просолв SMCC®90/HD90 73,71 мг (целлюлоза микрокристаллическая 72,24 мг + кремния диоксид 1,47 мг); натрия кроскармеллоза 4,5 мг, тальк 4,5 мг, магния стеарат 0,9 мг;

пленочное покрытие: Опадрай белый (Opadry 03F28446 White) около 2,7 мг: гипромеллоза бсР 1,64 мг, титана диоксид 0,66 мг, макрогол 6000 0,4 мг.

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, 10 мг содержит:

активное вещество: эсциталопрама оксалат 12,78 мг, соответствующий 10 мг эсциталопрама основания;

вспомогательные вещества: Просолв SMCC®90/HD90 147,42 мг (целлюлоза микрокристаллическая 144,47 мг + кремния диоксид 2,95 мг); натрия кроскармеллоза 9 мг, тальк 9 мг, магния стеарат 1,8 мг;

пленочное покрытие: Опадрай белый (Opadry 03F28446 White) около 5,4 мг: гипромеллоза бсР 3,29 мг, титана диоксид 1,31 мг, макрогол 6000 0,8 мг.

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, 15 мг содержит:

активное вещество: эсциталопрама оксалат 19,17 мг соответствующий 15 мг эсциталопрама основания;

вспомогательные вещества: Просолв SMCC®90/HD90 221,13 мг (целлюлоза микрокристаллическая 216,71 мг + кремния диоксид 4,42 мг); натрия кроскармеллоза 13,5 мг, тальк 13,5 мг, магния стеарат 2,7 мг;

пленочное покрытие: Опадрай белый (Opadry 03F28446 White) около 8,1 мг: гипромеллоза бсР 4,93 мг, титана диоксид 1,97 мг, макрогол 6000 1,2 мг.

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, 20 мг содержит:

активное вещество: эсциталопрама оксалат 25,56 мг соответствующий 20 мг эсциталопрама основания;

вспомогательные вещества: Просолв SMCC®90/HD90 294,84 мг (целлюлоза микрокристаллическая 288,94 мг + кремния диоксид 5,9 мг); натрия кроскармеллоза 18 мг, тальк 18 мг, магния стеарат 3,6 мг;

пленочное покрытие: Опадрай белый (Opadry 03F28446 White) около 10,8 мг: гипромеллоза бсР 6,57 мг, титана диоксид 2,63 мг, макрогол 6000 1,6 мг.

Описание:

Таблетки 5 мг: круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета с гравировкой 'E' с одной стороны.

Таблетки 10 мг: овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, с гравировкой 'E' с одной стороны, риской с другой стороны и боковыми рисками.

Таблетки 15 мг: овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета с гравировкой 'E-' с одной стороны, риской с другой стороны и боковыми рисками.

Таблетки 20 мг: овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета с гравировкой 'E' с одной стороны, риской с другой стороны и боковыми рисками.

Фармакотерапевтическая группа: антидепрессант

Код АТХ: N06AB10

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Эсциталопрам является антидепрессантом, селективным ингибитором 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-HT₂ рецепторы, дофаминовые D₁ и D₂ рецепторы, α₁-, α₂-, β-адренергические рецепторы, гистаминовые H₁, мускариновые холинергические, бензодиазепиновые и опиатные рецепторы.

Фармакокинетика

Всасывание не зависит от приема пищи. Биодоступность эсциталопрама составляет около 80%. Среднее время достижения максимальной концентрации в плазме крови (T_{max}) составляет около 4 часов. Кажущийся объем распределения (V_{d,β}/F) после перорального применения составляет от 12 до 26 л/кг. Связывание эсциталопрама и его основных метаболитов с белками плазмы крови около 80%. Эсциталопрам метаболизируется в печени до деметилированного и дидеметилированного метаболитов. Они оба 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 с помощью цитохрома CYP2C19. Возможно некоторое участие изоферментов CYP3A4 и CYP2D6. У лиц со слабой активностью CYP2C19 концентрация эсциталопрама может быть в два раза выше, чем в случаях с высокой активностью этого изофермента. Значительных изменений концентрации препарата в случаях со слабой активностью изофермента CYP2D6 обнаружено не было.

Период полувыведения (T_{1/2}) после многократного применения составляет около 30 часов. Клиренс при пероральном применении составляет около 0,6 л/мин. У основных метаболитов эсциталопрама период полувыведения более продолжителен. Эсциталопрам и его основные метаболиты выводятся печенью (метаболический путь) и почками.

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.

У пожилых (старше 65 лет) эсциталопрам выводится медленнее по сравнению с молодыми пациентами. Количество вещества, находящегося в системном кровотоке, рассчитанное с помощью фармакокинетического показателя площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) у пожилых на 50% больше, чем у молодых здоровых добровольцев.

Показания к применению

- депрессивные расстройства любой степени тяжести;
- панические расстройства с/без агорафобии.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к препарату или его компонентам, детский и юношеский возраст (до 18 лет), одновременный приём с ингибиторами моноаминоксидазы (МАО), беременность, период грудного вскармливания.

С осторожностью: почечная недостаточность (клиренс креатинина (КК) ниже 30 мл/мин), гипомания, маниакальные расстройства, фармакологически неконтролируемая эпилепсия, депрессия с суицидальными попытками, сахарный диабет, пожилой возраст, цирроз печени, склонность к кровотечениям; одновременный прием с лекарственными средствами, снижающими порог судорожной готовности, вызывающими гипонатриемию; этанолом; лекарственными средствами, метаболизирующимися с участием системы CYP2C19.

Способ применения и дозы

Внутрь. Препарат назначают взрослым один раз в сутки вне зависимости от приема пищи.

Депрессивные расстройства

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.

Пожилые пациенты (старше 65 лет)

Рекомендуется использовать половину обычной рекомендуемой дозы (т.е. всего 5 мг/сут) и более низкую максимальную дозу (10 мг/сут).

Сниженная функция почек

При легкой и умеренной почечной недостаточности корректировки доз не требуется. Пациентам с выраженной почечной недостаточностью (КК ниже 30 мл/мин) следует назначать препарат с минимальных терапевтических доз, постепенно их увеличивая с учетом переносимости и эффективности препарата.

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.

Сниженная активность цитохрома CYP2C19

Для пациентов со слабой активностью изофермента CYP2C19 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 доза должна постепенно снижаться в течение 1-2 недель для того, чтобы избежать возникновения синдрома отмены.

Побочное действие

Побочные эффекты наиболее часто возникают на 1 или 2 неделе лечения, затем обычно становятся менее интенсивными и возникают реже при продолжении терапии.

Со стороны центральной нервной системы (ЦНС): головокружение, слабость, бессонница или сонливость, судороги, тремор, двигательные нарушения, серотониновый синдром (ажитация, тремор, миоклонус, гипертермия), галлюцинации, маниакальные расстройства, спутанность сознания, ажитация, тревога, деперсонализация, панические атаки, повышенная раздражительность, расстройства зрения.

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), галакторея.

Со стороны мочеполовой системы: снижение либидо, импотенция, нарушение эякуляции, аноргазмия (у женщин), задержка мочи.

Со стороны кожных покровов: кожная сыпь, зуд, экхимоз, пурпура, ангионевротический отек.

Аллергические реакции: анафилактические реакции.

Лабораторные показатели: гипонатриемия, изменение лабораторных показателей функции печени.

Прочие: повышенная потливость, гипертермия, синуситы, артралгия, миалгия.

Кроме того, после длительного применения резкое прекращение терапии препаратом СЕЛЕКТРА 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, сонливость, помрачение сознания, судорожные припадки, тахикардия, изменения ЭКГ (изменение сегмента S-T, зубца T, расширение комплекса QRS, удлинение QT интервала), аритмии, угнетение дыхательной деятельности, рвота, рабдомиолиз, метаболический ацидоз, гипокалиемия, очень 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 моноаминоксидазы (МАО)

Возможно возникновение серьезных нежелательных реакций при одновременном приеме препарата СЕЛЕКТРА и ингибиторов МАО, а также при приеме ингибиторов МАО больными, незадолго до этого прекратившими прием препарата. В подобных случаях может развиваться серотониновый синдром.

Эсциталопрам нельзя назначать одновременно с ингибиторами МАО. Эсциталопрам может быть назначен через 14 дней после прекращения лечения необратимыми ингибиторами МАО и как минимум через 1 день после прекращения терапии обратимым ингибитором МАО типа А - моклобемидом. Как минимум 7 дней должно пройти после окончания приема эсциталопрама прежде чем можно начинать лечение неселективными ингибиторами МАО.

Серотонинергические лекарственные средства

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

Лекарственные средства, снижающие порог судорожной готовности

СЕЛЕКТРА может снижать порог судорожной готовности. Требуется проявлять осторожность при одновременном назначении с другими лекарственными средствами, снижающими порог судорожной готовности (трициклическими антидепрессантами, другими СИОЗС, нейролептиками (фенотиазинами, производными тиоксантена и бутирофенона), мефлохином и трамадолом).

Литий, триптофан

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

Зверобой продырявленный (Hypericum perforatum)

Одновременное назначение эсциталопрама и препаратов, содержащих зверобой продырявленный (*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.

Этанол

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

Влияние других лекарственных препаратов на фармакокинетику эсциталопрама

Совместный прием с лекарственными препаратами, ингибирующими цитохром СYP2C19, может повышать концентрацию эсциталопрама в плазме крови. Необходимо проявлять осторожность при одновременном использовании эсциталопрама с подобными препаратами, например, омепразолом. Может потребоваться уменьшение дозы

эсциталопрама.

С осторожностью следует назначать высокие дозы эсциталопрама одновременно с высокими дозами циметидина, являющегося сильным ингибитором цитохромов CYP2D6, CYP3A4 и CYP1A2.

Влияние эсциталопрама на фармакокинетику других лекарственных препаратов

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, пропafenона и метопролола (в случаях применения при сердечной недостаточности) или медицинских препаратов, в основном метаболизирующихся посредством CYP2D6 и действующих на ЦНС, например, антидепрессантов - дезипрамина, кломипрамина, нортриптилина, или антипсихотических средств - рисперидона, тиоридазина, галоперидола. В этих случаях может потребоваться корректировка 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 медицинских препаратов, метаболизирующихся CYP2C19.

Особые указания

При применении препаратов, принадлежащих к терапевтической группе СИОЗС, включая эсциталопрам, следует учитывать следующее:

У некоторых пациентов с паническим расстройством в начале лечения СИОЗС может наблюдаться усиление тревоги. Подобная парадоксальная реакция обычно исчезает в течение двух недель лечения. Чтобы снизить вероятность возникновения анксиогенного эффекта рекомендуется использовать низкие начальные дозы.

Следует отменить препарат в случае развития судорожных припадков. Не рекомендуется применение у больных с неконтролируемой эпилепсией; при контролируемых припадках необходимо тщательное наблюдение. При увеличении частоты судорожных припадков СИОЗС, включая эсциталопрам, должны быть отменены.

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

У пациентов с сахарным диабетом лечение эсциталопрамом может изменить уровень глюкозы в крови (возможна как гипогликемия, так и гипергликемия). Поэтому может потребоваться корректировка доз инсулина и/или пероральных гипогликемических препаратов.

Риск совершения самоубийства свойственен депрессии и может сохраняться до существенного улучшения 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 развития депрессии.

В ряде случаев при лечении антидепрессантами группы СИОЗС отмечалось повышение риска развития суицидальных мыслей и поведения у детей, подростков и молодых людей младше 24 лет по сравнению с плацебо.

Гипонатриемия, возможно, связанная с нарушением секреции АДГ, на фоне приема эсциталопрама возникает редко и обычно исчезает при отмене терапии. Осторожность должна проявляться при назначении эсциталопрама и других СИОЗС лицам, входящим в группу риска развития гипонатриемии: пожилым, больным циррозом печени и принимающим препараты, способные вызывать гипонатриемию.

При приеме эсциталопрама возможно развитие подкожных кровоизлияний (экхимозов и пурпур). Необходимо с осторожностью применять эсциталопрам у больных со склонностью к кровотечениям, а также принимающих пероральные антикоагулянты и другие лекарства, влияющие на свертываемость крови.

Поскольку клинический опыт одновременного применения эсциталопрама и электросудорожной терапии ограничен, то в подобных случаях должна соблюдаться осторожность.

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

У больных, принимающих эсциталопрам и другие СИОЗС одновременно с серотонинергическими препаратами, в редких случаях может развиваться серотониновый синдром. Необходимо с осторожностью применять эсциталопрам одновременно с лекарственными средствами, обладающими серотонинергическим действием. Комбинация таких симптомов как ажитация, тремор, миоклонус, гипертермия, может указывать на развитие серотонинового синдрома. Если это произошло, СИОЗС и серотонинергические препараты должны быть немедленно отменены и назначено симптоматическое лечение.

Влияние на способность управлять автомобилем или механизмами

В процессе лечения препаратом больным следует избегать выполнения потенциально опасных видов деятельности, требующих высокой скорости психомоторных реакций, таких как вождение автомобиля или управление механизмами.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 5, 10, 15 и 20 мг.

По 10 или 14 таблеток в блистер ПВХ/ПВДХ/алюминиевая фольга.

1, 2, 3 блистера по 10 таблеток или 1, 2, 4 блистера по 14 таблеток вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.

По 10 блистеров вместе с инструкциями по применению в картонную коробку (для стационаров).

Условия хранения

При температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности

24 месяца.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

«АКТАВИС Лтд.»

В 16 Булебель Инд. Эстейт,

Зейтун ЗТН 08, Мальта

Претензии по качеству направлять по адресу:

ООО «Эбботт Лэбораториз»

125171, г. Москва, Ленинградское шоссе, дом 16 А, стр. 1

Тел.: +7 (495) 258 42 80

Факс: +7 (495) 258 42 81

abbott-russia@abbott.com