

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
ДЕПРЕФОЛТ

Регистрационный номер и дата:

Торговое название: Депрефолт

Международное непатентованное название: сертралин

Лекарственная форма: таблетки, покрытые оболочкой

Состав

1 таблетка 50 мг содержит:

Активное вещество: сертралина гидрохлорида 55,95мг (в пересчете на сертралин - 50мг)

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный, микрокристаллическая целлюлоза, натрия кроскармеллоза, коповидон, лактозы моногидрат, магния стеарат, Опадрай белый Y-5-7068, гипромеллоза 3сР, гидроксипропилцеллюлоза, титана диоксид, макрогол/PEG 400, гипромеллоза 50сР.

1 таблетка 100 мг содержит:

Активное вещество: сертралина гидрохлорида 111,9 мг (в пересчете на сертралин - 100мг)

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный, микрокристаллическая целлюлоза, натрия кроскармеллоза, коповидон, лактозы моногидрат, магния стеарат, Опадрай белый Y-5-7068, гипромеллоза 3сР, гидроксипропилцеллюлоза, титана диоксид, макрогол/PEG 400, гипромеллоза 50сР.

Описание

Овальные, двояковыпуклые, покрытые оболочкой таблетки, белого или почти белого цвета, с риской с одной стороны, с боковыми рисками и с гравировкой «50» (для таблеток 50 мг) и «100» (для таблеток 100 мг) с другой стороны.

Фармакотерапевтическая группа: антидепрессант

Код АТХ: N06AB06

Фармакодинамика

Механизм действия.

Сертралин - селективный ингибитор обратного захвата серотонина (5-НТ). Он оказывает очень слабое влияние на обратный захват норадреналина и допамина. В терапевтических дозах сертралин блокирует захват серотонина в тромбоцитах человека. Он не оказывает стимулирующего, седативного или антихолинергического действия. Сертралин не обладает сродством к мускариновым (холинергическим), серотонинергическим, допаминергическим, адренергическим, гистаминергическим, ГАМК- или бензодиазепиновым рецепторам.

Антидепрессивный эффект отмечается к концу второй недели регулярного приема сертралина, тогда как максимальный эффект достигается только через 6 недель. В отличие от трициклических антидепрессантов, при назначении сертралина не происходит увеличения

массы тела. Сертралин не вызывает психической или физической лекарственной зависимости.

Фармакокинетика

Всасывание сертралина из желудочно-кишечного тракта значительное, но происходит медленно. Максимум концентрации в плазме крови достигается через 4,5-8,4 часа после приема препарата внутрь. Равновесная концентрация сертралина в плазме крови достигается в пределах недели при однократном ежедневном приеме. Биодоступность во время приема пищи повышается на 25%, при этом время достижения максимальной концентрации укорачивается.

Распределение. Общее связывание сертралина с белками плазмы составляет 98%. Объем распределения >20л/кг.

Метаболизм и выведение. Сертралин подвергается интенсивному метаболизму при первом прохождении через печень, подвергаясь N-деметилованию. Его основной метаболит - N-десметилсертралин менее активен по сравнению с исходным соединением. Метаболиты выделяются с мочой и калом в равных количествах. Около 0,2% сертралина выводится почками в неизменном виде. Время полувыведения препарата составляет 22-36 часов и не зависит от возраста или пола. Для N-десметилсертралина этот показатель составляет 62-104 часа.

Время полувыведения сертралина и площадь под кривой концентрации в плазме крови (AUC) увеличиваются при нарушении функции печени. Независимо от выраженности почечной недостаточности фармакокинетика сертралина при его постоянном применении не изменяется.

Сертралин проникает в грудное молоко. Данных о его способности проходить через гемато-плацентарный барьер нет.

Сертралин не диализируется.

Показания к применению

- Депрессии различной этиологии (лечение и профилактика),
- Обсессивно-компульсивные расстройства (ОКР)
- Панические расстройства (с агорофобией или без).
- Посттравматические стрессорные расстройства (ПТСР).

Противопоказания

- повышенная чувствительность к активному веществу или другим ингредиентам, входящим в состав препарата,
- совместное применение сертралина и ингибиторов MAO. При замене одного препарата на другой следует воздержаться от приема антидепрессантов в течение 14 дней,
- совместное применение сертралина с триптофаном или фенфлурамином
- нестабильная эпилепсия,
- детский возраст до 6 лет;

С осторожностью: органические заболевания головного мозга (в т.ч. задержка умственного развития), маниакальные состояния, эпилепсия, печеночная и/или почечная недостаточность, снижение массы тела, у детей старше 6 лет.

Беременность и грудное вскармливание:

Контролируемых результатов применения сертралина у беременных женщин нет, поэтому назначать им препарат стоит только в том случае, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Женщинам репродуктивного возраста, которым предполагается назначить сертралин, следует рекомендовать воспользоваться эффективными контрацептивными средствами. Сертралин обнаруживается в грудном молоке. Применение препарата в период грудного вскармливания не рекомендуется. Если же лечение все же необходимо, то кормление грудью лучше прекратить.

Способ применения и дозы

Депрессии и ОКР

Взрослые

Начальная доза составляет 50 мг один раз в день, утром или вечером. Дневную дозу можно постепенно, не раньше, чем через неделю увеличить с 50 мг, до максимальной ежедневной дозы в 200 мг (на 50 мг в неделю).

Дети

Для детей от 6 до 12 лет начальная доза составляет 25 мг сертралина один раз в день, утром или вечером. Через неделю, можно увеличить дозу до 50 мг один раз в день.

Для детей от 12 до 17 лет начальная доза составляет 50 мг один раз в день, утром или вечером. Дневную дозу можно постепенно, не раньше, чем через неделю увеличить с 50 мг, до максимальной ежедневной дозы в 200 мг.

Панические расстройства и ПТСР

Начальная доза составляет 25 мг один раз в день, утром или вечером. Через неделю можно увеличить дозу до 50 мг сертралина один раз в день, а затем постепенно, не раньше, чем через неделю, дневную дозу можно постепенно увеличить с 50 мг до максимальной ежедневной дозы в 200 мг.

Удовлетворительный терапевтический результат достигается обычно через 7 дней от начала лечения. Для достижения полного терапевтического эффекта требуется регулярный приём препарата в течение 2-4 недель. У больных с обсессивно-компульсивными расстройствами для достижения хорошего результата может потребоваться 8-12 недель. Минимальная доза, обеспечивающая лечебное действие, сохраняется в дальнейшем как поддерживающая (профилактическая).

Пожилые больные

Не требуется коррекция режима дозирования.

Больные с нарушениями функции печени

При тяжелом расстройстве функции печени следует уменьшить дозу препарата или же увеличить интервалы между приёмами.

Больные с нарушением функции почек

У больных с нарушениями функции почек специально подбирать дозу не требуется (см. «**Особые указания**»).

Побочное действие

Со стороны ЦНС: возможны головокружение, сонливость, головная боль, бессонница, слабость, повышенное потоотделение, тремор, гипомания, мания, экстрапирамидные расстройства, тревога, агитация, нарушение зрения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - покраснение кожи с ощущением жара или тепла, ощущение сердцебиения.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, снижение аппетита, диспепсические расстройства (метеоризм, тошнота, рвота, диарея), боль в животе, снижение массы тела.

Со стороны обмена веществ: гиперпролактинемия, галакторея.

Со стороны репродуктивной системы: редко - нарушения менструального цикла, расстройства эякуляции, снижение либидо.

Аллергические реакции: редко - повышение температуры, кожная сыпь, крапивница или зуд, мультиформная эритема.

При прекращении лечения сертралином описаны редкие случаи синдрома отмены. Могут появляться парестезии, гипостезии, симптомы депрессии, галлюцинации, агрессивные реакции, психомоторное возбуждение, беспокойство или симптомы психоза, которые невозможно отличить от симптомов основного заболевания.

Передозировка

Тяжелых симптомов при передозировке сертралина не выявлено даже при назначении препарата в больших дозах. Однако при одновременном введении с другими препаратами или этанолом может возникать тяжелое отравление.

Передозировка может вызвать серотониновый синдром с тошнотой, рвотой, сонливостью, тахикардией, ажитацией, головокружением, психомоторным возбуждением, диареей, повышенным потоотделением, миоклонусом и гиперрефлексией.

Лечение: специфических антидотов нет. Требуется интенсивная поддерживающая терапия и постоянное наблюдение за жизненно важными функциями организма. Вызывать рвоту не рекомендуется. Введение активированного угля может быть более эффективным, чем промывание желудка. Необходимо поддерживать проходимость дыхательных путей. У сертралина большой объем распределения, в связи с этим усиление диуреза, проведение диализа, гемоперфузии или переливание крови может оказаться безрезультатным.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Ингибиторы моноаминоксидазы (ИМАО). Отмечаются тяжелые осложнения при одновременном применении сертралина и ИМАО (включая избирательно действующие (селегилин) ИМАО и с обратимым типом действия (моклобемид). Возможно развитие серотонинового синдрома. Аналогичные осложнения, иногда со смертельным исходом, возникают при назначении ИМАО на фоне лечения антидепрессантами, угнетающими нейрональный захват моноаминов или сразу после их отмены.

При одновременном применении избирательных ингибиторов обратного нейронального захвата серотонина и ИМАО возникают: гипертермия, ригидность, миоклонус, лабильность вегетативной нервной системы (быстрые колебания параметров дыхательной и сердечно-сосудистой системы), изменения психического статуса, включая повышенную раздражительность, выраженное возбуждение, спутанность сознания, которое в некоторых случаях может перейти в делириозное состояние или кому.

Лекарственные средства, угнетающие центральную нервную систему и этанол. Комбинированное применение сертралина и веществ, угнетающих центральную нервную систему, требует пристального внимания, а также запрещено употребление спиртных напитков во время лечения сертралином.

Производные кумарина - при их совместном назначении с сертралином отмечается значительное увеличение протромбинового времени - в этих случаях рекомендуется контролировать протромбиновое время в начале лечения сертралином и после его отмены.

Фармакокинетическое взаимодействие

Сертралин связывается с белками плазмы крови. Поэтому необходимо учитывать возможность его взаимодействия с другими препаратами, связывающимися с белками (например: диазепамом, толбутамидом и варфарином).

Циметидин: одновременное применение в значительной степени снижает клиренс сертралина.

Лекарственные средства, метаболизируемые изоэнзимом 2D6 цитохрома P450: длительное лечение сертралином в дозе 50 мг в сутки сопровождается увеличением концентрации дезипрамина.

Лекарственные средства, метаболизируемые другими ферментными системами цитохрома P450. Эксперименты по изучению взаимодействия *in vitro* показали, что осуществляемое изоэнзимом CYP 3A3/4 бетагидроксилирование эндогенного кортизола, а также метаболизм карбамазепина и терфенадина при длительном назначении сертралина в дозе 200 мг в сутки не изменяются. Концентрация в плазме крови толбутамида, фенитоина и варфарина при длительном назначении сертралина в той же дозе также не изменяется. Таким образом, можно сделать заключение, что сертралин не угнетает изоэнзим CYP 2C9.

Сертралин не влияет на концентрацию диазепاما в сыворотке крови, что говорит об отсутствии ингибирования изоэнзима CYP 2C19. По данным исследований *in vitro* сертралин практически не влияет или минимально угнетает изоэнзим CYP 1A2.

Литий. Фармакокинетика лития не изменяется при сопутствующем введении сертралина. Однако, тремор наблюдается чаще при их совместном применении. Также как и назначение других избирательных ингибиторов обратного нейронального захвата серотонина,

совместное применение сертралина с лекарственными средствами, влияющими на серотонинергическую передачу (например, с литием), требует повышенной осторожности.

Препараты, влияющие на серотонинергическую передачу. При замене одного ингибитора нейронального захвата серотонина на другой нет необходимости в «периоде отмывания». Однако требуется соблюдать осторожность при изменениях курса лечения. Следует избегать совместного назначения триптофана или фенфлурамина с сертралином.

Индукция микросомальных ферментов печени. Сертралин вызывает минимальную индукцию ферментов печени. Одновременное назначение сертралина и антипирина в дозе 200 мг приводит к достоверному уменьшению периода полувыведения антипирина, хотя возникает это всего в 5 % наблюдений.

Атеиолол: при совместном введении сертралина не изменяет его р-адрен о блокирующее действие.

Глибеикламид и дигоксин: при введении сертралина в суточной дозе 200 мг лекарственного взаимодействия с этими препаратами не выявлено.

Особые указания

Сертралин не следует назначать совместно с ИМАО, а также в течение 14 дней после прекращения лечения ИМАО. Аналогично после отмены сертралина в течение 14 дней не назначают ИМАО.

У больных, подвергающихся электросудорожной терапии, достаточный опыт применения сертралина отсутствует. Возможный успех или риск подобного комбинированного лечения не изучен.

Больные, страдающие депрессией, являются группой риска в отношении суицидальных попыток. Эта опасность сохраняется до развития ремиссии. Поэтому от начала лечения до достижения оптимального клинического эффекта за больным следует установить постоянное медицинское наблюдение.

При длительном применении в редких случаях (0,8 % наблюдений) возникает асимптоматическое повышение активности трансаминаз в сыворотке крови. Отмена препарата приводит к нормализации активности ферментов печени.

Во время лечения сертралином может возникать транзиторная гипонатриемия. Это чаще развивается у пожилых больных, а также при приеме диуретиков или ряда других препаратов. Подобный побочный эффект связывают с синдромом неадекватной секреции антидиуретического гормона.

Влияние на способность к вождению автотранспорта или управлению механизмами:

Применение препарата, как правило, не сопровождается нарушением психомоторных функций. Однако его применение одновременно с другими лекарственными средствами может привести к нарушению внимания и координации движений. Поэтому во время лечения сертралином управлять транспортными средствами, специальной техникой или заниматься деятельностью, связанной с повышенным риском не рекомендуется.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые оболочкой. 50 мг и 100 мг. По 10 таблеток в блистер. По 1, 2 или 3 блистера с инструкцией по применению в пачку.

По 10, 20, 40, 60 блистеров вместе с инструкциями по применению в картонную коробку (для стационаров).

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

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

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

ФИРМА ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

АО «АКТАВИС», Исландия
Рейкьявикурвегур 76-78, П.О.Бокс 420,
222 Хафнарфьердур, Исландия.

Представлено в России:

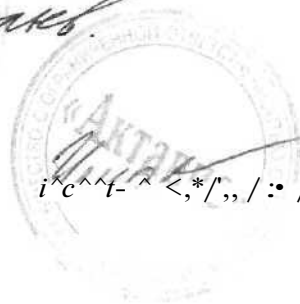
Представительство АО «Актавис» в г. Москве
127051, Москва, Ул. Трубная, д 17/4, строение 2.
Тел (095) 232-40-90, Факс (095) 232-40-91

Директор ИДКЭЛС
профессор



В. В. Чельцов

Представитель фирмы



С. А. Чекалова