

ФЛУОКСЕТИН

1. Флуоксетин.

2. Профлузак, Флуоксетин-Акри капсулы, Апо-Флуоксетин, Флуоксетин Ланнахер, Флоксет, Продеп, Биоксетин, Фрадекс, Депренон, Флуоксетин, Портал, Прозак, Флувал.

3. Средства, влияющие на центральную нервную систему (Антидепрессанты и средства нормотимического действия).

4. Антидепрессивное средство.

Улучшает настроение, снижает напряженность, тревожность и чувство страха, устраняет дисфорию. Не вызывает ортостатической гипотензии, седативного эффекта, не кардиотоксичен.

Приводит к снижению аппетита, может вызывать потерю массы тела пропорционально степени тучности до начала применения препарата (в соответствии с индексом массы тела).

5. Эффект доказан при депрессиях различной этиологии. Флуоксетин по силе антидепрессивного действия не отличается от трициклических антидепрессантов, но имеет меньше побочных эффектов и осложнений.

6. Цена за 1 капсулу (10 мг) от 2,23 до 2,73 руб.[1]; за 1 капсулу (20 мг) – 3,65 руб.[2].

7. Селективный ингибитор обратного захвата серотонина (5-гидрокситриптамин, 5-HT) в центральной нервной системе и не влияет на захват норадреналина. Флуоксетин прямо не взаимодействует с серотониновыми, м-холинергическими, гистаминовыми H_1 - рецепторами или α - адренорецепторами. Не вызывает снижения функциональной активности постсинаптических β - адренорецепторов.

Абсорбция - высокая, время, необходимое для достижения максимальной концентрации после приема внутрь 40 мг - 6-8 ч, значение максимальной концентрации - 15-55 нг/мл. Капсулы и водный раствор препарата биоэквивалентны, прием пищи не влияет на биодоступность.

Связь с белками плазмы – 94,5% (включая альбумин и α_1 -гликопротеин).

Объем распределения - высокий, легко проникает через гематоэнцефалический барьер

Обе энантиомерные формы эквиеффективны, но S-флуоксетин выводится медленнее и преобладает над R-формой при равновесной концентрации. В печени энантиомеры метаболизируются до активного метаболита - норфлуоксетина. Метаболиты выводятся почками (80%) и с каловыми массами (15%), преимущественно в виде глюкуронидов. Является ингибитором ферментной системы CYP2C19, CYP3A2D6 и CYP3A3, CYP3A5, CYP3A7. $T_{1/2}$ флуоксетина - 1-4 сут при однократном приеме и 4-6 сут - после достижения C_{ss}.

Период полувыведения норфлуоксетина при однократном приеме и после достижения равновесной концентрации - 4-16 сут, что вызывает значительную кумуляцию активных форм, медленное достижение их равновесной концентрации в плазме и длительное присутствие в организме после отмены. У больных с циррозом печени период полувыведения удлинится в 3-4 раза.

8. Депрессии (независимо от степени депрессивного расстройства - слабая, умеренная, тяжелая), булимия, анорексия, алкоголизм, навязчивые состояния.

9. Гиперчувствительность, хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 10 мл/мин), выраженная печеночная недостаточность, суицидальная настроенность, одновременный прием ингибиторов MAO (в предшествующие 2 недели), беременность, период лактации.

С осторожностью применяют при сахарном диабете, эпилептическом синдроме различного генеза и эпилепсии (в т.ч. в анамнезе), болезни Паркинсона, компенсированных почечной или печеночной недостаточности, кахексии.

10. Стойкий клинический эффект наступает через 1-2 недели лечения.

При депрессивных состояниях уменьшение двигательной заторможенности, улучшение настроения, нормализация сна, пищеварения и других соматических функций, стимулирующее влияние на общий тонус организма. Анальгезирующий эффект при хронических и периодических болевых синдромах. Уменьшение симптомов анорексии и булимии.

11. Препарат назначается внутрь, при депрессии начальная доза - 20 мг/сут 1 раз, утром; при необходимости еженедельно дозу увеличивают на 20 мг/сут. Максимальная суточная доза - 80 мг в 2-3 приема.

При булимии - 60 мг в 3 приема, при навязчивых состояниях - 20-60 мг/сут. Поддерживающая терапия - 20 мг/сут. Курс лечения - 3-4 недели.

DDD=20 мг (перорально).

12. Симптомы: тошнота, рвота, агитация, двигательное беспокойство, гипоманиакальное состояние (необычное возбуждение), эпилептические припадки.

Лечение: симптоматическое и поддерживающее - промывание желудка, назначение активированного угля, поддержание дыхания, сердечной деятельности (контроль электрокардиограммы), температуры тела; при судорогах применение анксиолитических лекарственных средств (транквилизаторов). Форсированный диурез, гемодиализ не эффективны.

13. При лечении больных с дефицитом массы тела следует учитывать анорексигенные эффекты (возможна прогрессирующая потеря массы тела).

У больных сахарным диабетом назначение флуоксетина повышает риск развития гипогликемии и гипергликемии - при его отмене. В связи с этим доза инсулина или любых других гипогликемических лекарственных средств, применяемых внутрь, должна быть скорректирована. До наступления значительного улучшения в лечении больные должны находиться под наблюдением врача.

Интервал между окончанием терапии ингибиторами MAO и началом лечения флуоксетином должен составлять как минимум 14 дней; между окончанием лечения флуоксетином и началом терапии ингибиторами моноаминоксидазы - не менее 5 недель.

14. При заболеваниях печени, почек и в пожилом возрасте лечение следует начинать с 1/2 дозы – 10 мг в сутки, не превышая 60 мг в сутки.

Препарат следует назначать во время беременности только в том случае, если потенциальная польза терапии для матери значительно превышает потенциальный риск для плода.

При применении в период лактации кормление грудью следует прекратить.

Безопасность и эффективность применения для детей до 18 лет не определены.

15. Головокружение, головная боль, сонливость или бессонница, вялость, повышенная утомляемость, астения, тремор, агитация, тревожность, суицидальная наклонность (свойственная больным с депрессивными расстройствами), мания или гипомания; снижение аппетита, сухость во рту или гиперсаливация, тошнота, диарея; аллергические реакции (кожная сыпь, крапивница); повышенное потоотделение, похудание, снижение либидо, системные нарушения со стороны легких, почек или печени, васкулиты.

16. Лекарственные средства, оказывающие угнетающее влияние на центральную нервную систему и этанол повышают риск развития побочных эффектов и усиления угнетающего действия на центральную нервную систему.

При одновременном применении с лекарственными средствами, обладающими высокой степенью связывания с белками, особенно с антикоагулянтами и дигитоксинами, возможно повышение концентрации в плазме свободных (несвязанных) лекарственных средств и увеличение риска развития неблагоприятных эффектов.

Ингибиторы MAO повышают риск развития серотонинового синдрома (гипертермия, озноб, повышенное потоотделение, миоклонус, гиперрефлексия, тремор, диарея, нарушения координации движений, вегетативная лабильность, возбуждение, бред и кома).

Повышает в плазме концентрацию фенитоина, трициклических антидепрессантов, мапротилина, тразодона в 2 раза (необходимо на 50% снижать дозу трициклических антидепрессантов при одновременном применении).

Триптофан усиливает серотонинергические свойства флуоксетина (усиление ажитации, двигательного беспокойства, нарушений со стороны желудочно-кишечного тракта).

Усиливает эффекты алпразолама, диазепамы и гипогликемических лекарственных средств.

Концентрация лития может изменяться, приводя к возникновению токсичности.

На фоне проведения электросудорожной терапии возможно развитие продолжительных эпилептических припадков.

17. Не применяется.

18. Во время лечения следует воздерживаться от приема алкоголя и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психических и двигательных реакций.

При появлении кожной сыпи или крапивницы следует прекратить прием флуоксетина и как можно скорее проконсультироваться с врачом.

Следует соблюдать осторожность при резком переходе в вертикальное положение из положения «лежа» или «сидя» (возможно головокружение).

При сухости во рту для облегчения состояния рекомендуется использовать не содержащие сахара жевательную резинку и леденцы, частое питье (если сухость во рту сохраняется более 2 недель, необходима консультация терапевта или стоматолога).

Для достижения антидепрессивного действия может потребоваться 4 недели терапии или более.

Не принимать пропущенную дозу и продолжить лечение в соответствии с принятой схемой, начиная со следующей дозы; не удваивать дозы.

19. Пациент должен дать согласие на лечение возможных осложнений.

20. Капсулы 10, 20 мг (упаковки ячейковые контурные).

Фирмы: Акрихин ХФК ОАО, Петрохим ЗАО, Россия; Apotex Inc, Канада; Lannacher Heilmittel GmbH, Австрия; Egis Pharmaceuticals Ltd, Венгрия; Sun Pharmaceutical Industries Ltd, Индия; Sanofi-Biocom Ltd, Польша; Gedeon Richter Ltd, Венгрия; J.S.C. Slovafarma, Словацкая Республика; Nu-Pharm Inc, Канада; Lek d.d., Словения; Eli Lilly and Company Limited, Великобритания; KRKA d.d., Словения; ГУ-Экспериментальное производство медико-биологических препаратов; Российский кардиологический научно-производственный комплекс, Россия.

21. Список Б. Хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте, при комнатной температуре, предпочтительно при 15-30⁰ С.