

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування препарату
СТИМУЛОТОН®
(STIMULOTON®)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: sertraline; (1S-цис)-4-(3,4-дихлорфеніл)-1,2,3,4-тетрагідро-N-метил-1-нафталенаміну гідрохлорид;

основні фізико-хімічні властивості:

таблетки по 50 мг – овальні, двоопуклі, білого або майже білого кольору, вкриті оболонкою з гравіруванням літери “E” і знаку “271” на одному боці та з розподільчою лінією на другому боці, без запаху;

склад: 1 таблетка містить сертраліну 50 мг, що відповідає 55,95 мг сертраліну гідрохлориду;

допоміжні речовини: магнію стеарат, гідроксипропілцелюлоза, натрію крохмальгліколят (тип А), кальцію гідрофосфат дигідрат, целюлоза мікрокристалічна;

Оболонка: гіпромелоза, макрогол 6000, титану діоксид.

Форма випуску. Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Антидепресанти. Код АТС N06A B06.

Фармакологічні властивості.

Активний інгредієнт препарату – сертралін вибірково пригнічує у головному мозку зворотне захоплення серотоніну синапсами. В терапевтичних дозах сертралін пригнічує також захоплення серотоніну тромбоцитами крові людини. Антидепресивний ефект відзначається наприкінці 2-го тижня регулярного прийому сертраліну, а максимальний ефект – через 6 тижнів.

Сертралін не виявляє жодних стимулюючих, седативних, антихолінергічних чи кардіотоксичних ефектів. Препарат не підвищує катехоламінергічну активність, не споріднений до мускаринових (холінергічних), серотонінових, дофамінових, адренергічних, гістамінових, ГАМК-ергічних і бензодіазепінових рецепторів.

Фармакокінетика.

При внутрішньому застосуванні швидко та майже повністю абсорбується зі шлунково-кишкового тракту. Активно біотрансформується через печінку. Максимальна концентрація у крові досягається протягом 4,5 – 8,4 години після прийому. Зв'язування з білками крові досягає 98 %. Інтенсивно метаболізується в печінці. Метаболіти головним чином виводяться із сечею та калом. 0,2 % сертраліну виводиться нирками в незмінному вигляді. Період напіввиведення становить 62 – 104 години. При порушенні функції печінки період напіввиведення сертраліну подовжується, а його АUC збільшується.

Показання для застосування.

- Короткочасне (при гострих станах) чи середньої тривалості (профілактика рецидивів) лікування депресивних епізодів (уніполярних, біполярних, що супроводжується тривогою);
- профілактика і лікування уніполярної депресії;
- короткочасне та довготривале лікування хронічного obsесивно-компульсивного розладу (ОКР);
- obsесивно-компульсивні розлади у дітей старше 6 років;
- напади паніки (з агорафобією або без такої).
- посттравматичний стресовий розлад (ПТСР);
- соціальна фобія (соціального тривожного розладу)

Спосіб застосування та дози.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Стимулотон необхідно приймати один раз на день (вранці або ввечері). Одночасний прийом їжі не впливає на всмоктування препарату, тому його можна застосовувати незалежно від їди.

Звичайною дозою для дорослих при лікуванні депресії чи обсесивно-компульсивних розладів є 50 мг 1 раз на добу.

Для зниження частоти і тяжкості побічних ефектів у пацієнтів з панічними розладами, соціальною фобією чи постратравматичними стресовими розладами рекомендують починати лікування з дози 25 мг на добу і через тиждень дозу можна підвищити до 50 мг на добу.

Якщо терапевтичний ефект недостатній, добову дозу препарату можна підвищувати на 50 мг кожний тиждень до максимальної добової дози 200 мг.

Терапевтичний ефект може настати протягом 7 днів. Повний терапевтичний ефект спостерігається через 2-4 тижні. При обсесивно-компульсивних розладах терапевтичний ефект розвивається ще повільніше. Для підтримуючої терапії слід призначити більш низьку дозу.

Для дітей та підлітків віком 13 – 17 років з обсесивно-компульсивними розладами препарат призначають починаючи з дози 50 мг на добу.

Для дітей віком 6 – 12 років рекомендується початкова доза 25 мг на добу, яку через тиждень можна підвищити до 50 мг на добу.

Якщо терапевтичний ефект недостатній, дозу препарату можна підвищувати до 200 мг (2 таблетки) на добу, але не більше, як 1 раз на тиждень. Однак, щоб уникнути передозування при збільшенні дози препарату слід враховувати масу тіла у дітей. При довготривалому лікуванні слід призначити найнижчі ефективні дози.

Порушення функції печінки: таким пацієнтам рекомендується знизити дозу або збільшити інтервал між прийомами.

Побічна дія.

Вегетативна нервова система: розлад еякуляції (14 %), сухість у роті (15 %), посилення пітливості (7 %).

Центральна нервова система: сонливість (14 %), запаморочення (13 %), тремор (9 %), розлади сну (22%), зниження лібідо (5 %), неспокій (6 %).

Шлунково-кишковий тракт: анорексія (6 %), діарея (20 %), диспептичні розлади (8 %), метеоризм (3 %), блювання (4 %), нудота (28 %).

Загальні: слабкість (12 %), припливи (2 %) та порушення зору (4%).

Під час лікування Стимулотоном® були відзначені екстрапірамідні розлади, дискінезії, судоми, розлади менструального циклу, гіперпролактинемія, галакторея, висип, рідко - мультиформна еритема.

Клінічні дані

Дуже рідко, хоча причинний зв'язок з прийомом препарату достовірно не встановлений, під час курсу лікування спостерігались рухові порушення (екстрапірамідні симптоми і порушення походки), судороги, порушення менструального циклу, гіперпролактинемія, галакторея, шкірний висип (дуже рідко - мультиформна еритема). У більшості випадків рухові порушення спостерігались у пацієнтів, що приймали нейролептичні препарати, а також при наявності довготривалого анамнезу рухових порушень.

В поодиноких випадках припинення застосування препарату спричинює симптоми відміни.

Лабораторні показники

У поодиноких випадках (0,8%) відмічалось безсимптомне підвищення трансаміназ (АСТ і АЛТ). Ці зміни спостерігались протягом перших 9 тижнів застосування препарату і припинялось відразу після його відміни. Також були повідомлення про оборотню гіпонатріємію, який здебільшого спостерігався у літніх пацієнтів, які одночасно отримували супутні діуретики чи інші препарати.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до інгредієнтів препарату;
- одночасне застосування з інгібіторами MAO, а також період протягом 14 днів після його відміни (і навпаки);

- нестабільна епілепсія;
- діти віком до 6 років (через відсутність достатнього клінічного досвіду, що свідчить про ефективність та безпеку препарату у цій віковій групі);

Передозування.

Симптоми: сонливість, неспокій, розширення зіниць, блювання, тахікардія;

Лікування: необхідна інтенсивна підтримуюча терапія та постійна реєстрація функцій життєво важливих органів. Введення активованого вугілля може бути ефективним. Необхідно підтримувати нормальну прохідність дихальних шляхів. Специфічний антидот відсутній.

Особливості застосування.

Електросудомна терапія

Відсутні дані щодо ризику чи переваги застосування ЕСТ і сертраліну.

Активізація манії і гіпоманії

Як і інші антидепресанти, цей препарат може викликати манію чи гіпоманію у невеликої кількості пацієнтів (до 0,4 %).

Суїцид

Пацієнти, які хворіють на депресію, належать до групи ризику щодо суїцидальних намірів. На початку курсу лікування, до моменту розвитку оптимального клінічного ефекту, такі пацієнти повинні бути під ретельним медичним наглядом.

Застосування у дітей та підлітків віком до 18 років

Стимулотон не слід застосовувати для лікування дітей та підлітків віком до 18 років, за винятком пацієнтів з обсесивно-компульсивним розладом. Якщо препарат призначений за клінічними показаннями, необхідно встановити спостереження за пацієнтом для виявлення суїцидальних симптомів.

Епілептичні випадки

Прямого зв'язку епілептичних випадків і застосування сертраліну не встановлено. Не слід призначати препарат хворим з нестабільною епілепсією. У разі виникнення нападів сертралін слід відмінити.

Печінкова недостатність

Метаболізм сертраліну в основному відбувається в печінці. Хворим з порушеннями функції печінки сертралін треба призначати з обережністю. Можливе зменшення дози або збільшення інтервалу застосування препарату.

Ниркова недостатність

Хворим з порушенням функції нирок необхідності у спеціальному підборі доз немає.

Вагітність і період лактації.

Через відсутність належних клінічних даних вагітним жінкам сертралін можна призначати лише за умови, коли користь від препарату виправдовує можливий ризик.

Сертралін виділяється у молоко. Не рекомендується застосування сертраліну в цей період.

Вплив на здатність керування транспортними засобами і механізмами

Монотерапія сертраліном не впливає на показники психомоторної діяльності пацієнтів. При проведенні клінічних досліджень не було виявлено небажаного впливу на здатність керувати машиною чи іншими механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Інгібітори MAO

Згідно наявних даних сумісність сертраліну з інгібіторами MAO, в тому числі селегіліном і оборотнім інгібітором моклобемідом призводить до тяжких наслідків. При суміщенні цих препаратів спостерігались гіпертермія, ригідність, міоклонус, лабільність вегетативної нервової системи, зміни психічного стану, включаючи дратівливість, збудженість, які можуть перейти в деліріозний стан або кому. Тому сертралін ніколи не можна призначати разом з інгібіторами MAO чи протягом 14 днів після їх відміни, а також менше, ніж за 1 день після відміни оборотнього інгібітора MAO.

Аналогічно після відміни лікування сертраліном повинно пройти не менше 14 днів до початку введення оборотного інгібітора MAO.

Речовини, що пригнічують ЦНС і алкоголь

Щоденне застосування сертраліну по 200 мг на добу не посилює ефекту алкоголю, карбамазепіну, галоперидолу чи фенітоїну на когнітивні функції і психомоторну діяльність.

Препарати, що зв'язуються з білками

Оскільки сертралін зв'язується з білками плазми крові, необхідно враховувати можливість взаємодії з іншими препаратами, що зв'язуються білками.

Циметидин

Сумісність застосування значно знижує кліренс сертраліну, проте клінічне значення цього феномену ще не відоме.

Похідні кумарину

Похідні кумарину значно збільшують протромбінований час, що зумовлює необхідність контролю протромбінованого часу на початку лікування і після його відміни.

Лікарські засоби, метаболізуючі ізоферментом цитохрома P₄₅₀

Тривале лікування сертраліном у дозі 50 мг на добу супроводжується збільшенням концентрації деспраміну (сполука, що застосовується для оцінки активності ізоензима 2D6 цитохрому P₄₅₀) у плазмі крові.

Літій

Дослідження на здорових добровольцях показало, що фармакокінетика суттєво не змінюється у випадку одночасного застосування з сертраліном. Проте, у порівнянні з групою плацебо частота виявлення тремору була вищою, що свідчить про можливу фармакодинамічну взаємодію.

Серотонінергічні засоби

Тривалість періоду вимивання, необхідного перед переведенням пацієнта з одного вибіркового інгібітора зворотнього захоплення серотоніну на інший, ще не визначена. Тому такі переходи необхідно робити з надзвичайною обережністю. Одночасного введення триптофану чи фенфлураміну і сертраліну бажано уникати.

Індукція мікросомальних ферментів

У дослідженнях був виявлений незначний індукуючий ефект сертраліну на печінкові ферменти.

Атенолол

При одночасному застосуванні сертралін не змінює бета-блокуючий ефект атенололу.

Глібенкламід і дигоксин

Не виявлено взаємодій.

Умови та термін зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °C у недоступному для дітей місці.

Термін придатності: 5 років

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері; по 3 блістери у картонній пачці.

Виробник. ВАТ Фармацевтичний завод ЕГІС.

Адреса. 1106 Будапешт, вул. Керештурі 30-38, Угорщина.