

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ВЕНЛАКСОР®
(VENLAXOR®)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: *venlafaxine*, 1-[2-(диметиламіно)-1-(4-метоксифеніл) етил] циклогексанол (у вигляді гідрохлориду);

основні фізико-хімічні властивості:

світло-рожеві, плоскоциліндричні таблетки з темно-рожевими вкрапленнями, з фаскою та рискою на одному боці (для таблеток по 37,5 мг і 75,0 мг);

склад: 1 таблетка містить 42,45 мг венлафаксину гідрохлориду, що еквівалентно 37,5 мг венлафаксину; 1 таблетка містить 84,90 мг венлафаксину гідрохлориду, що еквівалентно 75 мг венлафаксину;

допоміжні речовини: кальцію гідрофосфат безводний, лактоза безводна, натрію крохмальгліколят, магнію стеарат, кремнію діоксид колоїдний безводний, заліза оксид червоний (Е 172).

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Антидепресанти. Код АТС N06A X16.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Венлафаксин належить до препаратів групи антидепресантів похідних фенілетиламіну, справляє також протитривожну дію. Антидепресивний ефект венлафаксину гідрохлориду пов'язаний з посиленням нейромедіаторної активності у ЦНС. Венлафаксин та його основний метаболіт О-десметилвенлафаксин є інгібіторами зворотного захоплення серотоніну та норадреналіну, слабко зменшують зворотне захоплення дофаміну нейронами, однаково ефективно впливають на зворотне захоплення нейротрансмітерів і знижують β -адренергічні реакції.

Фармакокінетика.

Венлафаксин добре абсорбується із шлунково-кишкового тракту. Препарат піддається інтенсивному метаболізму при первинному проходженні через печінку. Його основним метаболітом є О-десметилвенлафаксин. Зв'язування венлафаксину та його метаболіту з білком плазми крові становить 27 і 30% відповідно. Після одноразового прийому 25-150 мг препарату максимальна концентрація венлафаксину в плазмі крові досягає 33-172

нг/мл приблизно через 2 години, максимальна концентрація О-десметилвенлафаксину досягає 61-325 нг/мл, приблизно через 4 години. Період напіввиведення венлафаксину та його метаболіту 5 і 11 годин відповідно.

Основний шлях виведення активної речовини та її метаболіту О-десметилвенлафаксину з організму - через нирки, головним чином у вигляді неактивних метаболітів (N-десметилвенлафаксину, N,O-дидесметилвенлафаксину та ін.), а також у вільній або кон'югированій формі. Приблизно 20% препарату виводиться з фекаліями. Кінетика венлафаксину та О-десметилвенлафаксину при прийомі добових доз 75–450 мг є лінійною та незалежною від віку та статі хворого.

Показання для застосування. Різні форми депресії, у тому числі депресії, що супроводжуються відчуттям тривоги.

Спосіб застосування та дози.

Дози повинні бути індивідуально добраними.

Препарат приймають внутрішньо, під час їжі, з невеликою кількістю рідини.

Депресії. Рекомендована початкова добова доза для дорослих становить 75 мг у 2 прийоми. Через декілька тижнів добову дозу можна збільшувати до 150 мг у 2 прийоми. За необхідності добова доза

може бути збільшена до 225 мг. Звичайно добову дозу збільшують кожні чотири доби на 75 мг. Максимальна добова доза становить 375 мг.

У стаціонарних умовах при тяжких захворюваннях початкова добова доза препарату для дорослих становить 150 мг, за необхідності дозу поступово збільшують до максимальної добової дози, котру розділяють на два прийоми. Після досягнення терапевтичного ефекту дозу препарату поступово знижують.

Хворі з порушеннями функцій печінки та нирок. Рекомендована добова доза препарату для дорослих при помірній печінкової недостатності становить не більше 187,5 мг, при помірній нирковій недостатності - 93,75 – 187,5 мг.

Хворі літнього віку. Загалом не потребується індивідуальний добір дози, однак при прийомі препарату потрібний ретельний нагляд лікаря.

Тривалість лікування визначається індивідуально, залежно від тяжкості та перебігу захворювання.

Побічна дія. Більшість перелічених нижче побічних ефектів залежить від дози. Побічні ефекти виникають частіше за все на початку терапії та зникають протягом перших тижнів лікування.

Загальні симптоми: слабкість, підвищена стомлюваність, зменшення маси тіла.

З боку системи травлення: зниження апетиту, запор, нудота, пронос, блювання, сухість у роті; рідко - біль у животі, порушення показників лабораторних проб функції печінки.

З боку серцево-судинної системи: гіпертензія, розширення кровоносних судин (припливи крові); іноді - ортостатична гіпотензія, тахікардія, затерплість кінцівок.

З боку нервової системи: незвичні сновидіння, запаморочення, безсоння, головний біль, нервова збудливість, дратівливість, страхи, парестезії, ступор, підвищення м'язового тону, тремор, позіхання; іноді - апатія, галюцинації, спазми м'язів, серотоніновий синдром; рідко - епілептичні напади, манакальні реакції, а також симптоми, що нагадують злоякісний нейролептичний синдром, судоми (препарат треба відмінити), нічні кошмари.

З боку опорно-рухової системи: артралгія, м'язовий біль.

З боку сечовидільної та статевих систем: порушення еякуляції, ерекції, аноргазмія, дизурічні розлади (в основному утруднення на початку сечовипускання); іноді - зниження лібідо, затримка сечі, порушення менструального циклу.

З боку органів чуття: порушення акомодатії, мідріаз, порушення зору; іноді - порушення смакових відчуттів, дзвін у вухах.

З боку шкірних покривів: пітливість, іноді - реакції підвищеної світлочутливості; рідко - облісіння, висипання.

З боку системи кровотворення: іноді - крововиливи в шкіру (екхімози) та слизові оболонки, тромбоцитопенія; рідко - подовження часу кровотечі, підвищення рівня холестерину сироватки крові, гіпонатріємія.

Реакції гіперчутливості: іноді - шкірний висип, дуже рідко - анафілактичні реакції, мульти-формна еритема, синдром Стівенса – Джонсона.

Синдром відміни, що спостерігається при припиненні терапії Венлаксором®: стомлюваність, сонливість, головний біль, нудота, блювання, анорексія, сухість у роті, запаморочення, діарея, безсоння, занепокоєння, тривога, дратівливість, дезорієнтація, гіпоманія, парестезії, пітливість. Ці симптоми звичайно слабо виражені і минають без лікування.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до венлафаксину чи до будь-якого компонента препарату.
- Комбінації венлафаксину з інгібіторами MAO, препаратами звіробою, антагоністами рецепторів серотоніну, засобами проти мігрені, сибутраміцином, декстрометорфаном.
- Тяжкі порушення функції нирок.
- Тяжкі порушення функції печінки.
- Вік до 18 років.

- Вагітність або передбачувана вагітність.
- Період лактації.

Передозування.

Симптоми та лікування передозування. Частіше за все може спостерігатися сонливість, але можуть спостерігатися судомні, синусова тахікардія середнього ступеня тяжкості. При одночасному прийомі з алкоголем чи іншими психотропними препаратами можуть спостерігатися зміна ЕКГ (подовження інтервалу QT, блокада пучка Гіса, збільшення комплексу QRS), синусова або вентрикулярна тахікардія, брадикардія, гіпотензія, порушення рівноваги, порушення свідомості (іноді кома), судомні.

У випадку передозування лікування Венлаксором[®] треба припинити та застосувати симптоматичну терапію. Потрібно забезпечити достатній доступ повітря, вентиляцію легенів. Потрібно проводити контроль серцевого ритму та інших життєво важливих функцій. Коли передозування встановлено, необхідно зробити промивання шлунка чи застосувати абсорбенти (наприклад активоване вугілля). Специфічні антидоти не відомі. Не рекомендують викликати блювання в зв'язку з небезпекою аспірації. Венлафаксин та його метаболіт не виводяться при діалізі.

Особливості застосування.

Препарат застосовують під ретельним медичним спостереженням для лікування:

- хворих, які перенесли інфаркт міокарда або напади нестабільної стенокардії;
- хворих на артеріальну гіпертензію;
- хворих на епілепсію;
- хворих на манію;
- хворих на глаукому;
- хворих з порушенням функцій печінки та нирок;
- хворих з афективними розладами, тому що при лікуванні антидепресантами існує можливість виникнення гіпоманіакальних або маніакальних станів;
- хворих з манією в анамнезі;
- хворих з епілептичними нападами в анамнезі. Лікування венлафаксином треба припинити при виникненні епілептичних нападів;
- хворих з депресивними розладами. Призначають будь-яку лікарську терапію таким хворим слід враховувати ймовірність суїцидальних спроб, тому для зниження ризику передозування лікування препаратом треба починати з якомога найнижчих доз;
- хворих, добова доза препарату в яких перевищує 200 мг. У таких випадках необхідний контроль кров'яного тиску.

При призначенні препарату хворим з підвищеною чутливістю до лактози слід враховувати вміст лактози (84,93 мг у кожній таблетці, що містить 37,5 мг венлафаксину; 169,86 мг у кожній таблетці, що містить 75 мг венлафаксину).

Жінкам дітородного віку призначають препарат тільки за умови використання ними відповідних методів контрацепції для запобігання настанню вагітності.

Застосування в період вагітності і лактації. Безпека застосування венлафаксину в період вагітності не доведена.

Венлафаксин і його метаболіт (ОДВ) виділяються в грудне молоко. Безпека цих речовин для новонароджених дітей не доведена, тому прийом Венлаксор[®] під час годування груддю заборонений. За необхідності прийому препарату у період лактації треба вирішити питання про припинення годування груддю. Якщо лікування вагітної було завершено незадовго до пологів, у новонародженого може виникнути синдром відміни препарату.

Застосування при керуванні транспортом і роботі з технікою. При керуванні транспортом і роботі з механізмами необхідний регулярний огляд лікаря, тому що Венлаксор[®] впливає на здатність керувати транспортом і працювати з технікою. Перед початком керування транспортним засобом або роботи з технікою потрібно впевнитись, що здатність концентрувати увагу та координувати порухи не порушена.

Припинення лікування. При відміні препарату Венлаксор[®], як і при відміні інших антидепресантів, різке припинення терапії, особливо після високих доз препарату, може причинити синдром відміни, у зв'язку з чим рекомендується перед відміною лікування препаратом поступово знизити його дозу. Тривалість періоду, необхідного для зниження дози, залежить від величини дози, тривалості терапії, а також від індивідуальної чутливості пацієнта. Тому при лікуванні препаратом більше тижня відміну препарату потрібно проводити поступово, зменшуючи дозу протягом тижня. Якщо терапія препаратом проводилася шість тижнів і більше, відміну препарату проводять не менше двох тижнів. Звичайно симптом синдрому відміни виражений незначно та зникає протягом декількох днів.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Якщо хворий приймав інгібітори MAO, терапію препаратом Венлаксор[®] можна розпочинати не раніше, ніж через 14 днів після закінчення терапії інгібіторами MAO; якщо застосовувався оборотний інгібітор MAO (моклобемід), цей інтервал може бути скороченим до 24 годин; терапію інгібіторами MAO можна починати не раніше ніж через 7 днів після закінчення терапії Венлаксором[®].

При одночасному прийомі Венлаксор[®] та :

- варфарину можливо посилення дії останнього;
- клозапину збільшується ризик виникнення побічних ефектів останнього;
- циметидину призводить до інгібування метаболізму Венлаксор[®] при першому проходженні через печінку, зниження кліренсу венлафаксину та збільшення максимальної концентрації у крові, при цьому циметидин не чинить впливу на фармакокінетику О-десметилвенлафаксину, котрий присутній у системному кровотоці у значно більшій кількості, ніж венлафаксин, тому при одночасному застосуванні необхідно ретельне спостереження за пацієнтами літнього віку та хворими з печінковою недостатністю чи хворими на артеріальну гіпертензію;
- препарату рослинного походження кава-кава, який впливає на ЦНС, можлива фармакодинамічна взаємодія, яка посилює гнітючу дію на ЦНС останнього;
- ентакапону можлива фармакодинамічна взаємодія на рівні метаболізму, яка ще недостатньо вивчена;
- золпідему можливі дезорієнтація, галюцинації, манія;
- індинавиру зменшується біодоступність останнього.

Венлафаксин не впливає на фармакокінетику літію.

Умови та термін зберігання. Зберігати в захищеному від світла місці, при температурі не вище 25°C. Зберігати в оригінальній упаковці. Зберігати в недоступному для дітей місці!

Термін придатності - 3 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

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

Виробник. АТ «Гріндекс», Латвія.

Адреса. Вул. Крустпілс, 53, Рига, Латвія, LV-1057.