

УТВЕРЖДЕНА
Приказом председателя
Комитета контроля медицинской и
фармацевтической деятельности
Министерства здравоохранения
Республики Казахстан
от « ____ » _____ 20 ____ г.
№ _____

**Инструкция по медицинскому применению
лекарственного средства**

ЭСЦИТА® 10
ЭСЦИТА® 20

Торговое название

ЭСЦИТА® 10

ЭСЦИТА® 20

Международное непатентованное название

Эсциталопрам

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 10 мг и 20 мг

Состав

Одна таблетка содержит

активное вещество – эсциталопрама оксалат 12,775 мг или 25,55 мг
(эквивалентно эсциталопраму 10 мг и 20 мг соответственно)

вспомогательные вещества: коповидон (коллидон VA 64), лактозы
моногидрат, крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая РН 102,
натрия кроскармеллоза, магния стеарат

состав оболочки Sepifilm LP 770: гипромеллоза
(метилгидроксипропилцеллюлоза) (Е 464), целлюлоза микрокристаллическая
(Е 460), кислота стеариновая (Е 570), титана диоксид (Е 171).

Описание

ЭСЦИТА® 10

Таблетки 10 мг, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, овальной
формы, двояковыпуклые, с углубленной риской на одной стороне и
маркировкой «10» на другой

ЭСЦИТА® 20

Таблетки 20 мг, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, овальной

формы, двояковыпуклые, с углубленной риской на одной стороне и маркировкой «20» на другой

Фармакотерапевтическая группа

Антидепрессанты. Серотонина обратного захвата ингибиторы селективные
Код АТХ N06AB10

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

Абсорбция не зависит от приема пищи. После приема внутрь среднее время достижения максимальной концентрации (C_{max}) в плазме крови составляет около 4 ч. Биодоступность эсциталопрама составляет около 80 %.

Связывание эсциталопрама и его основных метаболитов с белками плазмы крови ниже 80 %.

Эсциталопрам метаболизируется в печени до деметилированного и дидеметилированного метаболитов, которые являются фармакологически активными. Кинетика эсциталопрама линейна. Равновесная концентрация (C_{ss}) достигается примерно через 1 неделю.

Период полувыведения ($T_{1/2}$) после многократного применения составляет около 30 ч. Клиренс при пероральном применении составляет около 0,6 л/мин. У основных метаболитов эсциталопрама $T_{1/2}$ более продолжителен. Эсциталопрам и его основные метаболиты выводятся печенью (метаболический путь) и почками. Большая часть выводится в виде метаболитов с мочой.

Пожилые пациенты (>65 лет)

Эсциталопрам выводится медленнее у пожилых пациентов по сравнению с более молодыми пациентами. Системная экспозиция (AUC) примерно на 50% выше у пожилых по сравнению с молодыми здоровыми добровольцами.

Снижение функции печени

У пациентов со слабым или умеренным нарушением функции печени период полувыведения эсциталопрама примерно в два раза больше, и экспозиция примерно на 60% выше, чем у людей с нормальной функцией печени.

Снижение функции почек

Для эсциталопрама большой период полувыведения и небольшое возрастание экспозиции отмечены у пациентов со сниженной функцией почек (CL_{cr} 10-53 мл/мин). Концентрации метаболитов в плазме не исследовались, но они могут быть повышенными.

Фармакодинамика

ЭСЦИТА® - антидепрессант, селективный ингибитор 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 практически не связывается с рядом рецепторов, включая серотониновые 5-HT_{1A}-, 5-HT₂-рецепторы, допаминовые D₁- и D₂- рецепторы,

α_1 -, α_2 -, β -адренергические рецепторы, гистаминовые H_1 -рецепторы, м-холинорецепторы, бензодиазепиновые и опиоидные рецепторы.

Механизм антидепрессивного действия эсциталопрама взаимосвязан с усилением серотонинергической активности в центральной нервной системе (ЦНС) в результате подавления нейронного захвата серотонина (5-НТ). Эсциталопрам является высоко селективным ингибитором обратного захвата серотонина с минимальным влиянием на обратный нейронный захват норэпинефрина и допамина. Эсциталопрам (S-энантиомер) является более (в 100раз) сильнодействующим ингибитором белка-переносчика серотонина, который участвует в обратном захвате серотонина, чем рацемическая форма циталопрама - R-энантиомер. Эсциталопрам также не связывается или имеет очень слабую способность связываться с ионными каналами, включая Na^+ , K^+ , Cl^- , Ca^{++} каналы.

Показания к применению

- депрессия
- панические расстройства с/без агорафобии
- социальная тревога (социальная фобия)
- генерализованные состояния тревоги
- обсессивно-компульсивные нарушения

Способ применения и дозы

Препарат назначают 1 раз/сут вне зависимости от приема пищи.

В отношении безопасности суточной дозы, превышающей 20 мг эсциталопрама, данные отсутствуют.

Основные депрессивные эпизоды: препарат обычно назначают в дозе 10 мг/сут. 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 мес необходимо продолжать терапию для закрепления полученного эффекта.

Панические расстройства с/без агорафобии: в течение первой недели лечения рекомендуется доза 5 мг/сут с последующим увеличением 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 мес после начала лечения. Терапия длится несколько месяцев.

Социальная тревога (социальная фобия): препарат обычно назначают в дозе 10 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до максимальной – 20 мг/сут.

Состояния тревоги, связанные с социальным статусом, относятся к заболеваниям хронического типа, и лечение препаратом в течение 12 недель рекомендуется для усиления ответной реакции.

Генерализованные состояния тревоги: начальная доза препарата 10 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до максимальной – 20 мг/сут.

Генерализованные состояния тревоги относятся к заболеваниям хронического типа, и лечение препаратом в течение 12 недель рекомендуется для усиления ответной реакции. В ходе лечения соотношение пользы и дозы препарата должны переоцениваться с регулярным интервалом.

Обсессивно-компульсивные нарушения: начальная доза препарата 10 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза может быть увеличена до максимальной – 20 мг/сут.

Обсессивно-компульсивные нарушения – заболевания хронического типа, поэтому лечение таких пациентов длится в течение достаточного периода до полного излечения.

Пациенты пожилого возраста (старше 65 лет)

Назначается половина обычно рекомендуемой дозы (т.е. всего 5 мг/сут) и более низкую максимальную дозу (10 мг/сут).

Изучение эффективности препарата у пациентов пожилого возраста с социальной фобией не проводилось.

При почечной недостаточности легкой и средней степени тяжести коррекции дозы не требуется. Рекомендуется начальная доза в течение 2-х недель - 5 мг/сут. Пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК<30 мл/мин) препарат следует назначать с осторожностью.

Пациентам с нарушением функции печени рекомендуемая начальная доза в течение первых 2 недель лечения составляет 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции на лечение доза может быть увеличена до 10 мг/сут. Пациентам с печеночной недостаточностью тяжелой степени препарат следует назначать с осторожностью.

При сниженной активности изофермента CYP2C19 рекомендуемая начальная доза в течение первых 2 недель лечения составляет 5 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции на лечение доза может быть увеличена до 10 мг/сут.

При прекращении лечения препаратом дозу следует уменьшать постепенно в течение 1-2 недель во избежание развития синдрома отмены.

Побочные действия

- тошнота, снижение аппетита, диарея, запоры, абдоминальная боль
- бессонница или сонливость, головокружение, слабость
- повышенная потливость, гипертермия
- снижение либидо, импотенция, нарушение эякуляции, аноргазмия (у женщин)

Редко

- нарушения вкусовых ощущений
- рвота, сухость во рту, изменение лабораторных показателей функции печени
- ортостатическая гипотензия

- гипонатриемия
- недостаточная секреция АДГ, галакторея
- анафилактические реакции, ангионевротический отек
- кожная сыпь, зуд, экхимозы, пурпура
- синуситы
- артралгии, миалгии, задержка мочи

Возможны

- расстройства зрения, судорожные припадки, тремор, двигательные нарушения, серотониновый синдром, галлюцинации, мания, спутанность сознания, возбуждение, тревога, раздвоение личности с суицидальными наклонностями, панические атаки, повышенная раздражительность.

При резкой отмене препарата после длительного применения возможны реакции отмены - головокружение, головные боли и тошнота. Выраженность данных реакций незначительна, а продолжительность ограничена.

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

Противопоказания

- повышенная чувствительность к эсциталопраму и другим компонентам препарата
- одновременный прием с ингибиторами моноаминооксидазы (МАО)
- одновременный прием с пимозидом
- беременность и период лактации
- детский и подростковый возраст до 18 лет

Лекарственные взаимодействия

Взаимодействия при одновременном применении с препаратом ЭСЦИТА®.

С ингибиторами МАО, а также в начале приема ингибиторов МАО больными, незадолго до этого прекратившими прием препарата ЭСЦИТА®, возможно возникновение серьезных нежелательных реакций. В подобных случаях может развиваться серотониновый синдром.

С серотонинергическими препаратами (например, трамадолом, суматриптаном и другими триптанами) может привести к развитию серотонинового синдрома.

ЭСЦИТА® может снижать порог судорожной готовности, в связи с чем необходима осторожность при одновременном назначении препарата ЭСЦИТА® и других препаратов, снижающих порог судорожной готовности.

ЭСЦИТА® может привести к усилению действия *препаратов лития, триптофана*.

С пероральными антикоагулянтами и препаратами, влияющими на свертываемость крови (например, атипичными антипсихотиками и фенотиазинами, большинством трициклических антидепрессантов, ацетилсалициловой кислотой и НПВС, тиклопидином и дипиридамолом), может возникнуть нарушение свертываемости крови. В подобных случаях в

начале или по окончании терапии препаратом ЭСЦИТА® необходим тщательный мониторинг свертываемости крови.

Препараты, ингибирующие изофермент CYP2C19, могут повышать концентрацию препарата ЭСЦИТА® в плазме крови. С осторожностью следует применять препарат ЭСЦИТА® одновременно с подобными препаратами (в т.ч. с омепразолом), может потребоваться уменьшение дозы ЭСЦИТА®.

С осторожностью следует назначать препарат ЭСЦИТА® в высоких дозах одновременно с *циметидином* в высоких дозах, который является сильным ингибитором изоферментов CYP2D6, CYP3A4 и CYP1A2.

Одновременное назначение препарата ЭСЦИТА® и *препаратов, содержащих зверобой* (*Hypericum perforatum*), может привести к увеличению числа побочных эффектов.

При одновременном приеме *алкоголя* препарат ЭСЦИТА® не вступает в фармакодинамическое или фармакокинетическое взаимодействие, однако, как и в случае с другими психотропными средствами, одновременное применение препарата ЭСЦИТА® и *алкоголя* не рекомендуется.

ЭСЦИТА® 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 *препаратов, в основном метаболизирующихся посредством изофермента CYP2D6 и действующих на ЦНС* (например антидепрессантов дезипрамина, кломипрамина, нортриптилина или антипсихотиков рисперидона, тиоридазина, галоперидола). В этих случаях может потребоваться коррекция дозы.

Одновременное назначение препарата ЭСЦИТА® и *дезипрамина или метопролола* приводит к двукратному увеличению концентрации двух последних препаратов.

ЭСЦИТА® может незначительно ингибировать изофермент CYP2C19. Поэтому рекомендуется проявлять осторожность при одновременном использовании препарата ЭСЦИТА® и *препаратов, метаболизирующихся при участии данного изофермента*.

Особые указания

Препарат ЭСЦИТА® нельзя назначать одновременно с ингибиторами MAO. Препарат может быть назначен через 14 дней после прекращения лечения необратимыми ингибиторами MAO и как минимум через 1 день после прекращения терапии обратимыми ингибиторами MAO типа А (в т.ч. моклобемидом). Как минимум 7 дней должно пройти после окончания приема ЭСЦИТА®, прежде чем можно начинать лечение неселективными ингибиторами MAO.

У некоторых пациентов с паническими расстройствами в начале лечения селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (включая

ЭСЦИТА®) может наблюдаться усиление тревоги. Подобная парадоксальная реакция обычно исчезает в течение 2 недель лечения. Чтобы снизить вероятность возникновения анксиогенного эффекта, рекомендуется применять препарат в низких начальных дозах

Следует отменить ЭСЦИТА® в случае развития судорожных приступов.

Не рекомендуется применение препарата у больных с нестабильной эпилепсией, при контролируемых приступах необходимо тщательное наблюдение. При увеличении частоты возникновения судорожных приступов селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, включая ЭСЦИТА®, необходимо отменить.

С осторожностью следует применять ЭСЦИТА® у пациентов с указаниями в анамнезе на манию/гипоманию. При развитии маниакального состояния препарат ЭСЦИТА® необходимо отменить.

При лечении ЭСЦИТА® больных сахарным диабетом возможно изменение уровня глюкозы в крови, поэтому может потребоваться коррекция дозы 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, получающими лечение антидепрессантами, особенно в начале, из-за возможности клинического ухудшения и/или появления суицидальных проявлений (мыслей и поведения). Эта предосторожность должна соблюдаться и при лечении других психических расстройств, сопровождающихся депрессивными эпизодами.

Гипонатриемия, возможно связанная с нарушением секреции АДГ, на фоне приема ЭСЦИТА® возникает редко и обычно исчезает при отмене терапии.

С осторожностью следует назначать ЭСЦИТА® и другие селективные ингибиторы обратного захвата серотонина пациентам, входящим в группу риска развития гипонатриемии: пожилым, больным циррозом печени и принимающим препараты, способные вызывать гипонатриемию. При приеме ЭСЦИТА® возможно развитие кожных кровоизлияний (экхимозы и пурпура). Необходимо с осторожностью применять препарат ЭСЦИТА® у больных со склонностью к кровотечениям, а также принимающих пероральные антикоагулянты и препараты, влияющие на свертываемость крови.

Клинический опыт применения ЭСЦИТА® в сочетании с электросудорожной терапией ограничен, поэтому в данном случае следует соблюдать осторожность.

Не рекомендуется одновременное применение препарата ЭСЦИТА® и ингибиторов МАО типа А из-за риска развития серотонинового синдрома. У больных, принимающих ЭСЦИТА® и другие селективные ингибиторы обратного захвата серотонина одновременно с серотонинергическими препаратами, в редких случаях может развиваться серотониновый синдром.

Комбинация таких симптомов, как возбуждение, тремор, мышечный спазм, гипертермия, может указывать на развитие серотонинового синдрома. При этом следует немедленно отменить селективные ингибиторы обратного захвата серотонина и серотонинергические препараты и назначить симптоматическую терапию.

Одновременное применение ЭСЦИТА® и алкоголя не рекомендуется.

Пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени ($КК < 30$ мл/мин) препарат следует назначать с осторожностью

Беременность

Использование СИОЗС в III триместре беременности может негативно сказаться на психофизическом развитии новорожденного. Зарегистрированы неврологические нарушения у новорожденных, чьи матери принимали СИОЗС вплоть до родов: апное, цианоз, судороги, гипогликемию, гипотонию, раздражительность, тремор, гипертензия, повышенный мышечный тонус, нестабильную температуру, постоянный плач, трудности сосания, плохой сон. Эти симптомы могут свидетельствовать о серотонинергических эффектах или о возникновении синдрома отмены. В случае использования СИОЗС во время беременности их прием не должен резко прерываться, отменять препарат необходимо постепенно.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами

Следует соблюдать осторожность при управлении автомобилем и потенциально опасными механизмами.

Передозировка

Симптомы: головокружение, тремор, эмоциональное и двигательное возбуждение, сонливость, помрачение сознания, судорожные припадки, тахикардия, изменения ЭКГ (изменение сегмента ST и зубца T, расширение комплекса QRS, удлинение интервала QT), аритмии, угнетение дыхательной деятельности, рвота, рабдомиолиз, метаболический ацидоз, гипокалиемия.

Лечение: специфического антидота не существует, промывание желудка, адекватная оксигенотерапия, при необходимости проводится контроль дыхания и сердечно-сосудистой деятельности, симптоматическая терапия.

Форма выпуска и упаковка

По 14 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки белой ПВХ/ПЭ/ПВДХ и фольги алюминиевой печатной.

По 1, 2, 3 или 4 контурных упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках помещают в пачку картонную с голограммой фирмы – производителя.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25°C в сухом, защищенном от света месте. Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения

3 года

Не применять по истечении срока хранения

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

Нобел Илач Санаи ве Тиджарет А.Ш., Турция

Упаковщик

АО «Нобел Алматинская Фармацевтическая Фабрика»

Республика Казахстан

г. Алматы, ул. Шевченко 162 Е.

Владелец регистрационного удостоверения

АО «Нобел Алматинская Фармацевтическая Фабрика»

Республика Казахстан

Адрес организации, принимающей на территории Республики Казахстан претензии от потребителей по качеству продукции (товара):

АО «Нобел Алматинская Фармацевтическая Фабрика»

Республика Казахстан, г. Алматы, ул. Шевченко 162 Е.

Номер телефона: (+7 727) 399-50-50

Номер факса: (+7 727) 399-60-60

Адрес электронной почты nobel@nobel.kz