

Роксир



ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА

Торговое название: Роксир.

Международное непатентованное название: Гидроксизин.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав: каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Гидроксизина гидрохлорид USP 25 мг;

Вспомогательные вещества q.s.

Краситель: диоксид титана USP

Фармакотерапевтическая группа: транквилизатор (анксиолитик).

Код АТХ: N05BB01.

Фармакологическое действие:

Фармакодинамика:

Производное дифенилметана, обладает умеренной анксиолитической активностью; оказывает также седативное, противорвотное, антигистаминное и м-холиноблокирующее действие. Блокирует центральные м-холинорецепторы и гистаминовые H₁-рецепторы и угнетает активность определенных субкортикальных зон. Не вызывает психической зависимости и привыкания. Клинический эффект наступает через 15-30 мин после приема препарата внутрь.

Оказывает положительное влияние на когнитивные способности, улучшает память и внимание. Расслабляет скелетную и гладкую мускулатуру, обладает бронходилатирующим и анальгезирующим эффектами, умеренным ингибирующим влиянием на желудочную секрецию. Гидроксизин значительно уменьшает зуд у больных крапивницей, экземой и дерматитом. При длительном приеме не отмечено синдрома отмены и ухудшения когнитивных функций. Полисомнография у больных бессонницей и тревогой наглядно демонстрирует удлинение продолжительности сна, снижение частоты ночных пробуждений после однократного или повторного приема гидроксизина в дозе 50 мг. Снижение мышечного напряжения у больных тревогой отмечено при приеме препарата в дозе 50 мг 3 раза/сут.

Фармакокинетика:

Всасывание - гидроксизин в высокой степени абсорбируется из ЖКТ. C_{max} отмечается через 2 ч после приема препарата.

После однократного приема препарата в разовой дозе 25 мг или 50 мг у взрослых концентрация в плазме составляет 30 нг/мл и 70 нг/мл соответственно.

Биодоступность при приеме внутрь составляет 80%.

Распределение - гидроксизин больше концентрируется в тканях (в частности, в коже), чем в плазме.

Коэффициент распределения составляет 7-16 л/кг.

Гидроксизин проникает через ГЭБ и плацентарный барьер, концентрируясь, в большей степени, в тканях плода, чем в организме матери. Метаболиты обнаруживаются в грудном молоке.

Метаболизм и выведение - гидроксизин метаболизируется в печени. Основным метаболит (45%) - цетиризин, который является блоком гистаминовых H₁-рецепторов. Общий клиренс гидроксизина составляет 13 мл/мин/кг. T_{1/2} у взрослых составляет 14 ч. Только 0.8% гидроксизина выводится в неизменном виде с мочой.

Фармакокинетика в особых клинических случаях:

У детей общий клиренс в 4 раза меньше, чем у взрослых, T_{1/2} у детей в возрасте 14 лет составляет 11 ч, у детей в возрасте 1 года - 4 ч.

У пациентов пожилого возраста T_{1/2} составляет 29 ч, коэффициент распределения составляет 22.5 л/кг.

У пациентов с нарушениями функции печени T_{1/2} увеличивается до 37 ч, концентрация метаболитов в сыворотке крови выше, чем у молодых больных с нормальной функцией печени. Антигистаминный эффект может сохраняться на протяжении 96 ч.

Показания к применению:

- взрослым: для купирования тревоги, психомоторного возбуждения, чувства внутреннего напряжения, повышенной раздражительности при неврологических, психических (в т.ч. генерализованная тревога, расстройства адаптации) и соматических заболеваниях, хроническом алкоголизме; синдрома абстиненции при хроническом алкоголизме, сопровождающегося психомоторным возбуждением;
- в качестве седативного средства в период премедикации;
- кожный зуд (в качестве симптоматической терапии).

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к компоненту препарата, к цетиризину и другим производным пиперазина, аминифиллину или этилендиамину.
- порфирия;
- беременность и период лактации;
- период родовой деятельности.

С **осторожностью** следует назначать препарат при миастении, гиперплазии предстательной железы с клиническими проявлениями, затруднении мочеиспускания, запорах, при повышении внутриглазного давления, деменции, склонности к судорожным припадкам; при предрасположенности к развитию аритмии; при одновременном применении препаратов, обладающих аритмогенным действием; одновременно с другими средствами, угнетающими ЦНС, или холиноблокаторами (требуется снижение дозы). Требуется снижение дозы препарата у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой и средней степени, с печеночной недостаточностью, у пациентов пожилого возраста при снижении клубочковой фильтрации.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь.

Для симптоматического лечения зуда детям в возрасте от 12 месяцев до 6 лет препарат назначают в суточной дозе 1-2,5 мг/кг массы тела в несколько приемов; детям в возрасте старше 6 лет - в дозе 1-2 мг/кг в сутки в несколько приемов.

Для премедикации детям препарат назначают в дозе 1 мг/кг массы тела за 1 ч до операции, а также дополнительно в ночь перед операцией.

Взрослым для **симптоматического лечения тревоги** назначают в дозе 25-100 мг в сутки в несколько приемов в течение дня или на ночь. Средняя доза составляет 50 мг в сутки (12,5 мг утром, 12,5 мг днем и 25 мг на ночь).

При необходимости доза может быть увеличена до 300 мг в сутки.

Для симптоматического лечения зуда начальная доза составляет 25 мг, в случае необходимости доза может быть увеличена в 4 раза (по 25 мг 4 раза в сутки).

Максимальная разовая доза не должна превышать 200 мг, максимальная суточная доза составляет не более 300 мг.

У пациентов пожилого возраста начальную дозу следует уменьшить в 2 раза.

Пациентам с почечной недостаточностью средней и тяжелой степени тяжести, а также с печеночной недостаточностью необходимо снижение дозы.

Побочные действия:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: сонливость, повышенная утомляемость, тремор, судороги, головная боль, головокружение, атаксия, слабость.

Со стороны органа зрения: острая глаукома, нарушение аккомодации.

Со стороны мочевыделительной системы: острая задержка мочи.

Со стороны сердечно - сосудистой системы: тахикардия, снижение АД.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, запор, повышение активности трансаминаз.

Прочие: бронхоспазм, аллергические реакции, повышенная потливость.

Передозировка:

Симптомы: усиление антихолинергических эффектов, угнетение или парадоксальная стимуляция ЦНС, тошнота, рвота, непроизвольная двигательная активность, галлюцинации, нарушение сознания, аритмия, артериальная гипотензия; редко - тремор, судороги, дезориентация, которые возникают при значительной передозировке.

Лечение: если спонтанная рвота отсутствует, необходимо вызвать ее искусственным путем или провести промывание желудка. Проводят общие мероприятия, направленные на поддержание жизненно важных функций организма, и мониторинг наблюдение за пациентом до исчезновения симптомов интоксикации в последующие 24 ч.

В случае необходимости получения вазопрессорного эффекта назначается норэпинефрин или метарамнол.

Не следует применять эпинефрин. Специфического антидота не существует. Применение гемодиализа неэффективно.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Роксир потенцирует действие препаратов, угнетающих ЦНС, таких как опиоидные анальгетики, барбитураты, транквилизаторы, снотворные препараты, этанол (при комбинациях требуется индивидуальный подбор доз препаратов).

Роксир при одновременном применении препятствует прессорному действию эпинефрина (адреналина) и противосудорожной активности фенитоина, а также препятствует действию бетагистина и блокаторов холинэстеразы.

Применение препарата роксир не влияет на активность атропина, алкалоидов белладонны, сердечных гликозидов, гипотензивных средств, блокаторов гистаминовых H₂-рецепторов.

Следует избегать совместного назначения роксир с ингибиторами MAO и холиноблокаторами.

Гидроксизин является ингибитором изофермента CYP2D6 и при применении в высоких дозах может быть причиной взаимодействия с субстратами CYP2D6. Поскольку гидроксизин метаболизируется в печени, можно ожидать увеличения его концентрации в крови при совместном назначении с ингибиторами печеночных ферментов.

Особые указания:

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы.

применение гидроксизина связано с удлинением интервала QT на электрокардиограмме. В период пострегистрального наблюдения среди пациентов, принимающих гидроксизин, наблюдались случаи удлинения интервала QT и желудочковой тахикардии по типу «пируэт». У большинства из таких пациентов имелись другие факторы риска, электролитные нарушения, а также применялось сопутствующее лечение, которое могло являться предрасполагающим фактором.

Гидроксизин следует применять в самой низкой эффективной дозе и в течение как можно более короткого периода времени.

Лечение гидроксизином необходимо прекратить при появлении признаков или симптомов, которые связаны с аритмией, при этом пациенты должны немедленно обратиться за медицинской помощью.

Пациентам следует рекомендовать незамедлительно сообщать о любых симптомах нарушения работы сердца.

При необходимости проведения аллергологических тестов, прием гидроксизина необходимо прекратить за 5 дней до исследования.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами.

В период терапии необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстрых психомоторных реакций.

Форма выпуска:

15 таблеток, покрытых пленочной оболочкой, в каждом блистере ПВХ. 2 блистера вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

Условия хранения:

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

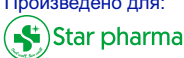
Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

По рецепту врача.

Произведено для:



Лондон, Великобритания

Производитель: