Гидроксизин Канон



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Гидроксизин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской; на поперечном разрезе почти белого цвета.

	1 таб.
гидроксизина гидрохлорид	25 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный прежелатинизированный - 30 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.7 мг, магния стеарат - 1 мг, маннитол - 40 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 33.3 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.
25 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
25 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гидроксизин является блокатором H_1-гистаминовых рецепторов первого поколения, поизводное фенотиазина с антимускариновыми и седативными свойствами и дифенилметана, способствует угнетению активности определенных субкортикальных зон.

Оказывает H_1-гистаминоблокирующее, бронходилатирующее и противорвотное действие, обладает умеренным ингибирующим влиянием на желудочную секрецию. Гидроксизин значительно уменьшает зуд у пациентов с крапивницей, экземой и дерматитом.

Гидроксизин положительно действует на когнитивные способности, улучшает внимание и память. Гидроксизин привыкания и психической зависимости не вызывает, при продолжительном использовании синдрома отмены не отмечено.
Гидроксизин способен угнетать центральную нервную систему, также оказывает антихолинергическое, антигистаминное, спазмолитическое, местноанестезирующее, симпатолетическое действие, обладает миорелаксирующей активностью.

При печеночной недостаточности H_1-гистаминоблокирующий эффект может продлеваться до 96 ч после однократного приема. Обладает умеренной анксиолитической активностью.

Полисомнография у пациентов с бессонницей и тревогой демонстрирует удлинение продолжительности сна, снижение частоты ночных пробуждений после приема однократно или повторно гидроксизина в дозе 50 мг. Снижение мышечного напряжения у пациентов с тревогой отмечено при приеме препарата в дозе 50 мг 3 раза в день.

H_1-гистаминоблокирующий эффект наступает приблизительно через 1 час после приема таблеток внутрь. Седативный эффект проявляется спустя 30-45 минут.

Фармакокинетика

Всасывание

Абсорбция высокая. TC_{max} после приема внутрь - 2 часа. После приема средней дозы 50 мг TC_{max} у взрослых составляет 70 мг/мл.

Распределение

Коэффициент распределения составляет 7-16 л/кг у взрослых. Гидроксизин проникает через гематоэнцефалический барьер и плаценту, концентрируясь в большей степени в фетальных, чем в материнских тканях. После приема внутрь гидроксизин хорошо проникает в кожу, при этом концентрации гидроксизина в коже намного превышают концентрации в сыворотке крови как после однократного, так и после многократных приемов. Плазменная концентрация гидроксизина необязательно отражает его связывание с тканями или распределение в рецепторах кожи. Оказывает влияние на кожное воспаление в зависимости от сывороточной концентрации.

Метаболизм

Гидроксизин метаболизируется в печени. Цетиризин - основной метаболит (45%) является блокатором H_1-гистаминовых рецепторов. Метаболиты обнаруживаются в грудном молоке.

Выведение

$T_{1/2}$ у взрослых - 14 ч (диапазон: 7-20 ч). Общий клиренс гидроксизина составляет 13 мл/мин/кг. Около 0,8% гидроксизина выводится в неизмененном виде через почки. Основной метаболит цетиризин экскретируется главным образом с мочой, также в неизмененном виде (25% от принятой дозы гидроксизина).

Фармакокинетика у особых групп пациентов

У пожилых пациентов

У пожилых больных $T_{1/2}$ составил 29 часов. Объем распределения составляет 22,5 л/кг. Рекомендуется снижение суточной дозы гидроксизина при назначении пожилым пациентам.

Дети до 1 года

У детей общий клиренс в 2,5 раза выше, чем у взрослых. Доза должна быть скорректирована. $T_{1/2}$ 4 часа.

Дети от 1 года до 14 лет

$T_{1/2}$ 11 часов.

У пациентов с печеночной недостаточностью

У пациентов с вторичной дисфункцией печени вследствие первичного билиарного цирроза общий клиренс составил приблизительно 66% от значения, зарегистрированного у здоровых добровольцев. У пациентов с заболеваниями печени $T_{1/2}$ увеличивался до 37 часов, концентрация метаболитов в сыворотке крове выше, чем у молодых пациентов с нормальной функцией печени. Пациентам с печеночной недостаточностью рекомендуется снижение суточной дозы или кратности приема.

У пациентов с почечной недостаточностью

Фармакокинетика гидроксизина исследовалась на примере 8 пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина 24+7 мл/мин). Длительность экспозиции гидроксизина значительно не изменилась, в то время как длительность экспозиции цетиризина была увеличена. Во избежание любого значительного накопления метаболита цетиризина после многократного применения гидроксизина у пациентов с нарушением функции почек следует снизить ежедневную дозу гидроксизина.

Показания к применению:

— симптоматическое лечение тревоги у взрослых;

— в качестве седативного средства в период премедикации;

— симптоматическое лечение зуда аллергического происхождения.

Относится к болезням:

- Аллергия
- Зуд

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата, цетиризину и другим производным пиперазина, аминофиллину или этилендиамину;

— порфирия;

— детский возраст до 3 лет;

— беременность, период родов и грудного вскармливания.

С осторожностью: при миастении, гиперплазии предстательной железы с клиническими проявлениями, затруднением мочеиспускания, запорами, при глаукоме, деменции, судорожных расстройствах, включая эпилепсию, при склонности к аритмии, включая электролитный дисбаланс (гипокалиемия, гипомагниемия), у пациентов с сердечными заболеваниями в анамнезе (при сердечной недостаточности и артериальной гипертензии) или при применении препаратов, которые могут вызывать аритмию, при гипертиреозе. Гидроксизин способствует снижению моторики ЖКТ, развитию стенозирующей пептической язвы, нарушение дыхания.

Способ применения и дозы:

Препарат применяется внутрь.

Детям:

Для симптоматического лечения зуда аллергического происхождения:

В возрасте от 3 до 6 лет: от 1,0 мг/кг/сут до 2,5 мг/кг/сут в несколько приемов.

В возрасте от 6 лет и старше: от 1,0 мг/кг/сут до 2,0 мг/кг/сут в несколько приемов.

Для премедикации: 1 мг/кг на ночь перед анестезией.

Дозировка рассчитывается врачом индивидуально в зависимости от массы тела ребенка в соответствии с рекомендуемыми дозами, при этом следует учесть, что минимальная получаемая дозировка, после деления таблетки, составляет 12,5 мг.

Взрослым:

Для симптоматического лечения тревоги: стандартная доза 50 мг в день, разделенная на 3 приема (1/2 таблетки (12,5 мг) утром, 1/2 таблетки (12,5 мг) днем и 1 таблетка (25 мг на ночь). При тревоге в тяжелых случаях препарат применяют в дозе 50-100 мг 4 раза в сутки.

Для симптоматического лечения зуда аллергического происхождения: начальная доза 1 таблетка (25 мг) перед сном, при необходимости доза может быть увеличена до 1 таблетки (25 мг) 3-4 раза в день.

Для премедикации в хирургической практике: 2-8 таблеток (50-200 мг) на ночь перед анестезией.

Однократная максимальная доза для взрослого человека не должна превышать 8 таблеток (200 мг), максимальная суточная доза составляет не более 12 таблеток (300 мг).

Применение у особых групп пациентов:

При применении у пожилых людей доза подбирается индивидуально с учетом сопутствующих заболеваний в диапазоне рекомендуемых доз (см. раздел Фармакокинетика).

Применение у пациентов с почечной недостаточностью и нарушением функции печени:

Пациентам с тяжелой и среднетяжелой почечной недостаточностью, а также с печеночной недостаточностью необходимо снижение дозы. У пациентов с печеночной недостаточностью рекомендуется снижать суточную дозу на 33%. У пациентов с тяжелой и среднетяжелой почечной недостаточностью препарат применяется в половинной дозе

вследствие снижения экскреции основного метаболита гидроксизина - цетиризина.

Побочное действие:

Возможные побочные эффекты приведены ниже по системам организма и частоте возникновения.

Классификация ВОЗ частоты развития побочных эффектов:

очень часто - ≥1/10 назначений (>10 %)

часто - от ≥1/100 до < 1/10 назначений (>1 % и <10 %)

нечасто - от ≥ 1/1000 до <1/100 назначений (>0.1 % и <1 %)

редко - от ≥ 1/10000 до <1/1000 назначений (>0.01 % и <0.1 %)

очень редко - <1/10000 назначений (<0.01 %)

Наиболее частыми нежелательными реакциями являлись сонливость, головная боль, заторможенность, сухость во рту и утомляемость.

Нарушения со стороны иммунной системы:

редко: гиперчувствительность;

очень редко: анафилактический шок.

Нарушения со стороны нервной системы:

нечасто: головокружение, бессонница, тремор;

редко: судороги, дискинезия.

нечасто: возбуждение, спутанность сознания;

редко: галлюцинации, дезориентация.

Нарушения со стороны органа зрения:

редко: нарушение аккомодации, нарушение зрения.

Нарушение со стороны сердца:

редко: тахикардия;

частота неизвестна: удлинение интервала QT на электрокардиограмме, желудочковая тахикардия по типу «пируэт».

Нарушение со стороны сосудов:

редко: снижение артериального давления.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:

очень редко: бронхоспазм.

Нарушения со стороны ЖКТ:

нечасто: тошнота; редко: рвота, запор.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

редко: нарушение функциональных проб печени;

частота неизвестна: гепатит.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:

редко: задержка мочеиспускания.

Нарушения со стороны колеи и подкожных тканей:

редко: зуд, сыпь (эритематозная, макуло-папулезная), крапивница, дерматит;

очень редко: ангионевротический отек, повышенная потливость, острое генерализованное экзантематозно-пустулезное высыпание, многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона.

Общие расстройства:

редко: гипертермия, недомогание.

Следующие побочные эффекты наблюдались при приеме цетиризина - основного метаболита гидроксизина: тромбоцитопения, агрессия, депрессия, тик, дистония, парестезия, окулогирный криз, диарея, дизурия, энурез, астения, отеки, повышение массы тела и могут наблюдаться при приеме гидроксизина.

Передозировка:

Симптомы токсичности со стороны ЦНС связаны с чрезмерным м-холиноблокирующим действием, подавлением или парадоксальной стимуляцией ЦНС. Эти симптомы включают тошноту, рвоту, тахикардию, гипертермию, сонливость, нарушение зрачкового рефлекса, тремор, спутанность сознания или галлюцинации. Впоследствии могут развиваться угнетение сознания, дыхания, судороги, снижение артериального давления, аритмия. Возможно усугубление коматозного состояния и сердечно-легочный коллапс.

Лечение: Необходимо контролировать состояние дыхательных путей, состояние дыхания и кровообращения при помощи Электрокардиографического (ЭКГ) мониторинга, обеспечить адекватную оксигенацию. Сердечную деятельность и артериальное давление необходимо контролировать в течение 24 часов после исчезновения симптомов.

В больших дозах гидроксизин может приводить к удлинению интервала QT и явным изменениям на электрокардиограмме.

В случае нарушения психического статуса, необходимо исключить прием других препаратов или алкоголя, в случае необходимости пациенту следует провести ингаляцию кислородом, ввести налоксон, декстрозу (глюкозу) и тиамин. Применение аналептиков не допустимо.

В случае необходимости получения вазопрессорного эффекта назначается норэпинефрин или метараминол. Не следует применять эпинефрин. В случае приема внутрь значительного количества препарата, можно выполнить промывание желудка с предшествующей эндотрахеальной интубацией. Возможно применение активированного угля, однако данных, свидетельствующих о его эффективности недостаточно. Специфического антидота не существует. Гемодиализ не эффективен.

Литературные данные свидетельствуют о том, что в случае развития тяжелых, опасных для жизни, трудноизлечимых м-холиноблокирующих эффектов, не купируемых другими препаратами, возможно применение терапевтической дозы физостигмина. Физостигмин не должен применяться только для того, чтобы привести пациента в сознание. Если пациент принимал трициклические антидепрессанты, применение физостигмина может спровоцировать судорожные приступы и необратимую остановку сердца. Также следует избегать использования физостигмина у пациентов с нарушениями сердечной проводимости.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат Гидроксизин Канон противопоказан при беременности, в период родов и грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Необходимо учитывать потенцирующее действие гидроксизина при совместном применении с лекарственными препаратами, угнетающими центральную нервную систему (ЦНС), такими как наркотические анальгетики, барбитураты, транквилизаторы, снотворные средства, алкоголь. В этом случае их дозы должны подбираться индивидуально. Следует избегать одновременного применения с ингибиторами моноаминооксидазы (МАО) и холиноблокаторами. Препарат препятствует прессорному действию эпинефрина и противосудорожной активности фенитоина, а также препятствует действию бетагистина и препаратов - ингибиторов холинэстеразы.

Установлено, что применение циметидина в дозе 600 мг дважды в день увеличивает концентрацию гидроксизина в сыворотке на 36% и снижает максимальную концентрацию метаболита цетиризина на 20 %.

Эффект атропина, алкалоидов белладонны, сердечных гликозидов, гипотензивных средств, блокаторов H_2-гистаминовых рецепторов не изменяются под действием гидроксизина. Гидроксизин является ингибитором изофермента CYP2D6 и в высоких дозах может быть причиной лекарственного взаимодействия с субстратами CYP2D6. Поскольку гидроксизин метаболизируется в печени, можно ожидать увеличения его концентрации в плазме крови при одновременном применении с ингибиторами микросомальных ферментов печени. Поскольку гидроксизин

метаболизируется алкогольдегидрогеназой и изоферментом CYP3A4/5, возможно повышение концентрации гидроксизина в плазме крови при одновременном применении с препаратами, потенциально ингибирующими изофермент CYP3A4/5 (телитромицином, кларитромицином, делавирдином, стирипентолом, кетоконазолом, вориконазолом, интраконазолом, позаконазолом и некоторыми ингибиторами протеаз ВИЧ, включая атазанавир, индинавир, нелфинавир, ритонавир, саквинарин, лопинавир/ритонавир, саквинарин/ритонавир и типранавир/ритонавир). Однако торможение одного метаболического пути может частично компенсироваться работой другого. Одновременное применение гидроксизина с лекарственными препаратами, которые потенциально могут вызвать аритмию, может увеличить риск удлинения интервала QTи возникновения желудочковой тахикардии по типу «пируэт».

Применение препарата одновременно со средствами, обладающими ототоксическим эффектом, например гентамицином, может маскировать такие симптомы ототоксичности, как головокружение. Препарат следует отменить за 3 дня до планируемого проведения кожных проб с аллергенами.

Особые указания и меры предосторожности:

При одновременном применении с препаратами, обладающими м-холиноблокирующими свойствами и препаратами, угнетающими ЦНС, дозу гидроксизина необходимо уменьшить.

Гидроксизин может приводить к удлинению интервала QTна электрокардиограмме, поэтому одновременное использование с другими препаратами, которые способны нарушать сердечную деятельность, может повышать риск развития аритмий. Предполагается, что прочие препараты, которые вызывают изменения на электрокардиограмме (атропин, противопаркинсонические средства, лития карбонат, хинидин, фенотиазины, прокаинамид, трициклические антидепрессанты, тиоридазин) могут усугублять и усиливать изменения, которые могут быть вызваны гидроксизином, и повышать опасность внезапной смерти. Необходимо избегать одновременного использования двух и более препаратов, которые удлиняют интервал QT, из-за опасности аддитивных эффектов, которые могут стать причиной развития потенциально опасных для жизни и тяжелых сердечных аритмий.

При почечной и/или печеночной недостаточности дозы должны быть уменьшены.

У пожилых дозировку следует подбирать индивидуально, начиная с половины минимальной дозы, и корректируя в диапазоне рекомендуемых доз. При необходимости постановки аллергологических проб или проведения метахолинового теста прием препарата Гидроксизин Канон должен быть прекращен за 5 дней до исследования для предотвращения получения искаженных данных.

Во время лечения препаратом Гидроксизин Канон следует избегать приема алкоголя.

Влияние на способность управления транспортными средствами и механизмами

Гидроксизин Канон может ухудшать способность к концентрации внимания и скорость психомоторных реакций. Прием других седативных лекарственных средств может усиливать этот эффект. Поэтому следует воздерживаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Пациентам с тяжелой и среднетяжелой почечной недостаточностью необходимо снижение дозы. У пациентов с тяжелой и среднетяжелой почечной недостаточностью препарат применяется в половинной дозе вследствие снижения экскреции основного метаболита гидроксизина - цетиризина.

При нарушениях функции печени

Пациентам с печеночной недостаточностью необходимо снижение дозы. У пациентов с печеночной недостаточностью рекомендуется снижать суточную дозу на 33%.

Применение в пожилом возрасте

При применении у пожилых людей доза подбирается индивидуально с учетом сопутствующих заболеваний в диапазоне рекомендуемых доз (см. раздел Фармакокинетика).

Применение в детском возрасте

Противопоказано детям до 3 лет.

Условия хранения:

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

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Gidroksizin_Kanon