ИНСТРУКЦИЯ
(информация для специалистов)
по медицинскому применению препарата
АНТАКСОН

Регистрационный номер:
Торговое название: АНТАКСОН
Международное непатентованное название: налтрексон

Лекарственная форма: капсулы.
Состав на 1 капсулу:
активное вещество: налтрексона гидрохлорид 50 мг; *вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат, магния стеарат; *состав капсулы:* титана диоксид, желатин, индигокармин.
Описание: твердые желатиновые капсулы с белым непрозрачным корпусом и голубой крышечкой, размер №4, содержащие белый порошок; на корпусе капсулы указан товарный знак фирмы, на крышечке капсулы имеется надпись «Antaxone® 50».

Фармакологическая группа: опиоидных рецепторов антагонист.
Код АТХ: N07BB04.
Фармакологические свойства
Налтрексон является специфическим антагонистом опиоидных рецепторов. Конкурентно связывается с опиоидными рецепторами всех типов и предупреждает или устраняет действие как эндогенных опиоидов, так и экзогенных опиоидных препаратов – наркотических анальгетиков и их суррогатов. Введением опиоидов в увеличенных дозах можно ослабить или устранить действие этого антагониста.
Фармакодинамика. налтрексон не обладает значимыми собственными фармакологическими свойствами, за исключением некоторого сужения зрачка. В дозе 50 мг налтрексон в течение 24 часов блокирует фармакологические эффекты, вызванные внутривенным введением 25 мг героина. При удваивании дозы налтрексона это его действие удлиняется до 48 часов, а при утраивании – до 72 часов.
Препарат не вызывает привыкания и лекарственной зависимости.
Фармакокинетика. Налтрексон хорошо всасывается после приема внутрь и на 95% метаболизируется в печени с образованием фармакологически активных метаболитов. Основной метаболит – 6-бета-налтрексон – также обладает свойствами конкурентного опиоидного антагониста. Кроме него образуется 2-гидрокси-3-метокси-6-бета-налтрексон. Максимальная концентрация налтрексона и 6-бета-налтрексона в плазме крови наблюдается через 1 час после приема препарата. Препарат хорошо проникает через гистогематические барьеры – объем распределения составляет 1350 л. Время полувыведения в плазме крови для налтрексона – 4 часа, для его метаболита 6-бета-налтрексона – 13 часов, что объясняет его способность к кумуляции. Налтрексон и его метаболиты подвергаются внутрипеченочной рециркуляции. Препарат выводится через почки в неизмененном виде (около 1%) и в виде метаболитов (38% в виде свободного и связанного 6-бета-налтрексона).

Показания к применению
Комплексная терапия опиоидной наркомании (зависимости) с целью поддержания у больного состояния, при котором опиоиды не смогут оказать характерного действия. Препарат назначают только после купирования абстинентного синдрома.
Применение АНТАКСОНА начинают в специализированных отделениях по лечению наркоманий через 7-10 дней после последнего приема опиоидного наркотика, в дальнейшем



во время амбулаторного лечения больной должен находиться под врачебным контролем. У больного должна быть положительная установка на лечение наркомании.
Комплексная терапия алкоголизма, в том числе при поддерживающей терапии, в тех же дозировках, что и при героиновой наркомании на фоне психотерапии.

Противопоказания
Применение наркотических анальгетиков или положительный анализ на содержание в моче опиоидов. Положительный тест на наличие опиатов в моче.
Опиоидный абстинентный синдром.
Отсутствие данных о проведении провокационной пробы с налоксоном (см. *Способ применения и дозы*).
Повышенная чувствительность к препаратам налтрексона в анамнезе больных.
Острый гепатит или печеночная недостаточность.
Не установлена безопасность применения АНТАКСОНА у больных моложе 18 лет, при беременности и в период лактации.
С осторожностью: Нарушения функции печени и/или почек.

Способ применения и дозы
Лечение героиновой наркомании.
Фаза введения в курс терапии АНТАКСОНОМ.
Лечение АНТАКСОНОМ может быть начато не ранее чем через 7-10 дней после последнего приема опиоидного наркотика и при условии отсутствия признаков абстинентного синдрома. Воздержание от приема наркотиков определяется по результатам анализа мочи на содержание опиоидов. Лечение не начинают до тех пор, пока провокационная проба с внутривенным введением 0,5 мг НАЛОКСОНА не станет отрицательной. Налоксоновая проба не проводится больным с признаками абстинентного синдрома или при обнаружении опиоидов в моче. Повторно налоксоновую пробу можно проводить через 24 часа.
Первая доза АНТАКСОНА обычно составляет 20 мг раствора для приёма внутрь. При отсутствии в течение часа признаков синдрома отмены больному дают остаток (30 мг) дневной дозы препарата. Врачу следует контролировать акт проглатывания раствора препарата.
Поддерживающая терапия АНТАКСОНОМ.
После окончания вводной фазы назначают 50 мг АНТАКСОНА каждые 24 часа (этой дозы достаточно для предупреждения действия 25 мг внутривенно введенного героина).
Можно использовать и другие схемы лечения:
1. 50 мг АНТАКСОНА назначают ежедневно в течение первых пяти дней недели и 100 мг в на 6 день;
2. 100 мг АНТАКСОНА назначают каждые 2 дня или 150 мг каждые три дня;
3. 100 мг препарата назначают в 1 день (напр. понедельник), 100 мг во 2 день (напр. вторник) и 150 мг на 5 день (в пятницу). Эта схема удобна для больных с установкой на длительное лишение опиоидов.

Минимальный курс – от 3 месяцев, рекомендуемый курс – от 6 месяцев.
Лечение алкоголизма.
Ежедневный прием 50 мг АНТАКСОНА, минимальный курс – 3 месяца.

Побочное действие
В терапевтических дозах у больных, в организме которых не содержатся опиоиды, АНТАКСОН обычно не вызывает серьезных побочных эффектов.
С частотой более 10% как до начала лечения АНТАКСОНОМ, так и на фоне его применения у больных отмечались: нарушения сна, тревога, повышенная раздражительность, боли в животе, тошнота и рвота, слабость, головные боли, боли в мышцах и суставах. С частотой менее 10%: снижение аппетита, запор или диарея, психомоторное возбуждение, головокружение, кожные высыпания, чувство озноба, снижение половой потенции, замедление эякуляции.

Dott. Falco S.r.l.
Via Quasimodo, 10 Bresso (MI) Italy
Tel. 02 6609241
Fax 02 6609221
P.IVA 01690280159

В единичных случаях отмечены повышенная утомляемость, спутанность сознания, депрессия, галлюцинации и ночные кошмары, светобоязнь, кашель.
При лабораторной диагностике возможно повышение активности трансаминаз в крови, лимфоцитоз.
Так как отмеченные симптомы с одинаковой частотой встречались как до начала лечения, так и на фоне применения АНТАКСОНА, их, по-видимому, нельзя считать проявлениями побочного действия препарата.
Описан один случай идиопатической тромбоцитопенической пурпуры у больного, который, возможно, был сенсибилизирован к АНТАКСОНУ в ходе предыдущего лечения; выздоровление произошло после отмены препарата и проведения курса кортикостероидной терапии.

Передозировка

Достаточных клинических данных о возможности передозировки препарата в настоящее время нет. При подозрении на интоксикацию следует назначить симптоматическое лечение.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Некоторые препараты, содержащие опиоиды (противокашлевые, противопоносные средства, наркотические анальгетики) могут не вызвать желаемого эффекта у лиц, принимающих АНТАКСОН. В этих случаях следует использовать альтернативные препараты, не содержащие опиоидов. Гепатотоксичные препараты увеличивают риск поражения печени.
Случаи несовместимости с другими препаратами не описаны.

Особые указания

Антаксон необходимо отменить не менее чем за 48 ч до хирургического вмешательства, при котором требуется назначение опиоидных анальгетиков. Больной должен иметь при себе карточку назначений АНТАКСОНА для информации других медработников в случае необходимости оказания неотложной помощи. При необходимости преодоления блокирования опиоидных рецепторов (общая анестезия, обезболивание в неотложных случаях) следует использовать увеличенные дозы короткодействующих опиоидных анальгетиков для уменьшения риска угнетения дыхания и кровообращения.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В рекомендуемых дозах препарат не влияет на работу, требующую быстрой реакции и управление транспортными средствами

Форма выпуска

Капсулы 50 мг: по 10 капсул в блистерах; по 1 блистеру вместе с инструкцией по медицинскому применению в картонной пачке.

Срок годности

3 года. Не использовать позже даты, указанной на упаковке.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше +30°С в недоступном для детей месте.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Предприятие-производитель

Замбон Груп С.п.А. Виале делла Кимика, 9, Виченца, Италия
Представительство АО «Замбон Груп С.П.А.» (Италия): Россия, 119002 Москва, Глазовский пер., д. 7, оф. 17
Тел.: (095) 933-38-30/32
Факс: (095) 933-38-31

Директор ИДКЭЛС, проф. Чельцов В.В.

Представитель фирмы Лукьянова О.Н.