

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения

НАЛТРЕКСОН

Торговое наименование: Налтрексон

Международное непатентованное наименование: Налтрексон

Лекарственная форма: Таблетки покрытые оболочкой

Состав на 1 таблетку:

Действующее вещество:

Налтрексона гидрохлорид – 50 мг;

Вспомогательные вещества:

лактозы моногидрат - 123,155 мг, целлюлоза - 17,593 мг, микрокристаллическая целлюлоза - 48,084 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 3,084 мг, кросповидон - 4,334 мг, магния стеарат - 3,750 мг.

Оболочка:

Лактозы моногидрат - 3,600 мг, гипромеллоза 15 cps - 2,800 мг, титана диоксид (Е 171) - 2,561 мг, макрогол 4000 - 1,000 мг, железа оксид черный (Е 172) - 0,003 мг, железа оксид красный (Е 172) - 0,001 мг, железа оксид желтый (Е 172) - 0,035 мг.

Описание

Таблетки белого с кремовым оттенком цвета в форме капсулы, покрытые пленочной оболочкой, с разделительной насечкой с обеих сторон.

Фармакотерапевтическая 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 конкурентно блокирует опиоидные рецепторы, а также может вызывать некоторое сужение зрачка. В дозе 50 мг налтрексон в течение 24 часов

блокирует фармакологические эффекты, вызванные внутривенным введением 25 мг героина. При удвоении дозы налтрексона это его действие удлинится до 48 часов, а при утравивании – 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. Основным метаболитом – 6-бета-налтрексол – также обладает свойствами конкурентного опиоидного антагониста. Кроме него образуется 2-гидрокси-3-метокси-6-бета-налтрексол и 2-гидрокси-3-метил-налтрексон. Максимальная концентрация налтрексона и 6-бета-налтрексолов в плазме крови наблюдается через 1 час после приема препарата. Хорошо проникает через гистогематические барьеры – объем распределения составляет 1350 л. Период полувыведения в плазме крови для налтрексона – 4 часа, для его метаболита 6-бета-налтрексолов – 13 часов, что объясняет его способность к кумуляции. Налтрексон и его метаболиты подвергаются внутрипеченочной рециркуляции. Налтрексон выводится через почки в неизменном виде (около 1%) и в виде метаболитов (43% в виде свободного и связанного 6-бета-налтрексолов).

Показания к применению

Опиоидная наркомания (в качестве вспомогательного лекарственного средства после отмены опиоидных анальгетиков), алкоголизм.

Противопоказания

Применение наркотических анальгетиков. Положительный тест на наличие опиоидов в моче. Состояние абстиненции на фоне опиоидной зависимости. Отсутствие данных о проведении провокационной пробы с налоксоном (см. *Способ применения и дозы*). Гиперчувствительность к компонентам препарата, в том числе в анамнезе. Острый гепатит или печеночная недостаточность. Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозогалактозная мальабсорбция.

Не установлена безопасность применения Налтрексона у больных моложе 18 лет, при беременности и в период лактации.

С осторожностью

Нарушение функции печени и/или почек.

Способ применения и дозы

Внутрь. Лечение опиоидной наркомании.

Фаза введения в курс терапии Налтрексоном.

Лечение Налтрексоном может быть начато не ранее чем через 7-10 дней после последнего приема опиоидного наркотика и при условии отсутствия признаков опиоидного 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 опиоидного абстинентного синдрома или при обнаружении опиоидов в моче. Повторно налоксоновую пробу можно проводить через 24 часа.

Первая доза Налтрексона обычно составляет 25 мг (половина таблетки). При отсутствии в течение часа признаков синдрома «отмены» больному дают остаток (25 мг) дневной дозы препарата.

Врачу следует контролировать акт проглатывания препарата.

Поддерживающая терапия Налтрексоном

После окончания вводной фазы назначают 50 мг Налтрексона каждые 24 часа (этой дозы достаточно для предупреждения действия 25 мг внутривенно введенного героина).

Можно использовать и другие схемы лечения:

1. 50 мг Налтрексона назначают ежедневно в течение первых пяти дней недели и 100 мг на 6 день;
2. 100 мг Налтрексона назначают каждые 2 дня или 150 мг каждые 3 дня;
3. 100 мг препарата назначают в 1 день (например, понедельник), 100 мг во 2 день (например, вторник) и 150 мг на 5 день (в пятницу). Эта схема удобна для больных с установкой на длительное лечение опиоидной наркомании.

Минимальный курс — от 3 месяцев, рекомендуемый курс — от 6 месяцев.

Лечение алкоголизма.

Внутрь по 50 мг 1 раз в день; минимальный курс - 3 месяца.

Комплексная терапия алкоголизма, в том числе при поддерживающей терапии, в тех же дозировках, что и при опиоидной наркомании на фоне психотерапии.

Лечение должно проходить под строгим врачебным контролем в специализированном отделении.

Критериями отбора пациентов для лечения алкоголизма являются: 1) положительная установка на лечение; 2) готовность отказаться от употребления алкоголя (психоактивных веществ); 3) участие в реабилитационных программах; 4) начало здорового образа жизни после окончания курса лечения.

Побочное действие

В терапевтических дозах у больных, в организме которых не содержатся опиоиды, Налтрексон обычно не вызывает серьезных побочных эффектов.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота и/или рвота, абдоминальная боль; снижение или повышение аппетита, анорексия, диарея или запор, сухость слизистой оболочки полости рта, метеоризм, усугубление симптомов геморроя, эрозивно-язвенные

поражения желудочно-кишечного тракта, боль в животе, повышение активности "печеночных" ферментов.

Со стороны нервной системы и органов чувств: беспокойство, нервозность, необычная усталость, общая слабость, беспокойный сон, "кошмарные" сновидения, головная боль, головокружение, нечеткость зрительного восприятия, спутанность сознания, галлюцинации, угнетение центральной нервной системы, звон и ощущение заложенности в ушах, боль и чувство жжения в глазах, светобоязнь, раздражительность, сонливость, дезориентация во времени и пространстве, мигрень, обморочные состояния, астения, вялость, летаргия, тревога.

Со стороны дыхательной системы: кашель, охриплость голоса, заложенность носа (гиперемия сосудов носа), ринорея, чиханье, бронхообструкция, затруднение дыхания, одышка, носовое кровотечение, сухость в горле, повышенное отделение слизистой мокроты, инфекции верхних дыхательных путей, синусит, ларингит, фарингит (в т.ч. стрептококковый), назофарингит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: боль в груди, повышение артериального давления, тахикардия, ощущение сердцебиения, неспецифические изменения на электрокардиограмме, флебит.

Со стороны мочеполовой системы: дискомфорт при мочеиспускании, учащение мочеиспускания, отечный синдром (отек лица, пальцев, стоп, голеней), сексуальные расстройства у мужчин (задержка эякуляции, снижение потенции).

Аллергические реакции: кожная сыпь, гиперемия кожи (в т.ч. гиперемия лица); гипертермия, кожный зуд, повышение секреции слюнных желез, озноб.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: артралгия, миалгия; артрит, скованность суставов, боль в спине, боль в конечностях, спазм, подергивание или скованность мышц.

Со стороны кожных покровов: папулезная сыпь, потница, угри, алопеция.

Прочие: жажда, увеличение или потеря массы тела, боль в паховой области, увеличение лимфатических узлов, лимфоцитоз; развитие идиопатической тромбоцитопенической пурпуры на фоне предварительной сенсibilизации к препарату (выздоровление произошло после отмены препарата и проведения курса глюкокортикостероидной терапии).

Синдром "отмены" опиоидов: абдоминальная боль, спазмы в эпигастриальной области, беспокойство, нервозность, усталость, раздражительность, диарея, тахикардия, гипертермия, ринорея, чиханье, "гусиная кожа", потливость, зевота, артралгия, миалгия, анорексия, тошнота и/или рвота, тремор, общая слабость.

Постмаркетинговый опыт:

Со стороны пищеварительной системы: извращение вкуса, гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь, геморрой, колит, желудочно-кишечное кровотечение, паралитическая непроходимость кишечника, параректальный абсцесс, гастроэнтерит, абсцесс зуба, холелитиаз, острый холецистит.

Со стороны центральной нервной системы: нарушение концентрации внимания, судороги, ишемический инсульт, аневризма мозговых артерий, раздражительность, алкогольный абстинентный синдром, агитация, эйфория, делирий.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: боль в конечностях.

Со стороны кожных покровов: воспаление подкожной клетчатки.

Со стороны органов чувств: конъюнктивит.

Со стороны дыхательной системы: боль в горле, одышка, хроническая обструктивная болезнь легких, грипп, бронхит, пневмония.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: "приливы", тромбоз глубоких вен, тромбоэмболия легочной артерии, фибрилляция предсердий, инфаркт миокарда, стенокардия, в т.ч. нестабильная, хроническая сердечная недостаточность, атеросклероз коронарных артерий.

Прочие: тепловой удар, обезвоживание, гиперхолестеринемия, лейкоцитоз.

Аллергические реакции: ангионевротический отек, крапивница.

Со стороны мочевыделительной системы: инфекции мочевыводящих путей.

Со стороны репродуктивной системы: самопроизвольный аборт, снижение либидо.

Передозировка:

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Некоторые препараты, содержащие опиоиды (противокашлевые, противодиарейные средства, наркотические анальгетики) могут не вызвать желаемого эффекта у лиц, принимающих Налтрексон. 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

Конкурентная блокада опиоидных рецепторов может быть преодолена введением более высокой дозы наркотического анальгетика.

Перед началом лечения необходимо исключить наличие печеночной недостаточности и в период лечения периодически контролировать активность трансаминаз; нельзя сочетать с препаратами, обладающими гепатотоксическими свойствами.

Налтрексон необходимо отменить не менее чем за 48 ч до хирургического вмешательства, при котором требуется применение опиоидных анальгетиков. 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.

Для предотвращения развития острого абстинентного синдрома пациенты должны, как минимум за 7–10 дней прекратить прием опиоидов и препаратов, их содержащих, обязательно определение опиоидов в моче и проведение провокационного теста с налоксоном; при несоблюдении этих требований абстинентный синдром может проявиться через 5 мин после введения и продолжаться в течение 48 ч.

При обращении за медицинской помощью больные обязаны информировать медицинских работников о лечении Налтрексоном.

В случае появления болей в животе, потемнения мочи, пожелтения склер необходимо прекратить прием и обратиться к врачу.

Налтрексон неэффективен при лечении кокаиновой, а также неопиоидной лекарственной зависимости.

Лекарственная зависимость

Налтрексон - полный антагонист опиоидов: не вызывает толерантности, физической или психической зависимости.

Препарат может вызывать головокружение и др. нежелательные явления, способные влиять на управление транспортными средствами и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой 50 мг.

По 7 таблеток в блистер из ПВХ (с нанесенным слоем ПВДХ)/алюминиевой фольги. По 4 блистера вместе с инструкцией по применению в пачку картонную.

Условия хранения

При температуре не выше 25°C, в сухом, защищенном от света месте.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

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

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения / Производитель

Русан Фарма Лтд, Индия

58-Д, Гавернмент Индастриал Истейт

Чаркоп, Кандивали Вест, Мумбай-400067

Адрес производственной площадки:

Плот №59-65, Сектор II,

Кандла Специал Экономик Зон,

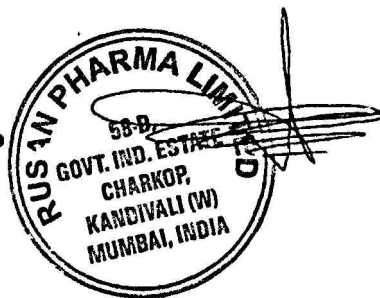
Гандхидхам, Кач – 370230, штат Гуджарат, Индия

Претензии потребителей направлять в адрес представительства:

117556, Москва, Симферопольский бульвар, д. 7а, к. 113.

Тел./Факс: +7 495-775-20-53

Представитель фирмы в РФ



Ашок Кумар