

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Алпразолам, 0,25 мг, таблетки

Алпразолам, 1 мг, таблетки

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: алпразолам.

Алпразолам, 0,25 мг, таблетки

Каждая таблетка содержит 0,25 мг алпразолама.

Алпразолам, 1 мг, таблетки

Каждая таблетка содержит 1 мг алпразолама.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. разделы 4.3., 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки.

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с фаской.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Алпразолам показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет:

- лечение невротических и неврозоподобных расстройств с проявлением тревоги (в т. ч. связанных с депрессией);
- панические расстройства.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Дозы подбирают в зависимости от выраженности синдрома, индивидуальной чувствительности больного и его реакции на препарат. Начинают применение с минимальных доз (0,25 - 0,5 мг/сут) с последующим увеличением сначала в вечерние, а затем в дневные часы в течение нескольких дней или недель.

Взрослые

Тревожные состояния, беспокойства

При тревожных состояниях, беспокойстве начальная суточная доза составляет 0,75 - 1,5 мг и может быть увеличена до 3 - 4,5 мг/сут.

Панические расстройства

При панических расстройствах и депрессивных состояниях суточная доза может достигать 3 - 6 мг, высшая суточная доза – 10 мг.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Пожилым и ослабленным больным назначают 0,25 мг 2 - 3 раза в сутки. Дальнейшее увеличение дозы до 0,5 - 0,75 мг/сут проводят с осторожностью при хорошей переносимости препарата.

Дети

Алпразолам противопоказан у детей.

Способ применения

Внутрь, независимо от приема пищи.

Продолжительность применения

Курс лечения алпразоламом – от нескольких дней (при остром состоянии страха) до 3 мес. Прекращение лечения следует проводить в течение 2 - 6 нед., снижая суточную дозу не более чем на 500 мкг каждые 3 дня, с целью предупреждения развития синдрома «отмены» (резкое прекращение терапии может вызвать обострение тревоги и страха), иногда может потребоваться еще более медленная отмена.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к алпразоламу или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- кома;
- шок;
- миастения;
- закрытоугольная глаукома (острая, приступ или предрасположенность);
- острые отравления алкоголем (с ослаблением жизненно важных функций) (см. раздел 4.4.);
- острые отравления наркотическими анальгетиками, снотворными и психоактивными лекарственными средствами (см. раздел 4.5.);
- одновременное применение с мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 (кетоконазол и итраконазол) (см. раздел 4.5.);

- тяжелое течение хронической обструктивной болезни легких (прогрессирование степени дыхательной недостаточности);
- тяжелая депрессия (могут проявляться суицидальные наклонности);
- беременность (см. раздел 4.6.);
- период лактации (см. раздел 4.6.);
- детский возраст до 18 лет (безопасность и эффективность не определены);
- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Печеночная и/или почечная недостаточность, церебральные или спинальные атаксии, лекарственная зависимость в анамнезе, склонность к злоупотреблению психоактивными веществами, в том числе лекарственными средствами, гиперкинезы, органические заболевания головного мозга, психоз (возможны парадоксальные реакции), гипопротеинемия, ночное апноэ (установленное или предполагаемое), пожилой возраст.

Особые указания

В процессе лечения алпразоламом пациентам категорически запрещается употребление этанола (см. раздел 4.5.).

При почечной недостаточности и длительном лечении необходим контроль за картиной периферической крови и «печеночными» ферментами.

Пациенты, не принимавшие ранее психоактивные лекарственные средства, «отвечают» на препарат в более низких дозах по сравнению с больными, принимавшими антидепрессанты, анксиолитики или с алкоголизмом.

Зависимость

Подобно другим бензодиазепинам алпразолам обладает способностью вызывать лекарственную зависимость при длительном приеме.

Депрессия

Прием алпразолама при тяжелой депрессии может усилить проявления суицидальной наклонности.

Алпразолам оказывает влияние на память, вызывая антероградную амнезию.

Глаукома

Алпразолам может повышать внутриглазное давление, поэтому его применение может вызвать острый приступ или предрасположенность к нему при закрытоугольной глаукоме.

Синдром отмены

При быстром снижении дозы или резком прекращении приема алпразолама возможно развитие синдрома «отмены» (депрессия, раздражительность, бессонница, повышенное потоотделение и другое), особенно при длительном приеме (более 8 - 12 нед). Синдром «отмены» чаще встречается у лиц, длительно получавших высокие дозы препарата.

Парадоксальные реакции

При возникновении у пациентов таких необычных реакций, как повышенная агрессивность, нарушение психомоторных функций, острые состояния возбуждения, чувство страха, мысли о самоубийстве, галлюцинации, усиление мышечных судорог, трудное засыпание, поверхностный сон, лечение следует прекратить.

Вспомогательные вещества

Препарат Алпразолам содержит лактозы моногидрат. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы лопарей или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует применять этот препарат.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Отмечается взаимное усиление эффекта при одновременном применении антипсихотических (нейролептических), противоэpileптических или снотворных лекарственных средств, а также центральных миорелаксантов, наркотических анальгетиков, этанола и лекарственных средств для общей анестезии.

Ингибиторы микросомальных ферментов печени

Ингибиторы микросомальных ферментов печени повышают, а индукторы снижают концентрацию алпразолама в плазме (возможно изменение эффективности алпразолама).

Ингибиторы протеазы ВИЧ и ингибиторы изофермента CYP3A4

Ингибиторы протеазы ВИЧ и ингибиторы изофермента CYP3A4 изменяют метаболизм алпразолама в печени, повышая его концентрацию в плазме и усиливая активность.

Ингибиторы MAO

Ингибиторы MAO потенцируют угнетающее действие на сердечно-сосудистую и центральную нервную систему.

Антидепрессанты

При одновременном применении с антидепрессантами отмечается усиление воздействия антидепрессантов.

Гипотензивные препараты

Алпразолам может усиливать выраженность снижения артериального давления на фоне гипотензивных лекарственных средств.

Клозапин

При одновременном применении с клозапином возможно усиление угнетения дыхания.

Гормональные контрацептивы

При одновременном применении гормональные контрацептивы для приема внутрь увеличивают $T_{1/2}$ алпразолама.

Декстропропоксифен

При одновременном применении алпразолама с декстропропоксифеном наблюдается более выраженное угнетение ЦНС, чем в комбинации с другими бензодиазепинами, т.к. возможно повышение концентрации алпразолама в плазме крови.

Дигоксин

Одновременный прием дигоксина увеличивает риск развития интоксикации сердечными гликозидами.

Имипрамин

Алпразолам повышает концентрацию имипрамина в плазме крови.

Итраконазол, кетоконазол

При одновременном применении итраконазол, кетоконазол усиливают эффекты алпразолама.

Пароксетин

При одновременном применении пароксетина возможно усиление эффектов алпразолама, обусловленное угнетением его метаболизма.

Флувоксамин

Флувоксамин повышает концентрацию алпразолама в плазме крови и риск развития его побочных эффектов.

Флуоксетин

При одновременном применении флуоксетина возможно повышение концентрации алпразолама в плазме крови вследствие уменьшения его метаболизма и клиренса под влиянием флуоксетина, что сопровождается психомоторными нарушениями.

Эритромицин

Нельзя исключить возможность усиления действия алпразолама при одновременном применении с эритромицином.

Леводопа

Снижает эффективность леводопы у больных паркинсонизмом.

Зидовудин

Может повышать токсичность зидовудина.

Этанол

В процессе лечения алпрозоламом пациентам категорически запрещается употребление этанола.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Применение алпрозолама во время беременности противопоказано. В период беременности применяют только в исключительных случаях и только по жизненным показаниям. Оказывает токсическое действие на плод и увеличивает риск развития врожденных пороков при применении в I триместре беременности. Прием терапевтических доз в более поздние сроки беременности может вызвать угнетение ЦНС новорожденного. Постоянное применение во время беременности может приводить к физической зависимости с развитием синдрома «отмены» у новорожденного. Резкое прекращение употребления алпрозолама у долгосрочных пользователей из-за опасений тератогенности связано с высоким риском сильной абстиненции и тяжелым синдромом отмены.

Использование алпрозолама непосредственно перед родами или во время родов может вызывать у новорожденного угнетение дыхания, снижение мышечного тонуса, гипотонию, гипотермию и слабый акт сосания (синдром «вялого ребенка»).

Лактация

На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

В период лечения необходимо воздержаться от вождения автомобиля и занятий потенциально опасными видами деятельности.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции приведены в соответствии с системно-органной классификацией и распределением по частоте возникновения. В каждой частотной группе побочные действия представлены в порядке уменьшения их серьезности.

Частота побочных эффектов определена следующим образом: очень часто: $\geq 1/10$; часто: $\geq 1/100$, $< 1/10$; нечасто: $\geq 1/1000$, $< 1/100$; редко: $\geq 1/10\ 000$, $< 1/1000$; очень редко: $< 1/10000$; частота неизвестна (не может быть определена на основании имеющихся данных).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы:

редко - лейкопения, нейтропения, анемия, тромбоцитопения;

очень редко - агранулоцитоз.

Нарушения со стороны иммунной системы:

очень редко - анафилаксия, кожная сыпь и зуд.

Нарушения со стороны нервной системы:

часто - сонливость, головокружение;

нечасто - головная боль, депрессия, нервозность, тревога, тремор, нарушения памяти и координации, шаткость походки, мышечная слабость, замедление психических и двигательных реакций, нарушения сна;

редко - возбуждение, нарушение концентрации внимания, раздражительность, анорексия, смазанная речь, спутанность сознания, галлюцинации;

очень редко - дезориентация, эйфория, снижение настроения, дистонические экстрапирамидные реакции (неконтролируемые движения, в том числе глаз), чувство усталости.

Нарушения со стороны органа зрения:

редко - размытое зрение, миопия, фотофобия, повышение внутриглазного давления.

Нарушения со стороны сердца:

редко - снижение сократимости миокарда и как следствие сердечного выброса, синусовая тахикардия.

Нарушения со стороны сосудов:

редко - невыраженная артериальная гипотензия при передозировке.

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

нечасто - заложенность носа, гипервентиляция;

редко - ощущение удушья, носовые кровотечения, ринорея.

Желудочно-кишечные нарушения:

редко - дисфагия, сухость слизистой оболочки полости рта или слюнотечение, изжога, тошнота, рвота, диспепсия, диарея или запор, боли в животе.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

очень редко - нарушения функции печени, желтуха, повышение активности «печеночных» трансаминаз и щелочной фосфатазы.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:

редко - увеличение частоты мочеиспускания, задержка или недержание мочи, нарушение функции почек, снижение или повышение либидо;

очень редко - дисменорея.

Общие нарушения и реакции в месте введения:

редко – изменение массы тела, различные проявления со стороны вегетативной нервной системы.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непосредственного мониторинга соотношения «польза/риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств - членов Евразийского экономического союза.

· Российская Федерация

Адрес: 109012, Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефон: +78005509903

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. Передозировка

Симптомы: атаксия, сонливость, спутанность сознания, снижение рефлексов, нистагм, тремор, брадикардия, одышка или затрудненное дыхание, снижение артериального давления, кома.

Лечение: необходимо вызвать рвоту и провести промывание желудка, прием активированного угля. Симптоматическая терапия (поддержание дыхания и артериального давления), введение флумазенила (в условиях стационара). При выраженной гипотензии – введение норэпинефрина. Гемодиализ малоэффективен.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: психолептики; анксиолитические средства; производные бензодиазепина.

Список III перечня наркотических средств, психотропных веществ и их прекурсоров, подлежащих контролю в Российской Федерации.

Код АТХ: N05BA12

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Алпразолам оказывает анксиолитическое, центральное миорелаксирующее, противосудорожное, седативно-снотворное и антипаническое действие. Оказывает угнетающее действие на центральную нервную систему, реализующееся преимущественно в таламусе, гипоталамусе и лимбической системе. Усиливает ингибирующее действие гамма-аминомасляной кислоты, являющейся одним из основных медиаторов пре- и постсинаптического торможения передачи нервных импульсов в центральной нервной системе.

Механизм действия алпразолама определяется стимуляцией бензодиазепиновых рецепторов супрамолекулярного гамма-аминомасляной кислоты-бензодиазепин-хлорионофор рецепторного комплекса, приводящей к активации рецептора гамма-аминомасляной кислоты, вызывающей снижение возбудимости подкорковых структур головного мозга, торможение полисинаптических спинальных рефлексов.

Анксиолитическое действие проявляется в уменьшении эмоционального напряжения, ослаблении симптомов тревоги, страха.

Выраженная анксиолитическая активность сочетается с умеренным снотворным действием; укорачивает период засыпания, увеличивает продолжительность сна, снижает количество ночных пробуждений. Механизм снотворного действия заключается в угнетении клеток ретикулярной формации ствола головного мозга. Уменьшает воздействие эмоциональных, вегетативных и моторных раздражителей, нарушающих механизм засыпания.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

При пероральном приеме максимальная концентрация в плазме достигается примерно через 1 - 2 часа. После однократного перорального приема дозы 0,5 мг средняя максимальная концентрация составила 7,1 мг/мл. Существует линейная зависимость между дозой алпразолама и концентрацией в плазме. При пероральном приеме всасывается примерно 80 % дозы.

Распределение

Около 80 % алпразолама связывается с белками плазмы. Может проходить через плаценту, гематоэнцефалический барьер, проникать в грудное молоко. Равновесная концентрация в плазме обычно достигается в течение нескольких (2 - 3) дней.

Биотрансформация

Алпразолам активно метаболизируется в печени до неактивных или малоактивных метаболитов. В метаболизме препарата участвуют изоферменты CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7. В моче человека обнаружено 29 метаболитов. Основными метаболитами являются α -гидроксиалпразолам, 4-гидроксиалпразолам, α -4-дигидроксиалпразолам.

Элиминация

Выведение алпразолама из организма происходит главным образом через почки в виде конъюгатов с глюкуроновой кислотой. Период полувыведения – 11 - 16 ч. Накопление при повторном приеме – минимальное (относится к бензодиазепинам со средним периодом полувыведения), выведение после прекращения лечения – быстрое.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Лактозы моногидрат,
Крахмал картофельный,
Повидон К-17,
Магния стеарат.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности

5 лет.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Список III перечня наркотических средств, психотропных веществ и их прекурсоров, подлежащих контролю в Российской Федерации.

Хранить при температуре не выше 25 °C в оригинальной упаковке (контурная ячейковая упаковка в пачке) для защиты от света.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению (листочком-вкладышем) помещают в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Акционерное общество «Органика» (АО «Органика»)

654034, Кемеровская область - Кузбасс, г.о. Новокузнецкий, г. Новокузнецк, район Кузнецкий, шоссе Кузнецкое, д. 3

тел. (3843) 994-222

root@organica.su

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Акционерное общество «Органика» (АО «Органика»)

654034, Кемеровская область - Кузбасс, г.о. Новокузнецкий, г. Новокузнецк, район Кузнецкий, шоссе Кузнецкое, д. 3

тел. (3843) 994-222

root@organica.su

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первичной регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Алпрозолам доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://www.eec.eaeunion.org/>.