

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата

ЗОЛОМАКС®

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: ЗОЛОМАКС®

Международное непатентованное название: алпразолам

Лекарственная форма: таблетки

СОСТАВ

1 таблетка содержит:

активное вещество: алпразолам – 0,25 мг или 1,0 мг;

вспомогательные вещества: докузат натрия, натрия бензоат, крахмал прежелатинизированный, целлюлоза микрокристаллическая; лактоза, моногидрат; магния стеарат, кремния диоксид коллоидный; краситель (только в таблетках 1 мг) – индигокармин (ЕЕС E132).

ОПИСАНИЕ

Таблетки 0,25 мг: овальные таблетки белого цвета, на одной стороне – риска, на другой стороне надпись «APZM 0.25», с фаской.

Таблетки 1 мг: овальные таблетки голубого цвета, на одной стороне – риска, на другой стороне надпись «APZM 1», с фаской.

Фармакотерапевтическая группа: анксиолитическое средство (транквилизатор).

Код АТХ: N05BA12.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКОЕ ДЕЙСТВИЕ

Сильнодействующее вещество (утверждено на заседании Постоянного комитета по контролю наркотиков 17 апреля 2002 г, протокол № 1/84-2002).

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

Механизм действия алпразолама определяется стимуляцией бензодиазепиновых рецепторов супрамолекулярного ГАМК-бензодиазепин-хлорионофор рецепторного комплекса, приводящей к активации рецептора ГАМК, 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.

Практически не оказывает влияния на сердечно-сосудистую и дыхательную систему.

Фармакокинетика

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

Около 80 % препарата связывается с белками плазмы.

Может проходить через плаценту, гематоэнцефалический барьер (ГЭБ), проникать в грудное молоко. Равновесная концентрация в плазме обычно достигается в течение нескольких (2 – 3) дней.

Алпразолам активно метаболизируется в печени, основным метаболитом является альфа-гидроксильный метаболит, который обладает биологической активностью. В метаболизме препарата участвуют изоферменты CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7. Выведение препарата из организма происходит главным образом через почки в виде соединений с глюкуроновой кислотой. Период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет 11 – 16 часов. Накопление при повторном назначении – минимальное (относится к бензодиазепинам с коротким или средним периодом полувыведения), выведение после прекращения лечения быстрое.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

Лечение невротических и невротоподобных расстройств с проявлением тревоги, в том числе связанных с депрессией.

Панические расстройства.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Повышенная чувствительность к алпразоламу или другим бензодиазепинам.

Кома, шок, закрытоугольная глаукома, миастения, острые отравления алкоголем, наркотическими, снотворными и психотропными средствами, тяжелое течение хронических обструктивных заболеваний легких, тяжелая депрессия (суицидальные попытки), синдром апноэ во сне, выраженные нарушения функции почек и печени; беременность (особенно I триместр – см. «Особые указания»), период кормления грудью.

В связи с наличием в составе лактозы, пациенты с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией, не должны принимать препарат.

Безопасность применения алпразолама у детей и подростков (до 18 лет) не установлена.

С осторожностью: церебральные и спинальные атаксии, лекарственная зависимость в анамнезе, склонность к злоупотреблению психотропными препаратами, гиперкинез, органические заболевания головного мозга, психоз (возможны парадоксальные реакции), гипопротейнемия, печеночная недостаточность, хроническая почечная недостаточность, пожилой возраст.

Применение при беременности и в период лактации

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.

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

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь, 2 – 3 раза в день, независимо от приема пищи.

Доза препарата ЗОЛОМАКС® подбирается индивидуально и корректируется в процессе лечения в зависимости от эффекта и индивидуальной переносимости. Рекомендуется использование минимальных эффективных доз.

При тревожных состояниях начальная доза составляет 0,25 мг – 0,5 мг три раза в день. При необходимости данную дозу можно увеличивать до 4 мг/сут (разделенных на несколько приемов).

При панических расстройствах – 0,5 мг 3 раза в сутки, суточная доза может достигать 3 - 6 мг, высшая суточная доза - 10 мг.

При тревожных состояниях, связанных с депрессией, начальная доза составляет 0,5 мг три раза в день. При необходимости доза повышается до 4,5 мг/сут. Начальная доза может назначаться перед сном, чтобы минимизировать дневную сонливость. Длительность лечения – 4 – 12 недель.

Прекращение приема препарата ЗОЛОМАКС® следует производить с большой осторожностью. Постепенная отмена препарата должна занимать продолжительный период времени, т.е. если пациент принимает 0,5 мг утром, 0,5 мг днем и 1 мг вечером, то ему следует снижать суточную дозу не более чем на 0,25 мг каждые 3 дня.

Для большинства пациентов достаточной дозой является 4 – 6 мг/сут на протяжении 4 – 12 недель. В отдельных случаях, при необходимости, дозу можно увеличивать до 10 мг/сут (но не более чем на 1 мг каждые 3 – 4 дня), а длительность лечения – до 8 месяцев.

При лечении пожилых и ослабленных больных следует использовать меньшие дозы: начальная доза – 0,25 мг 2 – 3 раза в сутки, при необходимости и хорошей переносимости ее постепенно увеличивают до 0,5 – 0,75 мг/сут.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Побочные эффекты, как правило, встречаются в начале лечения и постепенно исчезают по мере дальнейшего применения препарата или снижения дозы.

Со стороны центральной нервной системы: в начале лечения (особенно у пожилых больных) – сонливость, чувство усталости, головокружение, нарушение концентрации внимания, дезориентация, замедление психических и двигательных реакций; редко – головная боль, эйфория, снижение настроения, тремор, снижение памяти, спутанность сознания, нарушения координации движений, дистонические экстрапирамидные реакции (неконтролируемые движения, в т.ч. глаз), миастения, дизартрию; крайне редко – парадоксальные реакции (агрессивные вспышки, спутанность сознания, психомоторное возбуждение, страх, суицидальная наклонность, мышечный спазм, галлюцинации, раздражительность, тревожность, бессонница).

Со стороны органов кроветворения: лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз (озноб, гипертермия, боль в горле, необычная усталость или слабость), анемия, тромбоцитопения.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту или слюнотечение, изжога, тошнота, рвота, анорексия, запор, диарея; нарушения функции печени, повышение активности «печеночных» трансаминаз и щелочной фосфатазы (ЩФ), желтуха.

Со стороны мочеполовой системы: недержание мочи, задержка мочи, нарушение функции почек, снижение или повышение либидо, дисменорея.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

Влияние на плод: тератогенность (особенно I триместр), угнетение центральной нервной системы, нарушение дыхания и подавление сосательного рефлекса у новорожденных, матери которых применяли препарат.

Прочие: привыкание, лекарственная зависимость; снижение артериального давления (АД); редко – нарушение зрения (диплопия), снижение массы тела, тахикардия. При резком снижении дозы или прекращении приема – синдром «отмены» (повышенная раздражительность, нарушение сна, дисфория, спазм гладких мышц внутренних органов и скелетной мускулатуры, деперсонализация, усиление потоотделения, депрессия, тошнота, рвота, тремор, расстройства восприятия, в т.ч. гиперактузия, парестезия, светобоязнь; тахикардия, судороги, редко – острый психоз).

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Передозировка – прием 500 – 600 мг препарата.

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

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля; симптоматическая терапия (поддерживание дыхания и АД), введение флумазенила (в условиях стационара).

Гемодиализ – малоэффективен.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Алпразолам усиливает действие других психотропных препаратов, противосудорожных и антигистаминных средств, этанола и препаратов, оказывающих угнетающее воздействие на ЦНС.

Ингибиторы микросомального окисления – повышают риск развития токсических эффектов. Индукторы микросомальных ферментов печени – уменьшают эффективность. Гипотензивные средства могут усиливать выраженность снижения АД.

Клозапин – возможно усиление угнетения дыхания. Снижает эффективность леводопы у больных паркинсонизмом. Потенциально возможно повышение токсичности зидовудина.

Алпразолам в дозе 4 мг/сут увеличивает концентрации в плазме имипрамина и дезипрамина при одновременном приеме. Метаболический клиренс алпразолама уменьшается при одновременном приеме обычных терапевтических доз циметидина и антибиотиков из группы макролидов. Одновременное применение с циметидином, макролидами, нефазодоном, флувоксамином, флуоксетином, декстропропаксифеном, сертралином, дилтиаземом, дигоксином и пероральными контрацептивами может снизить метаболизм алпразолама в печени и усилить его эффект.

Особые указания

В процессе лечения алпразоламом больным категорически запрещается употребление алкоголя (этанола).

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

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

При эндогенных депрессиях алпразолам можно применять в комбинации с антидепрессантами. При применении алпразолама больными депрессией отмечены случаи развития гипоманиакального и маниакального состояния.

Пациенты с депрессивными расстройствами должны находиться под наблюдением, особенно в начале лечения, из-за повышенного риска суицидальных попыток.

Подобно другим бензодиазепинам, алпразолам обладает способностью вызывать лекарственную зависимость при длительном приеме в больших дозах (более 4 мг/сут).

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

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки по 0,25 мг и 1 мг.

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой. 3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Сильнодействующее вещество (утверждено на заседании Постоянного комитета по контролю наркотиков 17 апреля 2002 г, протокол № 1/84-2002).

Владелец регистрационного удостоверения

АО «Гриндекс».

Ул. Крустпилс, 53, Рига, LV-1057, Латвия

Телефон: +371 67083205

Факс: +371 67083505

Электронная почта: grindeks@grindeks.lv

Производитель: «Драгенофарм Апотекер Пюшль ГмбХ», Германия

Фасовка и упаковка: АО «Гриндекс», Латвия

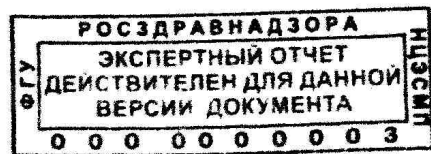
Организация, принимающая претензии: представительство в Москве.

Адрес представительства: 123242, Москва, ул. Б. Грузинская, д. 14, комн. правления 2, тел. в Москве: (495) 7716505 *.

**Представитель
АО «Гриндекс»**



М.В. Колпакова



* В случае изменения указывается новый номер телефона.