

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

Sprawdzono
pod względem merytorycznym
2008 -09- 24

1. NAZWA WŁASNA PRODUKTU LECZNICZEGO

HYDROXYZINUM ESPEFA, 25 mg, tabletki powlekane

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY SUBSTANCJI CZYNNYCH

1 tabletka zawiera 25 mg chlorowodorku hydroksyzyny (*Hydroxyzini hydrochloridum*).

Produkt zawiera laktozę bezwodną.

Substancje pomocnicze, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletka powlekana

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

- leczenie objawowe lęku u dorosłych
- objawowe leczenie świądu
- premedykacja przed zabiegami chirurgicznymi

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dorośli :

W leczeniu lęku:

50 mg/dobę w 2-3 dawkach podzielonych;

W ciężkich przypadkach można stosować doustnie dawki do 300 mg/dobę.

W objawowym leczeniu świądu:

Leczenie należy rozpocząć od dawki 25 mg przed snem, kontynuować terapię zwiększając w miarę potrzeby dawkę, podając po 25 mg, 3 do 4 razy na dobę.

W premedykacji przed zabiegami chirurgicznymi:

50 do 100 mg w pojedynczej dawce.

Dzieci:

W wieku od 3 do 6 lat: nie zaleca się stosowania tabletek (25 mg) u dzieci w tym wieku. Dla dzieci w wieku od 3 do 6 lat są dostępne inne produkty lecznicze zawierające hydroksyzynę, w postaci syropu doustnego, które zapewniają właściwe dawkowanie i nie powodują ryzyka zachłyśnięcia.

W wieku powyżej 6 lat, tylko wtedy, kiedy zalecana dawka pojedyncza wynosi 25 mg, dla innych dzieci jest dostępna postać hydroksyzyny w syropie, pozwalająca na właściwe dawkowanie.

W objawowym leczeniu świądu:

Od 3 do 6 lat: 5 do 15 mg / dobę, aż do 50 mg / dobę w dawkach podzielonych.

Powyżej 6 lat: 15 do 25 mg / dobę, aż do 50 - 100 mg / dobę w dawkach podzielonych.

W premedykacji przed zabiegami chirurgicznymi:

0,6 mg / kg mc. doustnie w pojedynczej dawce.

Maksymalna pojedyncza dawka nie powinna być większa niż 100 mg, a maksymalna dawka dobową nie powinna być większa niż 400 mg.

Dostosowanie dawkowania:

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Polityki Lekowej i Farmacji
00-852 Warszawa
11 1111111111 11

Dawkowanie należy dostosowywać indywidualnie, w zalecanym zakresie dawek, w zależności od reakcji pacjenta na leczenie.

Pacjenci w podeszłym wieku:

U osób w podeszłym wieku zaleca się rozpoczęcie leczenia od połowy dawki stosowanej u dorosłych.

Pacjenci z umiarkowaną lub ciężką niewydolnością nerek:

U pacjentów z umiarkowaną lub ciężką niewydolnością nerek ze względu na zmniejszone wydalanie metabolitu leku, cetyryzyny, należy zmniejszyć stosowane dawki.

Pacjenci z niewydolnością wątroby:

U pacjentów z niewydolnością wątroby zaleca się zmniejszenie dawki dobowej o 33%.

Produkt stosuje się doustnie.

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną lub którąkolwiek substancję pomocniczą produktu, cetyryzynę, inne pochodne piperazyny, aminofilinę lub etylenodiaminę lub porfiria.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Należy zachować ostrożność podczas podawania Hydroxyzinum Espefa pacjentom ze zwiększoną skłonnością do drgawek.

Małe dzieci są bardziej narażone na wystąpienie działań niepożądanych ze strony OUN (patrz punkt 4.8). U dzieci występowanie drgawek zgłaszano częściej niż u dorosłych.

U pacjentów w podeszłym wieku zaleca się rozpoczęcie leczenia od połowy dawki stosowanej u dorosłych z uwagi na przedłużone działanie.

Ze względu na potencjalne działanie przeciwocholinergiczne, Hydroxyzinum Espefa należy stosować ostrożnie u pacjentów z jaskrą, u pacjentów z utrudnionym odpływem moczu z pęcherza moczowego, osłabioną perystaltyką przewodu pokarmowego, nużliwością mięśni oraz ośpieniem.

Dostosowanie dawkowania może być konieczne, jeśli Hydroxyzinum Espefa jest stosowany jednocześnie z innymi lekami działającymi depresyjnie na ośrodkowy układ nerwowy lub z lekami o właściwościach przeciwocholinergicznych (patrz punkt 4.5).

Należy unikać jednoczesnego picia alkoholu i stosowania produktu leczniczego Hydroxyzinum Espefa (patrz punkt 4.5).

Należy zachować ostrożność u pacjentów ze znanymi czynnikami predysponującymi do wystąpienia zaburzeń rytmu serca lub jednocześnie leczonych preparatem mogącym wywołać zaburzenia rytmu serca.

W celu uniknięcia wpływu na wyniki testów alergicznych lub test prowokacji dooskrzelowej metacholiną, leczenie należy przerwać przynajmniej 5 dni przed ich wykonaniem.

Produkt może powodować senność.

Z uwagi na zawartość laktozy, produkt nie powinien być stosowany u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją galaktozy, niedoborem laktazy (typu Lapp) lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy.

4.5 Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Rzadko: zaparcia, wymioty
Zaburzenia ogólne:
Często: zmęczenie
Niezbyt często: złe samopoczucie, gorączka
Zaburzenia układu immunologicznego:
Rzadko: reakcje nadwrażliwości
Bardzo rzadko: wstrząs anafilaktyczny
Badania:
Rzadko: nieprawidłowe wyniki testów czynnościowych wątroby
Zaburzenia układu nerwowego:
Bardzo często: senność
Często: ból głowy, sedacja
Niezbyt często: zawroty głowy, bezsenność, drżenie
Rzadko: drgawki, dyskineza,
Zaburzenia psychiczne:
Niezbyt często: pobudzenie, splątanie
Rzadko: dezorientacja, omamy
Zaburzenia nerek i dróg moczowych:
Rzadko: zatrzymanie moczu
Zaburzenia oddechowe, klatki piersiowej i śródpiersia:
Bardzo rzadko: skurcz oskrzeli
Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej:
Rzadko: świąd, wysypka rumieniowa, wysypka grudkowo-plamkowa, pokrzywka, zapalenie skóry
Bardzo rzadko: obrzęk naczynioruchowy, wzmożona potliwość, utrwalona wysypka polekowa
Zaburzenia naczyń:
Rzadko: niedociśnienie

4.9 Przedawkowanie

Objawy obserwowane po znacznym przedawkowaniu wiążą się głównie z nadmiernym działaniem przeciwocholinergicznym, depresją lub paradoksalnym pobudzeniem OUN.

Należą do nich: nudności, wymioty, tachykardia, gorączka, senność, osłabiony odruch żreniczny, drżenie, splątanie lub omamy, a następnie może wystąpić obniżony poziom świadomości, depresja oddechowa, drgawki, niedociśnienie lub arytmia serca oraz pogłębiająca się śpiączka i zapaść sercowo-oddechowa.

Konieczne jest ścisłe kontrolowanie drożności dróg oddechowych, oddychania i krążenia poprzez ciągłe badanie EKG oraz zapewnienie odpowiedniej ilości tlenu. Należy kontrolować czynność serca i ciśnienie krwi do momentu, gdy u pacjenta przez 24 godziny nie będą występowały objawy przedawkowania. W przypadku pacjentów z zaburzeniami świadomości należy sprawdzić, czy nie przyjmowali jednocześnie innych leków lub alkoholu oraz podać im tlen, nalokson, glukozę i tiaminę, jeśli uzna się to za konieczne.

W razie konieczności podania środka obkurczającego naczynia, należy zastosować noradrenalinę lub metaraminol. Nie należy stosować adrenaliny.

Nie należy stosować preparatów wymiotnicy u pacjentów z objawami przedawkowania ani u tych, u których może szybko nastąpić utrata świadomości, śpiączka lub napady drgawek, ponieważ może to spowodować zachyłkowe zapalenie płuc. Jeżeli nastąpiło klinicznie znaczące spożycie leku, to można wykonać płukanie żołądka z uprzednią intubacją dotchawiczą. Istnieje niewiele danych potwierdzających działanie zastosowanego węgla aktywowanego.

Wątpliwe jest, by hemodializa lub hemoperfuzja miały jakiegokolwiek istotne znaczenie.

Nie istnieje swoiste antidotum.

Dane literaturowe wskazują, że w przypadku silnego, zagrażającego życiu, działania przeciwocholinergicznego opornego na leczenie innymi preparatami, skuteczne może być podanie fizostygminy w dawce terapeutycznej.

Jeśli jednocześnie zostały zażyte trójpierścieniowe leki przeciwdepresyjne, stosowanie fizostygminy może wywołać drgawki i oporne na leczenie zatrzymanie akcji serca. Należy również unikać fizostygminy u pacjentów z zaburzeniami przewodnictwa sercowego.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: leki psycholeptyczne, anksjolityki, pochodne difenylometanu, hydroksyzyna

Kod ATC: N 05 BB 01

Hydroksyzyna działa hamująco na czynność ośrodków ośrodkowego układu nerwowego, z czego wynika jej uspokajające działanie. Nie zaburza czynności kory mózgu. Jej działanie może polegać na hamowaniu aktywności niektórych głównych obszarów podkorowych OUN.

Wykazano doświadczalnie działanie przeciwhistaminowe, rozkurczające oskrzela i przeciwwymiotne.

Hydroksyzyna w dawkach terapeutycznych nie zwiększa wydzielania kwasu solnego ani kwaśności treści żołądkowej. W większości przypadków wykazuje łagodne działanie przeciwwydzielnicze.

Wykazano zmniejszenie odczynu bąbel-rumień u zdrowych, dorosłych ochotników oraz u dzieci po śródskórnym podaniu histaminy lub antygenów. Wykazano również skuteczność hydroksyzyny w zmniejszaniu świądu w różnych postaciach pokrzywki, wyprysku i zapalenia skóry.

W niewydolności wątroby, działanie przeciwhistaminowe pojedynczej dawki może ulec wydłużeniu do 96 godzin po zażyciu.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Po podaniu doustnym hydroksyzyna jest szybko wchłaniana z przewodu pokarmowego. Początek działania uspokajającego stwierdzono po 15 do 30 minut od momentu podania i utrzymuje się ono przez 4 do 6 godzin.

Stężenie maksymalne w osoczu (C_{max}) jest osiągane w ciągu około dwóch godzin po zażyciu doustnym. Po doustnym podaniu jednorazowo dawek 25 mg i 50 mg u dorosłych, stężenie maksymalne C_{max} wynosi zwykle odpowiednio 30 i 70 ng/ml. Szybkość i zakres ekspozycji na hydroksyzynę są bardzo podobne w przypadku podawaniu leku w postaci tabletek i syropu. Po kolejnej dawce podawanej raz na dobę stężenie wzrasta o 30%. Biodostępność hydroksyzyny po podaniu doustnym w stosunku do podania domięśniowego wynosi około 80%.

Hydroksyzyna jest w znacznym stopniu metabolizowana. Główny metabolit to cetyryzyna (45% dawki doustnej), a jej powstawanie katalizuje dehydrogenaza alkoholowa. Metabolit ten wywiera istotne działanie blokujące na obwodowe receptory H_1 . Zidentyfikowano kilka innych metabolitów, w tym N-dealkilowany metabolit oraz O-dealkilowany metabolit o 59 godzinny okres półtrwania w osoczu. CYP3A4/5 bierze udział w we wspomnianych szlakach metabolicznych.

Okres półtrwania hydroksyzyny u dorosłych wynosi około 14 godzin (zakres: 7 - 20 godzin). Pozorny całkowity klirens określony w badaniach wynosi 13 ml/min na kg mc. Jedynie 0,8% dawki jest wydalane w postaci niezmienionej z moczem. Główny metabolit, cetyryzyna, jest wydalana z moczem (25% dawki doustnej).

Populacje szczególne

Pacjenci w podeszłym wieku

Farmakokinetykę hydroksyzyny badano u 9 zdrowych osób w podeszłym wieku ($69,5 \pm 3,7$ lat) po doustnym podaniu jednorazowo dawki 0,7 mg/kg mc. Okres półtrwania w fazie eliminacji hydroksyzyny był wydłużony do 29 godzin, a pozorna objętość dystrybucji była zwiększona do 22,5 l/kg mc. Zaleca się zmniejszenie dawki dobowej hydroksyzyny u pacjentów w podeszłym wieku (patrz punkt 4.2).

Dzieci

Farmakokinetykę hydroksyzyny oceniano u 12 dzieci ($6,1 \pm 4,6$ lat; $22,0 \pm 12,0$ kg) po podaniu pojedynczej dawki 0,7 mg/kg. Pozorny klirens osoczowy był około 2,5 razy większy niż u dorosłych. Okres półtrwania był krótszy niż u dorosłych. Wynosił on około 4 godzin u rocznych pacjentów oraz 11 godzin u pacjentów czternastoletnich. U dzieci konieczne jest dostosowanie dawki (patrz punkt 4.2).

Niewydolność wątroby

U pacjentów z wtórną niewydolnością wątroby spowodowaną pierwotną marskością żółciową wątroby, całkowity klirens leku wynosił 66% klirensu osób zdrowych. Okres półtrwania był wydłużony do 37 godzin, a stężenie metabolitu, cetyryzyny, w surowicy krwi było większe niż u młodych pacjentów z prawidłową czynnością wątroby. U pacjentów z niewydolnością wątroby należy zmniejszyć dawkę dobową lub częstość dawkowania (patrz punkt 4.2).

Niewydolność nerek

Farmakokinetykę hydroksyzyny badano u 8 pacjentów z ciężką niewydolnością nerek (klirens kreatyniny: 24 ± 7 ml/min). Zakres ekspozycji (AUC) na hydroksyzynę nie uległ istotnej zmianie, natomiast na metabolit, cetyryzynę, zwiększył się. Metabolit ten nie jest skutecznie usuwany za pomocą hemodializy. Aby uniknąć znacznego gromadzenia się metabolitu po wielokrotnych dawkach hydroksyzyny, należy zmniejszyć dawkę dobową preparatu u pacjentów z niewydolnością nerek (patrz punkt 4.2).

Zaleca się przerwanie podawania hydroksyzyny na 4 dni przed planowanym wykonaniem śródskórnych testów z podaniem alergenów lub histaminy.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Nie przeprowadzono badań nieklinicznych produktu Hydroxyzinum Espefa.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Skrobia ziemniaczana, celuloza mikrokrystaliczna, laktoza bezwodna, karboksymetyloskrobia sodowa (typ C), krzemionka koloidalna bezwodna, magnezu stearynian, talk, Opadry II różowy (makrogol/Peg 3350, alkohol poliwinylowy, tytanu dwutlenek, talk, koszenila E 120).

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy

6.3 Okres ważności

2 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C, chronić od wilgoci.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Opakowanie zawiera 2 blistry po 15 sztuk tabletek

Opakowanie bezpośrednie: blister z folii PVC/PVDC/Al

Opakowanie zewnętrzne: pudełko tekturowe

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Polityki Lekowej i Farmacji
00-952 Warszawa
ul. Miodowa 18

6.6 Instrukcja dotycząca przygotowania produktu leczniczego do stosowania i usuwania jego pozostałości

Bez szczególnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Chemiczno – Farmaceutyczna Spółdzielnia Pracy ESPEFA, 30 –133 Kraków, ul. J.Lea 208

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

15084

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU / DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

05.02.2009r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

05.02.2009r.