

## فيتاكلوزين

**التركيب:** كل مضغوطة ملبسة متأخرة التحرر تحتوي على:

دوكسيلامين سوكسينات 10 ملغ

بيريدوكسين هيدروكلورايد (فيتامين B6) 10 ملغ

**السواغات:** لاکتوز، ميكروكريستالين السيليلوز، إيدراجيت، إيروزيل، PVP K30.

## الحرائك الدوائية:

**الامتصاص:** يمتص كل من الدوكسيلامين والبيريدوكسين من الجهاز المعدي المعوي، بشكل رئيسي في منطقة الصائم، يتحقق التركيز البلازمي الأعظمي لكل من الدوكسيلامين والبيريدوكسين خلال 7,5 و 5,5 ساعة، حسب الترتيب.

**تأثير الطعام:** يؤخر تناول الطعام من امتصاص كل من الدوكسيلامين والبيريدوكسين. يتوافق هذا التأخر بـقمة تركيز أقل للدوكسيلامين ولكن لا يتأثر مدى الامتصاص.

**التوزيع:** يرتبط البيريدوكسين بشكل كبير بالبروتين، بشكل أساسي الألبومين.

**الاستقلاب:** يتحول الدوكسيلامين حيويًا في الكبد إلى مستقبلاته الرئيسية الفعالة.

يعتبر البيريدوكسين طليعة دواء ويستقلب بشكل رئيسي في الكبد.

**الإطراح:** تطرح المستقبلات الرئيسية للدوكسيلامين عن طريق الكليتين. نصف عمر الإطراح النهائي للدوكسيلامين والبيريدوكسين هي 12,5 ساعة ونصف ساعة، حسب الترتيب.

## الاستطبابات:

يستطب فيتاكلوزين لمعالجة غثيان وإقياء الحمل عند النساء اللواتي لا يستجبن للتدبير التحفظي.

**حدود الاستعمال:** لم يدرس هذا الدواء عند النساء المصابات بالإقياء الحملي المفرط.

## مضادات الاستطباب:

● فرط التحسس المعروف للدوكسيلامين سوكسينات، مشتقات الإيتانولامين المضادة للتحسس الأخرى، البيريدوكسين هيدروكلورايد أو أي مادة غير فعالة في الصيغة.

● تقوي مثبطات المونو أمين أوكسيداز وتطيل التأثيرات الجانبية لفيتاكلوزين على الجهاز العصبي المركزي.

## التحذيرات والاحتياطات:

### النشاطات التي تتطلب يقظة:

يمكن أن يسبب هذا الدواء النعاس. يجب على النساء تجنب الانخراط في نشاطات تتطلب يقظة ذهنية كاملة مثل قيادة السيارات أو العمل على الآلات الثقيلة و ذلك خلال فترة استعمال فيتاكلوزين.

لا يوصى باستعمال فيتاكلوزين إذا كانت المرأة تستعمل في نفس الوقت كابتات الجهاز العصبي المركزي بما في ذلك الكحول. يمكن أن ينتج عن المشاركة نعاس شديد يؤدي إلى السقوط أو حوادث.

**حالات طبية متزامنة:** يملك هذا الدواء تأثيرات مضادة للفعل الكولييني ولذلك يجب أن يستعمل بحذر عند النساء المصابات بـ: ربو، ارتفاع الضغط داخل العين، زرق ضيق الزاوية، قرحة هضمية متضيقة، انسداد بوابي اثني عشري و انسداد عنق المثانة.

## الحمل:

الفئة A، فيتاكلوزين معد للاستخدام عند النساء الحوامل.

## الإرضاع:

على النساء عدم الإرضاع أثناء تناولهن لهذا الدواء.

سجلت حالات من الإثارة، الهيجية والتهدة عند الأطفال الرضع ممن يحتمل أنهم تعرضوا للدوكسيلامين سوكسينات عن طريق حليب الإرضاع. يمكن أن يكون الرضع المصابين بانقطاع النفس أو متلازمات تنفسية أخرى بشكل خاص سريري التأثير بالتأثيرات المهدئة لهذا الدواء مما ينتج عنه تدهور في حالة انقطاع النفس لديهم أو الأعراض التنفسية الأخرى.

يطرح البيريدوكسين هيدروكلورايد عن طريق حليب الإرضاع. لا يوجد تقارير عن آثار جانبية عند الأطفال الرضع ممن يحتمل أنهم تعرضوا للبيريدوكسين هيدروكلورايد عن طريق حليب الإرضاع.

### الاستعمال عند الأطفال

لم يتم إثبات أمان وفعالية هذا الدواء عند الأطفال بعمر أقل من 18 سنة.

### التداخلات الدوائية:

- يعد استعمال فيتاكلوزين مضاد استطباب عند النساء اللواتي يتناولن مثبطات المونو أمين أوكسيداز التي تطيل وتقوي التأثيرات المضادة للفعل الكوليني (الجفاف) لمضادات الهيستامين.

- لا ينصح بتناول الكحول و كابتات الجهاز العصبي المركزي الأخرى (مثل المنومات و المهدئات) بشكل متزامن مع فيتاكلوزين.

### التأثيرات الجانبية:

النعاس، السقوط أو الحوادث الأخرى الناتجة عن تأثير المشاركة بين فيتاكلوزين مع كابتات الجهاز العصبي المركزي الأخرى بما فيها الكحول.

### التجربة ما بعد التسويق:

ضيق النفس، خفان، تسرع القلب، دوار، تغييم الرؤية، اضطرابات بصرية، تمدد في البطن، ألم بطني، إمساك، إسهال، ضيق في الصدر، تعب، هيجية، توعك، فرط تحسس، دوخة، صداع، شقيقة، مذل، فرط نشاط حركي نفسي، قلق، توهان، أرق، كوابيس، عسر تبول، احتباس بول، فرط تعرق، حكة، طفح، طفح بقعي حطاطي.

### الجرعة وطريقة الاستعمال:

- بشكل بدئي، تؤخذ مضغوتين متأخرتين التحرر عن طريق الفم عند النوم (اليوم الأول). في حال كانت هذه الجرعة تضبط بشكل مناسب الأعراض في اليوم التالي، يتابع أخذ مضغوتين يومياً عند النوم. لكن، في حال استدامة الأعراض حتى فترة بعد الظهر لليوم الثاني، تؤخذ الجرعة الاعتيادية من مضغوتين عند النوم في ذلك المساء ومن ثم تؤخذ ثلاث مضغوبات عند بدء اليوم الثالث (مضغوبة في الصباح ومضغوتين عند النوم). في حال كانت هذه المضغوبات الثلاثة كافية لضبط ملائم لأعراض اليوم الرابع، يُتابع تناول ثلاث مضغوبات يومياً. ما عدا ذلك، يؤخذ 4 مضغوبات بدءاً من اليوم الرابع (مضغوبة في الصباح، مضغوبة في منتصف فترة بعد الظهر ومضغوتين عند النوم).
- الجرعة اليومية القصوى هي 4 مضغوبات في اليوم.
- إن بدء التأثير المتأخر لهذا الدواء يمكن أن يزداد تأخراً و أن ينخفض الامتصاص عند إعطاء المضغوبات مع الطعام. لذلك يجب تناول فيتاكلوزين على معدة فارغة مع كأس من الماء.
- تبلغ المضغوبة كاملة. يجب عدم كسر أو مضغ المضغوبات.
- تؤخذ كما هو موصوف يومياً وليس على أساس الحاجة. يجب إعادة تقييم حالة المرأة من أجل الاحتياج المستمر لهذا الدواء مع تقدم الحمل.

### فرط الجرعة:

يعد فيتاكلوزين شكل لتحرر متأخر، لذلك، يمكن ألا تظهر علامات و أعراض التسمم على الفور. يمكن أن تشمل علامات و أعراض فرط الجرعة تملل، جفاف في الفم، توسع حدقات، نعاس، دوار، تخليط ذهني و تسرع قلب. بالجرعات السمية، يظهر الدوكسيلامين تأثيرات مضادة للفعل الكوليني تشمل نوبات، انحلال الريدات، فشل كلوي حاد وموت. في حال الحاجة للعلاج، يتكون من الغسيل المعدي أو الفحم الفعال، إرواء كامل للأمعاء ومعالجة العرضية.

**شروط الحفظ:** يحفظ في مكان بارد وجاف بدرجة حرارة 25°م.

**التعبئة:** علبة كرتونية تحتوي على 20 مضغوبة ملبسة متأخرة التحرر من فيتاكلوزين.

## VITACLOZINE

**Composition:** Each delayed release tablet contains :

Doxylamine succinate 10 mg

Pyridoxine Hcl (Vitamin B6) 10 mg

**Excipients:** Lactose, microcrystalline cellulose, eudragit, aerosil, PVP K30

### **Pharmacokinetics:**

Absorption: Doxylamine and pyridoxine are absorbed in the gastrointestinal tract, mainly in the jejunum. The  $C_{max}$  of doxylamine and pyridoxine are achieved within 7.5 and 5.5 hours, respectively.

Food effect: The administration of food delays the absorption of both doxylamine and pyridoxine. This delay is associated with a lower peak concentration of doxylamine, but the extent of absorption is not affected.

Distribution: Pyridoxine is highly protein bound, primarily to albumin.

Metabolism: Doxylamine is biotransformed in the liver to its principle metabolites.

Pyridoxine is a prodrug primarily metabolized in the liver.

Excretion: The principle metabolites of doxylamine are excreted by the kidney. The terminal elimination half-life of doxylamine and pyridoxine are 12.5 hours and 0.5 hours, respectively.

### **Indications:**

VITACLOZINE is indicated for the treatment of nausea and vomiting of pregnancy in women who do not respond to conservative management.

Limitations of Use: This drug has not been studied in women with hyperemesis gravidarum.

### **Contraindications:**

- Known hypersensitivity to doxylamine succinate, other ethanolamine derivative antihistamines, pyridoxine hydrochloride or any inactive ingredient in the formulation.
- Monoamine oxidase inhibitors intensify and prolong the adverse central nervous system effects of VITACLOZINE.

### **Warnings & Precautions:**

Activities Requiring Mental Alertness: This drug may cause somnolence. Women should avoid engaging in activities requiring complete mental alertness, such as driving or operating heavy machinery, while using VITACLOZINE.

The use of VITACLOZINE is not recommended if a woman is concurrently using central nervous system depressants including alcohol. The combination may result in severe drowsiness leading to falls or accidents.

Concomitant Medical Conditions: THIS DRUG has anticholinergic properties and, therefore, should be used with caution in women with: asthma, increased intraocular pressure, narrow angle glaucoma, stenosing peptic ulcer, pyloroduodenal obstruction and urinary bladder-neck obstruction.

### **Pregnancy:**

Category A, VITACLOZINE is intended for use in pregnant women.

### **Lactation:**

Women should not breastfeed while using THIS DRUG.

Excitement, irritability and sedation have been reported in nursing infants presumably exposed to doxylamine succinate through breast milk. Infants with apnea or other respiratory syndromes may be particularly vulnerable to the sedative effects of THIS DRUG resulting in worsening of their apnea or respiratory conditions.

Pyridoxine hydrochloride is excreted into breast milk. There have been no reports of adverse events in infants presumably exposed to pyridoxine hydrochloride through breast milk.

## **Pediatric Use**

The safety and effectiveness of THIS DRUG in children under 18 years of age have not been established.

## **Drug Interactions**

- Use of VITACLOZINE is contraindicated in women who are taking monoamine oxidase inhibitors, which prolong and intensify the anticholinergic (drying) effects of antihistamines.
- Concurrent use of alcohol and other CNS depressants (such as hypnotic, sedatives) with VITACLOZINE is not recommended.

## **Side effect:**

Somnolence, Falls or other accidents resulting from the effect of the combined use of VITACLOZINE with CNS depressants including alcohol.

## Postmarketing Experience:

dyspnea, palpitation, tachycardia, vertigo, blurred vision, visual disturbances, abdominal distension, abdominal pain, constipation, diarrhea, chest discomfort, fatigue, irritability, malaise, hypersensitivity, dizziness, headache, migraines, paresthesia, psychomotor hyperactivity, anxiety, disorientation, insomnia, nightmares, dysuria, urinary retention, hyperhidrosis, pruritus, rash, maculo-papular rash.

## **Doses & Administration:**

- Initially, take two delayed-release tablets orally at bedtime (Day 1). If this dose adequately controls symptoms the next day, continue taking two tablets daily at bedtime. However, if symptoms persist into the afternoon of Day 2, take the usual dose of two tablets at bedtime that night then take three tablets starting on Day 3 (one tablet in the morning and two tablets at bedtime). If these three tablets adequately control symptoms on Day 4, continue taking three tablets daily. Otherwise take four tablets starting on Day 4 (one tablet in the morning, one tablet mid-afternoon and two tablets at bedtime).
- The maximum recommended dose is four tablets daily.
- the delay in the onset of action of this drug may be further delayed, and a reduction in absorption may occur when tablets are taken with food. Therefore, it should be taken on an empty stomach with a glass of water.
- Swallow tablets whole. Do not crush, or chew the tablets.
- Take as a daily prescription and not on an as needed basis. Reassess the woman for continued need for THIS DRUG as her pregnancy progresses.

## **Overdoses:**

VITACLOZINE is a delayed-release formulation, therefore, signs and symptoms of intoxication may not be apparent immediately.

Signs and symptoms of overdose may include restlessness, dryness of mouth, dilated pupils, sleepiness, vertigo, mental confusion and tachycardia. At toxic doses, doxylamine exhibits anticholinergic effects, including seizures, rhabdomyolysis, acute renal failure and death.

If treatment is needed, it consists of gastric lavage or activated charcoal, whole bowel irrigation and symptomatic treatment.

**Storage conditions:** Store in a cool and dry place below 25°C.

**How supplied:** A carton box contains 20 delayed release tablets of VITACLOZINE.