

Апаурин



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой	1 таб.
дiazepam	2 мг
15 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.	
Таблетки, покрытые оболочкой	1 таб.
дiazepam	5 мг
15 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.	

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Диазепам - производное бензодиазепина с широким спектром действия. Оказывает анксиолитическое, гипноседативное, мышечно-релаксирующее и противосудорожное действие через специфические бензодиазепиновые рецепторы, наибольшее количество которых расположено в лимбической системе, гипоталамусе, мозжечке и полосатом теле. Эти рецепторы наряду с рецепторами ГАМК (гамма-аминомасляная кислота) образуют анатомическое и функциональное целое. После связи диазепама с рецептором усиливается ГАМК-ергическая передача и угнетение центральной нервной системы. Это приводит к противосудорожному и мышечно-релаксирующему эффекту. За счёт потенцирования эффектов ГАМК уменьшается стимулирующее влияние таких нейромедиаторов, как серотонин, норадреналин или ацетилхолин, что вызывает анксиолитическое, снотворное и седативное действие.

Фармакокинетика

Всасывание. Всасывание диазепама из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) быстрое и полное. После приема внутрь всасывается около 75%. Биодоступность - 90%.

Пища не влияет на всасывание диазепама.

Метаболизм. Метаболизируется в печени с участием изоферментов CYP2C19, CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7 с образованием трех метаболитов. Основной метаболит - N-десметилдiazepam, обладающий биологической активностью и большим $T_{1/2}$, чем diazepam. Другие два метаболита - оксазепам и темазепам, биологически активны, но не принимают значительного участия в развитии фармакодинамических эффектов diazепама за счёт более короткого $T_{1/2}$ по сравнению с основным веществом. Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьер, обнаруживается в грудном молоке в концентрациях, соответствующих 1/10 части концентрации в плазме крови. Связь с белками плазмы - 98%.

Распределение и выведение. Диазепам - быстро распределяется в организме человека. V_d составляет примерно 1.1 л/кг, что свидетельствует об активном связывании с белками плазмы (98-99%). Выводится почками - 70% (в виде глюкуронидов), в неизменном виде 1-2% и менее 10% - кишечником. Выведение имеет двухфазный характер: за

первоначальной фазой быстрого и обширного распределения ($T_{1/2}$ - 3 ч) следует продолжительная фаза ($T_{1/2}$ - 20-70 ч). $T_{1/2}$ десметилдиазепама - 30-100 ч, темазепама - 9.5-12.4 ч и оксазепама - 5-15 ч. При повторном применении накопление диазепама и его активных метаболитов значительное. Относится к бензодиазепинам с длительным $T_{1/2}$, выведение после прекращения лечения - медленное, т.к. метаболиты сохраняются в крови в течение нескольких дней или даже недель.

Показания к применению:

Тревожные расстройства.

Дисфория (в составе комбинированной терапии в качестве дополнительного лекарственного средства).

Бессонница (затруднение засыпания).

Спазм скелетных мышц при местной травме; спастические состояния, связанные с поражением головного или спинного мозга (церебральный паралич, атетоз, столбняк); миозит, бурсит, артрит, спондилоартрит, ревматоидный артрит; остеоартроз, сопровождающийся напряжением скелетных мышц; вертебральный синдром, стенокардия, головная боль напряжения.

Абстинентный алкогольный синдром: тревожность, напряженность, агитация, тремор, транзиторные реактивные состояния.

Премедикация перед оперативными вмешательствами и эндоскопическими манипуляциями, общей анестезией.

В составе комплексной терапии: артериальная гипертензия, язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки; психосоматические расстройства в акушерстве и гинекологии: климактерические и менструальные расстройства, гестоз; экзема и др. заболевания, сопровождающиеся зудом, раздражительностью.

Болезнь Меньера. Судорожный синдром при отравлении лекарственными средствами.

Относится к болезням:

- [Анестезия](#)
- [Артериальная гипертензия](#)
- [Артрит](#)
- [Артроз](#)
- [Бурсит](#)
- [Гестоз](#)
- [Гипертензия](#)
- [Головная боль](#)
- [Зуд](#)
- [Остеоартрит](#)
- [Остеоартроз](#)
- [Паралич](#)
- [Ревматоидный артрит](#)
- [Спондилоартрит](#)
- [Стенокардия](#)
- [Столбняк](#)
- [Травмы](#)
- [Тремор](#)
- [Экзема](#)
- [Язвенная болезнь](#)
- [Язвенная болезнь желудка](#)

Противопоказания:

Гиперчувствительность, кома, шок, острая алкогольная интоксикация с ослаблением жизненно важных функций, острые интоксикации лекарственными средствами, оказывающие угнетающее действие на ЦНС (в т.ч. наркотические анальгетики и снотворные лекарственные средства), миастения, закрытоугольная глаукома (острый приступ или предрасположенность); тяжелая хроническая обструктивная болезнь легких (опасность прогрессирования дыхательной недостаточности), острая дыхательная недостаточность, беременность, период лактации, детский возраст до 3 лет, дефицит лактазы и/или сахаразы/изомальтазы, непереносимость фруктозы или лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

С осторожностью. Эпилепсия или эпилептические судороги в анамнезе (начало лечения диазепамом или его резкая отмена могут ускорять развитие судорог или эпилептического статуса), печеночная и/или почечная недостаточность, церебральные и спинальные атаксии, гиперкинезы, лекарственная зависимость в анамнезе, склонность к злоупотреблению психоактивными лекарственными средствами, органические заболевания головного мозга, гипопропротеинемия, ночное апноэ (установленное или предполагаемое), пожилой возраст.

Способ применения и дозы:

Доза всегда устанавливается врачом.

Режим дозирования зависит от тяжести симптомов, возраста пациента и его состояния.

Тревожные расстройства, дисфория: От 2 мг до 10 мг 2-3 раза в сут.

Бессонница (затруднение засыпания): От 4 мг до 10 мг вечером, перед сном.

Мышечные спазмы: 2-10 мг 3 раза в сут.

Спастические состояния центрального происхождения при дегенеративных неврологических заболеваниях, болезнь Меньера, судорожный синдром: по 5-10 мг 2-3 раза в сут.

Заболевания опорно-двигательного аппарата: по 5 мг 1-4 раза в сут.

Алкогольный абстинентный синдром: 10 мг 3-4 раза в сут в первые 24 ч, с последующим уменьшением до 5 мг 3-4 раза в сут.

Премедикация: накануне операции, вечером - 10-20 мг.

Стенокардия и артериальная гипертензия, язвенная болезнь желудка и 12 п.к., экзема и другие заболевания, сопровождающиеся зудом и раздражительностью: по 2-5 мг 2-3 раза в сут.

Акушерство и гинекология: психосоматические расстройства, климактерические и менструальные расстройства, гестоз: по 2-5 мг 2-3 раза в сут.

Пожилым, ослабленным больным, а также пациентам с атеросклерозом в начале лечения: по 2 мг 2 раза в сут, при необходимости дозу увеличить до получения оптимального эффекта.

Работающим больным: по 2 мг 1-2 раза в сут или 5 мг (основную дозу) вечером.

Синдром «отмены» диазепам: 2 таблетки (по 5 мг) 3 раза в первые 24 ч, затем по 1 таблетке (5 мг) 3 раза в сут.

Дети старше 3 лет: 1 таблетка (2 мг) 2-3 раза в сут.

Лечение начинают с рекомендованных доз. Через одну или две недели доза препарата при необходимости может быть уменьшена так, чтобы препарат принимался 1 раз в сут, предпочтительно, вечером.

Лечение обычно продолжается от нескольких дней до нескольких недель.

При длительном применении бензодиазепинов изменяется переносимость этих препаратов; могут появиться признаки психологической и физической зависимости. Риск развития зависимости выше при применении высоких доз и при длительном применении.

При длительном применении препарат Апаурин необходимо отменять постепенно, поскольку резкое прекращение терапии может вызвать симптомы синдрома «отмены» (тремор, брюшные и мышечные спазмы, рвота, потливость).

Побочное действие:

Классификация частоты развития побочных эффектов (ВОЗ): очень часто (>1/10); часто (от > 1/100 до < 1/10); нечасто (от > 1/1000 до < 1/100); редко (от >1/10000 до < 1/1000); очень редко (от < 1/10000), включая отдельные сообщения.

Со стороны системы кроветворения: очень редко - нейтропения (при длительном применении рекомендуется периодический контроль состава крови), лейкопения, агранулоцитоз, анемия, тромбоцитопения;

Со стороны нервной системы: часто - слабость, сонливость, атаксия; нечасто - спутанность сознания, депрессия, дизартрия, несвязная речь, снижение активности, снижение либидо, головная боль, головокружение, тремор, нарушения памяти, бессонница, галлюцинации, тревожность; редко - головная боль, эйфория, депрессия, тремор, подавленность настроения, катаlepsия, экстрапирамидные реакции (неконтролируемые движения тела, включая глаза), гипорефлексия; очень редко - парадоксальные реакции (агрессивные вспышки, психомоторное возбуждение, страх, суицидальная наклонность, мышечный спазм, раздражительность, острое возбуждение);

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - ощущение сердцебиения, брадикардия, обморок, сердечно-сосудистый коллапс;

Со стороны органов чувств: нечасто - нечеткость зрения, диплопия, нистагм;

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - запор, тошнота, рвота, сухость слизистой оболочки полости рта или гиперсаливация, изжога, икота, гастралгия, снижение аппетита; очень редко - желтуха (при длительном применении рекомендуется периодический контроль функции печени), нарушения функции печени, повышение активности «печеночных» трансаминаз и щелочной фосфатазы;

Со стороны кожных покровов: редко - крапивница, кожная сыпь, зуд;

Со стороны опорно-двигательного аппарата: нечасто - мышечная слабость;

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - недержание мочи, задержка мочи, нарушения функции почек;

Со стороны репродуктивной системы: нечасто - нарушения менструального цикла, повышение или снижение либидо.

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

Во время и после терапии диазепамом возможны небольшие, клинически незначимые изменения на электроэнцефалограмме (чаще всего, низковольтажная быстрая активность).

При длительном применении бензодиазепинов изменяется переносимость этих препаратов; могут развиваться признаки психической или физической зависимости. Риск развития зависимости выше при использовании высоких доз и длительном применении препаратов.

При резком прекращении применения диазепама развиваются симптомы синдрома «отмены» (судороги, тремор, спазмы в животе и мышцах, рвота, потливость). Чаще всего эти симптомы развиваются после длительного применения высоких доз. Более лёгкие симптомы (дисфория, бессонница) отмечаются после внезапной отмены бензодиазепинов, принимавшихся в терапевтических дозах в течение нескольких месяцев.

Таким образом, следует избегать быстрой отмены препарата при его длительном применении, при этом суточная доза должна уменьшаться постепенно.

При развитии тяжёлых неблагоприятных эффектов лечение должно быть прекращено.

Передозировка:

Симптомы: сонливость, головокружение, слабость, дизартрия, дыхательная недостаточность; в более тяжёлых случаях - потеря сознания, гипорефлексия или арефлексия, угнетение дыхания, особенно при сочетании с алкоголем или другими веществами, угнетающими ЦНС.

Лечение: промывание желудка, форсированный диурез, прием активированного угля. Пациент нуждается в активном наблюдении в условиях отделения интенсивной терапии; в тяжёлых случаях, особенно при угнетении дыхания, назначается специфический антагонист бензодиазепиновых рецепторов - флумазенил. Период полувыведения флумазенила - примерно 1 ч, и он короче периода полувыведения диазепама. Поэтому, для поддержания желаемого уровня сознания, необходимо повторное введение флумазенила, лучше в виде инфузий. Рекомендуемая начальная доза флумазенила составляет 0.3 мг внутривенно. Если в течение 60 сек желаемый эффект не достигается, можно повторно ввести по 0.1 мг до достижения общей дозы 2 мг или до приведения пациента в сознание. Если после восстановления сознания пациента оно нарушается повторно, обычно вводятся те же дозы. В таких случаях возможно внутривенное введение флумазенила со скоростью от 0.1 мг до 0.4 мг/ч, в зависимости от желаемого уровня сознания.

Хотя флумазенил является эффективным антидотом при интоксикациях бензодиазепинами, его не следует вводить при бензодиазепиновых интоксикациях у пациентов с эпилепсией, поскольку он может спровоцировать развитие судорог. Гемодиализ малоэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат Апаурин не рекомендуется беременным женщинам. Его применение перед родами может вызывать снижение АД, угнетение дыхания и вызывать синдром «отмены» у новорожденного.

Препарат Апаурин секретируется в грудное молоко, поэтому его нельзя применять в период грудного вскармливания. В случае необходимости применения препарата Апаурин грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Во время терапии диазепамом необходимо избегать употребления алкоголя из-за возможности потенцирования его эффектов.

При одновременном применении диазепама с седативными лекарственными средствами, антидепрессантами, нейролептиками, барбитуратами, наркотическими анальгетиками, анестетиками, ингибиторами моноаминоксидазы (МАО), противоэпилептическими средствами и антигистаминными препаратами усиливается его угнетающее действие на ЦНС. Совместное применение эритромицина или рифампицина также усиливает эффекты диазепама. Диазепам снижает действие леводопы.

Циметидин уменьшает клиренс диазепама и усиливает его действие.

Омепразол замедляет метаболизм диазепама и увеличивает время его действия и выведения. Одновременное применение противогрибковых средств (итраконазол, флуконазол и кетоконазол) может повышать плазменные концентрации диазепама и вызывать нежелательные эффекты. Пероральные контрацептивы могут замедлять метаболизм диазепама.

Рифампицин может усиливать выведение диазепама и понижать его концентрации в плазме крови. Теофиллин (применяемый в низких дозах) может уменьшать или даже извращать седативное действие диазепама.

Особые указания и меры предосторожности:

У пожилых пациентов, детей и у пациентов с органическими поражениями ЦНС лечение препаратом Апаурин необходимо начинать осторожно и постепенно, из-за больших различий в индивидуальной переносимости.

Осторожность также необходима при хронических заболеваниях лёгких, поскольку возможно усугубление дыхательной недостаточности.

Пациенты с тяжёлыми заболеваниями почек, выраженной сердечной недостаточностью, с психозами и склонностью к алкогольной зависимости, психотропным препаратам или запрещённым психотропным веществам, должны находиться под особенно тщательным наблюдением. При длительном применении бензодиазепинов изменяется переносимость этих препаратов.

Иногда может развиваться психическая или физическая лекарственная зависимость, особенно при длительном применении высоких доз (более 3 месяцев). Поэтому лица, склонные к развитию зависимости, такие как страдающие алкоголизмом или зависимостью от других психотропных веществ, и пациенты с расстройствами личности, в ходе лечения должны находиться под тщательным наблюдением.

Резкое прекращение терапии может вызывать транзиторное усиление тревоги (тревога «отмены») или бессонницы.

После длительного применения препарат Апаурин следует отменять постепенно, поскольку резкое прекращение терапии может вызывать симптомы отмены (тремор, спазмы мышц и живота, рвота, потливость).

Лечение обычно продолжается от нескольких дней до, максимум, 12 недель, включая период постепенного снижения дозы. Лечение можно продолжать только после тщательного повторного анализа состояния пациента.

При применении любых бензодиазепинов в отдельных случаях может развиваться парадоксальная реакция. Она чаще развивается у пожилых людей и у детей. При появлении возбуждения, агрессивности, тревоги, спутанности сознания, повышении мышечных спазмов или бессонницы лечение препаратом Апаурин необходимо прекратить.

Специальная информация о некоторых компонентах препарата.

Сахароза может оказывать повреждающее действие на зубы.

Азоловые красители E110 (таблетки 2 мг) могут вызывать аллергические реакции.

Влияние на способность управления автотранспортом и другими сложными механизмами: Препарат может влиять на психофизическую деятельность, особенно при одновременном употреблении алкоголя или других средств, угнетающих ЦНС. Во время применения препарата Апаурин необходимо воздержаться от управления автотранспортом и занятиями др. потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью при почечной недостаточности. Пациенты с тяжёлыми заболеваниями почек должны находиться под особенно тщательным наблюдением. При длительном применении бензодиазепинов изменяется переносимость этих препаратов.

При нарушениях функции печени

С осторожностью при печеночной недостаточности.

Апаурин

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью: пожилой возраст. У пожилых пациентов лечение препаратом Апаурин необходимо начинать осторожно и постепенно, из-за больших различий в индивидуальной переносимости.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 3-х лет. У детей лечение препаратом Апаурин необходимо начинать осторожно и постепенно, из-за больших различий в индивидуальной переносимости.

Условия хранения:

Препарат относится к списку №1 сильнодействующих веществ Постоянного комитета по контролю наркотиков Минздравсоцразвития.

При температуре не выше 25°C, в оригинальной упаковке. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности. 5 лет. Не использовать препарат после истечения срока годности.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Apaurin>