Эстазолам



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Снотворное и анксиолитическое средство из группы производных бензодиазепина. Обладает также седативным, мышечно-расслабляющим и противосудорожным действием. Основные эффекты обусловлены стимуляцией GABA-ергической передачи в разных структурах ЦНС за счет возбуждения бензодиазепиновых рецепторов, что, в свою очередь, повышает чувствительность GABA-рецепторов к медиатору.

Эстазолам облегчает засыпание, меньше влияет на продолжительность сна, т.к. длительность его действия относительно невелика. Вызывает умеренные изменения структуры сна. Эффект последействия по утрам выражен мало. У больных неврозами уменьшает чувство эмоционального напряжения, беспокойства, тревогу, проявления вегетативной дисфункции (повышенное потоотделение, неадекватные сосудистые реакции).

Фармакокинетика

При приеме внутрь эстазолам обладает высокой степенью абсорбции. Связывание с белками плазмы составляет 93%. У здоровых людей, получавших до трех раз рекомендуемые дозы эстазолама, C_{max} достигается в течение 2 ч (от 0.5 до 6 ч), и пропорциональна принятой дозе. Эстазолам проникает через гистогематические барьеры (включая ГЭБ и плацентарный барьер), в ткани ЦНС и грудное молоко. Подвергается интенсивному метаболизму в печени.

$T_{1/2}$ составляет 10-24 ч. Выводится преимущественно почками в виде метаболитов, менее 5% - в неизмененном виде. С калом выводится лишь 4% от принятой дозы. Способность к кумуляции - небольшая, скорость выведения после прекращения лечения - средняя (относится к бензодиазепинам со средним $T_{1/2}$). У курящих пациентов клиренс бензодиазепинов ускорен по сравнению с некурящими (вследствие индукции ферментов печени никотином).

Показания к применению:

Неврозы (депрессивно-фобический синдром, повышенная возбудимость); нарушения сна при неврозах, психосоматических состояниях и органических заболеваниях (в т.ч. нарушение засыпания, частые ночные и ранние пробуждения); эпилепсия (в составе комбинированной терапии).

Относится к болезням:

- Депрессия
- Неврит
- Неврозы
- Эпилепсия

Противопоказания:

Миастения, выраженная дыхательная недостаточность, указания в анамнезе на алкоголизм или лекарственную зависимость, беременность, лактация, кома, шок, острые интоксикации лекарственными средствами, оказывающими угнетающее действие на ЦНС (наркотические, снотворные и психотропные средства), закрытоугольная глаукома (острый приступ или предрасположенность), тяжелая ХОБЛ (прогрессирование степени дыхательной недостаточности), гиперкапния, тяжелая депрессия (могут отмечаться суицидальные наклонности), беременность, период лактации, детский и подростковый возраст до 18 лет, повышенная чувствительность к производным бензодиазепина.

Способ применения и дозы:

При лечении неврозов средняя суточная доза составляет 4-6 мг в несколько приемов. В качестве снотворного средства применяют у взрослых в дозе 2-4 мг, у пациентов пожилого возраста - 1 мг, за 30 мин до сна.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: в начале лечения (особенно у пожилых больных) возможны сонливость, чувство усталости, головокружение, нарушение концентрации внимания, атаксия, неустойчивость походки и плохая координация движений, вялость, притупление эмоций, замедление психических и двигательных реакций; редко - головная боль, эйфория, депрессия, тремор, подавленность настроения, оцепенение, антероградная амнезия, спутанность сознания, дистонические экстрапирамидные реакции (неконтролируемые движения тела, включая глаза), слабость, мышечная слабость в течение дня, дизартрия, смазанность речи; крайне редко - парадоксальные реакции (агрессивные вспышки, страх, суицидальная наклонность, мышечный спазм, спутанность сознания, галлюцинации, острое возбуждение, раздражительность, тревожность, бессонница).

Со стороны системы 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 ЩФ, желтуха.

Со стороны мочевыделительной системы: недержание мочи, задержка мочи, нарушение функции почек.

Со стороны половой системы: повышение или снижение либидо, дисменорея.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

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

Прочие: привыкание, лекарственная зависимость, снижение АД; редко - угнетение дыхательного центра, нарушение зрения (диплопия), булимия, снижение массы тела, тахикардия.

При резком снижении дозы или прекращении приема: синдром отмены (раздражительность, головная боль, тревожность, волнение, возбуждение, чувство страха, нервозность, напряженность, спутанность сознания, нарушение сна, дисфория, спазм гладких мышц внутренних органов и скелетной мускулатуры, миалгия, деперсонализация, усиление потоотделения, депрессия, тошнота, рвота, тремор, расстройства восприятия, в т.ч. гиперакузия, гиперестезия, парестезии, светобоязнь, тахикардия, судороги, галлюцинации, эпилептические припадки, редко - острый психоз).

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности эстазолам применяют только в исключительных случаях и только по жизненным показаниям. Оказывает токсическое действие на плод и повышает риск развития врожденных пороков при применении в I триместре беременности. Прием в терапевтических дозах в более поздние сроки беременности может вызвать угнетение ЦНС новорожденного. Постоянное применение при беременности может приводить к физической зависимости с развитием синдрома отмены у новорожденного. Применение 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").

Эстазолам противопоказан к применению в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с лекарственными средствами, оказывающими угнетающее влияние на ЦНС (в т.ч. с нейролептиками, седативными, снотворными средствами, опиоидными анальгетиками, средствами для наркоза), усиливается угнетающее влияние на ЦНС, на дыхательный центр, развивается выраженная артериальная гипотензия.

При одновременном применении с трициклическими антидепрессантами возможно усиление угнетающего влияния на ЦНС, повышение концентрации антидепрессантов, усиление антихолинергического действия.

У пациентов, длительно получавших антигипертензивные препараты центрального действия, бета-адреноблокаторы, антикоагулянты, сердечные гликозиды, степень и механизмы лекарственного взаимодействия с эстазоламом непредсказуемы.

При одновременном применении действие миорелаксантов усиливается, увеличивается риск возникновения апноэ.

Особые указания и меры предосторожности:

При длительном применении возможно формирование лекарственной зависимости.

Прекращение приема эстазолама следует проводить, уменьшая дозу постепенно, во избежание появления признаков психического и двигательного возбуждения.

С осторожностью назначают эстазолам при печеночной и/или почечной недостаточности, церебральной и спинальной атаксии, гиперкинезе, лекарственной зависимости в анамнезе, склонности к злоупотреблению психотропными препаратами, органических заболеваниях головного мозга, психозе (возможны парадоксальные реакции), гипопротеинемии, ночном апноэ (установленном или предполагаемом), пациентам пожилого возраста.

В процессе лечения пациентам категорически запрещается употребление этанола.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения не рекомендуется выполнение работ, требующих концентрации внимания и быстрых психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью назначают эстазолам при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С осторожностью назначают эстазолам при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью назначают эстазолам пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Источник: http://drugs.thead.ru/Estazolam