Фезанеф



Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Анксиолитическое средство (транквилизатор) бензодиазепинового ряда. Оказывает анксиолитическое, седативно-снотворное, противосудорожное и центральное миорелаксирующее действие.

Усиливает ингибирующее действие GABA на передачу нервных импульсов. Стимулирует бензодиазепиновые рецепторы, расположенные в аллостерическом центре постсинаптических GABA-рецепторов восходящей активирующей ретикулярной формации ствола мозга и вставочных нейронов боковых рогов спинного мозга; уменьшает возбудимость подкорковых структур головного мозга (лимбическая система, таламус, гипоталамус), тормозит полисинаптические спинальные рефлексы.

Анксиолитическое действие обусловлено влиянием на миндалевидный комплекс лимбической системы и проявляется в уменьшении эмоционального напряжения, ослаблении тревоги, страха, беспокойства.

Седативный эффект обусловлен влиянием на ретикулярную формацию ствола головного мозга и неспецифические ядра таламуса и проявляется уменьшением симптоматики невротического происхождения (тревоги, страха).

На продуктивную симптоматику психотического генеза (острые бредовые, галлюцинаторные, аффективные расстройства) практически не влияет, редко наблюдается уменьшение аффективной напряженности, бредовых расстройств.

Снотворное действие сопряжено с угнетением клеток ретикулярной формации ствола головного мозга. Уменьшает воздействие эмоциональных, вегетативных и моторных раздражителей, нарушающих механизм засыпания.

Противосудорожное действие реализуется путем усиления пресинаптического торможения, подавляет распространение судорожного импульса, но не снимается возбужденное состояние очага.

Центральное миорелаксирующее действие обусловлено торможением полисинаптических спинальных афферентных тормозящих путей (в меньшей степени и моносинаптических). Возможно и прямое торможение двигательных нервов и функции мышц.

Фармакокинетика

После приема внутрь хорошо всасывается из ЖКТ, время достижения C_{max} - 1-2 ч.

Метаболизируется в печени. $T_{1/2}$ - 6-10-18 ч. Выводится в основном почками в виде метаболитов.

Показания к применению:

— невротические, неврозоподобные, психопатические и психопатоподобные и другие состояния (раздражительность, тревожность, нервное напряжение, эмоциональная лабильность);

— реактивные психозы и сенесто-ипохондрические расстройства (в т.ч. резистентные к действию других анксиолитиков (транквилизаторов);

— вегетативные дисфункции и расстройства сна;

— профилактика состояний страха и эмоционального напряжения;

— в качестве противосудорожного средства: височная и миоклоническая эпилепсия;

— в неврологической практике: гиперкинезы, тики, ригидность мышц, вегетативная лабильность.

Относится к болезням:

- Ипохондрия
- Неврит
- Неврозы
- Тики
- Эпилепсия

Противопоказания:

— гиперчувствительность (в т.ч. к другим бензодиазепинам);

— кома, шок;

— миастения;

— закрытоугольная глаукома (острый приступ или предрасположенность);

— острые отравления алкоголем (с ослаблением жизненно важных функций), наркотическими анальгетиками и снотворными лекарственными средствами;

— тяжелая ХОБЛ (возможно усиление дыхательной недостаточности);

— острая дыхательная недостаточность;

— тяжелая депрессия (могут проявляться суицидальные наклонности);

— беременность (особенно I триместр);

— период лактации;

— возраст до 18 лет (безопасность и эффективность не определены).

С осторожностью: печеночная и/или почечная недостаточность, церебральные и спинальные атаксии, лекарственная зависимость в анамнезе, склонность к злоупотреблению психоактивными препаратми, гиперкинезы, органические заболевания головного мозга, психоз (возможны парадоксальные реакции), гипопротеинемия, ночное апноэ (установленное или предполагаемое), пожилой возраст.

Способ применения и дозы:

В/м или в/в (струйно или капельно): для *быстрого купирования страха, тревоги, психомоторного возбуждения, а также при вегетативных пароксизмах и психотических состояниях* начальная доза - 0.5-1 мг (0.5-1 мл 0.1% раствора), средняя суточная доза - 3-5 мг, в *тяжелых случаях* - до 7-9 мг.

Внутрь: при *нарушениях сна* - 0.25-0.5 мг за 20-30 мин до сна.

Для *лечения невротических, психопатических, неврозоподобных и психопатоподобных состояний* начальная доза - 0.5-1 мг 2-3 раза в день. Через 2-4 дня с учетом эффективности и переносимости доза может быть увеличена до 4-6 мг/сут.

При *выраженной ажитации, страхе, тревоге* лечение начинают с дозы 3 мг/сут, быстро наращивая дозу до получения терапевтического эффекта.

При *лечении эпилепсии* - 2-10 мг/сут.

Для *лечения алкогольной абстиненции* - внутрь, по 2-5 мг/сут или в/м, по 0.5 мг 1-2 раза в день, при *вегетативных пароксизмах* - в/м, 0.5-1 мг.

Средняя суточная доза - 1.5-5 мг, ее разделяют на 2-3 приема, обычно по 0.5-1 мг утром и днем и до 2.5 мг на ночь. В неврологической практике при заболеваниях с мышечным гипертонусом назначают по 2-3 мг 1 или 2 раза в день.

Максимальная суточная доза - 10 мг. Во избежание развития лекарственной зависимости при курсовом лечении продолжительность применения бромдигидрохлорфенилбензодиазепина, как и др. бензодиазепинов, составляет 2 нед (в отдельных случаях длительность лечения может быть увеличена до 2 мес). При отмене препарата дозу уменьшают постепенно.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: в начале лечения (особенно у пожилых больных) - сонливость, чувство усталости, головокружение, снижение способности к концентрации внимания, атаксия, дезориентация, неустойчивость походки, замедление психических и двигательных реакций, спутанность сознания; редко - головная боль, эйфория, депрессия, тремор, снижение памяти, нарушения координации движений (особенно при высоких дозах), подавленность настроения, дистонические экстрапирамидные реакции (неконтролируемые движения, в т.ч. глаз), астения, мышечная слабость, дизартрия, эпилептические припадки (у больных эпилепсией); крайне редко - парадоксальные реакции (агрессивные вспышки, психомоторное возбуждение, страх, суицидальная наклонность, мышечный спазм, галлюцинации, возбуждение, раздражительность, тревожность, бессонница).

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз (озноб, гипертермия, боль в горле, чрезмерная утомляемость или слабость), анемия, тромбоцитопения.

Со стороны пищеварительной системы: сухость слизистой оболочки полости рта или слюнотечение, изжога, тошнота, рвота, снижение аппетита, запор или диарея; нарушения функции печени, повышение активности "печеночных" трансаминаз и ЩФ, желтуха.

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

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд кожи.

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

Местные реакции: флебит или венозный тромбоз (краснота, припухлость или боль в месте введения).

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

При *резком снижении дозы или прекращении приема* - синдром "отмены" (раздражительность, нервозность, нарушения сна, дисфория, спазм гладких мышц внутренних органов и скелетной мускулатуры, деперсонализация, усиление потоотделения, депрессия, тошнота, рвота, тремор, расстройства восприятия, в т.ч. гиперакузия, парестезии, светобоязнь; тахикардия, судороги; редко - острый психоз).

Передозировка:

Симптомы: выраженная сонливость, длительная спутанность сознания, снижение рефлексов, длительная дизартрия, нистагм, тремор, брадикардия, одышка или затрудненное дыхание, снижение АД, кома.

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля. Симптоматическая терапия (поддержание дыхания и АД), введение флумазенила (в условиях стационара). Гемодиализ - малоэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано при беременности (I триместр) и в период лактации.

В период беременности применяют 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 (синдром "вялого ребенка").

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Снижает эффективность леводопы у больных паркинсонизмом.

Может повышать токсичность зидовудина.

Отмечается взаимное усиление эффекта при одновременном назначении антипсихотических (нейролептических), противоэпилептических или снотворных препаратов, а также центральных миорелаксантов, наркотических анальгетиков, этанола.

Ингибиторы микросомального окисления повышают риск развития токсических эффектов.

Индукторы микросомальных ферментов печени уменьшают эффективность.

Увеличивает концентрацию имипрамина в сыворотке крови.

Гипотензивные лекарственные средства могут усиливать выраженность снижения АД.

На фоне одновременного назначения клозапина возможно усиление угнетения дыхания.

Особые указания и меры предосторожности:

В процессе лечения больным категорически запрещается употребление этанола.

Эффективность и безопасность применения препарата у пациентов моложе 18 лет не установлена.

При почечной/печеночной недостаточности и длительном лечении необходим контроль за картиной периферической крови и активностью печеночных ферментов.

Пациенты, не принимавшие ранее психоактивные лекарственные средства, отвечают на применение препарата в более низких дозах, по сравнению с больными, принимавшими антидепрессанты, анксиолитики или пациентами с алкоголизмом.

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

При внезапном прекращении приема может отмечаться синдром "отмены" (депрессии, раздражительность, бессонница, повышенное потоотделение) особенно при длительном приеме (более 8-12 нед).

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.

Дети, особенно в младшем возрасте, очень чувствительны к угнетающему ЦНС действию бензодиазепинов.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии др. потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью: почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

С осторожностью: печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью: пожилой возраст.

Применение в детском возрасте

Противопоказано: детский возраст до 18 лет. Дети, особенно в младшем возрасте, очень чувствительны к угнетающему ЦНС действию бензодиазепинов.

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