Грандаксин



Код АТХ:

- N05BA23

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Тофизопам

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого или серовато-белого цвета, круглые, плоские, в виде диска, с фаской, с гравировкой "GRANDAX" на одной стороне и с риской на другой стороне, без запаха или почти без запаха.

	1 таб.
тофизопам	50 мг

Вспомогательные вещества: стеариновая кислота - 1 мг, магния стеарат - 1 мг, желатин - 3.5 мг, тальк - 2 мг, крахмал картофельный - 20.5 мг, лактозы моногидрат - 92 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 10 мг.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Транквилизатор. Препарат из группы производных бензодиазепина (атипичное производное бензодиазепина). Оказывает анксиолитическое действие, практически не сопровождающееся седативным, миорелаксирующим, противосудорожным эффектом. Является психовегетативным регулятором, устраняет различные формы вегетативных нарушений. Обладает умеренной стимулирующей активностью.

Вследствие отсутствия миорелаксирующего эффекта препарат можно применять у больных с миопатией и миастенией.

Вследствие атипичности химической структуры, в отличие от классических производных бензодиазепина, Грандаксин в терапевтических дозах не потенцирует действие алкоголя и практически не вызывает развитие физической, психической зависимости и синдрома отмены.

Грандаксин относится к дневным транквилизаторам.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь быстро и почти полностью всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается в течение 2 ч, после этого концентрация в плазме снижается моноэкспоненциально.

Распределение

Тофизопам не кумулирует в организме.

Метаболизм

Метаболиты тофизопама не обладают фармакологической активностью.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет 6-8 ч.

Выводится главным образом с мочой (60-80%) в форме конъюгатов с глюкуроновой кислотой и в меньшей степени (около 30%) - с калом.

Показания к применению:

— неврозы и неврозоподобные состояния (состояния, сопровождающиеся эмоциональным напряжением, вегетативными расстройствами, умеренно выраженной тревогой, апатией, пониженной активностью, навязчивыми переживаниями);

— реактивная депрессия с умеренно выраженными психопатологическими симптомами;

— расстройство психической адаптации (посттравматическое стрессовое расстройство);

— климактерический синдром (как самостоятельное средство, а также в комбинации с гормональными препаратами);

— синдром предменструального напряжения;

— кардиалгии (в виде монотерапии или в комбинации с другими препаратами);

— синдром алкогольной абстиненции;

— миастения, миопатии, неврогенные мышечные атрофии и другие патологические состояния со вторичными невротическими симптомами в случаях, когда противопоказаны анксиолитики с выраженным миорелаксирующим действием.

Относится к болезням:

- Депрессия
- Кардиалгия
- Кардит
- Климактерический синдром
- Миопия
- Неврит
- Неврозы
- Синдром предменструального напряжения
- Стрессовые расстройства

Противопоказания:

— состояния, сопровождающиеся выраженным психомоторным возбуждением, агрессивностью или глубокой депрессией;

— дыхательная недостаточность в стадии декомпенсации;

— синдром остановки дыхания во сне (в анамнезе);

— одновременное применение с такролимусом, сиролимусом, циклоспорином;

— I триместр беременности;

— период лактации (грудного вскармливания);

— непереносимость галактозы, врожденная недостаточность лактазы, синдром мальабсорбции глюкозы и галактозы (препарат содержит лактозы моногидрат);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата или любым другим бензодиазепинам.

С *осторожностью* следует назначать препарат при декомпенсированном хроническом респираторном дистресс-синдроме, острой дыхательной недостаточности в анамнезе, закрытоугольной глаукоме, эпилепсии, органических поражениях головного мозга (например, при атеросклерозе).

Способ применения и дозы:

Устанавливают индивидуально с учетом состояния больного, клинической формы заболевания и индивидуальной чувствительности к препарату.

Взрослым назначают по 50-100 мг (1-2 таб.) 1-3 раза/сут. При нерегулярном применении можно принять 1-2 таб. Максимальная суточная доза - 300 мг.

Пациентам пожилого возраста и пациентам с почечной недостаточностью суточную дозу снижают примерно в 2 раза.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: головная боль, бессонница, повышенная раздражительность, психомоторное возбуждение, спутанность сознания, судорожные припадки у больных эпилепсией.

Со стороны пищеварительной системы: снижение аппетита, запор, метеоризм, тошнота, сухость во рту; в отдельных случаях - холестатическая желтуха.

Аллергические реакции: кожный зуд, экзантема (в т.ч. скарлатиноподобная экзантема).

Со стороны костно-мышечной системы: напряжение мышц, боль в мышцах.

Со стороны дыхательной системы: угнетение дыхания.

Передозировка:

Симптомы: после приема препарата в высоких дозах (50-120 мг/кг массы тела) возможно подавление функций ЦНС: рвота, спутанность сознания, кома, угнетение дыхания и/или эпилептические припадки.

Лечение: при выраженном подавлении функций ЦНС не рекомендуется вызывать рвоту, следует промыть желудок. Введение активированного угля помогает уменьшить всасывание препарата. Следует постоянно следить за основными физиологическими параметрами и применять соответствующую симптоматическую терапию. При угнетении дыхания можно проводить искусственную вентиляцию легких. Введение стимуляторов ЦНС не рекомендуется. Гипотензию лучше всего устранять в/в введением жидкостей и переводом пациента в положение Тренделенбурга. Если эти меры не восстанавливают нормальное АД, можно ввести допамин или норэпинефрин (норадреналин). Диализ и форсированный диурез не эффективны. В экстренных случаях возможно применение специфического антагониста бензодиазепина - флумазенила, однако его применение при передозировке тофизопамом клинически не протестировано.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Грандаксин противопоказан к применению в I триместре беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение такролимуса, сиролимуса, циклоспорина и Грандаксина противопоказано. Концентрация в плазме крови препаратов, которые метаболизируются при участии изофермента CYP3A4, может увеличиться при одновременном приеме с тофизопамом.

Применение Грандаксина с препаратами, подавляющими функции ЦНС (анальгетики, средства для общей анестезии, антидепрессанты, блокаторы гистаминовых H_1-рецепторов, седативные, снотворные препараты, антипсихотические препараты), усиливает их эффекты (например, седативный эффект или угнетение дыхания).

Индукторы печеночных ферментов (этанол, никотин, барбитураты, противоэпилептические средства) могут усилить метаболизм тофизопама, что может привести к снижению его концентрации в плазме крови и ослаблению терапевтического эффекта.

Некоторые противогрибковые препараты (кетоконазол, итраконазол) могут замедлить печеночный метаболизм тофизопама, что приводит к увеличению его концентрации в плазме крови.

Некоторые антигипертензивные препараты (клонидин, блокаторы кальциевых каналов) могут усилить эффекты Грандаксина.

Бета-адреноблокаторы могут замедлить метаболизм тофизопама, однако этот эффект не имеет клинического значения.

Тофизопам при одновременном применении может повысить уровень дигоксина в плазме крови.

Бензодиазепины, в т.ч. тофизопам, могут повлиять на антикоагулянтный эффект варфарина.

Длительное одновременное применение дисульфирама может угнетать метаболизм тофизопама.

Антацидные средства могут влиять на всасывание тофизопама.

Циметидин и омепразол при одновременном применении угнетают метаболизм тофизопама.

Пероральные контрацептивные средства могут снижать интенсивность метаболизма тофизопама.

Тофизопам ослабляет угнетающее действие этанола на ЦНС.

Особые указания и меры предосторожности:

Следует учитывать, что у пациентов с задержкой психического развития, пожилых больных, у пациентов с нарушениями функции почек и/или печени чаще, чем у других пациентов, могут наблюдаться побочные эффекты.

Не рекомендуется применять тофизопам при хроническом психозе, фобии или навязчивых состояниях. В этих случаях возрастает риск суицидальных попыток и агрессивного поведения. Поэтому Грандаксин не рекомендован в качестве монотерапии депрессии или депрессии, сопровождающейся тревогой.

Необходима осторожность при лечении пациентов с деперсонализацией, а также с органическим поражением головного мозга (например, с атеросклерозом).

У больных с эпилепсией тофизопам может повышать порог судорожной готовности.

Каждая таблетка Грандаксина содержит 92 мг лактозы, что следует учитывать пациентам с непереносимостью лактозы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Грандаксин существенно не снижает внимание и способность концентрироваться.

При нарушениях функции почек

Пациентам с почечной недостаточностью суточную дозу снижают примерно в 2 раза.

При нарушениях функции печени

У пациентов с нарушениями функции печени чаще, чем у других пациентов, могут наблюдаться побочные эффекты

Применение в пожилом возрасте

Больным пожилого возраста суточную дозу снижают примерно в 2 раза.

Применение в детском возрасте

Препарат назначают взрослым.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре от 15° до 25°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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