Клоназепам



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Клоназепам

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоэпилептическое средство из группы производных бензодиазепина. Оказывает выраженное противосудорожное, а также центральное миорелаксирующее, анксиолитическое, седативное и снотворное действие.

Усиливает ингибирующее действие GABA на передачу нервных импульсов. Стимулирует бензодиазепиновые рецепторы, распложенные 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 постсинаптические спинальные рефлексы.

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

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

Противосудорожное действие реализуется за счет усиления пресинаптического торможения. При этом происходит подавление распространения эпилептогенной активности, возникающей в эпилептогенных очагах в коре, таламусе и лимбических структурах, но не снимается возбужденное состояние очага.

Показано, что у человека клоназепам быстро подавляет пароксизмальную активность разных типов, в т.ч. комплексы "спайк-волна" при абсансах (petit mal), медленные и генерализованные комплексы "спайк-волна", "спайки" височной и другой локализации, а также нерегулярные "спайки" и волны.

Изменения на ЭЭГ генерализованного типа подавляются в большей степени, чем фокального. В соответствии с этими данными клоназепам оказывает благоприятный эффект при генерализованных и фокальных формах эпилепсии.

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

Фармакокинетика

При приеме внутрь биодоступность составляет более 90%. Связывание с белками плазмы - более 80%. V_d - 3.2 л/кг. $T_{1/2}$ - 23 ч. Выводится преимущественно в виде метаболитов.

Показания к применению:

Средство I ряда - эпилепсия (взрослые, дети грудного и младшего возраста): типичные абсансы (petit mal), атипичные абсансы (синдром Леннокса-Гасто), кивательные судороги, атонические припадки (синдром "падения" или "drop-атаки").

Средство II ряда - инфантильные спазмы (синдром Веста).

Средство III ряда - тонико-клонические судороги (grand mal), простые и сложные парциальные припадки и вторично-генерализованные тонико-клонические судороги.

Эпилептический статус (в/в введение).

Сомнамбулизм, мышечный гипертонус, бессонница (особенно у больных с органическими поражениями головного мозга), психомоторное возбуждение, алкогольный абстинентный синдром (острая ажитация, тремор, угрожающий или острый алкогольный делирий и галлюцинации), панические расстройства.

Относится к болезням:

- Абстинентный синдром
- Бессонница
- Гипертония
- Паническое расстройство
- Спазмы
- Судороги
- Тремор
- Эпилепсия

Противопоказания:

Угнетение дыхательного центра, тяжелая ХОБЛ (прогрессирование степени дыхательной недостаточности), острая дыхательная недостаточность, миастения, кома, шок, закрытоугольная глаукома (острый приступ или предрасположенность), острая алкогольная интоксикация с ослаблением жизненно важных функций, острые отравления наркотическими анальгетиками и снотворными средствами, тяжелая депрессия (могут отмечаться суицидальные наклонности), беременность, период лактации, повышенная чувствительность к клоназепаму.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный. Для приема внутрь взрослым рекомендуется начальная доза не более 1 мг/сут. Поддерживающая доза - 4-8 мг/сут.

Для грудных детей и детей в возрасте 1-5 лет начальная доза должна составлять не более 250 мкг/сут, для детей в возрасте 5-12 лет - 500 мкг/сут. Поддерживающие суточные дозы для детей в возрасте до 1 года - 0.5-1 мг, 1-5 лет - 1-3 мг, 5-12 лет - 3-6 мг.

Для пациентов пожилого возраста рекомендуется начальная доза не более 500 мкг.

Суточную дозу следует разделять на 3-4 равных дозы. Поддерживающие дозы назначают через 2-3 недели лечения.

В/в (медленно) взрослым - по 1 мг, детям в возрасте до 12 лет - по 500 мкг.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: в начале лечения - выраженная заторможенность, чувство усталости, сонливость, вялость, головокружение, состояние оцепенения, головные боли; редко - спутанность сознания, атаксия. При применении в высоких дозах, особенно при длительном лечении - нарушения артикуляции, диплопия, нистагм; парадоксальные реакции (в т.ч. острые состояния возбуждения); антероградная амнезия. Редко - гиперергические реакции, мышечная слабость - депрессия. При длительном лечении некоторых форм эпилепсии возможно увеличение частоты припадков.

Со стороны пищеварительной системы: редко - сухость во рту, тошнота, диарея, изжога, тошнота, рвота, снижение аппетита, запоры или диарея, нарушения функции печени, повышение активности печеночных трансаминаз и ЩФ, желтуха. У детей грудного и раннего возраста возможно усиленное слюнотечение.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД, тахикардия.

Со стороны эндокринной системы: изменение либидо, дисменорея, обратимое преждевременное половое развитие у детей (неполный преждевременный пубертат).

Со стороны дыхательной системы: при в/в введении возможно угнетение дыхания, особенно на фоне лечения другими препаратами, вызывающими дыхательную депрессию; у детей грудного и младшего возраста возможна бронхиальная гиперсекреция.

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз, анемия, тромбоцитопения.

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

Аллергические реакции: крапивница, кожная сыпь, зуд, крайне редко - анафилактический шок.

Дерматологические реакции: преходящая алопеция, изменение пигментации.

Прочие: привыкание, лекарственная зависимость; при резком снижении дозы или прекращении приема - синдром отмены.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период лактации. Клоназепам проникает через плацентарный барьер. Клоназепам может выделяться с грудным молоком.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с лекарственными средствами, оказывающими угнетающее влияние на ЦНС, этанолом, этанолсодержащими препаратами возможно усиление угнетающего влияния на ЦНС.

При одновременном применении клоназепам усиливает действие миорелаксантов; с вальпроатом натрия - ослабление действия вальпроата натрия и провокация судорожных припадков.

При одновременном применении описан случай уменьшения концентрации дезипрамина в плазме крови в 2 раза и ее повышения после отмены клоназепама.

При одновременном применении с карбамазепином, который вызывает индукцию микросомальных ферментов печени, возможно усиление метаболизма и в результате этого снижение концентрации клоназепама в плазме крови, уменьшение его $T_{1/2}$.

При одновременном применении с кофеином возможно уменьшение седативного и анксиолитического действия клоназепама; с ламотриджином - возможно уменьшение концентрации клоназепама в плазме крови; с лития карбонатом - развитие нейротоксичности.

При одновременном применении с примидоном повышается концентрация примидона в плазме крови; с тиапридом - возможно развитие ЗНС.

При одновременном применении с торемифеном возможно значительное уменьшение AUC и $T_{1/2}$ торемифена в связи с индукцией микросомальных ферментов печени под влиянием клоназепама, что приводит к ускорению метаболизма торемифена.

Описан случай развития головной боли с локализацией в затылочной области при одновременном применении с фенелзином.

При одновременном применении возможно повышение концентрации фенитоина в плазме крови и развитие токсических реакций, снижение его концентрации или отсутствие указанных изменений.

При одновременном применении с циметидином усиливаются побочные эффекты со стороны ЦНС, однако частота судорожных припадков у некоторых пациентов уменьшалась.

Особые указания и меры предосторожности:

С особой осторожностью применяют у пациентов с атаксией, тяжелыми заболеваниями печени, тяжелой хронической дыхательной недостаточностью, в особенности в стадии острого ухудшения, с эпизодами ночных апноэ.

С осторожностью применяют у пациентов пожилого возраста, т.к. у них может быть замедлено выведение клоназепама и снижена толерантность, особенно при наличии сердечно-легочной недостаточности.

При длительном применении возможно развитие лекарственной зависимости. При резкой отмене клоназепама после длительного лечения возможно развитие синдрома абстиненции.

При продолжительном применении клоназепама у детей следует иметь в виду возможность побочного действия на физическое и психическое развитие, что может не проявляться в течение многих лет.

В период лечения не допускать употребления алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения наблюдается замедление скорости психомоторных реакций. Это необходимо учитывать лицам, занимающимся потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции печени

С особой осторожностью применяют у пациентов с тяжелыми заболеваниями печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью применяют у пациентов пожилого возраста, т.к. у них может быть замедлено выведение клоназепама и снижена толерантность, особенно при наличии сердечно-легочной недостаточности.

Применение в детском возрасте

При продолжительном применении клоназепама у детей следует иметь в виду возможность побочного действия на физическое и психическое развитие, что может не проявляться в течение многих лет.

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