

Клозастен



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Клозапин](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндекс](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[РЛС](#) [VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки зеленовато-желтого цвета, плоскоцилиндрические, с фаской.

	1 таб.
клозапин	25 мг

Вспомогательные вещества: лактоза (сахар молочный), крахмал картофельный, повидон, кремния диоксид коллоидный (аэросил), магния стеарат.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.

Таблетки зеленовато-желтого цвета, плоскоцилиндрические, с фаской и риской.

	1 таб.
клозапин	100 мг

Вспомогательные вещества: лактоза (сахар молочный), крахмал картофельный, повидон, кремния диоксид коллоидный (аэросил), магния стеарат.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антипсихотический препарат (нейролептик), производное дибензодиазепина. Оказывает выраженное антипсихотическое и седативное действие. Практически не вызывает экстрапирамидных нарушений; в связи с этим клозапин относят к группе так называемых "атипичных" нейролептиков.

Антипсихотическое действие обусловлено блокадой допаминовых D₂-рецепторов в мезолимбических и мезокортикальных структурах головного мозга.

Седативное действие обусловлено блокадой α-адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга; противорвотное действие — блокадой допаминовых D₂-рецепторов триггерной зоны рвотного центра; гипотермическое действие - блокадой допаминовых рецепторов гипоталамуса. Оказывает периферическое и центральное м-холиноблокирующее, α-адреноблокирующее действие. Не влияет на концентрацию пролактина в крови.

Антипсихотическое действие близко к таковому алифатических фенотиазинов, но без "субмеланхолического

оттенка" и неприятных субъективных ощущений, не обладает каталептогенным эффектом, снижает порог судорожной готовности.

Не влияет на высшие интеллектуальные функции.

Развитие терапевтического эффекта характеризуется этапностью: быстрое наступление снотворного и седативного действия, купирование беспокойства, психомоторного возбуждения и агрессивности (через 3-6 дней), антипсихотическое действие (через 1-2 недели), действие на симптомы негативизма (через 20-40 дней).

Фармакокинетика

Всасывание

Препарат хорошо всасывается в ЖКТ. Биодоступность - 27-60%. C_{max} определяется в плазме крови через 2.5 ч (1-6 ч).

Распределение

Стабильная C_{ss} в плазме крови определяется через 8-10 дней и составляет в среднем 319 нг/мл (102-771 нг/мл). Связь с белками плазмы - 95%. Клозапин быстро распределяется в организме и накапливается в паренхиматозных органах (легкие, печень, почки).

Метаболизм

Метаболизируется в печени ферментной системой CYP1A2, метаболиты имеют слабую активность, либо неактивны.

Выведение

Выводится в виде метаболитов почками (50%) и с желчью (35%). $T_{1/2}$ подвержен большим колебаниям, после приема однократной дозы 75 мг - 8 ч (4-12 ч); при приеме 100 мг 2 раза/сут - 12 ч (4-66 ч).

Показания к применению:

- острая и хроническая формы шизофрении (в т.ч. резистентная к терапии другими нейролептиками и/или при их непереносимости),
- маниакальные состояния;
- маниакально-депрессивный психоз;
- психомоторное возбуждение при психопатиях;
- эмоциональные и поведенческие расстройства (в т.ч. у детей);
- расстройства сна.

Относится к болезням:

- [Депрессия](#)
- [Маниакально-депрессивный психоз](#)
- [Шизофрения](#)

Противопоказания:

- гранулоцитопения или агранулоцитоз в анамнезе (за исключением развития гранулоцитопении или агранулоцитоза вследствие ранее применявшейся химиотерапии);
- угнетение костномозгового кроветворения;
- миастения;
- коматозные состояния;
- токсический психоз (в т.ч. алкогольный);
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы и глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- беременность;
- период лактации;

— детский возраст до 16 лет;

— повышенная чувствительность к клозапину.

С *осторожностью* следует применять препарат при декомпенсированных заболеваниях сердечно-сосудистой системы, тяжелой печеночной и/или почечной недостаточности, закрытоугольной глаукоме, гиперплазии предстательной железы, атонии кишечника, эпилепсии, интеркуррентных заболеваниях с лихорадочным синдромом.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь после еды 2-3 раза/сут.

Разовая доза для **взрослых и детей старше 16 лет** - 50-200 мг, начальная суточная доза - 150-300 мг, средняя суточная доза - 200-400 мг. Высшая суточная доза - 600 мг.

Дозу подбирают индивидуально, начиная с назначения в небольших дозах (25 мг) и повышая их на 25-50 мг/сут, до получения терапевтического эффекта.

При легких формах заболевания для поддерживающей терапии, а также у **пациентов с печеночной и/или почечной недостаточностью, хронической сердечной недостаточностью, с цереброваскулярными расстройствами** назначают в более низких суточных дозах (25-200 мг).

Следует учитывать этапность проявления терапевтического эффекта: быстрое наступление снотворного и седативного действия, купирование беспокойства, психомоторного возбуждения и агрессивности (через 3-6 дней), антипсихопатическое действие (через 1-2 недели), действие на симптомы негативизма (через 20-40 дней).

После достижения терапевтического эффекта переходят на поддерживающий курс.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: головокружение, сонливость, головная боль, повышение температуры тела, обморочные состояния, ажитация, акатизия, спутанность сознания; редко - экстрапирамидные расстройства (акинезия или гипокинезия, ригидность мышц, тремор), бессонница, нарушения сна, депрессия, злокачественный нейролептический синдром (судороги, затрудненное дыхание или тахипноэ, тахикардия или аритмия, повышение температуры тела, нестабильное АД, непроизвольное мочеиспускание, выраженная ригидность мышц, бледность кожных покровов, чрезмерная утомляемость или слабость), эпилептические припадки, поздняя дискинезия.

Со стороны мочевыделительной системы: задержка мочи.

Со стороны половой системы: снижение потенции.

Со стороны обмена веществ: повышение массы тела.

Со стороны костно-мышечной системы: миастения.

Со стороны пищеварительной системы: гиперсаливация, тошнота, рвота, изжога, сухость во рту, запор.

Со стороны органов кроветворения: гранулоцитопения вплоть до агранулоцитоза (первыми признаками агранулоцитоза могут быть симптомы, напоминающие грипп: озноб, лихорадка, боль в горле, воспаление десен и слизистой оболочки полости рта, вяло заживающие раны, фурункулез, обострение хронических или латентных очагов инфекции - тонзиллит, периостит, пиодермия), лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны органов чувств: нарушение аккомодации.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД (в т.ч. ортостатическая гипотензия), реже - повышение АД, тахикардия, уплощение зубца Т на ЭКГ.

Передозировка:

Симптомы: оглушенность, сонливость, сопорозное состояние, угнетение дыхания, коматозное состояние, делириозные расстройства, развитие больших эпилептических припадков, тревожность, возбуждение, лабильность температуры тела, тахикардия, снижение АД, нарушения ритма сердца, коллапс, атония кишечника.

Лечение: промывание желудка с назначением сорбентов, поддержание функции дыхания и сердечно-сосудистой системы, контроль электролитного баланса и кислотно-щелочного состояния, симптоматическое лечение. На протяжении 4 дней после исчезновения симптомов отравления за больным устанавливают наблюдение из-за

возможных поздних осложнений. Перитонеальный диализ или гемодиализ неэффективны.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение препарата при беременности и в период лактации. На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Увеличивает эффект седативных и снотворных лекарственных средств, препаратов для общей анестезии, опиоидных анальгетиков, ингибиторов MAO, антигипертензивных лекарственных средств, этанола.

Ослабляет эффект леводопы и других стимуляторов допаминовых рецепторов.

Всасывание из кишечника ухудшается при приеме гелеобразных антацидов и колестирамина.

В комбинации с бензодиазепинами возможно чрезмерное снижение АД, нарушение сознания, угнетение или остановка дыхания.

Одновременный прием препаратов лития увеличивает нейротоксичность (бред, судороги, экстрапирамидные расстройства).

Пентетразол повышает опасность появления судорог.

Нельзя применять совместно с трициклическими антидепрессантами, антипсихотическими лекарственными средствами, лекарственными средствами, повреждающими клетки крови (пиразолонсодержащие НПВП), антидепрессантами, карбамазепином, препаратами золота, тиреостатиками и противомаларийными препаратами.

Следует соблюдать осторожность при совместном назначении противосудорожных препаратов, антикоагулянтов, противомикробных и гипогликемических препаратов (производных сульфонилмочевины).

Миелотоксические лекарственные средства усиливают проявления гематотоксичности препарата.

Особые указания и меры предосторожности:

При развитии явлений гранулоцитопении лечение следует немедленно прекратить.

Для устранения артериальной гипотензии, развивающейся на фоне приема клозапина, можно применять только ангиотензин или производные норэпинефрина.

Во время приема клозапина следует воздерживаться от употребления этанола.

Вначале еженедельно, а затем каждые 3-4 мес необходимо осуществлять контроль за картиной крови. При появлении гранулоцитопении лечение немедленно прекращают.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью назначают в более низких суточных дозах (25-200 мг).

При нарушениях функции печени

У пациентов с печеночной недостаточностью назначают в более низких суточных дозах (25-200 мг).

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 16 лет

Условия хранения:

Клозастен

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

Список Б. Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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