

## Лексотан



### **Полезные ссылки:**

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### **Фармакологические свойства:**

#### **Фармакодинамика**

Анксиолитическое средство (транквилизатор), производное бензодиазепина. Оказывает анксиолитическое, седативное, снотворное, противосудорожное и центральное миорелаксирующее действие.

Механизм действия связывают с усилением тормозного влияния GABA в ЦНС за счет повышения чувствительности GABA-рецепторов к медиатору в результате возбуждения бензодиазепиновых рецепторов. 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 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).

Выраженная анксиолитическая активность сочетается с умеренным снотворным действием; укорачивает период засыпания, увеличивает продолжительность сна, снижает количество ночных пробуждений. Механизм снотворного действия заключается в угнетении клеток ретикулярной формации ствола головного мозга. Уменьшает воздействие эмоциональных, вегетативных и моторных раздражителей, нарушающих механизм засыпания.

#### **Фармакокинетика**

После приема внутрь быстро и почти полностью абсорбируется из ЖКТ.  $C_{max}$  в плазме крови достигается через 0.5-4 ч и поддерживается в течение 12 ч. Связывание с белками плазмы составляет около 70%.

Подвергается интенсивному метаболизму в печени. Основной путь метаболизма у человека - гидроксилирование в 3 положении с последующей глюкуронизацией и расщеплением гетероциклического кольца, гидроксилирование его в бенzenовое кольцо и конъюгация. Из образующихся метаболитов только 3-гидроксибромазепам обладает фармакологической активностью и выводится с мочой в тех же количествах, что и неизмененный бромазепам.

$T_{1/2}$  из плазмы крови составляет 20-32 ч.

Менее 2% выводится в неизмененном виде с мочой. В моче присутствует около 37% неидентифицированных метаболитов с неустановленной активностью.

## Показания к применению:

Неврозы и психопатии (сопровождающиеся фобиями, тревогой, эмоциональным напряжением, беспокойством), бессонница (при неврозах страха).

Функциональные психосоматические расстройства сердечно-сосудистой системы (псевдостенокардия, вазоспастическая стенокардия, кардиалгия, кардиофобия, артериальная гипертензия эмоционального генеза); дыхательной системы (гипервентиляция, затруднение дыхания, одышка); пищеварительной системы (синдром раздраженного толстого кишечника); мочевыделительной и половой системы (учащенное мочеиспускание, дисменорея, климактерические и менструальные расстройства). Психогенная головная боль. Психогенные дерматозы (заболевания, сопровождающиеся зудом, раздражительностью).

## Относится к болезням:

- [Бессонница](#)
- [Гипертензия](#)
- [Головная боль](#)
- [Дерматит](#)
- [Дисменорея](#)
- [Зуд](#)
- [Кардиалгия](#)
- [Кардит](#)
- [Неврит](#)
- [Неврозы](#)
- [Одышка](#)
- [Стенокардия](#)
- [Фобия](#)

## Противопоказания:

Кома, шок, острая алкогольная интоксикация с ослаблением жизненно важных функций, острые отравления опиоидными анальгетиками, снотворными и психотропными средствами, миастения, закрытоугольная глаукома (острый приступ или предрасположенность), тяжелая ХОБЛ (прогрессирование степени дыхательной недостаточности), острая дыхательная недостаточность, тяжелая депрессия (могут отмечаться суицидальные попытки), беременность (особенно I триместр), период лактации, детский и подростковый возраст до 18 лет (безопасность и эффективность не определены), повышенная чувствительность к бензодиазепинам.

## Способ применения и дозы:

В амбулаторных условиях применяют по 1.5-3 мг 2-3 раза/сут, в условиях стационара в тяжелых случаях - по 6-12 мг 2-3 раза/сут. Длительность приема - 2-4 недели, затем бромазепам постепенно отменяют или переходят на поддерживающую терапию.

*Максимальная доза:* 60 мг/сут.

## Побочное действие:

*Со стороны ЦНС и периферической нервной системы:* в начале лечения (особенно у пациентов пожилого возраста) - сонливость, чувство усталости, головокружение, снижение способности к концентрации внимания, атаксия, вялость, притупление эмоций, замедление психических и двигательных реакций; редко - головная боль, депрессия, тремор, снижение памяти, антероградная амнезия, подавленность настроения, спутанность сознания, дистонические экстрапирамидные реакции (неконтролируемые движения тела, включая глаза), слабость, миастения, дизартрия, диплопия; в отдельных случаях - парадоксальные реакции (агрессивные вспышки, галлюцинации, острое возбуждение, раздражительность, тревожность, бессонница).

*Со стороны системы кроветворения:* лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз (озноб, гипертермия, боли в горле, необычная слабость), анемия, тромбоцитопения.

*Со стороны пищеварительной системы:* сухость во рту или слюнотечение, изжога, тошнота, рвота, снижение аппетита, запор или диарея; нарушение функции печени, повышение активности печеночных трансаминаз и ЩФ, желтуха.

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

*Со стороны половой системы:* возможны снижение либидо, дисменорея.

*Аллергические реакции:* редко - кожная сыпь, зуд.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* редко - артериальная гипотензия, тахикардия, palpitation.

*Прочие:* редко - снижение массы тела.

## **Применение при беременности и кормлении грудью:**

Бромазепам оказывает токсическое действие на плод и повышает риск развития врожденных пороков при применении в I триместре беременности. Применение во II и III триместрах беременности возможно только по жизненным показаниям. Применение при беременности может вызывать замедление ЧСС плода.

Постоянное применение при беременности может приводить к физической зависимости с развитием синдрома отмены у новорожденного. Прием в терапевтических дозах в более поздние сроки беременности может вызвать угнетение ЦНС новорожденного. Применение непосредственно перед родами или во время родов может вызывать у новорожденного угнетение дыхания, снижение мышечного тонуса, гипотензию, гипотермию и слабый акт сосания (синдром "вялого ребенка").

Противопоказан в период лактации.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами:**

При одновременном применении бромазепам усиливает действие средств, оказывающих угнетающее влияние на ЦНС, этанола.

При одновременном применении с метопрололом возможно увеличение AUC бромазепам и усиление действия метопролола на систолическое АД.

При одновременном применении с флувоксамином повышается концентрация бромазепам в плазме крови, что может сопровождаться нарушением когнитивной функции. Полагают, что данное взаимодействие обусловлено ингибированием метаболизма бромазепам под влиянием флувоксамина.

## **Особые указания и меры предосторожности:**

С осторожностью применять при церебральной и спинальной атаксии, печеночной недостаточности, хронической почечной недостаточности, гиперкинезах, лекарственной зависимости в анамнезе, склонности к злоупотреблению психотропными лекарственными средствами, при органических заболеваниях головного мозга, психозах (возможны парадоксальные реакции), при гипопроотеинемии, ночном апноэ (установленном или предполагаемом), у пациентов пожилого возраста.

У пациентов с эпилепсией применение бромазепам может привести к увеличению частоты и/или тяжести судорожных приступов. В таких случаях рекомендуется коррекция режима дозирования противосудорожных средств. Следует иметь в виду, что резкая отмена бензодиазепинов у пациентов с судорожными заболеваниями может быть связана с временным увеличением частоты и/или тяжести судорожных приступов. При одновременном применении бромазепам с противосудорожным средством следует контролировать концентрацию последнего в плазме крови.

С осторожностью применять у пациентов, злоупотребляющих лекарственными средствами. В таких случаях рекомендуется ограничить повторное применение бромазепам без медицинского контроля.

С осторожностью применять бензодиазепины у пациентов с нарушениями функции печени и/или почек.

При длительном применении необходим систематический контроль картины периферической крови и функции печени.

При применении бромазепам в рекомендуемых дозах под наблюдением врача толерантность развивается редко.

При быстром снижении дозы или резкой отмене бромазепам возможно развитие синдрома отмены (головная боль, миалгия, тревожность, напряженность, спутанность сознания, раздражительность; в тяжелых случаях - дереализация, гиперактузия, парестезии в конечностях, световая и тактильная гиперчувствительность, галлюцинации и эпилептические приступы). Синдром отмены чаще встречается при длительном применении бромазепам в высоких дозах. Отмену бромазепам следует проводить постепенно.

Лечение следует прекратить при возникновении таких необычных реакций как повышенная агрессивность, острые состояния возбуждения, чувство страха, мысли о самоубийстве, галлюцинации, усиление мышечных судорог, трудное засыпание, поверхностный сон.

## **Лексотан**

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

---

В период лечения не допускать употребления алкоголя.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

В период лечения следует воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

### **При нарушениях функции почек**

С осторожностью применять при хронической почечной недостаточности, а также у пациентов с нарушениями функции почек.

### **При нарушениях функции печени**

С осторожностью применять при печеночной недостаточности, а также у пациентов с нарушениями функции печени.

### **Применение в пожилом возрасте**

С осторожностью применять у пациентов пожилого возраста.

### **Применение в детском возрасте**

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 18 лет (безопасность и эффективность не определены).

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Leksotan>