Лексотан

Полезные ссылки:

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

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, 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).

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 бензеновое 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, пальпитация.

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 бромазепама и усиление действия метопролола на систолическое АД.

При одновременном применении с флувоксамином повышается концентрация бромазепама в плазме крови, что может сопровождаться нарушением когнитивной функции. Полагают, что данное взаимодействие обусловлено ингибированием метаболизма бромазепама 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 гипопротеинемии, ночном апноэ (установленном или предполагаемом), у пациентов пожилого возраста.

У пациентов с эпилепсией применение бромазепама может привести к увеличению частоты и/или тяжести судорожных припадков. 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 припадков. При одновременном применении бромазепама 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 бромазепама 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 бромазепама в рекомендуемых дозах под наблюдением врача толерантность развивается редко.

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

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