Мезапам



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Медазепам

Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Анксиолитическое средство (транквилизатор), производное бензодиазепина. Оказывает анксиолитическое, миорелаксирующее и противоэпилептическое действие, обладает незначительно выраженным тимолептическим эффектом. Седативное и снотворное действие выражено в меньшей степени, чем у типичных бензодиазепиновых транквилизаторов, поэтому медазепам относят к группе так называемых "дневных" транквилизаторов.

Взаимодействует с бензодиазепиновыми рецепторами лимбической системы и восходящей активирующей формации ствола головного мозга, способствует открытию хлорных каналов, что ведет к усилению тормозного влияния GABA в ЦНС.

Устраняет состояние тревоги, чувство страха, психоневротическое напряжение, общее двигательное возбуждение, избыточную суетливость, восстанавливает эмоциональное поведение и оказывает стабилизирующее влияние на вегетативную нервную систему. Восстанавливает критическую оценку собственного заболевания. Противоэпилептическое, центральное миорелаксирующее, седативное и снотворное действие выражено в меньшей степени, чем у типичных анксиолитических средств производных бензодиазепина.

Фармакокинетика

После приема внутрь быстро всасывается. Абсорбция составляет 49-75%. C_{max} достигается через 1-2 ч. Связывание с белками плазмы - 99.8%. Метаболизируется путем гидроксилирования, N-деметилирования, окисления с образованием активных метаболитов: десметилмедазепам (нордиазепам), диазепам, десметилдиазепам, оксазепам (7.1% дозы).

Нордиазепам имеет длительный $T_{1/2}$, накапливается в организме и оказывает выраженное седативное действие. Метаболиты, связанные с глюкуроновой кислотой, выводятся почками (63-85%) и через кишечник (15-37%). $T_{1/2}$ - 20-176 ч. После завершения приема еще в течение 3-14 дней определяются значимые концентрации метаболитов в плазме (имеют длительный $T_{1/2}$).

Показания к применению:

Неврозы, психопатия с тревогой, возбуждение, нервное напряжение, раздражительность, нейроциркуляторная дистония, мигрень (профилактика приступов), климактерический синдром, хронический алкоголизм (абстинентный синдром). "Школьные" неврозы, психическая лабильность и чрезмерная возбудимость у детей.

Относится к болезням:

- Абстинентный синдром
- Алкоголизм
- Климактерический синдром
- Мигрень
- Неврит
- Неврозы
- Нейроциркуляторная дистония

Противопоказания:

Миастения, острые заболевания печени и почек, ночное апноэ, алкогольная и наркотическая зависимость, I триместр беременности, период лактации, детский возраст до 10 лет, повышенная чувствительность к медазепаму.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь. Взрослым в начале лечения - по 5 мг 2-3 раза/сут, затем дозу постепенно повышают до 30 мг/сут. В амбулаторных условиях рекомендуются дозы по 5 мг утром и днем и 10 мг вечером. При необходимости дозу можно увеличить до 40 мг/сут. Лицам пожилого возраста и подросткам - по 10-20 мг/сут; детям 10 лет и старше - в дозе 2 мг/кг/сут. Длительность применения зависит от показаний и индивидуальной реакции пациента на лечение.

Максимальные суточные дозы: для взрослых при амбулаторном лечении - 40 мг, в условиях стационара - 60 мг.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: возможны сонливость, чувство легкой усталости, головная боль (первая реакция на прием, исчезающая после снижения дозы), слабость, головокружение, оглушенность, антероградная амнезия, депрессия, спутанность сознания, дизартрия, парез аккомодации.

У пожилых пациентов и детей более вероятны потеря ориентации, отсутствие торможения, агрессивность, повышенная мышечная утомляемость. У пожилых пациентов и больных с умственной отсталостью возможна атаксия.

Со стороны эндокринной системы: снижение либидо, снижение потенции, нарушения менструального цикла.

Со стороны дыхательной системы: угнетение дыхательного центра (при обструкции дыхательных путей или повреждении головного мозга), альвеолярная гиповентиляция (у больных с ХОБЛ при приеме в высоких дозах).

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

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, диспепсия.

Прочие: задержка мочи, спазм голосовых связок, боли в грудной клетке, синдром отмены, парадоксальные реакции, лекарственная зависимость (особенно при длительном применении), аллергические реакции.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан в I триместре беременности и в период лактации (грудного вскармливания). Применение во II и III триместрах беременности возможно только по строгим показаниям.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с опиоидными анальгетиками, средствами для наркоза, миорелаксантами, этанолом возможно усиление угнетающего влияния на ЦНС.

При одновременном применении с гипотензивными средствами центрального действия, бета-адреноблокаторами, антикоагулянтами результаты лекарственного взаимодействия непредсказуемы.

При одновременном применении с циметидином возможно увеличение интенсивности и длительности действия медазепама, барбитураты и фенитоин могут уменьшать его эффективность.

Пероральные контрацептивы могут ингибировать метаболизм медазепама, что приводит к усилению интенсивности и длительности его действия.

Уменьшает эффективность леводопы, усиливает действие фенитоина.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют при почечной и/или печеночной недостаточности, спинальной и мозжечковой атаксии, внутриглазной гипертензии, органических поражениях ЦНС, при дыхательной недостаточности, у пациентов пожилого возраста, при тяжелом общем состоянии, при беременности.

Медазепам следует применять по возможности кратковременно, т.к. при длительном применении, особенно в высоких дозах, имеется опасность формирования лекарственной зависимости. Физическая зависимость наступает редко, однако при чрезмерном превышении дозы наблюдалось развитие толерантности и психической зависимости. Для предотвращения развития абстинентного синдрома медазепам следует отменять постепенно.

При лечении бензодиазепинами установлено наличие торможения способности к обучению, процессов запоминания.

В период лечения не допускать употребления алкоголя.

У детей медазепам применяют по строгим показаниям.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период применения медазепама не рекомендуется заниматься потенциально опасными видами деятельности, требующими быстрых психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при острых заболеваниях почек. С осторожностью применяют при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при острых заболеваниях печени. С осторожностью применяют при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью применяют у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте до 10 лет.

У детей старше 10 лет медазепам применяют по строгим показаниям.

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