Седуксен (раствор)



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Раствор для в/в и в/м введения прозрачный, от бесцветного до светло-зеленого цвета.

	1 мл	**1 амп.**
диазепам	5 мг	10 мг

Вспомогательные вещества: гликофурол, метилпарагидроксибензоат (нипагин), натрия метабисульфит, натрия цитрат, пропиленгликоль, пропилпарагидроксибензоат (нипазол), этанол 96%, вода д/и.

2 мл - ампулы темного стекла (5) - пеналы пластиковые (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Транквилизатор (анксиолитик), производное бензодиазепина. Оказывает угнетающее действие на ЦНС, реализующееся преимущественно в таламусе, гипоталамусе и лимбической системе. Усиливает ингибирующее действие GABA, являющейся одним из основных медиаторов пре- и постсинаптического торможения передачи нервных импульсов в ЦНС. Обладает анксиолитическим, седативным, снотворным, миорелаксирующим и противосудорожным действием.

Механизм действия диазепама определяется стимуляцией бензодиазепиновых рецепторов супрамолекулярного GABA-бензодиазепин-хлорионофор рецептурного комплекса, приводящей к активации GABA-рецепторов, вызывающей снижение возбудимости подкорковых структур головного мозга, торможение полисинаптических спинальных рефлексов.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

При в/м введении всасывание диазепама может быть медленным и непостоянным (зависит от места введения); при введении в дельтовидную мышцу - абсорбция быстрая и полная.

Биодоступность - 90%. C_{max} в плазме крови достигаются через 0.5-1.5 ч при в/м и в пределах 0.25 ч при в/в введении. C_{ss} достигаются через 1-2 недели при постоянном приеме.

Диазепам и его метаболиты проникают через ГЭБ и плацентарный барьеры, обнаруживаются в грудном молоке в концентрациях, соответствующих 1/10 части от концентраций в плазме. Связывание с белками плазмы - 98%.

Метаболизм

Метаболизируется в печени с участием изоферментов CYP2C19, CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7 (98-99%) до

фармакологически активных производных (N-дезметилдиазепам) и менее активных (темазепам и оксазепам).

Выведение

Выводится почками - 70% (в виде глюкуронидов), в неизмененном виде - 1-2% и менее 10% - с каловыми массами. $T_{1/2}$ N-дезметилдиазепама - 30-100 ч, темазепама - 9.5-12.4 ч и оксазепама - 5-15 ч. При повторном применении накопление диазепама и его активных метаболитов значительное. Относится к бензодиазепинам с длительным $T_{1/2}$, выведение после прекращения лечения - медленное, т.к. метаболиты сохраняются в крови в течение нескольких дней или даже недель.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

$T_{1/2}$ может удлиняться у новорожденных (до 30 ч), пациентов пожилого и старческого возраста (до 100 ч) и у больных с печеночно-почечной недостаточностью (до 4 сут).

Показания к применению:

— невротические и неврозоподобные расстройства с проявлением тревоги;

— купирование психомоторного возбуждения, связанного с тревогой;

— купирование эпилептических припадков и судорожных состояний различной этиологии;

— состояния, сопровождающиеся повышением мышечного тонуса (столбняк, при острых нарушениях мозгового кровообращения);

— купирование абстинентного синдрома и делирия при алкоголизме;

— премедикация и атаралгезия в сочетании с анальгетиками и другими нейротропными препаратами при различных диагностических процедурах, в хирургической и в акушерской практике;

— в клинике внутренних болезней: в комплексной терапии гипертонической болезни, (сопровождающейся тревогой, повышенной возбудимостью), гипертонического криза, спазмов сосудов, климактерических и менструальных расстройств.

Относится к болезням:

- Алкоголизм
- Гипертоническая болезнь
- Гипертония
- Неврит
- Неврозы
- Нейротропия
- Спазмы
- Столбняк
- Судороги

Противопоказания:

— тяжелая форма миастении;

— кома;

— шок;

— закрытоугольная глаукома;

— явления зависимости в анамнезе (в т.ч. наркотическая зависимость и хронический алкоголизм, за исключением лечения алкогольного абстинентного синдрома и делирия);

— синдром ночного апноэ;

— состояние алкогольного опьянения различной степени тяжести;

— острые интоксикации лекарственными средствами, оказывающими угнетающее действие на ЦНС (наркотические, снотворные и психотропные средства);

— тяжелые хронические обструктивные заболевания легких (опасность прогрессирования дыхательной недостаточности);

— острая дыхательная недостаточность;

— детский возраст до 30 дней включительно;

— беременность (особенно I и III триместр);

— лактация (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к производным бензодиазепина.

Способ применения и дозы:

Для *купирования психомоторного возбуждения, связанного с тревогой*, Седуксен назначают по 10-20 мг в/м или в/в, при необходимости дозу повторяют через 3-4 ч.

При *столбняке* назначают в/м, в/в струйно или капельно по 10-20 мг каждые 2-8 ч.

При *эпилептическом статусе* назначают в/м или в/в по 10-20 мг, при необходимости дозу повторяют через 3-4 ч.

Для *снятия спазма скелетных мышц* вводят по 10 мг в/м за 1-2 ч до начала операции.

В *акушерской практике* назначают в/м по 10-20 мг при раскрытии шейки матки на 2-3 пальца.

Новорожденным назначают после 5-й недели жизни (старше 30 дней) в/в медленно по 0.1-0.3 мг/кг массы тела до максимальной дозы 5 мг, при необходимости инъекции повторяют через 2-4 ч (в зависимости от клинической симптоматики).

Детям от 5 лет и старше препарат следует вводить в/в медленно по 1 мг каждые 2-5 мин до максимальной дозы 10 мг; при необходимости введение можно повторить через 2-4 ч.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: в начале лечения (особенно у пожилых больных) - сонливость, головокружение, повышенная утомляемость, нарушение концентрации внимания, атаксия, дезориентация, неустойчивость походки и нарушение координации движений, вялость, притупление эмоций, замедление психических и двигательных реакций, антероградная амнезия; редко - головная боль, эйфория, депрессия, тремор, снижение настроения, каталепсия, спутанность сознания, дистонические экстрапирамидные реакции, астения, мышечная слабость, гипорефлексия, дизартрия; крайне редко - парадоксальные реакции (агрессивные вспышки, психомоторное возбуждение, страх, суицидальная наклонность, мышечный спазм, спутанность сознания, галлюцинации, тревога, нарушения сна).

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз (проявляющийся ознобом, гипертермией, болью в горле, необычной утомляемостью или слабостью), анемия, тромбоцитопения.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, гиперсаливация, изжога, икота, гастралгия, тошнота, рвота, снижение аппетита, запоры; нарушения функции печени, повышение активности печеночных трансаминаз и ЩФ, желтуха.

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

Со стороны мочеполовой системы: недержание или задержка мочи, нарушение функции почек, повышение или снижение либидо, дисменорея.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

Местные реакции: в месте введения - флебит или венозный тромбоз (краснота, припухлость или боль в месте введения).

Прочие: привыкание, лекарственная зависимость; редко - угнетение дыхательного центра, нарушение зрения (диплопия), булимия, снижение массы тела.

При резком снижении дозы или прекращении приема возможно развитие синдрома отмены: повышенная раздражительность, головная боль, тревога, страх, психомоторное возбуждение, нарушения сна, дисфория, спазм гладких мышц внутренних органов и скелетной мускулатуры, деперсонализация, усиление потоотделения, депрессия, тошнота, рвота, тремор, расстройства восприятия, в т.ч. гиперакузия, парестезии, светобоязнь, тахикардия, судороги, галлюцинации; редко - психотические расстройства.

Передозировка:

Симптомы: сонливость, угнетение сознания различной степени тяжести, парадоксальное возбуждение, снижение рефлексов до арефлексии, сниженная реакция на болевые раздражения, дизартрия, атаксия, нистагм, тремор, брадикардия, выраженная слабость, снижение АД, коллапс, угнетение сердечной и дыхательной (вплоть до апноэ) деятельности, кома.

Лечение: промывание желудка, форсированный диурез, прием активированного угля. Симптоматическая терапия (поддержание дыхания и АД), ИВЛ. Специфический антагонист – флумазенил, применяется в условиях стационара. Гемодиализ малоэффективен. Антагонист бензодиазепинов флумазенил не показан больным эпилепсией, которые получали лечение бензодиазепинами. У таких больных антагонистическое действие по отношению к бензодиазепинам может спровоцировать развитие эпилептических припадков.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат не следует назначать в I и III триместрах беременности.

При необходимости применения при беременности следует тщательно оценить предполагаемую пользу для матери и потенциальный риск для плода и ребенка.

Оказывает токсическое действие на плод и увеличивает риск развития врожденных пороков при применении в I триместре беременности.

Прием терапевтических доз в более поздние сроки беременности может вызвать угнетение ЦНС, нарушение дыхания и подавление сосательного рефлекса.

Использование в дозах выше 30 мг в течение 15 ч до родов или во время родов может вызывать у новорожденного угнетение дыхания (до апноэ), снижение мышечного тонуса, снижение АД, гипотермию, синдром вялого сосания новорожденного. Постоянное применение во время беременности может приводить к формированию физической зависимости и к возможному развитию симптомов отмены у новорожденного (мышечная гипотензия, гипотермия, диспноэ).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При совместном применении с ингибиторами МАО, стрихнином и коразолом возможен антагонизм в отношении эффектов Седуксена.

При сочетанном применении со снотворными и седативными средствами, опиоидными анальгетиками, другими транквилизаторами, производными бензодиазепина, миорелаксантами, средствами для общей анестезии, антидепрессантами, нейролептиками, этанолом возможно резкое усиление угнетающего действия на ЦНС.

При одновременном применении с циметидином, дисульфирамом, эритромицином, флуоксетином, а также с пероральными контрацептивами и эстрогеносодержащими препаратами, которые конкурентно ингибируют метаболизм в печени (процессы окисления), возможно замедление метаболизма Седуксена и повышение концентрации диазепама в плазме.

При совместном применении изониазид, кетоконазол и метопролол замедляют метаболизм диазепама и увеличивают его концентрацию в плазме крови.

При сочетанном применении пропранолол и вальпроевая кислота повышают концентрацию диазепама в плазме крови.

При совместном применении рифампицин может усиливать метаболизм диазепама и в результате снижать его концентрацию в плазме крови.

При совместном применении индукторы микросомальных ферментов печени уменьшают эффективность диазепама.

Опиоидные анальгетики усиливают угнетающее действие диазепама на ЦНС.

При одновременном применении с Седуксеном гипотензивные средства могут усиливать выраженность снижения АД.

При совместном применении с клозапином возможно усиление угнетения дыхания.

При одновременном применении Седуксена с сердечными гликозидами возможно увеличение концентрации последних в сыворотке крови и развитие дигиталисной интоксикации (в результате конкурентной связи с белками плазмы).

При совместном применении Седуксен снижает эффективность леводопы у больных паркинсонизмом.

Омепразол удлиняет время выведения диазепама.

Ингибиторы МАО, дыхательные аналептики, психостимуляторы при совместном применении снижают активность Седуксена.

При совместном применении потенциально возможно повышение токсичности зидовудина.

Теофиллин в низких дозах при одновременном применении может уменьшать седативное действие диазепама.

Премедикация диазепамом позволяет снизить дозу фентанила, требующуюся для вводной общей анестезии, и сокращает время наступления общей анестезии.

Фармацевтическое взаимодействие

Раствор Седуксена фармацевтически несовместим в одном шприце с другими препаратами.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью препарат назначают при абсансе (petit mal) или синдроме Леннокса-Гасто (при в/в введении может спровоцировать развитие тонического эпилептического статуса); эпилепсии или эпилептических припадках в анамнезе (начало лечения диазепамом или его резкая отмена могут ускорять развитие припадков или эпилептического статуса), при печеночной и/или почечной недостаточности, церебральной и спинальной атаксии, гиперкинезе, склонности к злоупотреблению психотропными препаратами, при органических заболеваниях головного мозга (возможны парадоксальные реакции), гипопротеинемии, лицам пожилого возраста, при депрессии.

Требуется соблюдение особой осторожности при назначении диазепама при тяжелых депрессиях, т.к. препарат может быть использован для реализации суицидальных намерений.

В/в раствор диазепама необходимо вводить медленно, в крупную вену, по крайней мере в течение 1 мин на каждые 5 мг (1 мл) препарата. Не рекомендуется проводить непрерывные в/в инфузии, т.к. возможны образование осадка и адсорбция препарата поливинилхлоридными материалами инфузионных баллонов и трубок.

Препарат не рекомендуется назначать длительно.

Риск формирования лекарственной зависимости возрастает при использовании препарата в высоких дозах, значительной длительности лечения, у пациентов, ранее злоупотреблявших алкоголем или лекарственными средствами.

Недопустимо резкое прекращение лечения из-за риска возникновения синдрома отмены.

При возникновении у больных таких необычных реакций, как повышенная агрессивность, психомоторное возбуждение, тревога, чувство страха, мысли о самоубийстве, галлюцинации, усиление мышечных судорог, нарушение засыпания, поверхностный сон, препарат следует отменить.

Начало лечения диазепамом или его резкая отмена у больных эпилепсией или с эпилептическими припадками в анамнезе могут ускорять развитие припадков или эпилептического статуса.

Пожилым пациентам Седуксен следует назначать с особой осторожностью и не следует превышать рекомендуемые дозы.

При назначении препарата пациентам с нарушениями функции почек и печени следует тщательно оценить соотношение риска и пользы терапии.

Противопоказано введение Седуксена в артериальное русло из-за возможного развития гангрены.

Во время лечения Седуксеном запрещено употребление алкоголя.

Контроль лабораторных показателей

При почечной/печеночной недостаточности или при проведении длительной терапии необходим контроль картины периферической крови и активности печеночных ферментов.

Использование в педиатрии

Дети, особенно в младшем возрасте, очень чувствительны к угнетающему ЦНС действию бензодиазепинов.

Новорожденным не рекомендуется назначать препараты, содержащие бензиловый спирт, т.к. возможно развитие токсического синдрома, проявляющегося метаболическим ацидозом, угнетением ЦНС, затруднением дыхания, почечной недостаточностью, гипотензией и, возможно, эпилептическими припадками, а также внутричерепным кровоизлиянием.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

На фоне применения Седуксена пациентам не рекомендуется заниматься потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При назначении препарата пациентам с нарушениями функции почек следует тщательно оценить соотношение риска и пользы терапии.

При нарушениях функции печени

При назначении препарата пациентам с нарушениями функции печени следует тщательно оценить соотношение риска и пользы терапии.

Применение в пожилом возрасте

Препарат с осторожностью назначают пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказание - детский возраст до 30 дней включительно.

Дети, особенно в младшем возрасте, очень чувствительны к угнетающему ЦНС действию бензодиазепинов.

Новорожденным не рекомендуется назначать препараты, содержащие бензиловый спирт, т.к. возможно развитие токсического синдрома, проявляющегося метаболическим ацидозом, угнетением ЦНС, затруднением дыхания, почечной недостаточностью, гипотензией и, возможно, эпилептическими припадками, а также внутричерепным кровоизлиянием.

Условия хранения:

Препарат относится к списку №1 сильнодействующих веществ Постоянного комитета по контролю наркотиков МЗ РФ.

Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре от 8° до 15°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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