Транквезипам



Код АТХ:

- N05BX

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Бромдигидрохлорфенилбензодиазепин

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Анксиолитическое средство (транквилизатор) бензодиазепинового ряда. Оказывает анксиолитическое, седативно-снотворное, противосудорожное и центральное миорелаксирующее действие.

Усиливает ингибирующее действие GABA на передачу нервных импульсов. 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 полисинаптические спинальные рефлексы.

Анксиолитическое действие обусловлено влиянием на миндалевидный комплекс лимбической системы и проявляется в уменьшении эмоционального напряжения, ослаблении тревоги, страха, беспокойства.

Седативный эффект обусловлен влиянием на ретикулярную формацию ствола головного мозга и неспецифические ядра таламуса и проявляется уменьшением симптоматики невротического происхождения (тревоги, страха).

На продуктивную симптоматику психотического генеза (острые бредовые, галлюцинаторные, аффективные расстройства) практически не влияет, редко наблюдается уменьшение аффективной напряженности, бредовых расстройств.

Снотворное действие сопряжено с угнетением клеток ретикулярной формации ствола головного мозга. Уменьшает воздействие эмоциональных, вегетативных и моторных раздражителей, нарушающих механизм засыпания.

Противосудорожное действие реализуется путем усиления пресинаптического торможения, подавляет распространение судорожного импульса, но не снимается возбужденное состояние очага. Центральное миорелаксирующее действие обусловлено торможением полисинаптических спинальных афферентных тормозящих

путей (в меньшей степени и моносинаптических). Возможно и прямое торможение двигательных нервов и функции мышц.

Фармакокинетика

После приема внутрь хорошо всасывается из ЖКТ, T_{max} - 1-2 ч. Метаболизируется в печени. $T_{1/2}$ - 6-10-18 ч. Выводится в основном почками в виде метаболитов.

Показания к применению:

Невротические, неврозоподобные, психопатические и психопатоподобные и др. состояния (раздражительность, тревожность, нервное напряжение, эмоциональная лабильность), реактивные психозы и сенесто-ипохондрические расстройства (в т.ч. резистентные к действию других анксиолитических средств (транквилизаторов), навязчивость, бессонница, абстинентный синдром (алкоголизм, токсикомания), эпилептический статус, эпилептические припадки (различной этиологии), височная и миоклоническая эпилепсия.

В экстремальных условиях - как средство, облегчающее преодоление чувства страха и эмоционального напряжения.

В качестве антипсихотического средства - шизофрения с повышенной чувствительностью к антипсихотическим препаратам (в т.ч. фебрильная форма).

В неврологической практике - ригидность мышц, атетоз, гиперкинезы, тик, вегетативная лабильность (пароксизмы симпатоадреналового и смешанного характера).

В анестезиологии - премедикация (в качестве компонента вводной анестезии).

Относится к болезням:

- Абстинентный синдром
- Алкоголизм
- Анестезия
- Бессонница
- Ипохондрия
- Неврит
- Неврозы
- Пароксизм
- Токсикоз
- Шизофрения
- Эпилепсия

Противопоказания:

Кома, шок, миастения, закрытоугольная глаукома (острый приступ или предрасположенность), острые отравления алкоголем (с ослаблением жизненно важных функций), наркотическими анальгетиками и снотворными средствами, тяжелая ХОБЛ (возможно усиление дыхательной недостаточности), острая дыхательная недостаточность, тяжелая депрессия (могут проявляться суицидальные наклонности); I триместр беременности, период лактации, детский и подростковый возраст до 18 лет (безопасность и эффективность не определены), повышенная чувствительность (в т.ч. к другим бензодиазепинам).

Способ применения и дозы:

В/м или в/в (струйно или капельно): для быстрого купирования страха, тревоги, психомоторного возбуждения, а также при вегетативных пароксизмах и психотических состояниях, начальная доза - 0.5-1 мг, средняя суточная доза - 3-5 мг, в тяжелых случаях - до 7-9 мг.

Внутрь: при нарушениях сна - 250-500 мкг за 20-30 мин до сна. Для лечения невротических, психопатических, неврозоподобных и психопатоподобных состояний начальная доза - 0.5-1 мг 2-3 раза в день. Через 2-4 дня с учетом эффективности и переносимости доза может быть увеличена до 4-6 мг/сут. При выраженной ажитации, страхе, тревоге лечение начинают с дозы 3 мг/сут, быстро наращивая дозу до получения терапевтического эффекта. При лечении эпилепсии - 2-10 мг/сут.

Для лечения алкогольной абстиненции - внутрь, по 2-5 мг/сут или в/м, по 500 мкг 1-2 раза/сут, при вегетативных пароксизмах - в/м, 0.5-1 мг. Средняя суточная доза - 1.5-5 мг, ее разделяют на 2-3 приема, обычно по 0.5-1 мг утром и днем и до 2.5 мг на ночь. В неврологической практике при заболеваниях с мышечным гипертонусом назначают по 2-3 мг 1-2 раза/сут. Максимальная суточная доза - 10 мг.

Во избежание развития лекарственной зависимости при курсовом лечении продолжительность применения феназепама составляет 2 нед (в отдельных случаях длительность лечения может быть увеличена до 2 мес). При отмене феназепама дозу уменьшают постепенно.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: в начале лечения (особенно у пожилых больных) - сонливость, чувство усталости, головокружение, снижение способности к концентрации внимания, атаксия, дезориентация, неустойчивость походки, замедление психических и двигательных реакций, спутанность сознания; редко - головная боль, эйфория, депрессия, тремор, снижение памяти, нарушения координации движений (особенно при высоких дозах), подавленность настроения, дистонические экстрапирамидные реакции (неконтролируемые движения, в т.ч. глаз), астения, миастения, дизартрия, эпилептические припадки (у больных эпилепсией); крайне редко - парадоксальные реакции (агрессивные вспышки, психомоторное возбуждение, страх, суицидальная наклонность, мышечный спазм, галлюцинации, возбуждение, раздражительность, тревожность, бессонница).

Со стороны органов кроветворения: лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз (озноб, гипертермия, боль в горле, чрезмерная утомляемость или слабость), анемия, тромбоцитопения.

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

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

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

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

Прочие: привыкание, лекарственная зависимость; снижение АД; редко - нарушение зрения (диплопия), снижение массы тела, тахикардия.

При резком снижении дозы или прекращении приема - синдром отмены (раздражительность, нервозность, 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, редко - острый психоз).

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности применение возможно только по жизненным показаниям. Оказывает токсическое действие на плод и повышает развития врожденных пороков при применении в I триместре беременности. Прием в терапевтических дозах в более поздние сроки беременности может вызвать угнетение ЦНС у новорожденного. Постоянное применение во время беременности может приводить к физической зависимости с развитием синдрома отмены у новорожденного. Дети, особенно в младшем возрасте, очень чувствительны к угнетающему ЦНС действию бензодиазепинов.

Применение непосредственно перед родами или во время родов может вызывать у новорожденного угнетение дыхания, снижение мышечного тонуса, гипотонию, гипотермию и слабый акт сосания (синдром "вялого ребенка").

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении феназепам снижает эффективность леводопы у больных паркинсонизмом.

Феназепам может повышать токсичность зидовудина.

Отмечается взаимное усиление эффекта при одновременном применении антипсихотических, противоэпилептических или снотворных средств, а также центральных миорелаксантов, наркотических анальгетиков, этанола.

Ингибиторы микросомального окисления повышают риск развития токсических эффектов. Индукторы микросомальных ферментов печени уменьшают эффективность.

Повышает концентрацию имипрамина в сыворотке крови.

При одновременном применении с антигипертензивными средства возможно усиление антигипертензивного действия. На фоне одновременного назначения клозапина возможно усиление угнетения дыхания.

Особые указания и меры предосторожности:

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

При почечной и/или печеночной недостаточности и длительном лечении необходимо контролировать картину периферической крови и активность печеночных ферментов.

У пациентов, не принимавших ранее психоактивные лекарственные средства, наблюдается терапевтический ответ на применение феназепама в более низких дозах, по сравнению с больными, принимавшими антидепрессанты, анксиолитики или страдающими алкоголизмом.

Подобно другим бензодиазепинам, обладает способностью вызывать лекарственную зависимость при длительном приеме в больших дозах (более 4 мг/сут). При внезапном прекращении приема может отмечаться синдром отмены (в т.ч. депрессия, раздражительность, бессонница, повышенное потоотделение), особенно при длительном приеме (более 8-12 нед.). При возникновении у пациентов таких необычных реакций, как повышенная агрессивность, острые состояния возбуждения, чувство страха, мысли о самоубийстве, галлюцинации, усиление мышечных судорог, затруднение засыпания, поверхностный сон, лечение следует прекратить.

В процессе лечения пациентам категорически запрещается употребление этанола.

Эффективность и безопасность применения препарата у пациентов моложе 18 лет не установлена.

При передозировке возможны выраженная сонливость, длительная спутанность сознания, снижение рефлексов, длительная дизартрия, нистагм, тремор, брадикардия, одышка или затрудненное дыхание, снижение АД, кома. Рекомендуются промывание желудка, прием активированного угля; симптоматическая терапия (поддержание дыхания и АД), введение флумазенила (в условиях стационара); гемодиализ малоэффективен.

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

С осторожностью применять при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применять при печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет (безопасность и эффективность не определены).

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