Золомакс



Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Анксиолитическое средство (транквилизатор), производное триазоло-бензодиазепина. Оказывает анксиолитическое, седативное, снотворное, противосудорожное, центральное миорелаксирующее действие. Механизм действия заключается в усилении тормозного влияния эндогенной GABA в ЦНС за счет повышения чувствительности GABA-рецепторов к медиатору в результате стимуляции бензодиазепиновых рецепторов, расположенных 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.

Выраженная анксиолитическая активность (уменьшение эмоционального напряжения, ослабление тревоги, страха, беспокойства) сочетается с умеренно выраженным 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 алпразолам быстро и полностью абсорбируется из ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается в пределах 1-2 ч.

Связывание с белками плазмы крови составляет 80%.

Метаболизируется в печени.

$T_{1/2}$ составляет в среднем 12-15 ч. Алпразолам и его метаболиты выводятся главным образом почками.

Показания к применению:

Тревожные состояния, неврозы, сопровождающиеся чувством тревоги, опасности, беспокойства, напряжения, ухудшением сна, раздражительностью, а также соматическими нарушениями; смешанные тревожно-депрессивные состояния; невротические реактивно-депрессивные состояния, сопровождающиеся снижением настроения, потерей интереса к окружающему, беспокойством, потерей сна, снижением аппетита, соматическими нарушениями; тревожные состояния и невротические депрессии, развившиеся на фоне соматических заболеваний; панические расстройства в сочетании и без симптомов фобии.

Относится к болезням:

- Депрессия
- Неврит
- Неврозы
- Паническое расстройство
- Тревожные состояния

Противопоказания:

Кома, шок, миастения, закрытоугольная глаукома (острый приступ или предрасположенность), острые отравления алкоголем (с ослаблением жизненно важных функций), опиоидными анальгетиками, снотворными и психотропными средствами, хронические обструктивные заболевания дыхательных путей с начальными проявлениями дыхательной недостаточности, острая дыхательная недостаточность, тяжелая депрессия (могут проявляться суицидальные наклонности), беременность (особенно I триместр), период лактации, детский и подростковый возраст до 18 лет, повышенная чувствительность к бензодиазепинам.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный. Рекомендуется использовать минимальные эффективные дозы. Дозу корригируют в процессе лечения в зависимости от достигнутого эффекта и переносимости. При необходимости повышения дозы ее следует увеличивать постепенно, вначале в вечерний, а затем в дневной прием.

Начальная доза составляет 250-500 мкг 3 раза/сут, при необходимости возможно постепенное увеличение до 4.5 мг/сут.

Для пожилых или ослабленных пациентов начальная доза составляет по 250 мкг 2-3 раза/сут, поддерживающие дозы - 500-750 мкг/сут, при необходимости с учетом переносимости дозу можно увеличивать.

Отмену или снижение дозы алпразолама следует проводить постепенно, снижая суточную дозу не более чем на 500 мкг каждые 3 дня; иногда может потребоваться еще более медленная отмена.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: в начале лечения (особенно у пациентов пожилого возраста) сонливость, чувство усталости, головокружение, снижение способности к концентрации внимания, атаксия, дезориентация, неустойчивость походки, замедление психических и двигательных реакций; редко - головная боль, эйфория, депрессия, тремор, снижение памяти, нарушения координации движений, подавленность настроения, спутанность сознания, дистонические экстрапирамидные реакции (неконтролируемые движения, в т.ч. глаз), слабость, миастения, дизартрия; в отдельных случаях - парадоксальные реакции (агрессивные вспышки, спутанность сознания, психомоторное возбуждение, страх, суицидальная наклонность, мышечный спазм, галлюцинации, возбуждение, раздражительность, тревожность, бессонница).

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

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

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

Со стороны эндокринной системы: возможны изменение массы тела, нарушения либидо, нарушения менструального цикла.

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

Аллергические реакции: возможны кожная сыпь, зуд.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Алпразолам оказывает токсическое действие на плод и повышает риск развития врожденных пороков при применении в I триместре беременности. Постоянное применение во время 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 сосания новорожденного).

Возможно выделение бензодиазепинов с грудным молоком, что может вызвать у новорожденного сонливость и затруднять кормление.

В *экспериментальных исследованиях* показано, что алпразолам и его метаболиты выделяются с грудным молоком.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении психотропных, противосудорожных, средств и этанола наблюдается усиление угнетающего действия алпразолама на ЦНС.

При одновременном применении блокаторы гистаминовых H_2-рецепторов уменьшают клиренс алпразолама и усиливают угнетающее действие алпразолама на ЦНС; антибиотики из группы макролидов - уменьшают клиренс алпразолама.

При одновременном применении гормональные контрацептивы для приема внутрь увеличивают $T_{1/2}$ алпразолама.

При одновременном применении алпразолама с декстропропоксифеном наблюдается более выраженное угнетение ЦНС, чем в комбинации с другими бензодиазепинами, т.к. возможно повышение концентрации алпразолама в плазме крови.

Одновременный прием дигоксина увеличивает риск развития интоксикации сердечными гликозидами.

Алпразолам повышает концентрацию имипрамина в плазме крови.

При одновременном применении итраконазол, кетоконазол усиливают эффекты алпразолама.

При одновременном применении пароксетина возможно усиление эффектов алпразолама, обусловленное угнетением его метаболизма.

Флувоксамин повышает концентрацию алпразолама в плазме крови и риск развития его побочных эффектов.

При одновременном применении флуоксетина возможно повышение концентрации алпразолама в плазме крови вследствие уменьшения его метаболизма и клиренса под влиянием флуоксетина, что сопровождается психомоторными нарушениями.

Нельзя исключить возможность усиления действия алпразолама при одновременном применении с эритромицином.

Особые указания и меры предосторожности:

При эндогенных депрессиях алпразолам можно применять в комбинации с антидепрессантами. При применении алпразолама у пациентов с депрессией отмечены случаи развития гипоманиакального и маниакального состояния.

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

У пациентов, ранее не принимавших лекарственные средства, влияющие на ЦНС, алпразолам эффективен в более низких дозах, по сравнению с больными, которые получали антидепрессанты, анксиолитики или страдающими хроническим алкоголизмом.

При длительном применении в высоких дозах возможно развитие привыкания и формирование лекарственной зависимости, особенно у пациентов, склонных к злоупотреблению лекарственными средствами.

При быстром снижении дозы или резкой отмене алпразолама наблюдается синдром отмены, симптомы которого могут колебаться от небольшой дисфории и бессонницы до тяжелого синдрома со спазмами в животе и скелетных мышцах, рвотой, усилением потоотделения, тремором и судорогами. Синдром отмены чаще встречается у лиц, длительно (более 8-12 нед.) получавших алпразолам.

Не следует применять одновременно с алпразоламом другие транквилизаторы.

Безопасность применения алпразолама у детей и подростков в возрасте до 18 лет не установлена. Дети, особенно в младшем возрасте, очень чувствительны к угнетающему действию бензодиазепинов на ЦНС.

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 (вождение транспортных средств или работа с механизмами).

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять алпразолам у пациентов с нарушениями функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять алпразолам у пациентов с нарушениями функции печени.

Применение в пожилом возрасте

Для пожилых или ослабленных пациентов начальная доза составляет по 250 мкг 2-3 раза/сут, поддерживающие дозы - 500-750 мкг/сут, при необходимости с учетом переносимости дозу можно увеличивать.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 18 лет.

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