

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

НИТРАЗЕПАМ

(информация для специалистов)

Регистрационный номер ЛСР-005757/08

Торговое название препарата: Нитразепам

Международное непатентованное название - Нитразепам

Лекарственная форма: таблетки

Состав на одну таблетку.

Действующее вещество:

Нитразепам - 5,0 мг

Вспомогательные вещества:

лактозы моногидрат - 70,0 мг,

крахмал картофельный - 21,7 мг,

повидон - 0,8 мг,

(поливинилпирролидон

низкомолекулярный медицинский)

магния стеарат -1,0 мг,

тальк - 0,5 мг,

карбоксиметилкрахмал натрия -1,0 мг.

(примогель)

Описание: Таблетки круглые двояковыпуклой формы с риской, белого или белого с желтоватым или желтовато-зеленоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа: снотворное средство.

Психотропное вещество, внесенное в список III «Перечня наркотических средств, психотропных веществ и их прекурсоров, подлежащих контролю в Российской Федерации».

Код АТХ N05CD02

Фармакологические свойства

Снотворное средство из группы бензодиазепинов оказывает угнетающее действие на нервную систему (ЦНС), реализующееся преимущественно в таламусе, гипоталамусе и лимбической системе. Усиливает ингибирующее действие гамма-аминомасляной кислоты (ГАМК), являющейся одним из основных медиаторов пре- и постсинаптического торможения передачи импульсов в ЦНС.

Препарат обладает также анксиолитическим, седативным, миорелаксантным, и противосудорожным действием. Снотворное действие наступает через 20-40 минут после приема препарата и длится 6-8 часов. Под влиянием препарата увеличивается глубина и продолжительность сна. Сон и пробуждение протекают физиологически.

Препарат хорошо проходит через гематоэнцефалический барьер, плаценту, проникает в грудное молоко, что необходимо учитывать при назначении препарата беременным и кормящим грудью женщинам.

Фармакокинетика

Абсорбция из ЖКТ - быстрая и полная. Биодоступность - от 54 % до 98 % (в зависимости от лекарственной формы). При приеме одновременно с пищей всасывание замедляется и максимальная концентрация в плазме уменьшается примерно на 30 %. При однократном пероральном приеме 10 мг нитразепама среднее значение максимальной концентрации составляет 0,08-0,1 мкг/мл и достигается через 1-4 часа. Связь с белками плазмы - около 85-90 %. Фаза распределения активного вещества в организме очень сильно варьирует и составляет от 1,7 до 3,5 ч. Объем распределения увеличивается с возрастом больных и составляет 1,3-2,6 л/кг. Хорошо проникает через гистогематические барьеры, включая ГЭБ и плацентарный барьер, обнаруживается в молоке матери.

Метаболизируется в печени путем восстановления нитрогруппы и последующего ацетилирования с образованием неактивных ацетилпроизводных. Период полувыведения -16-48 ч (зависит от возраста и массы тела больных) из спинномозговой жидкости - 68 ч. Основные метаболиты - 7-амино-нитразепам, 7-ацетамино-нитразепам, 2-амино-5-нитробензофенон и гидрокси-2-амино-5-нитробензофенон, выводятся почками (65-71 %) и с каловыми массами (14-20 %). Около 1-5 % выводится в неизменном виде почками.

Накопление при повторном назначении - минимальное (относится к бензодиазепинам с коротким или средним периодом полувыведения), выведение после прекращения лечения - быстрое.

Показания к применению

- нарушение сна различного генеза (трудность засыпания, частые ночные и/или ранние утренние пробуждения);
- некоторые формы судорожных припадков (особенно у детей), в т. ч. синдром Веста.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к бензодиазепинам;
- кома, шок;
- закрытоугольная глаукома (острый приступ или предрасположенность);

- острая алкогольная интоксикация с ослаблением жизненно важных функций;
- острые интоксикации лекарственными средствами, оказывающими угнетающее действие на центральную нервную систему;
- наркомания;
- тяжелая депрессия (могут отмечаться суицидальные наклонности);
- миастения;
- лекарственная или алкогольная зависимость;
- беременность, кормление грудью;
- острая дыхательная недостаточность;
- гиперкапния;
- нарушение глотания у детей;
- височная эпилепсия;
- тяжелые хронические обструктивные заболевания легких (риск прогрессирования степени дыхательной недостаточности)

С осторожностью

- печеночная и/или почечная недостаточность, дыхательная недостаточность, церебральные и спинальные атаксии, гиперкинезы, лекарственная зависимость в анамнезе, склонность к злоупотреблению психоактивными лекарственными средствами, органические заболевания головного мозга, психоз (возможны парадоксальные реакции), гипопротеинемия, ночное апное (установленное или предполагаемое), пожилой возраст.

Способ применения и дозы

Внутрь. В качестве снотворного за 30 минут до сна:

- взрослым 2,5-5 мг нитразепама, максимальная суточная доза -10 мг;
- больным пожилого возраста, а также ослабленным больным - 2,5 мг, максимальная суточная доза - 5 мг.

Для лечения синдрома Веста суточная доза для детей 1-2 лет и детей грудного возраста - 2,5-5 мг. Суточная доза принимается однократно, при назначении детям грудного возраста, соответствующее количество препарата измельчается и растворяется (суспенсируется) в удобном для приема объеме воды.

Побочное действие

Со стороны нервной системы: в начале лечения (особенно у пожилых больных) - сонливость, чувство усталости, головокружение, снижение концентрации внимания, атаксия, вялость, притупление эмоций, замедление психических и двигательных реакций; редко - головная боль, эйфория, депрессия, тремор, каталепсия, антероградная амнезия, спутанность сознания,

дистонические экстрапирамидные реакции (неконтролируемые движения тела, включая глаза), мышечная слабость, дизартрия, смазанность речи; крайне редко - парадоксальные реакции (агрессивные вспышки, страх, суицидальная наклонность, мышечный спазм, галлюцинации, психомоторное возбуждение, повышенная раздражительность, тревога, бессонница).

Со стороны органов кроветворения: лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз (озноб, гипертермия, боль в горле, необычная усталость или слабость), анемия, тромбоцитопения. Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту или слюнотечение, изжога, тошнота, рвота, снижение или повышение аппетита, запор или диарея; нарушения функции печени, повышение активности «печеночных» трансаминаз и щелочной фосфатазы, желтуха. Со стороны мочеполовой системы: недержание мочи, задержка мочи, нарушение функции почек, повышение или снижение либидо, дисменорея. Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд. Влияние на плод: угнетение центральной нервной системы, нарушение дыхания и подавление сосательного рефлекса у новорожденных, матери которых применяли препарат во время беременности.

Прочие: привыкание, лекарственная зависимость; снижение артериального давления; редко - угнетение дыхательного центра, нарушение зрения (диплопия), булимия, снижение массы тела, тахикардия. При резком снижении дозы или прекращении приема - синдром «отмены» (повышенная раздражительность, головная боль, тревога, психомоторное возбуждение, страх, нарушение сна, дисфория, спазм гладких мышц внутренних органов и скелетной мускулатуры, деперсонализация, усиление потоотделения, депрессия, тошнота, рвота, тремор, расстройства восприятия, в т. ч. гипераккузия, гиперестезия, парестезия, светобоязнь, тахикардия, судороги, галлюцинации, редко - острый психоз).

Передозировка

Симптомы: сонливость, угнетение сознания различной степени тяжести (вплоть до комы), парадоксальное возбуждение, снижение рефлексов, сниженная реакция на болевые раздражения, глубокий сон, дизартрия, атаксия, нарушение зрения (нистагм), тремор, брадикардия, одышка или затрудненное дыхание, выраженная слабость, снижение артериального давления, коллапс, угнетение сердечной и дыхательной деятельности. Лечение: промывание желудка, форсированный диурез, прием активированного угля. Симптоматическая терапия (поддержание дыхания и артериального давления). В качестве специфического антагониста используют флумазенил (в условиях стационара). Гемодиализ - малоэффективен.

Взаимодействие

Снижает эффективность леводопы у больных паркинсонизмом.

Взаимное усиление действия при сочетании с психотропными средствами, препаратами лития, наркотическими анальгетиками, общими анестетиками, алкоголем, миорелаксантами, антигистаминными и седативными препаратами, кпонидином, барбитуратами и анксиолитическими средствами (транквилизаторами).

Эффект усиливается и удлиняется циметидином, пероральными эстрогенсодержащими контрацептивами (задержка выведения и удлинение периода полувыведения).

Ингибиторы микросомального окисления удлиняют период полувыведения, повышают риск развития токсических эффектов препарата.

Индукторы микросомальных ферментов печени уменьшают эффективность нитразепама.

Наркотические анальгетики усиливают эйфорию, приводя к нарастанию лекарственной зависимости.

Гипотензивные средства могут усиливать выраженность снижения артериального давления.

На фоне одновременного назначения клозапина возможно усиление угнетения дыхания.

Может повышать токсичность зидовудина.

Вальпроевая кислота, вероятно, усиливает влияние нитразепама у детей, больных эпилепсией.

Особые указания

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

В период лечения необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

В процессе лечения больным категорически запрещается употребление алкоголя.

Без особых указаний не следует применять длительно.

Если до начала лечения нитразепамом, больной длительное время проходил терапию другими лекарственными средствами, то лечение начинают с осторожностью.

При почечной/печеночной недостаточности и длительном лечении необходим контроль картины периферической крови и «печеночных» ферментов.

Риск формирования лекарственной зависимости возрастает при использовании больших доз, значительной длительности лечения, у пациентов, ранее злоупотреблявших алкоголем или лекарственными препаратами.

Нитразепам обладает первичным потенциалом, вызывающим зависимость.

Уже при ежедневном приеме его в течение нескольких недель возникает опасность развития физической и психической зависимости. Этот эффект развивается не только при злоупотреблении нитразепамом, особенно высокими дозами, но и при применении его в

обычных терапевтических дозах. Поэтому лечение продолжают проводить только по жизненным показаниям после тщательного взвешивания пользы терапии с риском развития привыкания к препарату и зависимости от него.

Отмену препарата следует проводить постепенно во избежание синдрома «отмены».

При возникновении у больных таких необычных реакций, как агрессивность, психомоторное возбуждение, страх, мысли о самоубийстве, галлюцинации, усиление мышечных судорог, затрудненное засыпание, поверхностный сон, лечение нитразепамом следует прекратить.

Если, несмотря на то, что препарат противопоказан во время беременности, он часто применялся - возможно развитие физической зависимости (синдром «отмены») у новорожденного.

Использование непосредственно перед родами или во время родов может вызывать у новорожденного угнетение дыхания, снижение мышечного тонуса, снижение артериального давления, гипотермию и слабый акт сосания («синдром вялого ребенка»).

У детей раннего возраста отмечается повышенная продукция слизи и мокроты в дыхательных путях, поэтому следует принять меры по обеспечению хорошей проходимости дыхательных путей (учитывая угнетающее действие препарата).

Форма выпуска

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке. По 1, 2 или 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению в картонной пачке.

Условия хранения

В соответствии с правилами хранения психотропных веществ, внесенных в список III «Перечня наркотических средств, психотропных веществ и их прекурсоров, подлежащих контролю в Российской Федерации».

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

3 года. Не применять по истечении срока, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения/организация, принимающая претензии

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод», 109052, Россия, г. Москва, ул. Новохохловская, д. 25.

Тел./факс (495) 678-00-50/911-42-10.

<http://www.endopharm.ru>.

Наименование, адрес производителя лекарственного препарата и адрес места производства лекарственного препарата

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод»,
109052, Россия, г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25, стр. 1, стр. 2.