

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Тофизопам

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Тофизопам

Международное непатентованное или группировочное наименование: тофизопам

Лекарственная форма: таблетки

Состав

1 таблетка содержит:

действующее вещество: тофизопам – 50,00 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал картофельный, целлюлоза микрокристаллическая 101, желатин, кросповидон, стеариновая кислота, натрия стеарилфумарат.

Описание

Таблетки от белого до серовато-белого или почти белого с желтоватым оттенком цвета, круглые, плоскоцилиндрические, с фаской, риской с одной стороны. Допускаются вкрапления серого и желтого цвета, мраморность.

Фармакотерапевтическая группа: психолептики; анксиолитические средства; производные бензодиазепина.

Код АТХ: N05BA23.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Тофизопам является мягким анксиолитиком с кратковременным действием и широким терапевтическим индексом. Точный механизм действия неизвестен. Как по химической структуре, так и по клинико-фармакологическому эффекту тофизопам отличается от других 1,4-бензодиазепинов.

Препарат эффективен при лечении тревожных расстройств, в том числе сопровождающихся вегетативными проявлениями, усталостью, апатией. В отличие от других бензодиазепинов, тофизопам не обладает седативным, снотворным, миорелаксирующим и противосудорожным действием. Препарат не оказывает неблагоприятного действия на память, психомоторную и когнитивную функцию, но обладает умеренной стимулирующей активностью.

Вследствие отсутствия миорелаксирующего эффекта препарат может применяться и у пациентов с миопатией, миастенией и нейрогенными атрофиями мышц, при которых

применение миорелаксантов противопоказано или нежелательно. При длительном применении тофизопам не вызывает развитие физической или психической зависимости.

Фармакокинетика

Абсорбция

При приеме внутрь быстро и почти полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). Максимальная концентрация в крови (С_{max}) достигается в течение 1-1,5 часов.

Распределение

Около 50 % тофизопама связывается с белками крови.

Биотрансформация

После всасывания тофизопам подвергается значительному пресистемному метаболизму в печени. Основным метаболическим путем является деметилирование.

Элиминация

Выводится главным образом почками (около 60 %) и в форме метаболитов через кишечник. Период полувыведения (Т_{1/2}) составляет 6-8 часов.

Показания к применению

Лечение психических (невротических) и психосоматических расстройств, сопровождающихся эмоциональным напряжением, беспокойством, вегетативными расстройствами, апатией, усталостью и подавленным настроением.

Алкогольный абстинентный синдром.

Противопоказания

- гиперчувствительность к тофизопаму, другим производным группы бензодиазепина, а также другим компонентам препарата;
- детский возраст до 18 лет;
- беременность;
- период грудного вскармливания;
- состояния, сопровождающиеся выраженным психомоторным возбуждением, агрессией или выраженной депрессией;
- декомпенсированная дыхательная недостаточность;
- синдром обструктивного апноэ;
- кома;
- одновременное применение с такролимусом, сиролимусом, циклоспорином;
- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (препарат содержит лактозы моногидрат).

С осторожностью

Не декомпенсированная хроническая дыхательная недостаточность, острая дыхательная

недостаточность в анамнезе, закрытоугольная глаукома, эпилепсия, органические поражения головного мозга (например, атеросклероз).

Пожилые пациенты и пациенты с нарушением функции печени или почек. Совместное применение с опиоидами.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата во время беременности и в период грудного вскармливания противопоказано.

Способ применения и дозы

Способ применения

Для приема внутрь.

Обычно рекомендуемая доза: 1-2 таблетки от 1 до 3 раз в день (общая суточная доза от 50 до 300 мг).

При нерегулярном применении можно принять 1-2 таблетки.

Максимальная доза составляет 300 мг.

Постепенное повышение дозы обычно не требуется – лечение можно начинать с необходимой дозы, т.к. препарат хорошо переносим и во время его приема обычно не наблюдается уменьшение активности и психического бодрствования.

Особые группы пациентов

Информация об особых группах пациентов отсутствует. Клинических исследований, изучающих эффективность и безопасность тофизопама у пожилых, у пациентов с почечной и печеночной недостаточностью не проводилось.

Дети

Применение у детей и подростков до 18 лет противопоказано. Отсутствует опыт применения препарата у детей и подростков до 18 лет.

Побочное действие

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: снижение аппетита, запор, повышенное отделение газов, тошнота, сухость во рту. В отдельных случаях возможна застойная желтуха.

Нарушения со стороны центральной нервной системы: могут наблюдаться головная боль, бессонница, повышенная раздражимость, возбуждение, психомоторное возбуждение, спутанность сознания, могут возникать судорожные припадки у больных эпилепсией.

Нарушения со стороны иммунной системы: экзантема, скарлатиноподобная экзантема, зуд.

Нарушения со стороны опорно-двигательного аппарата: напряжение мышц, боль в мышцах.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: угнетение дыхания.

Передозировка

Симптомы: эффекты подавления функции центральной нервной системы (ЦНС) проявляются только после приема высоких доз (50-120 мг/кг веса тела). Такие дозы могут вызвать рвоту, спутанное сознание, кому, угнетение дыхания и/или эпилептические припадки.

Лечение: при выраженном подавлении функций ЦНС не рекомендуется вызывать рвоту. Промыть желудок. Введение активированного угля помогает уменьшить всасывание препарата. Следует постоянно следить за основными физиологическими параметрами и применять соответствующую симптоматическую терапию. При угнетении дыхания можно проводить искусственную вентиляцию легких. Введение стимуляторов ЦНС не рекомендуется. Гипотензию лучше всего устранять в/в введением жидкостей и переводом пациента в положение Тренделенбурга. Если эти меры не восстанавливают нормальное артериальное давление (АД), можно ввести дофамин или норадреналин. Диализ и вызванный диурез не эффективны.

В качестве антагониста можно ввести Флумазенил, однако его применение при передозировке тофизопамом клинически не протестировано.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Концентрация в плазме крови препаратов, которые метаболизируются изоферментом CYP3A4, может увеличиться при одновременном приеме с тофизопамом, поэтому одновременное применение такролимуса, сиролимуса, циклоспорина и тофизопама противопоказано.

Применение тофизопама с препаратами, оказывающими угнетающее действие на ЦНС (анальгетики, средства общей анестезии, антидепрессанты, седативные, снотворные), H₁-гистаминовых рецепторов блокаторами, антипсихотическими, усиливает их эффекты (например, седативный эффект или угнетение дыхания).

Опиоиды. Совместное применение лекарственных средств с седативным действием, таких как бензодиазепины или подобные им препараты, такие как тофизопам, с опиоидами повышает риск седации, угнетения дыхания, комы и смертельного исхода в связи с аддитивным угнетающим эффектом этих препаратов на ЦНС. Дозы и продолжительность совместного применения таких препаратов должны быть ограничены.

Индукторы печеночных ферментов (алкоголь, никотин, барбитураты, противосудорожные средства) могут усилить метаболизм тофизопама, что может привести к снижению его концентрации в плазме крови и ослаблению терапевтического эффекта.

Некоторые противогрибковые препараты (кетоназол, итраконазол) могут замедлить печеночный метаболизм тофизопама, что приводит к увеличению его концентрации в плазме крови.

Некоторые гипотензивные препараты (клонидин, блокаторы «медленных» кальциевых каналов) могут усилить эффекты тофизопама. β-адреноблокаторы могут замедлить метаболизм препарата, однако этот эффект не имеет клинического значения.

Дигоксин: тофизолам может повысить концентрацию дигоксина в плазме крови.

Варфарин: бензодиазепины могут повлиять на антикоагулянтный эффект варфарина.

Дисульфирам: длительное применение дисульфирама может угнетать метаболизм тофизолама.

Антацидные средства по-разному влияют на всасывание тофизолама. Циметидин и омепразол угнетают метаболизм тофизолама.

Пероральные контрацептивные средства могут снижать интенсивность метаболизма тофизолама.

Алкоголь: тофизолам ослабляет угнетающее действие алкоголя на перцепцию.

Особые указания

- Необходима особая осторожность при лечении пациентов с компенсированной хронической дыхательной недостаточностью или ранее перенесших острую дыхательную недостаточность.
- Осторожность необходима при лечении пожилых пациентов и лиц с психической деградацией, а также имеющих нарушения функции почек и/или печени, т.к. у них чаще, чем у других пациентов, наблюдаются нежелательные реакции препарата.
- При сочетании препарата тофизолама с препаратами, подавляющими функцию ЦНС (антидепрессанты, седативные, снотворные, опиоидные анальгетики, средства общей анестезии), антигистаминными препаратами, антипсихотическими, алкоголем возможно усиление взаимных эффектов.
- Не рекомендуется применять препарат при хроническом психозе, фобии или навязчивых состояниях. При уменьшении торможения возрастает риск суицидальных попыток и агрессивного поведения. Поэтому тофизолам не рекомендуется в качестве монотерапии депрессии или депрессии, сопровождающейся тревогой.
- Необходима осторожность при лечении пациентов с расстройствами личности (психопатии).
- Препарат следует применять с повышенной осторожностью при органических поражениях головного мозга (например, при атеросклерозе).
- У пациентов с эпилепсией препарат тофизолама может провоцировать судорожные припадки.
- Не рекомендуется применять этот препарат пациентам с закрытоугольной глаукомой.

Риск при совместном применении с опиоидами

Совместное применение препарата тофизолама с опиоидами повышает риск седации, угнетения дыхания, комы и смертельного исхода. В связи с повышенным риском совместное применение седативных препаратов возможно лишь у пациентов, для которых невозможно применение альтернативных методов лечения. Если принято решение об одновременном назначении препарата тофизолама с другими седативными лекарственными средствами, следует использовать самые низкие эффективные дозы, а продолжительность лечения должна быть как можно короче. Таким пациентам необходим тщательный контроль симптомов угнетения

дыхания и седации. В связи с этим настоятельно рекомендуется ознакомить пациентов и ухаживающих за ними лиц (при наличии таковых) о симптомах угнетения дыхания и седации.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период применения препарата запрещено вождение транспортных средств и/или работа со сложными механизмами, требующими повышенной концентрации внимания.

Форма выпуска

Таблетки 50 мг.

По 10 таблеток в блистер из пленки ПВХ/ПВДХ или ПВХ/ПВДХ/ПВХ и фольги алюминиевой.

По 2 или 6 блистеров вместе с инструкцией по применению в пачку картонную.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке (в пачке) при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель/Организация, принимающая претензии потребителей

АО «Биоком», Россия

355016, Ставропольский край, г. Ставрополь, Чапаевский проезд, д. 54

Телефон: +7 (495) 646-28-68

e-mail: info@binnopharmgroup.ru