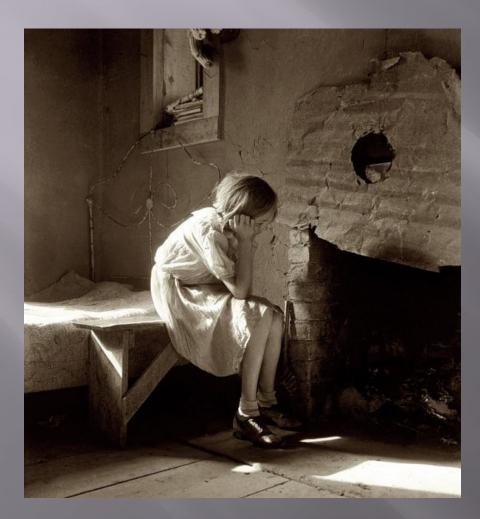
Ингибиторы нейронального захвата. Неизбирательные ингибиторы нейронального захвата.



КРИЦКАЯ А.О. ОП-309

Неизбирательные ингибиторы нейронального происхождения.

Трициклические антидепрессанты проявляют Мхолиноблокирующую и адреноблокирующую активность. Поэтому для этих препаратов характерны такие побочные эффекты, как нарушение аккомодации, сухость во рту, тахикардия, констипация, задержка мочеиспускания, снижение артериального давления.





- <u>Имизин</u>. Имипрамина гидрохлорид. Imipramine, Имизин,
 Мелипрамин, Antideprin, Surplix. Imizinum. Antideprin. Imipramini
 Hydrochloridum. Melipramin. Tofranil.
- N- (3-Диметиламинопропил) -иминодибензила гидрохлорид.
- Форма выпуска лекарства. Драже (таблетки) по 0,025 г, ампулы по 2 мл 1,25 % раствора.
- Применение и дозы препарата. Внутрь после еды; начинают с дозы 0,025 − 0,05 г, постепенно увеличивают ее до 0,1 − 0,15 г в сутки (в случае необходимости до 0,2 − 0,3 г). Внутримышечно по 2 мл 1,25 % раствора 1 − 2 раза в сутки (к 10-му дню лечения суточную дозу доводят до 6 мл 1,25 % раствора, затем ее постепенно уменьшают и переходят на пероральное введение). У пожилых лечение начинают с дозы 0,01 г, постепенно увеличивая ее до получения оптимального эффекта.
- <u>Высшие дозы внутрь</u> разовая 0,1 г, суточная 0,3 г; внутримышечно — разовая 0,05 г, суточная 0,2 г. Детям дают внутрь, начиная с 0,01 г один раз утром, постепенно в течение 10 дней дозу повышают: в возрасте 1 — 7 лет до 0,02 г, 8 — 14 лет до 0,02 — 0,05 г.

- <u>Действие лекарства.</u> Имизин относится к числу так называемых тимолептических, или эутимических, средств. Антидепрессивные свойства имизина связаны с нарушением обратного захвата, а следовательно, с увеличением содержания катехоламинов в центральных адренореактивных образованиях и повышением чувствительности этих образований к действию норадреналина; определенное значение имеет центральный холинолитическии эффект имизина.
- Показания к применению. Депрессия периодическая, депрессия реактивная, депрессивные состояния при шизофрении, депрессивные синдромы при различных психических заболеваниях (органические психозы, атеросклероз сосудов головного мозга, паркинсонизм), тетраэтилсвинцовые и алкогольные интоксикации и др. (наиболее выраженный лечебный эффект наблюдается при депрессивной форме маниакально-депрессивного психоза); ночное недержание мочи.

Меры предосторожности:

- 1. Во избежание синдрома отмены нельзя резко прерывать медикаментозную терапию, доза препарата должна снижаться постепенно в течение одной-двух недель.
- 2. Осторожно использовать у пациентов с заболеваниями сердечнососудистой системы, щитовидной железы, судорожными приступами в анамнезе, а также у больных, которым противопоказана чрезмерная стимуляция антихолинергической системы (при доброкачественной гипертрофии предстательной железы, задержке мочеиспускания в анамнезе, повышении ВГД). Лекарственное средство можно использовать при закрытоугольной форме глаукомы только при компенсированной форме заболевания и при постоянном контроле ВГД.
- 3. Противопоказан пациентам, принимающим ингибиторы МАО, и в течение двух недель после приема, пациентам, недавно перенесшим инфаркт миокарда, и больным с гиперчувствительностью к амитриптилину в анамнезе. Иногда встречается перекрестная чувствительность с другими трициклическими антидепрессантами.

- 4. Лекарственные формы препарата могут содержать сульфиты и/или тартразин, которые могут привести к развитию аллергических реакций.
- 5. Препарат может вызвать сонливость, поэтому он противопоказан лицам, работа которых связана с повышенной концентрацией внимания, координацией движении, повышенной опасностью (вождение автомобиля, работа с тяжелыми предметами и др.). Дневная сонливость может быть уменьшена путем снижения дозы препарата, более раннего вечернего приема или заменой на препарат с менее выражения м сонствии и оффектом.

- <u>Противопоказания.</u> Декомпенсация сердечно-сосудистой системы, стенокардия, пароксизмальная тахикардия, выраженный атеросклероз, болезни печени, почек, кроветворной системы, туберкулез легких в активной фазе, острые инфекционные заболевания, расстройства мозгового кровообращения, глаукома, гипертрофия простаты, пилоростеноз. С осторожностью следует назначать при эпилепсии лицам, находящимся в состоянии возбуждения, и лицам с тяжелой депрессией, с идеями самоубийства. Не назначают одновременно с ингибиторами моноамин-оксидазы или после их применения (не меньше 2 недели), а также одновременно с препаратами щитовидной железы (тиреоидин).
- Возможные побочные явления. Сухость во рту, нарушения аккомодации, запор, задержка мочи, тахикардия, аллергические реакции (кожная сыпь, зуд). Потливость, головокружение, тошнота, рвота, тремор конечностей, бессонница, возбуждение, усиление бреда, тревоги; галлюцинации, бредовые состояния. Ортостатическая гипотензия, понижение артериального давления, особенно у лиц, страдающих гипертензией. Реже наблюдается асимптоматическая желтуха, угнетение кроветворной системы (лейкопения, агранулоцитоз).
- При парентеральном применении возможны осложнения, связанные с местными раздражающими свойствами имизина.

Лечение осложнений и отравлений. Искусственная вентиляция легких. Промывание желудка взвесью активированного угля, активированный уголь и солевые слабительные внутрь. Трансфузионная терапия. Сосудосуживающие вещества противопоказаны. При возбуждении и судорогах — барбитураты, дитилин. При тахикардии, аритмии сердца и судорогах — физостигмина салицилат (0,00003 г/кг в 5 мл изотонического раствора натрия хлорида) подкожно, внутримышечно, внутривенно в течение 2 мин; повторно можно вводить через 30 мин. При коме и гипотензий физостигмин противопоказан. При рефрактерной аритмии сердца – растворы натрия лактата, натрия гидрокарбоната (50 мл 7,5 % раствора), дифенин (0,0005 — 0,001 г/кг; до 0,01 г/кг в сутки), анаприлин. Осмотический диурез. Гемодиализ и гемосорбция малоэффективны.



- <u>Амитриптилин.</u> Амитриптилина гидрохлорид. Амитриптилин HCL.
 Amitriptylinum. Elavil. Teperin. Triptizolum.
- 5- (3-Диметиламинопропилиден) -дибензо- [a,d] -1,4-циклогептадиена гидрохлорид.
- **Форма выпуска лекарства.** Амитриптилина гидрохлорид (Elavil, Endep): таблетки, покрытые оболочкой, по 10 мг, 25 мг, 50 мг, 75 мг, 100 мг, 150 мг.
- Амитриптилина гидрохлорид (Elavil, Enovil): раствор для инъекций, содержащий 10 мг/мл.
- Амитриптилина гидрохлорид и хлордиазепоксид (Limbitrol): таблетки, покрытые оболочкой, содержащие 12,5 мг амитриптилина гидрохлорида и 10 мг хлордиазепоксида.
- Амитриптилина гидрохлорид и перфеназин (Etrafon): таблетки, содержащие 10 мг амитриптилина гидрохлорида и 2 мг перфеназина; 25 мг амитриптилина гидрохлорида и 2 мг перфеназина
- Амитриптилина гидрохлорид и перфеназин (Etrafon-Forte): таблетки, содержащие 25 мг амитриптилина гидрохлорида и 4 мг перфеназина.
- Амитриптилина гидрохлорид и перфеназин (Triavil): таблетки, покрытые оболочкой, содержащие 10 мг амитриптилина гидрохлорида и 2 мг перфеназина, содержащие 25 мг амитриптилина гидрохлорида и 2 мг перфеназина, содержащие 10 мг амитриптилина гидрохлорида и 4 мг перфеназина, содержащие 25 мг амитриптилина гщфохлорида и 4 мг перфеназина, содержащие 50 мг амитриптилина гидрохлорида и 4 мг

- Применение и дозы препарата. Внутрь после еды; вначале по 0,025 г 3 раза в день, постепенно повышая дозу (утром и в полдень по 0,025 г, вечером и перед сном по 0,05 г). Иногда дозу увеличивают до 0,3 г в день. После достижения оптимального лечебного эффекта (3—4 недели) переходят на поддерживающие дозы (0,04—0,1 г). Внутривенно и внутримышечно по 2 мл 1 % раствора 4—6 раз в день (обычно в начале лечения). Курс лечения 3—4 мес.
- <u>Действие лекарства.</u> Амитриптилин одно из сильных антидепрессивных средств (тимолептик) с невыясненным до конца механизмом действия. Не угнетает моноаминоксидазу. Амитриптилин обладает довольно выраженными транквилизирующими и анксиолитическими свойствами, благодаря чему устраняет явления страха и угнетенности, часто наблюдающиеся при депрессии.
- □ <u>Показания к применению.</u> Депрессивная форма маниакальнодепрессивного психоза, инволюционная меланхолия, реактивная депрессия, шизо-аффективные депрессии, невротические депрессивные реакции (особенно формы, сопровождающиеся осесивно-руминативными тенденциями).



Меры предосторожности:

- 1. Во избежание синдрома отмены нельзя резко прерывать медикаментозную терапию, доза препарата должна снижаться постепенно в течение одной-двух недель.
- 2. Осторожно использовать у пациентов с заболеваниями сердечнососудистой системы, щитовидной железы, судорожными приступами в анамнезе, а также у больных, которым противопоказана чрезмерная стимуляция антихолинергической системы (при доброкачественной гипертрофии предстательной железы, задержке мочеиспускания в анамнезе, повышении ВГД). Лекарственное средство можно использовать при закрытоугольной форме глаукомы только при компенсированной форме заболевания и при постоянном контроле ВГД.
- 3. Противопоказан пациентам, принимающим ингибиторы МАО, и в течение двух недель после приема пациентам, недавно перенесшим инфаркт миокарда, и больным с гиперчувствительностью к амитриптилину в анамнезе. Иногда встречается перекрестная чувствительность с другими трициклическими антидепрессантами.
- 4. Препарат может вызвать сонливость, поэтому он противопоказан лицам, работа которых связана с повышенной концентрацией внимания, координацией движений, повышенной опасностью (вождение автомобиля, работа с тяжелыми предметами и др.). Лневная сондивость может быть

- <u>Противопоказания.</u> Глаукома, гипертрофия предстательной железы, атония мочевого пузыря. Не назначают одновременно с ингибиторами моноаминоксидазы.
- Возможные побочные явления. Сонливость, головокружение, изжога, сухость во рту, тошнота, возбуждение, тремор, гипотензия, головная боль, кожная сыпь, чувство покалывания в руках; тахикардия, ухудшение зрения, задержка мочеиспускания, запоры. Может привести к активации латентно протекающей шизофрении

ГРИПТИЛИН НИКОМ

Хлорацизин.

$$\begin{array}{c|c} S & HCI \\ \hline \\ O = C - CH_2 - CH_2 - N \\ \hline \\ C_2H_5 \end{array}$$

- <u>Хлорацизин</u>. Chloracyzinum.
- 2-Хлор-10-(3-диэтиламинопропионил)-фенотиазина гидрохлорид.
- □ Форма выпуска лекарства. Таблетки по 0,015 г.
- <u>Применение и дозы препарата.</u> Внутрь по 0,015 г 3 4 раза в день после еды. Курс лечения 10 20 дней. При лечении психических заболеваний дозу увеличивают и курс лечения продлевают до 3 мес.
- Высшие дозы внутрь разовая 0,05 г, суточная 0,15 г.
- <u>Действие лекарства.</u> Хлорацизин расширяет венечные сосуды, почти не влияет на артериальное давление, оказывает антиаритмическое, М холинолитическое и противогистаминное действие, уменьшает содержание норадреналина в сосудистой стенке.

Хлорацизин.

- Показания к применению. Хроническая сердечная недостаточность, атеросклероз сосудов сердца, депрессивная форма маниакальнодепрессивного психоза, инволюционная депрессия.
- **Противопоказания.** Болезни печени и почек.
- Возможные побочные явления. Сухость во рту, головокружение, тошнота, парестезии, в отдельных случаях усиление боли в области сердца.



Фторацизин.



- <u>Фторацизин.</u> Phthoracizinum.
- 2-Трифторметил-10-(3-диэтиламинопропионил)-фенотиазина гидрохлорид.
- Форма выпуска лекарства. Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,01 и 0,025 г; ампулы по 1 мл 1,25 % раствора.
- применение и дозы препарата. Внутрь по 0,025 0,05 г (в 2 3 приема) в день после еды с постепенным увеличением дозы до 0,1 0,3 г в день. Средняя суточная терапевтическая доза 0,1 0,15 г. Внутримышечно по 2 мл 1,25 % раствора 2 раза в день. В случае необходимости суточную дозу доводят до 0,075 0,1 г в день (6 8 мл 1,25 % раствора). После получения терапевтического эффекта инъекции фторацизином заменяют приемом препарата внутрь.

Фторацизин.



- Показания к применению. Маниакально-депрессивный психоз, шизофрения с аффективными расстройствами (страх, тревога, эмоциональное напряжение), депрессии при реактивных, невротических состояниях и передозировке нейролептических средств. Паркинсонизм, гиперкинезы.
- Противопоказания. Болезни печени, почек, язвенная болезнь желудка, глаукома, гипертрофия предстательной железы, атония мочевого пузыря. Не назначают фторацизин одновременно с ингибиторами моноаминоксидазы.
- Возможные побочные явления. Сухость во рту, тошнота, слабость, понижение артериального давления, боль в конечностях, нарушение аккомодации, затруднение мочеиспускания.

Неизбирательные ингибиторы нейронального

захвата нейромедиаторных аминов Внутрь (после еды) по 50 Возможны сухость во рту, Амитриптилин Преимущественно -250 мг в сутки (в 3-4 (амизол, амирол, нарушение аккомодации, видогенные эливел и др.). депресии. Более приема); внутримышечно задержка мочеиспускания, эффективен при или внутривенно сонливость, головокружение, Таблетки и драже (медленно) по 25—40 мг тремор рук, парестезии, тревожнопо 10; 25 и 50 мг; 3-4 раза в сутки депрессивных аллергические реакции, 1% р-р в ампулах состояниях нарушение сердечного ритма. по 2 мл и флаконах по 10 мл Противопоказания: глаукома, аденома предстательной железы, атония моневого пузыря Внутрь по 25 мг 2-Дезимипрамин Побочные действия и Те же, что для 3 раза в сутки (в начале (десметилимипраминимипрамина противопоказания те же, что и др.). лечения), постепенно увеличивая дозу до 100-Драже по 25 мг 150 мг (иногда до 200 мг) в сутки. Поддерживающая доза — 75—100 мг в сутки Имипрамин Депрессивные, Взрослым внутрь после еды по 75-250 мг в (импрамин, особенно астенодепрессивные, мелипрамин и др.). сутки (высшая суточная доза 300 мг); состояния,

Драже по 10 и сопровождающиеся 25 мг; таблетки по моторной и 10; 25; 50; 75 и идеомоторной 150 мг; ампулы по ваторможенностью; 2 мл 1,25% р-ра энурез у детей

внутримышечно - по 25-200 мг в сутки.

Детям назначают внутрь, начиная с 10 мг в сутки, в течение 10 дней увеличивают суточную дозу для детей 1-7 лет до 20 мг, 8-14 лет - до

20—50 мг, старше 14 лет - до 50 мг и

более

при использовании имипрамина Усиление тревоги, бреда, галлюцинаций, головная боль, головокружение, потливость, нарушения сердечного ритма, сухость во рту, нарушение аккомодации, задержка мочеиспускания, кожные

аллергические реакции, эозинофилия, лейкоцитоз. Раздражает ткани при парентеральном введении. При эпилепсии назначают с осторожностью. Противопоказания: активный туберкулез, инфекционные болезни; острые заболевания печени, почек, кроветворных органов; недостаточность и нарушения проводимости сердца; расстройства мозгового кровообращения; глаукома;

аденома предстательной железы,

атония моневого пузыря

Кломипрамин (анафранил, кломинал, клофранил и др.). Драже по 25 мг; таблетки по 10 и 25 мг; таблетки- ретард о 75 мг; ампулы по 2 мл 1,25% р-ра	Депрессии различного генеза, в том числе глубокие и затяжные формы	Внутрь, обычно по 25 мг 3 раза в сутки. При тяжелых депрессиях вводят внутривенно (медленно) от 25—50 до 200 мг	Побочные действия и противопоказания в основном те же, что при использовании имипрамина. В отличие от имипрамина препарат обычно не усиливает страха и тревоги
Мапротилин (людиомил и др.). Драже по 10; 25 и 50 мг; ампулы по 2 мл 1,25% р-ра	Различные формы депрессий, сопровождающиеся раздражительностью, страхом	—150 <i>мг</i> в сутки	Сухость во рту, нарушение аккомодации, запоры, задержка мочеиспускания. Противопоказания: заболевания печени и почек, глаукома, аденома предстательной железы
Опипрамол (инсидон и др.). Драже по 50 мг	Нетяжелые депрессивно- тревожные состояния, психовегетативные нарушения, в сочетании со страхом, напряжением, нарушением сна	Внутрь взрослым по 25— 100 мг вечером или по 50 мг 2—3 раза в сутки. Детям старше 6 лет — по 50 мг 1—2 раза в сутки	Головокружение, возбуждение, сухость во рту, тахикардия (возникают редко). Противопоказания те же, что для имипрамина
Пипофезин (азафен и др.). Таблетки по 25 <i>мг</i>	Астенодепрессивные и тревожно- депрессивные состояния. Более эфективен при нетяжелых депрессиях	Внутрь после еды по 25— 200 мг в сутки (в 3—4 приема)	Головокружение, тошнота, в отдельных случаях рвота

