

[Амитриптилин Зентива](#)



Код АТХ:

- [N06AA09](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Амитриптилин](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[PLC VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Раствор для в/м введения прозрачный, бесцветный.

	1 мл	1 амп.
амитриптилина гидрохлорид	11.315 мг	22.63 мг,
что соответствует содержанию амитриптилина	10 мг	20 мг

Вспомогательные вещества: декстроза - 80 мг, вода д/и - до 2 мл.

2 мл - ампулы бесцветного стекла (5) - контейнеры ПВХ (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Нейротропные средства](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Амитриптилин - трициклический антидепрессант из группы неизбирательных ингибиторов нейронального захвата моноаминов.

Оказывает также некоторое анальгезирующее (центрального генеза), H₂-гистамино-блокирующее и антисеротониновое действие, способствует устранению ночного недержания мочи и снижает аппетит.

Обладает сильным периферическим и центральным антихолинергическим действием, обусловленным высоким сродством к м-холинорецепторам; сильным седативным эффектом, связанным со сродством к H₁-гистаминовым рецепторам, и альфа-адреноблокирующим действием. Обладает свойствами антиаритмического средства подгруппы Ia, подобно хинидину в терапевтических дозах замедляет желудочковую проводимость (при передозировке может вызывать тяжелую внутрижелудочковую блокаду).

Механизм антидепрессивного действия связан с увеличением концентрации норадреналина в синапсах и/или серотонина в ЦНС (снижение их обратного всасывания). Накопление этих нейромедиаторов происходит в результате ингибирования обратного их захвата мембранами пресинаптических нейронов. При длительном применении снижает функциональную активность бета-адренергических и серотониновых рецепторов головного мозга, нормализует адренергическую и серотонинергическую передачу, восстанавливает равновесие этих систем, нарушенное при депрессивных состояниях. При тревожно-депрессивных состояниях уменьшает тревогу, ажитацию и депрессивные проявления.

Механизм противоязвенного действия обусловлен способностью блокировать H_2 -гистаминовые рецепторы в париетальных клетках желудка, а также оказывать седативное и м-холиноблокирующее действие (при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки ослабляет боль, способствует ускорению заживления язвы). Эффективность при ночном недержании мочи обусловлена, по-видимому, антихолинергической активностью, приводящей к повышению способности мочевого пузыря к растяжению, прямой бета-адренергической стимуляцией, активностью альфа-адренергических агонистов, сопровождающейся повышением тонуса сфинктера и центральной блокадой захвата серотонина.

Оказывает центральное анальгезирующее действие, которое, как полагают, может быть связано с изменениями концентрации моноаминов в ЦНС, особенно серотонина, и влиянием на эндогенные опиоидные системы.

Механизм действия при нервной булимии неясен (может быть сходным с таковым при депрессии). Показан отчетливый эффект препарата при булимии у больных как без депрессии, так и при ее наличии, при этом снижение булимии может отмечаться без сопутствующего ослабления самой депрессии.

При проведении общей анестезии снижает АД и температуру тела. Не ингибирует MAO. Антидепрессивное действие развивается в течение 2-3 недель после начала применения.

Фармакокинетика

Биодоступность амитриптилина при различных путях введения - 30-60 %, его активного метаболита нортриптилина - 46-70%. V_d 5-10 л/кг. Эффективные терапевтические концентрации в крови амитриптилина 50-250 нг/мл, для нортриптилина (его активного метаболита) - 50-150 нг/мл. C_{max} - 0.04-0.16 мкг/мл. Проходит через гистогематические барьеры, включая гематоэнцефалический барьер (в т.ч. нортриптилин). Концентрация амитриптилина в тканях выше, чем в плазме. Связь с белками плазмы - 92-96 %.

Метаболизируется в печени (путем деметилирования, гидроксирования) с образованием активных метаболитов - нортриптилина, 10-гидрокси-амитриптилина, и неактивных метаболитов.

$T_{1/2}$ из плазмы крови - от 10 до 28 ч для амитриптилина и от 16 до 80 ч для нортриптилина. Выделяется почками - 80%, частично - с желчью. Полное выведение - в течение 7-14 дней.

Амитриптилин проникает через плацентарный барьер, выделяется в грудное молоко в концентрациях, аналогичных плазменным.

Показания к применению:

- депрессии (особенно с тревогой, ажитацией и нарушениями сна, в т.ч. в детском возрасте, эндогенная, инволюционная, реактивная, невротическая, лекарственная, при органических поражениях мозга, алкогольной абстиненции);
- шизофренические психозы;
- смешанные эмоциональные расстройства;
- нарушения поведения (активности и внимания);
- ночной энурез (за исключением больных с гипотонией мочевого пузыря);
- нервная булимия;
- хронический болевой синдром (хронические боли у онкологических больных, мигрень, ревматические заболевания, атипичные боли в области лица, постгерпетическая невралгия, посттравматическая невралгия, диабетическая или другая периферическая невралгия);
- головная боль;
- мигрень (профилактика);
- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки.

Относится к болезням:

- [Болевой синдром](#)
- [Гипотония](#)
- [Головная боль](#)
- [Депрессия](#)
- [Мигрень](#)
- [Невралгия](#)
- [Неврит](#)
- [Неврозы](#)
- [Нервная булимия](#)
- [Ревматизм](#)
- [Ревматические заболевания](#)
- [Шизофрения](#)
- [Энурез](#)
- [Язвенная болезнь](#)
- [Язвенная болезнь желудка](#)

Противопоказания:

- одновременный прием с ингибиторами MAO и их прием за 14 дней до начала лечения амитриптилином;
- инфаркт миокарда (острый и восстановительный периоды);
- острая алкогольная интоксикация;
- острая интоксикация снотворными, анальгезирующими и психоактивными лекарственными средствами;
- закрытоугольная глаукома;
- тяжелые нарушения AV- и внутрижелудочковой проводимости (AV-блокада II степени, блокада ножек пучка Гиса);
- период лактации (грудного вскармливания);
- детский возраст до 12 лет;
- повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С осторожностью: у лиц, страдающих алкоголизмом, при бронхиальной астме, маниакально-депрессивном психозе и эпилепсии, при угнетении костномозгового кроветворения, гипертиреозе, стенокардии и сердечной недостаточности, внутриглазной гипертензии, шизофрении (хотя при его приеме обычно не происходит обострения продуктивной симптоматики), беременности (особенно в I триместре).

Способ применения и дозы:

Назначают в/м.

При *тяжелых депрессиях, резистентных к терапии*, в/м медленно вводят в дозе 10-20-30 мг до 4 раз/сут, увеличение дозы следует проводить постепенно, максимальная суточная доза - 150 мг. Спустя 1-2 недели переходят на прием препарата внутрь.

Детям старше 12 лет и лицам пожилого возраста вводят более низкие дозы и повышают их медленнее. Если состояние больного не улучшается в течение 3-4 недель лечения, то дальнейшая терапия нецелесообразна.

Побочное действие:

В основном связаны с холиноблокирующим действием препарата: парез аккомодации, нечеткость зрения, повышение внутриглазного давления, сухость во рту, запор, кишечная непроходимость, задержка мочеиспускания, повышение температуры тела. Все эти явления обычно проходят после адаптации к препарату или снижения доз.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, атаксия, повышенная утомляемость, слабость, раздражительность, головокружение, шум в ушах, сонливость или бессонница, нарушение концентрации внимания, кошмарные сновидения, дизартрия, спутанность сознания, галлюцинации, двигательное возбуждение, дезориентация, тремор, парестезии, периферическая невралгия, изменения на ЭЭГ; редко - экстрапирамидальные расстройства, судороги, тревога.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, аритмия, нарушение проводимости, лабильность артериального давления, расширение комплекса QRS на ЭКГ (нарушение внутрижелудочковой проводимости),

симптомы сердечной недостаточности, обморок.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, изжога, анорексия, стоматит, нарушения вкуса, потемнение языка, ощущение дискомфорта в эпигастрии, гастралгия, повышение активности печеночных трансаминаз; редко - холестатаческая желтуха, диарея.

Со стороны эндокринной системы: увеличение размеров грудных желез у мужчин и у женщин, галакторея, изменение секреции антидиуретического гормона, изменение либидо, потенции; редко - гипо- или гипергликемия, глюкозурия, нарушение толерантности к глюкозе, отек яичек.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, фотосенсибилизация, ангионевротический отек, крапивница.

Прочие: агранулоцитоз, лейкопения, эозинофилия, тромбоцитопения, пурпура и другие изменения крови, выпадение волос, увеличение лимфатических узлов, повышение массы тела при длительном применении, потливость, поллакиурия.

При длительном лечении, особенно в высоких дозах, при резком прекращении лечения, возможно развитие синдрома отмены: головная боль, тошнота, рвота, диарея, а также раздражительность, нарушение сна с яркими, необычными сновидениями, повышенная возбудимость.

Передозировка:

Симптомы: сонливость, дезориентация, спутанность сознания, угнетение сознания вплоть до комы, расширение зрачков, повышение температуры тела, одышка, дизартрия, возбуждение, галлюцинации, судорожные припадки, ригидность мышц, рвота, аритмия, артериальная гипотензия, сердечная недостаточность, угнетение дыхания.

Лечение: прекращение терапии амитриптилином, инфузия жидкости, симптоматическая терапия, поддержание АД и водно-электролитного баланса. Показано мониторирование сердечно-сосудистой деятельности (ЭКГ) в течение 5 дней, т.к. рецидив может наступить через 48 ч и позже. Гемодиализ и форсированный диурез мало эффективны.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказание: период лактации (грудного вскармливания).

С осторожностью: в период беременности.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Амитриптилин усиливает угнетающее действие на ЦНС следующих препаратов: нейролептиков, седативных и снотворных средств, противосудорожных препаратов, анальгетиков, средств для наркоза, алкоголя; проявляет синергизм при взаимодействии с другими антидепрессантами.

При совместном применении амитриптилина с нейролептиками и/или антихолинергическими препаратами может возникнуть фебрильная температурная реакция, паралитическая кишечная непроходимость.

Амитриптилин потенцирует гипертензивные эффекты катехоламинов и других адреностимуляторов, что повышает риск развития нарушений сердечного ритма, тахикардии, тяжелой артериальной гипертензии, но ингибирует эффекты препаратов, воздействующих на высвобождение норадреналина.

Амитриптилин может снижать антигипертензивное действие гуанетидина, препаратов со сходным механизмом действия, а также ослаблять эффект противосудорожных средств.

При одновременном применении амитриптилина и антикоагулянтов - производных кумарина возможно повышение антикоагулянтной активности последних.

При одновременном приеме амитриптилина и цемитидина возможно повышение концентрации в плазме амитриптилина с возможным развитием токсических эффектов. Индукторы микросомальных ферментов печени (барбитураты, карбамазепин) снижают плазменные концентрации амитриптилина.

Амитриптилин усиливает действие противопаркинсонических средств и других лекарственных средств, вызывающих экстрапирамидальные реакции.

Хинидин замедляет метаболизм амитриптилина.

Амитриптилин с дисульфирамом и другими ингибиторами ацетальдегиддегидрогеназы может спровоцировать делирий.

Эстрогенсодержащие пероральные противозачаточные средства могут повышать биодоступность амитриптилина.

Пимозид и пробукол могут усиливать сердечные аритмии.

Амитриптилин может усиливать депрессию, вызванную применением ГКС.

Совместное применение с лекарственными средствами для лечения тиреотоксикоза повышает риск развития агранулоцитоза.

Одновременный прием амитриптилина с ингибиторами MAO может привести к летальному исходу. Перерыв в лечении между приемом ингибиторов MAO и трициклических антидепрессантов должен составлять не менее 14 дней.

Особые указания и меры предосторожности:

Амитриптилин в дозах выше 150 мг/сут снижает порог судорожной активности, поэтому следует учитывать возможность возникновения судорожных припадков у больных с таковыми в анамнезе и у больных, которые предрасположены к этому из-за возраста или травм.

Лечение амитриптилином в пожилом возрасте должно проходить под тщательным контролем, с применением минимальных доз препарата и постепенным их повышением, во избежание развития делириозных расстройств, гипомании и других осложнений.

Пациенты с депрессивной фазой маниакально-депрессивного психоза могут перейти в маниакальную стадию.

Во время приема амитриптилина запрещается прием алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Во время приема амитриптилина запрещается вождение транспортных средств, обслуживание механизмов и других видов работ, требующих повышенной концентрации внимания.

Применение в пожилом возрасте

Лицам пожилого возраста лечение амитриптилином должно проходить под тщательным контролем, с применением минимальных доз препарата и постепенным их повышением во избежание развития делириозных расстройств, гипомании и других осложнений.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст до 12 лет.

Детям старше 12 лет вводят более низкие дозы и повышают их медленнее.

Условия хранения:

При температуре от 10 до 25°C в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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