Амитриптилин (таблетки)



Код АТХ:

- N06AA09

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Амитриптилин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
амитриптилина гидрохлорид	28.3 мг,
что соответствует содержанию амитриптилина	25 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, желатин, кальция стеарат, тальк, кремния диоксид коллоидный.

Состав оболочки: симетикон SE-2, макрогол, сепифилм 3048 желтый (Sepifilm 3048 Yellow) (гипромеллоза, целлюлоза микрокристаллическая, полиоксил 40 стеарат, титана диоксид, краситель хинолиновый желтый (Quinolin Yellow) (E104).

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Амитриптилин - трициклический антидепрессант из группы неизбирательных ингибиторов нейронального захвата моноаминов. Обладает выраженным тимоаналептическим и седативным действием.

Механизм антидепрессивного действия амитриптилина связан с угнетением обратного нейронального захвата катехоламинов (норадреналина, дофамина) и серотонина в ЦНС. Амитриптилин является антагонистом мускариновых холинергических рецепторов в ЦНС и на периферии, обладает периферическими антигистаминовыми (H_1) и

антиадренергическими свойствами. Также вызывает антиневралгическое (центральное анальгетическое), противоязвенное и антибулимическое действие, эффективен при ночном недержании мочи.

Антидепрессивное действие развивается в течение 2-4 недель после начала применения.

Фармакокинетика

Абсорбция - высокая. Время достижения C_{max} после приема внутрь - 4-8 ч. Биодоступность амитриптилина - от 33 до 62%, 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} в плазме крови – 0.04-0.16 мкг/мл.

Проходит через гистогематологические барьеры, включая гематоэнцефалический барьер (в т.ч. нортриптилин).

Концентрации амитриптилина в тканях выше, чем в плазме. Связь с белками плазмы - 92-96%.

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

$T_{1/2}$ - 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 любой этиологии (из-за выраженности седативного эффекта особенно эффективен при тревожно-депрессивных состояниях);

— смешанные эмоциональные расстройства и нарушения поведения;

— фобические расстройства;

— детский энурез (за исключением детей с гипотоническим мочевым пузырем);

— психогенная анорексия, булимический невроз;

— хронический болевой синдром (неврогенного характера);

— профилактика мигрени.

Относится к болезням:

- Болевой синдром
- Гипотония
- Депрессия
- Мигрень
- Неврит
- Неврозы
- Энурез

Противопоказания:

— сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— острый и восстановительный период инфаркта миокарда;

— нарушения проводимости сердечной мышцы;

— выраженная артериальная гипертензия;

— острые заболевания печени и почек с выраженным нарушением функций;

— язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в стадии обострения;

— гипертрофия предстательной железы;

— атония мочевого пузыря;

— пилоростеноз, паралитическая непроходимость кишечника;

— одновременное лечение ингибиторами МАО;

— беременность, период грудного вскармливания;

— детский возраст до 6 лет;

— повышенная чувствительность к амитриптилину.

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

Способ применения и дозы:

Назначают внутрь (во время или после еды).

Начальная суточная доза при приеме внутрь составляет 50-75 мг (25 мг в 2-3 приема), затем дозу постепенно увеличивают на 25-50 мг до получения желаемого антидепрессивного эффекта. Оптимальная суточная терапевтическая доза составляет 150-200 мг (максимальная часть дозы принимается на ночь). При тяжелых депрессиях, резистентных к терапии, дозу увеличивают до 300 мг и более, до максимально переносимой дозы (максимальная доза для амбулаторных больных - 150 мг/сут). В этих случаях лечение целесообразно начинать с в/м или в/в введения препарата, применяя при этом более высокие начальные дозы, ускоряя наращивание дозировок под контролем соматического состояния.

После получения стойкого антидепрессивного эффекта через 2-4 недели дозы постепенно и медленно снижают. В случае появления признаков депрессии при снижении доз необходимо вернуться к прежней дозе.

Если состояние больного не улучшается в течение 3-4 недель лечения, то дальнейшая терапия нецелесообразна.

У **больных пожилого возраста** при легких нарушениях, в амбулаторной практике, дозы составляют 25-50-100 мг максимально, в разделенных дозах или 1 раз/сут на ночь.

При *энурезе* **детям старше 6 лет** - 12.5-25 мг перед сном (доза не должна превышать 2.5 мг/кг массы тела ребенка).

Для *профилактики мигрени, при хронических болях неврогенного характера (в т.ч. длительных головных болях)* от 12.5-25 мг до 100 мг/сут.

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 невропатия, изменения на ЭЭГ; редко - экстрапирамидные 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 - холестатическая 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, промывание желудка, 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: беременность, период грудного вскармливания.

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 и 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 циметидина 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 экстрапирамидные реакции. Хинидин замедляет метаболизм амитриптилина. Совместное применение амитриптилина 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 ГКС.

При совместном применении с лекарственными средствами для лечения тиреотоксикоза повышается риск развития агранулоцитоза.

Одновременный прием амитриптилина с ингибиторами МАО может привести к летальному исходу. Перерыв в лечении между приемом ингибиторов МАО 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.

При нарушениях функции почек

Применение препарата противопоказано при острых заболеваниях почек с выраженным нарушением функций.

При нарушениях функции печени

Применение препарата противопоказано при острых заболеваниях печени с выраженным нарушением функций.

Применение в пожилом возрасте

У **больных пожилого возраста** при легких нарушениях, в амбулаторной практике, дозы составляют 25-50-100 мг максимально, в разделенных дозах или 1 раз/сут на ночь.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст до 6 лет.

При *энурезе* **детям старше 6 лет** - 12.5-25 мг перед сном (доза не должна превышать 2.5 мг/кг массы тела ребенка).

Условия хранения:

При температуре от 15 до 25°С в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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