Эфедрин



Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Симпатомиметик (адреномиметик непрямого действия); алкалоид, получаемый из различных видов эфедры (Ephedra L.) семейства эфедровых (Ephedraceae). Эфедрин, содержащийся в растениях, является левовращающим изомером. Синтетически получен рацемат, уступающий по активности левовращающему изомеру.

После введения эфедрина происходит возбуждение α- и β-адренорецепторов: действуя на варикозные утолщения эфферентных адренергических волокон, эфедрин способствует выделению медиатора норадреналина в синаптическую щель. Кроме того, он оказывает слабое стимулирующее влияние непосредственно на адренорецепторы.

Стимулирует деятельность сердца (увеличивает частоту и силу сокращений), облегчает AV-проводимость, повышает АД, вызывает бронхолитический эффект, подавляет перистальтику кишечника, расширяет зрачок (не влияя на аккомодацию и внутриглазное давление), повышает тонус скелетных мышц, вызывает гипергликемию.

В отличие от эпинефрина эффект эфедрина развивается медленно, но продолжается более длительно. При повторном введении эфедрина с небольшим интервалом (в 10-30 мин) его прессорное действие быстро снижается - возникает тахифилаксия (быстрое привыкание), связанная с прогрессирующим уменьшением запасов норадреналина в варикозных утолщениях.

Эфедрин стимулирует ЦНС, по психостимулирующему действию близок к фенамину.

Тормозит активность МАО и КОМТ.

Фармакокинетика

В небольших количествах метаболизируется в печени. $T_{1/2}$ составляет 3-6 ч. Выводится почками, главным образом в неизмененном виде.

Показания к применению:

Артериальная гипотензия при хирургических операциях (особенно при спинномозговой анестезии), травме, кровопотере, инфекционных болезнях.

Бронхиальная астма и другие обструктивные заболевания дыхательных путей, вазомоторный и аллергический ринит, синусит (для сужения сосудов слизистой носа), сывороточная болезнь, крапивница и другие аллергические состояния.

Нарколепсия, энурез (в результате стимулирующего влияния на ЦНС сон становится менее глубоким, облегчается

просыпание при появлении позывов к мочеиспусканию), миастения.

В офтальмологической практике: для расширения зрачка с диагностической целью.

Относится к болезням:

- Аллергический ринит
- Аллергия
- Анестезия
- Астма
- Гипотензия
- Инфекции
- Крапивница
- Ринит
- Синусит
- Сывороточная болезнь
- Травмы
- Энурез

Противопоказания:

Неконтролируемая артериальная гипертензия и тахикардия, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, бессонница, феохромоцитома, фибрилляция желудочков.

Способ применения и дозы:

Взрослым п/к, в/м или в/в вводят по 20-50 мг; внутрь - по 25-50 мг 2-3 раза/сут.

Для местного применения режим дозирования индивидуальный.

Максимальные дозы: для взрослых при приеме внутрь и п/к разовая доза - 50 мг, суточная доза - 150 мг.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, нарушение сна, слабость, нервозность, двигательное беспокойство, головокружение, судороги, мышечные спазмы, тремор, онемение рук или ног, сонливость, расширение зрачков, нечеткость зрительного восприятия; при применении в высоких дозах - галлюцинации, изменение настроения или психики.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: стенокардия, брадикардия или тахикардия, сердцебиение, повышение или снижение АД, желудочковые аритмии, ощущение дискомфорта или боль в грудной клетке, необычные кровоизлияния, гиперемия кожи лица, сужение периферических сосудов.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, сухость или раздражение полости рта или глотки (при парентеральном применении), потеря аппетита, изжога.

Со стороны мочевыделительной системы: затрудненное и болезненное мочеиспускание.

Прочие: повышенное потоотделение, бледность кожных покровов, аллергические реакции, одышка или затрудненное дыхание, озноб, гипертермия; местные реакции - боль или жжение в месте в/м инъекции.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение эфедрина при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) возможно только в том случае, если потенциальная польза для матери превосходит возможный риск для плода или младенца.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Эфедрин ослабляет действие опиоидных анальгетиков и других средств, угнетающих ЦНС.

При одновременном применении с неселективными бета-адреноблокаторами и нитратами - ослабление терапевтического действия (блокада β-адренорецепторов может привести к превалированию альфа-

адренергической активности с риском развития артериальной гипертензии и резко выраженной брадикардии с возможным развитием блокады сердца; блокада β-адренорецепторов также препятствует бета$_2$-адренергическому бронхорасширяющему действию).

Средства, подщелачивающие мочу (в т.ч. антациды, содержащие ионы кальция и магния, ингибиторы карбоангидразы, цитраты, натрия гидрокарбонат), увеличивают $T_{1/2}$ эфедрина и риск развития интоксикации.

При одновременном применении с сердечными гликозидами, хинидином, трициклическими антидепрессантами, допамином, средствами для ингаляционного наркоза (хлороформ, энфлуран, галотан, изофлуран, метоксифлуран, трихлорэтилен) возрастает риск развития тяжелых желудочковых аритмий; с другими симпатомиметиками - усиление выраженности побочных эффектов со стороны сердечно-сосудистой системы; с антигипертензивными средствами (в т.ч. с симпатолитиками, диуретиками, алкалоидами раувольфии) - снижение гипотензивного эффекта.

Одновременное применение с бронхолитическими средствами бета-адреномиметиками возможна дополнительная избыточная стимуляция ЦНС, что может вызвать повышенную возбудимость, раздражительность, бессонницу, судороги, аритмии.

При одновременном применении с резерпином и ингибиторами МАО (включая фуразолидон, прокарбазин, селегилин) возможны головная боль, нарушения сердечного ритма, рвота, внезапное и выраженное повышение АД, гиперпиретический криз; с фенитоином - внезапное снижение АД и брадикардия (зависит от дозы и скорости введения); с препаратами гормонов щитовидной железы - взаимное усиление действия.

Повышает метаболический клиренс ГКС, АКТГ при длительном применении (может потребоваться коррекция их доз). Эргометрин, эрготамин, метилэргометрин, окситоцин увеличивают вазоконстрикторный эффект и риск возникновения ишемии и гангрены.

Леводопа повышает риск развития аритмий (требуется снижения дозы симпатомиметика).

Усиливает стимулирующее влияние на ЦНС и риск возникновения токсических явлений ксантинов (в т.ч. аминофиллина, теофиллина, кофеина).

Кокаин усиливает стимулирующее влияние на ЦНС и сердечно-сосудистую систему.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять при метаболическом ацидозе, гиперкапнии, гипоксии, мерцательной аритмии, закрытоугольной глаукоме, легочной гипертензии, гиповолемии, инфаркте миокарда, окклюзионных заболеваниях сосудов (в т.ч. в анамнезе): артериальной эмболии, атеросклерозе, болезни Бюргера, отморожении, диабетическом эндартериите, болезни Рейно; заболеваниях сердечно-сосудистой системы (в т.ч. стенокардия, тахиаритмия, желудочковая аритмия, коронарная недостаточность, артериальная гипертензия), сахарном диабете, тиреотоксикозе, доброкачественной гиперплазии предстательной железы, одновременном применении средств для ингаляционного наркоза.

Во избежание нарушения ночного сна не следует применять эфедрин и содержащие его препараты в конце дня и перед сном.

Нецелесообразно применять длительно. В связи со стимулирующим влиянием на ЦНС эфедрин может быть средством злоупотребления.

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