Кломипрамин

Код АТХ:

- N06AA04

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Кломипрамин

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антидепрессант из группы трициклических соединений. Действие препарата связывают со стимуляцией адренергических и серотонинергических механизмов в ЦНС за счет угнетения обратного нейронального захвата медиаторов. В большей степени влияет на захват серотонина; этим, по-видимому, обусловлена его эффективность при лечении навязчиво-компульсивных нарушений. Антидепрессивный эффект наступает относительно быстро (на первой неделе лечения). Обладает адреноблокирующей (преимущественно альфа$_1$), холиноблокирующей и антигистаминной активностью.

Психостимулирующее действие кломипрамина выражено в меньшей степени, чем у имипрамина, а седативный эффект - слабее, чем у амитриптилина.

Фармакокинетика

После приема внутрь или в/м введения всасывается быстро и полностью. C_{max} в плазме достигается через 1.5-4 ч после приема внутрь. Связывание с белками плазмы - 97.6%. V_d - 12 л. Подвергается интенсивному метаболизму с образованием активного метаболита десметилкломипрамина.

$T_{1/2}$ в конечной фазе составляет 21 ч. Выводится с мочой в виде метаболитов и неизмененного вещества, через кишечник - в виде метаболитов.

Показания к применению:

Депрессивные состояния различной этиологии (в т.ч. эндогенные, реактивные, невротические, органические, маскированные и инволюционные депрессии); депрессивный синдром при шизофрении и расстройствах личности;

пресенильные и сенильные депрессии; депрессивные состояния при длительном болевом синдроме и при хронических соматических заболеваниях; депрессивные расстройства реактивной, невротической и психопатической природы, включая их соматические эквиваленты у детей; обсессивно-компульсивные синдромы (фобия), панические приступы страха, хронический болевой синдром (хронические боли у онкологических больных, мигрень, ревматические заболевания, атипичные боли в области лица, постгерпетическая невралгия, посттравматическая невропатия, диабетическая или другая периферическая невропатия), нарколепсия, сопровождающаяся катаплексией; головная боль; профилактика мигрени.

Относится к болезням:

- Болевой синдром
- Головная боль
- Депрессивное расстройство
- Депрессия
- Мигрень
- Нарколепсия
- Невралгия
- Неврит
- Неврозы
- Ревматизм
- Ревматические заболевания
- Фобия
- Шизофрения

Противопоказания:

Недавно перенесенный инфаркт миокарда, блокады проводящей системы миокарда, аритмии, мания, тяжелая печеночная недостаточность, закрытоугольная глаукома, задержка мочи, I триместр беременности, лактация, повышенная чувствительность к кломипрамину и другим трициклическим антидепрессантам из группы производных дибензоазепина.

Способ применения и дозы:

Внутрь взрослым - по 25-50 мг 2-3 раза/сут; детям в зависимости от возраста - 25-50 мг/сут. Взрослым в/м 25-100 мг/сут, в/в капельно 50-75 мг 1 раз/сут.

Максимальные дозы: при приеме внутрь взрослым амбулаторно - 250 мг/сут, в условиях стационара - 300 мг/сут; детям старше 10 лет - 3 мг/кг/сут, но не более 200 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: часто - головокружение, повышенная утомляемость, тремор, головная боль, миоклонус, нарушения зрения; редко - нарушения вкусовых ощущений, ощущение жара, мидриаз, дезориентация, галлюцинации (наиболее вероятны у пациентов пожилого возраста и при болезни Паркинсона), состояние тревоги, ажитация, нарушения сна, мания, гипомания, агрессивность, нарушения памяти, деперсонализация, зевота, кошмарные сновидения, усиление депрессии, нарушения концентрации внимания, делирий, нарушения речи, парестезии, нарушения мышечного тонуса, шум в ушах, судороги, атаксия; в отдельных случаях - усиление психотических симптомов, глаукома.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - постуральная гипотензия, синусовая тахикардия, изменения ЭКГ, пальпитация, аритмии, повышение АД; в отдельных случаях - изменения ЭЭГ, нарушения сердечной проводимости.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, сухость во рту, запор; редко - рвота, неприятные ощущения в животе, диарея, анорексия, повышение активности трансаминаз; в отдельных случаях - гепатит, желтуха.

Со стороны системы кроветворения: в отдельных случаях - лейкопения, агранулоцитоз, тромбоцитопения, эозинофилия, тромбоцитопеническая пурпура.

Со стороны обмена веществ: часто - повышение аппетита, увеличение массы тела.

Со стороны эндокринной системы: часто - нарушения либидо и потенции, галакторея, увеличение грудных желез; в отдельных случаях - синдром неадекватной секреции АДГ, отеки.

Дерматологические реакции: редко - фотосенсибилизация.

Аллергические реакции: редко - кожная сыпь, зуд.

Прочие: часто - усиление потоотделения; в отдельных случаях - повышение температуры тела.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан к применению в I триместре беременности. Не следует применять во II и III триместрах беременности, за исключением случаев крайней необходимости. Адекватных и хорошо контролируемых исследований безопасности применения кломипрамина при беременности у человека не проводилось.

Кломипрамин в небольшом количестве выделяется с грудным молоком, поэтому при необходимости применения в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с лекарственными средствами, оказывающими угнетающее влияние на ЦНС, возможно значительное усиление угнетающего действия на ЦНС, гипотензивного действия, угнетения дыхания.

При одновременном применении со средствами, обладающими антихолинергической активностью, возможно усиление антихолинергического действия.

При одновременном применении кломипрамин может снижать или полностью устранять антигипертензивное действие антиадренергических средств, влияющих на нейрональную передачу возбуждения (гуанетидина, бетанидина, резерпина, клонидина и альфа-метилдопы).

При одновременном применении с антипсихотическими средствами (нейролептиками) возможно повышение уровня кломипрамина в плазме крови, снижение порога судорожной готовности и развитие судорог. Комбинация с тиоридазином может приводить к возникновению тяжелых аритмий.

Возможно уменьшение концентрации кломипрамина в плазме крови вследствие индукции микросомальных ферментов печени под действием барбитуратов.

При одновременном применении с ингибиторами МАО возможны гипертонический криз, гиперпирексия, миоклонус, генерализованные судороги, делирий и кома.

При одновременном применении селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в т.ч. флуоксетина и флувоксамина) возможно усиление действия на серотониновую систему. Флуоксетин и флувоксамин могут повышать концентрацию кломипрамина в плазме крови, что сопровождается развитием соответствующих побочных эффектов.

Кломипрамин может усиливать действие на сердечно-сосудистую систему адрено- и симпатомиметических средств (эпинефрина, норэпинефрина, изопреналина, эфедрина и фенилэфрина), в т.ч., когда эти вещества входят в комбинацию с местными анестетиками.

При одновременном применении с адеметионином описан случай развития серотонинового синдрома; с вальпроатом натрия - описан случай повышения концентрации в плазме крови кломипрамина и его метаболита дезметилкломипрамина.

Имеется сообщение о повышении концентрации в плазме крови кломипрамина и его главного метаболита (дезметилкломипрамина) при одновременном применении с карбамазепином.

При одновременном применении с пароксетином повышается концентрация в плазме крови кломипрамина его метаболита S-дезметилкломипрамина, по-видимому, в связи с ингибированием изофермента CYP2D6 .

При одновременном применении с циметидином возможно повышение концентрации кломипрамина в плазме крови вследствие ингибирования микросомальных ферментов печени под влиянием циметидина.

Описан случай увеличения концентрации кломипрамина в плазме крови, что обусловлено ингибированием изоферментов CYP3A3/4 под влиянием эритромицина.

При одновременном применении с эстрогенами возможно нарушение метаболизма кломипрамина.

Возможно усиление действия этанола, особенно в течение первых нескольких дней терапии кломипрамином.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с пониженным судорожным порогом; при тяжелых заболеваниях печени или почек; в период лечения стероидными гормонами; при феохромоцитоме и нейробластоме из-за риска развития гипертонического криза; при гипертиреоидизме; сахарном диабете (требуется коррекция режима дозирования гипогликемических препаратов).

Перед началом лечения необходим контроль АД, в период лечения рекомендуется контроль картины периферической крови, при длительной терапии - контроль функций сердца и печени.

Кломипрамин можно применять не ранее чем через 14 дней после отмены ингибиторов МАО, начиная терапию с минимальной дозы. Не следует применять одновременно с симпатомиметическими средствами, в т.ч. с эпинефрином, эфедрином, изопреналином, норэпинефрином, фенилэфрином, фенилпропаноламином; с хинидиноподобными антиаритмическими препаратами. При одновременном применении кломипрамина с алпразоламом или дисульфирамом требуется уменьшение дозы кломипрамина.

Пациентам с тенденцией к суициду в начальном периоде лечения необходим постоянный врачебный контроль.

Использование электрошока на фоне применения кломипрамина возможно только по строгим показаниям и при тщательном наблюдении врача.

При внезапном прекращении лечения возможно развитие синдрома отмены.

В период лечения не допускать употребления алкоголя.

Не рекомендуется для приема внутрь детям в возрасте до 6 лет, парентерально - детям до 12 лет.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения следует воздерживаться от потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенного внимания и быстрых психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применяют при тяжелых заболеваниях почек.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности.

С осторожностью применяют при тяжелых заболеваниях печени.

Применение в детском возрасте

Не рекомендуется для приема внутрь детям в возрасте до 6 лет, парентерально - детям до 12 лет.

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