Тетурам



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Дисульфирам

Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Средство для лечения алкогольной зависимости. Оказывает ингибирующее влияние на фермент альдегид дегидрогеназу, которая участвует в метаболизме этилового спирта. Это приводит к повышению концентрации метаболита этилового спирта ацетальдегида, вызывающего приливы крови к лицу, тошноту, рвоту, общее недомогание, тахикардию, понижение АД, которые делают чрезвычайно неприятным употребление алкоголя после приема дисульфирама.

Фармакокинетика

После приема внутрь происходит быстрая, но неполная (70-90%) абсорбция активного вещества из ЖКТ.

Благодаря высокой растворимости в липидах, дисульфирам широко распределяется в организме и накапливается в различных жировых депо.

Дисульфирам быстро метаболизируется в диэтилдитиокарбамат (ДДК), который частично выводится в виде сероуглерода с выдыхаемым воздухом и частично метаболизируется в печени в метил-ДДК. Последний превращается в активный метаболит - диэтилтиокарбаминовой кислоты метиловый эфир (метил-ДТК). C_{max} в плазме крови метил-ДТК достигается через 4 ч после приема дисульфирама, но максимальная ингибирующая активность в отношении альдегид дегидрогеназы впервые наблюдается через 3 дня приема.

$T_{1/2}$ метил-ДТК составляет около 10 ч, при этом ингибирующая активность в отношении альдегид дегидрогеназы продолжается значительно дольше. Эффект, таким образом, может сохраняться в течение 7-14 дней после отмены.

При слабом или умеренном ухудшении функции печени, метаболизм не меняется. Напротив, при циррозе печени наблюдается повышение концентрации метаболитов в крови.

Метаболиты выводятся главным образом с мочой. Часть выводится с выдыхаемым воздухом в виде сероуглерода. 20% в виде неизмененного дисульфирама выводится через кишечник.

До 20% дозы может оставаться в организме в течение 1 недели и более.

После имплантации дисульфирам проникает в кровь. Минимальное содержание дисульфирама в крови - около 20 нг/мл. Содержание в крови ДДК и сероуглерода достигает 0.14 мкг/мл после имплантации 1-1.6 г дисульфирама. Однако, несмотря на эти очень низкие уровни, реакции дисульфирам-этанол могут возникать в течение 5-9 мес после имплантации.

Показания к применению:

Для приема внутрь: профилактика рецидивов во время лечения хронического алкоголизма.

Для имплантации: лечение хронического алкоголизма, в качестве дезинтоксикационного средства при хроническом отравлении никелем.

Относится к болезням:

- Алкоголизм

Противопоказания:

Тяжелые сердечно-сосудистые заболевания, тяжелая печеночная недостаточность, сахарный диабет, эпилепсия, нервно-психические заболевания; одновременный прием фенитоина, изониазида, метронидазола, одновременное употребление напитков, содержащих алкоголь или прием лекарственных препаратов, содержащих этанол, а также их употребление в течение 24 ч после приема дисульфирама; беременность, лактация; повышенная чувствительность к дисульфираму.

Способ применения и дозы:

При приеме внутрь доза составляет 125-500 мг/сут, схема лечения определяется индивидуально.

При имплантации в подкожно-жировую клетчатку с помощью специальной методики вводят 800 мг.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: металлический привкус во рту; редко - гепатиты.

Со стороны ЦНС: полиневриты нижних конечностей, нервно-психические расстройства, снижение памяти, дезориентация, головная боль.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

Реакции, обусловленные ассоциацией дисульфирам-этанол: коллапс, нарушения сердечного ритма, приступы стенокардии, инфаркт миокарда, отек мозга.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

Перед проведением имплантации следует исключить беременность. На фоне действия дисульфирама необходимо применять надежные средства контрацепции.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с антикоагулянтами производными кумарина (в т.ч. с варфарином) усиливается антикоагулянтное действие, повышается риск развития кровотечений.

Дисульфирам ингибирует ферменты печени, поэтому при одновременном применении препаратов, метаболизирующихся в печени, возможно нарушение их метаболизма.

При одновременном применении дисульфирама с трициклическими антидепрессантами, производными фенотиазина, ингибиторами МАО существует риск развития серьезных побочных реакций, связанных с лекарственным взаимодействием.

Описан случай развития мании у пациента, принимающего дисульфирам и буспирон.

При одновременном применении уменьшается клиренс дезипрамина и имипрамина из организма.

При одновременном применении с амитриптилином возможно усиление терапевтического действия дисульфирама, однако возможно также усиление токсического действия амитриптилина на ЦНС.

При одновременном применении повышается концентрация в плазме крови диазепама и хлордиазепоксида, в некоторых случаях сопровождающееся головокружением. Под влиянием диазепама возможно уменьшение интенсивности реакции дисульфирам-алкоголь. Описан случай усиления токсичности темазепама.

При одновременном применении с изониазидом описаны случаи развития головокружения, депрессии; с кофеином - уменьшается выведение кофеина из организма; с метронидазолом - развивается острый психоз, спутанность сознания; с омепразолом - описан случай развития нарушения сознания и кататонии.

При одновременном применении с перфеназином нельзя исключить развития психотических симптомов.

При одновременном применении дисульфирам ингибирует метаболизм и выведение рифампицина.

При одновременном применении с феназоном увеличивается $T_{1/2}$ феназона; с фенитоином - усиливаются эффекты фенитоина вследствие повышения его концентрации в плазме крови, развиваются токсические реакции.

При одновременном применении с хлорзоксазоном повышается концентрация хлорзоксазона в плазме крови; с хлорпромазином - возможно усиление артериальной гипотензии.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять у пациентов с почечной недостаточностью, заболеваниями печени, дыхательной системы.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применять у пациентов с почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности. С осторожностью применять у пациентов с заболеваниями печени.

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