Реферат на тему

“О психофармакологии”

Введение

В настоящее время достигнуты значительные успехи в лечении психических, психосоматических и неврологических заболеваний, рынок психофармакологической продукции богат различными средствами лечения тех или иных заболеваний. Однако до сих пор ни один из самых современных препаратов, ни одна их схем лечения не приводят к удовлетворительному результату, который мог бы порадовать своим эффектом больного, его родственников и медицинских работников. Несомненно, что с 1949г., когда общественности было сообщено об эффективности солей лития при мании, и с 1952г., когда был открыт хлорпромазин (аминазин), научная медицина сделала огромный шаг вперёд в лечении психопатологических состояний. Мы научились купировать острые опасные для жизни больного и его окружения психотические состояния; найдены химические формулы препаратов, позволяющих сохранять длительную ремиссию и адаптирующие больного к жизни в социуме; современные препараты позволяют не только избавляться от психопатологической продукции, но и успешно помогают в борьбе с синдромами негативных психопатологических расстройств.

В своём реферате я попытался сделать обзор основных нейролептических препаратов, которые зарегистрированы на фармацевтическом рынке Украины, описать их спектр действия, показания к применению, способ применения и дозировки, а также противопоказания к приёму.

Хлорпромазин

(Аминазин, плегомазин, гибернал, ларгактил)

Лекарственная форма

• Таблетки, покрытые оболочкой 10 мг, 100 мг.

• Драже 25 мг, 50 мг, 100 мг.

• Раствор для инъекций 25 мг/мл 1 мл; 25 мг/мл 2 мл; 25 мг/мл 5 мл; 25 мг/мл 10 мл

Показания:

- в психиатрической практике — разные виды психомоторного возбуждения у больных шизофренией, маниакальное возбуждение у больных с маниакально-депрессивным психозом, другие психические заболевания (психопатия, реактивно-невротические состояния различного генеза, сопровождающиеся чувством страха, тревоги, возбуждением, бессонницей; психогенные изменения настроения у психопатов, дисфория у больных эпилепсией, органические заболевания ЦНС, психоз в умственно отсталых; острый алкогольный психоз и абстиненция при алкоголизме и токсикомании);

- в терапевтической и неврологической практике — как средство с выраженными седативными свойствами, в качестве противорвотного и успокаивающего икоту средства; в комплексном лечении гипертонического криза, сопровождающегося психомоторным возбуждением; для потенцирования действия анальгетиков при хроническом болевом синдроме и барбитуратов при хронической бессоннице; при заболеваниях, сопровождающихся повышением тонуса мышц; при гипертермии;

- в анестезиологии — в составе так называемых литических смесей;

- в дерматологической практике — в комплексной терапии зудящего дерматоза.

Применение: высшая разовая доза для в/м введения — 0,15 г, суточная — 0,6 г. Обычно в/м вводят 1-5 мл 2,5% р-ра не более 3 раз в сутки. При остром психическом возбуждении вводят в/в 2-3 мл 2,5% р-ра в 20 мл 40% р-ра глюкозы. Высшая разовая доза при в/в введении — 0,1 г, суточная — 0,25 г. Детям в зависимости от возраста назначают в более низких дозах — от 0,01-0,02 до 0,15-0,2 г/сут. Ослабленным пациентам и больным пожилого возраста назначают до 0,3 г/сут. Внутрь: разовая доза — 0,025 г, суточная —0,6-0,7 г.

Противопоказания - гепатит, цирроз, гемолитическая желтуха, нарушения кроветворения, прогрессирующие заболевания головного и спинного мозга, пептическая язва желудка и двенадцатиперстной кишки, декомпенсированные пороки сердца, выраженная АГ, тромбоэмболия, выраженная миокардиодистрофия, ревмокардит.

С осторожностью. Алкоголизм (повышена вероятность развития гепатотоксических реакций), рак молочной железы (в результате индуцированной фенотиазином секреции пролактина возрастают потенциальный риск прогрессирования болезни и резистентность к лечению эндокринными и цитостатическими ЛС), закрытоугольная глаукома, гиперплазия предстательной железы с клиническими проявлениями, печёночная и/или почечная недостаточность; заболевания, сопровождающиеся повышенным риском тромбоэмболических осложнений; болезнь Паркинсона; эпилепсия; микседема; хронические заболевания, сопровождающиеся нарушением дыхания (особенно у детей); синдром Рейи\* в анамнезе (повышение риска развития гепатотоксичности у детей и подростков); кахексия, рвота (противорвотное действие фенотиазинов может маскировать рвоту, связанную с передозировкой др. ЛС). Пожилой возраст.

Побочные эффекты: Попадание р-ра хлорпромазина под кожу, на кожу и слизистые оболочки может вызвать раздражение тканей; в/м введение часто сопровождается образованием болезненных инфильтратов; при в/в введении возможно повреждение эндотелия. Из системных побочных эффектов возможны тошнота, рвота, выраженная артериальная гипотензия, иногда — желтуха, агранулоцитоз, фотосенсибилизация, злокачественный нейролептический синдром.

\* Рейи синдром (Rely). Расширение сосудов, повышение проницаемости капилляров, отек, множественные инфаркты. Наступает в результате сосудистогормональных изменении в ответ на различные раздражения (в том числе и фармакологические блокады) вегетативной нервной системы.

Левомепромазин

(Тизерцин, нозинан)

Лекарственная форма

• Таблетки, покрытые оболочкой, 25 мг.

• Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 25 мг/мл/ 1 мл (2,5 %).

Выражены адренолитический, антигистаминный, гипотермический и гипотензивный эффекты.

Показания:

• психомоторное возбуждение разной этиологии: маниакальная стадия маниакально-депрессивного психоза, депрессивно-параноидальная форма шизофрении, кататоническое возбуждение, реактивная депрессия, алкогольный психоз и другие психотонические состояния, сопровождающиеся явлениями тревоги, страха;

• невротические расстройства с повышенным возбуждением, нарушением сна;

• заболевания, сопровождающиеся болевым синдромом: невралгия тройничного нерва, опоясывающий лишай и т.п.;

• зудящие дерматозы (как средство дополнительной терапии);

• эпилепсия, олигофрения (в составе комбинированной терапии);

• для потенцирования действия анальгетиков, средств для наркоза.

Применение: при психотических состояниях суточная доза составляет 25-50 мг (1-2 таблетки), при необходимости доза может быть повышена до 150-250 мг/сут (6-10 таблеток в сутки). Нельзя принимать больше 10 таблеток в сутки. Для уменьшения чувства тревоги начальная суточная доза составляет 12,5-25 мг (У2-1 таблетка) в сутки. В случае необходимости эту дозу можно повысить до 75-100 мг/сут (3-4 таблеток в сутки). После улучшения состояния доза может быть снижена и подобрана поддерживающая.

Парентеральное введение препарата показано в тех случаях, когда прием внутрь невозможен. Суточная доза - обычно 75-100 мг 1-2 раза в сутки (3-4 мл препарата) под контролем АД и ЧСС. Инъекции необходимо делать глубоко в/м. При в/в применении р-р следует развести и вводить только в виде капельной инфузии (50-100 мг препарата в 250 мл изотонического р-ра натрия хлорида или р-ра глюкозы).

Противопоказания:

Таблетки и р-р Тизерцина не следует применять:

• при аллергии к фенотиазину или любым ингредиентам, входящим в состав препарата;

• в период беременности (или ее планирования) или кормления грудью;

• при тяжелом заболевании печени, изменениях показателей крови, недостаточности кровообращения;

• в случае внезапного снижения АД;

• при лечении антидепрессантом, принадлежащим к ингибиторам МАО;

• при лечении препаратами для снижения АД (особенно гуанетидин и ингибитор АПФ).

Препарат нельзя вводить детям и лицам, находящимся в бессознательном состоянии, в состоянии алкогольного опьянения или под действием наркотиков.

Побочные эффекты: наиболее частое - постуральная гипотензия. В таком случае может возникать потеря сознания, головокружение, сонливость или повышенная утомляемость. Кроме этого, могут отмечать сухость во рту, тахикардия, констипация (запор) и/или затруднение мочеиспускания. Отмечали случаи импотенции, фригидности, прекращения менструальных кровотечений. В некоторых случаях изменялся состав крови и возникали неврологические симптомы (возможны экстрапирамидные нарушения с преобладанием акинетико-гипотонического синдрома, например неспособность стоять неподвижно, тремор). Также иногда могут развиваться аллергические реакции и реакции фотосенсибилизации.

Особыеуказания: если больной уже принимал ингибиторы МАО, то перед началом лечения Тизерцином необходимо сделать перерыв продолжительностью не менее 14 дней, на протяжении которых не принимать никакого лекарственного препарата.

Трифлуоперазин

(Трифтазин, Стелазин, Триперазин)

Лекарственная форма

• Таблетки, покрытые оболочкой, 1 мг, 5 мг и 10 мг.

• Раствор для в/м введения 2 мг/мл (0,2 %).

Нейролептическое действие сочетается с определенным стимулирующим эффектом. Оказывает седативное (в больших дозах), противорвотное, выраженное каталептическое действие.

Показания: шизофрения, особенно параноидная, простая с апатоабулическим синдромом, ядерная шизофрения с выраженными галлюцинаторно-параноидными явлениями и психопатоподобными, неврозоподобными, ипохондрическими, сенестопатическими симптомами; периодическая шизофрения.

Применяют также при других психических заболеваниях, протекающих с бредом и галлюцинациями: алкогольных галлюцинациях и параноидах, инволюционных психозах, неврозах и иных заболеваниях ЦНС. Трифлуоперазин можно использовать в качестве противорвотного средства при рвоте различного происхождения.

Применение: для достижения быстрого эффекта вводят в/м. Начальная доза составляет 1-2 мг каждые 4-6 ч, при более высокой частоте введения возможны явления кумуляции. Суточная доза, как правило, равна б мг, в исключительных случаях —10 мг. При депрессивно-галлюцинаторных и депрессивно-бредовых состояниях трифлуоперазин применяют в комбинации с анти депрессантами. В качестве противорвотного средства трифлуоперазин назначают в дозах 1-4 мг/сут. Схемы лечения трифлуоперазином следует устанавливать строго индивидуально и с учетом тяжести течения заболевания. Продолжительность лечения — 3-9 мес, а в отдельных случаях и более. В зависимости от клинического течения заболевания возможно комбинированное применение трифлуоперазина с анти депрессантами, с различными нейролептиками или транквилизаторами.

Противопоказания: острые воспалительные, другие тяжелые острые и хронические заболевания печени, тяжелые заболевания почек, заболевания сердца с нарушением проводимости и в стадии декомпенсации, период беременности.

Побочнье эффекты: применение трифлуоперазина часто сопровождается экстрапирамидными расстройствами (дискинезия, акинеторигидные явления, акатизия, гиперкинезы, тремор, вегетативные нарушения). В качестве корректоров применяют противопаркинсонические средства — тропацин, тригексифенидил и др. Дискинезию (пароксизмально возникающие судороги мышц шеи, языка, дна ротовой полости, окулогирные кризы) купируют введением кофеин-бензоата натрия (2 мл 20% р-ра п/к) или хлорпромазина (1-2 мл 2,5% р-ра в/м). Редко возникающими осложнениями являются токсический гепатит, агранулоцитоз. В начале лечения могут наблюдаться сонливость, незначительное понижение АД.

Флуфеназин

(модитен-депо, миренил, лиоген)

Лекарственная форма

• Таблетки, покрытые оболочкой, 1 мг, 2,5 мг и 5 мг. – не зарег. в Украине.

• Раствор (масляной) для в/м введения 25 мг/мл (2,5 %) ампула 1 мл – модитен-депо, зарегистрирован в Украине.

• Раствор для в/м введения 2,5 мг/мл (0,25 %) 1 мл. – не зарег. в Украине.

Оказывает легкий стимулирующий эффект.

Показания: неврозоподобные и галлюцинаторные расстройства (слуховые, телесные и другие галлюцинации), различные формы шизофрении, особенно при наличии сопорозно-кататонических расстройств, параноидные состояния, протекающие с аффектом страха, при вялом течении процесса с преобладанием депрессивно-апатических состояний, расстройства поведения, апато-абулические состояния. Часто используется в амбулаторной практике.

Применение (модитен-депо): р-р вводят глубоко в/м. Рекомендуемая доза составляет 0,5-2 мл 1 раз в 1-3 нед.

Противопоказания: коматозное состояние; выраженный атеросклероз сосудов мозга, органические поражения головного мозга; выраженные нарушения функции печени и почек; феохромоцитома; болезни крови; гипертрофия предстательной железы; тяжелая депрессия; повышенная чувствительность к фенотиазинам.

Побочные эффекты: возможны экстрапирамидные расстройства, поздняя дискинезия, гиперкинезы мышц лица, повышенная утомляемость, головокружение, нарушение интеллектуальных функций, судорожные реакции, ощущение сухости во рту, тошнота, запор, нарушения сердечного ритма, галакторея, нарушения менструального цикла, фотосенсибилизация, лейкопения, тромбоцитопения, нарушения функции печени, аллергические реакции.

Особые указания: грименяют с осторожностью при заболеваниях печени, аритмии, тиреотоксикозе, эпилепсии, болезни Паркинсона, закрытоугольной глаукоме.

Тиоридазин

(сонапакс, меллерил, ридазин, тиорил, тисон)

Лекарственная форма

• Таблетки, покрытые оболочкой 10 мг и 25 мг.

• Драже 10 мг и 25 мг.

Оказывает антипсихотическое, транквилизирующее, антидепрессивное, противозудное, а также α-адрено- и М-холиноблокирующее действие. В малых дозах оказывает анксиолитическое действие; снижает чувство напряжённости и тревоги, в более высоких дозах проявляет антипсихотические (нейролептические) свойства. В средних терапевтических дозах не вызывает экстрапирамидных нарушений и сонливости. Оказывает слабое противорвотное действие, умеренное гипотензивное.

Показания: в качестве анксиолитика при состояниях тревоги, напряженности, смешанном состоянии тревоги и депрессии, возбуждении, эмоциональных расстройствах с тревогой и напряженностью, психосоматических нарушениях, нарушениях сна, непереносимой боли; в гериатрии — при патологических состояниях, обусловленных органическим поражением головного мозга различной различной степени тяжести: сенильное возбуждение и спутанность сознания, тревожность и смешанные депрессивно-тревожные состояния, бессонница; в педиатрии — при тревоге, напряженности, нарушениях концентрации внимания, сна, поведения (возбуждение, гиперактивность или агрессивность). В качестве антипсихотического средства особенно показан при стационарном лечении больных хроническими психозами; амбулаторном лечении больных психозами; синдроме алкогольной абстиненции (для устранения тревожности, возбуждения, враждебности, галлюцинаций); ажитированной депрессии (как дополнительное средство); при лечении детей с тяжелыми нарушениями поведения типа эмоциональной нестабильности, гипервозбудимости, двигательной гиперактивности и агрессивности.

Применение: дозу и время приема устанавливают индивидуально. В качестве анксиолитика взрослым назначают в суточной дозе 10-75 мг, детям в возрасте 1 года и старше — 0,5-2 мг на 1 кг массы тела. В качестве нейролептика при психозах у взрослых применяют в условиях стационара в суточной дозе 100-600 мг, в амбулаторных условиях — 50-300 мг, при ажитированных депрессиях и при использовании в гериатрии — 25-300 мг, при алкогольной абстиненции — 100-200 мг, при тяжелых нарушениях психики непсихотического характера — 25-150 мг. Максимальная суточная доза для взрослых — 800 мг, для детей в возрасте 1 года и старше — 1-4 мг на 1 кг массы тела. При назначение дозы, близкой к максимальной суточной, ее делят на 2-4 приема. Лечение пациентов с дефицитом массы тела, заболеваниями почек и печени, а также больных старческого возраста рекомендуется начинать с самих низких доз и повышать их очень медленно. Тиоридазин можно применять для лечения нарушений поведения у больных эпилепсией; в таких случаях прием противосудорожных средств следует продолжать, при необходимости повысив их дозы.

Противопоказания: коматозные состояния или вьраженное угнетение функции ЦНС; повышенная чувствительность к тиоридазину и другим фенотиазшам; заболевания крови в анамнезе; тяжелые заболевания сердечно-сосудистой системы; возраст до 1 года.

Побочные эффекты: к обычным побочным явлениям, особенно при применении высокой дозы и в начале лечения, относятся сонливость, седативное действие, головокружение, заложенность носа, сухость во рту. Иногда наблюдается дозозависимая ортостатическая гитотензия, особенно у больных пожилого возраста. К другим дозозависимым нарушениям, обусловленным антихолинергической активностью тиоридазина, относятся нарушения аккомодации, тахикардия, запор, задержка или недержание мочи. У некоторых пациентов тиоридазин даже в низких дозах может вызывать ощущение умственного угнетения, тошноту, головокружение, головную боль, или, напротив, — парадоксальные эффекты возбуждения, ажитацию или бессонницу.

Галоперидол

(Сенорм, галоприл, галомонд, галоперидол деканоат)

Лекарственная форма

• Капли для приёма внутрь 2 мг/мл 30 мл.

• Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 5 мг/мл 1 мл.

• Раствор для внутримышечного введения [масляный] 50 мг/мл 1 мл.

• Таблетки 1 мг, 1,5 мг, 5 мг.

Антипсихотический эффект сочетается с выраженным седативным действием. Обладает жаропонижающим, противосудорожным, противорвотным и антигистаминным свойствами. Не вызывает вялости, апатии (в отличие от аминазина). В малых дозах нередко оказывает стимулирующий эффект.

Показания: психомоторное возбуждение при различных заболеваниях и состояниях (маниакальная фаза психозов, деменция, олигофрения, психопатии, острая и хроническая шизофрения, алкоголизм); бред и галлюцинации различного происхождения (при шизофрении, параноидных состояниях, острых психозах); хорея Гентингтона, возбуждение, агрессивность, расстройство поведения у лиц пожилого возраста и детей; синдром Туретта; заикание, стойкая рвота или икота.

Применение: парентеральное введение показано при невозможности его приема внутрь, а также при остром психомоторном возбуждении. При остром психозе взрослым галоперидол вводят в/м или в/в в дозе 5-10 мг. В случае необходимости в такой же дозе можно вводить повторно 1-2 раза с интервалом 30-40 мин до достижения терапевтического эффекта. Максимальная суточная доза галоперидола составляет 30-40 мг (в отдельных случаях ее можно повысить до 100 мг). При остром алкогольном психозе галоперидол вводят в/в в дозе 5-10 мг, при необходимости введение повторяют, однако максимальная суточная доза не должна превышать 60 мг. Доза галоперидола для приема внутрь у взрослых составляет 2,25-18 мг в 3 приема. Для достижения максимального эффекта дозу следует повысить, а впоследствии постепенно снизить до поддерживающей минимальной эффективной. Галоперидол деканоат вводят 1-3 мл 1 раз в 3-4 недели.

Детям при продолжительном применении в качестве нейролептического средства обычно назначают внутрь по 1-3 мг 3 раза в сутки, но не более чем 3 раза в сутки по 10-20 мг. При психомоторном возбуждении обычно назначают внутрь по 0,5-1 мг 3 раза в сутки, но не более чем по 2-3 мг 3 раза в сутки.

Противопоказания: заболевания нервной системы, проявляющиеся пирамидными или экстрапирамидными расстройствами, депрессия, кома любой этиологии, повышенная чувствительность к галоперидолу, период беременности и кормления грудью.

Побочные эффекты: возможны экстрапирамидные нарушения (паркинсоноподобный синдром), психомоторное возбуждение, акатизия, заторможенность, сонливость, ухудшение настроения, снижение или повышение АД, тахикардия, тошнота, рвота, запор, увеличение молочных желез, галакторея, нарушения менструального цикла, импотенция; редко — лейкопения, гепатотоксическое действие, сыпь. При длительном применении возможно развитие поздней дискинезии.

Особые указания: С осторожностью применяют у пациентов с тяжелыми заболеваниями сердечно-сосудистой системы (возможно развитие артериальной гипотензии). Из-за возможности развития парадоксальных реакций галоперидол с особой осторожностью назначают больным пожилого возраста. Во время приема галоперидола запрещается употребление алкоголя.

Мелперон

(Мелперон сандоз)

Лекарственная форма

• Раствор для перорального применения 5 мг/мл фл. 200 мл.

• Таблетки, покрытые оболочкой, 10 мг, 25 мг, 50 мг, 100 мг.

Фармакологические свойства: мепперон принадлежит бутирофенонам, обладает нейролептической активностью, которая колеблется от незначительной до умеренной. Антипсихотический эффект проявляется только при приеме препарата в высоких дозах. Кроме указанных основных эффектов, типичных для нейролептиков с низкой активностью, мепперон может также вызывать миорелаксацию и оказывать антиаритмическое действие. В противоположность другим нейролептикам, мепперон в терапевтических дозах не повышает порог судорожной готовности мозговых структур. Было доказано, что незначительное повышение этого порога возможно при введении мелперона гидрохлорида в средних терапевтических дозах.

Показания: дисомния (нарушение сна), состояние спутанности сознания, психомоторное возбуждение (особенно у больных пожилого возраста и психических больных), психозы, гипофрения (название, которое объединяет различные формы врожденного и приобретенного слабоумия), деменция (обусловленная органическими поражениями ЦНС), неврозы (если транквилизаторы нельзя применять через непереносимость или риск развития зависимости) и алкоголизм.

Применение: доза Мелперона САНДОЗ должна быть откорректирована с учетом индивидуальной переносимости, возраста и массы тела пациента, а также типа и тяжести клинической картины заболевания. Основной принцип, которым при этом должен руководствоваться врач, - это максимально возможное снижение дозы и уменьшение продолжительности лечения. Суточную дозу препарата следует разделить на несколько приемов. Разовую дозу лучше принимать с пищей и (особенно при необходимости получения седативного эффекта) перед сном. Не принимать препарат с кофе, чаем или молоком. Для получения слабого седативного и преимущественно анксиолитического эффекта, который сопровождается улучшением настроения, обычно препарат применяют в дозе 20-75 мг/сут. Для достижения более выраженного седативного эффекта можно вечером принять препарат в более высокой дозе.

Для пациентов с ажитацией и спутанностью сознания начальная доза Мелперона САНДОЗ составляет 50-100 мг/сут. При необходимости она может быть повышена на протяжении нескольких дней до 200 мг/сут. При некоторых тяжелых состояниях ажитации и спутанности сознания, ассоциированных с агрессивностью, а также иллюзорными и галлюциногенными состояниями, суточная доза препарата может быть повышена до максимальной — 400 мг.

Период применения Мелперона САНДОЗ обычно не ограничивается. Необходимые антипсихотические эффекты иногда могут не проявляться на протяжении 2-3 недель терапии. В дальнейшем в зависимости от индивидуальной реакции больного дозу можно снижать.

Для пациентов пожилого и старческого возраста часто бывает достаточным прием в низких дозах. При одновременном применении препаратов лития дозы обоих лечебных средств следует по возможности снизить.

Противопоказания: повышенная чувствительность к мелперону, другим бутирофенонам или к любому из компонентов препарата; острая интоксикация и коматозные состояния, вызванные алкоголем, опиатами, снотворными и другими психотропными препаратами, которые снижают активность ЦНС (нейролептики, антидепрессанты, соли лития), тяжелая печеночная недостаточность. Детям возрастом до 12 лет препараты мелперона принимать нельзя.

Побочные эффекты: препарат в терапевтических дозах обычно не влияет или влияет незначительно на функции дыхания, кровообращения, пищеварения, мочеиспускания и функцию печени. Лишь в начале лечения может возникать усталость, а также очень редко — артериальная гипотензия, ортостатическая дисрегуляция, рефлекторное повышение ЧСС. При приеме препарата в высоких дозах, а также в зависимости от индивидуальной реакции организма, могут отмечаться нарушения типа произвольных движений (экстрапирамидные расстройства), симптомов болезни Паркинсона (дрожание, ригидность), а также акатизии (гиперкинезии).

Хлорпротиксен

(Труксал, Хлопротиксен 15 лечива, Хлопротиксен 50 лечива )

Лекарственная форма

• Таблетки, покрытые оболочкой, 15 мг, 25 мг и 50 мг.

Оказывает также седативное, противорвотное, антидепрессивное и антигистаминное действие. Относится к малым нейролептикам, применяется для поддерживающей терапии, при пограничных состояниях, корректор поведения.

Показания:

- в психиатрии и неврологии — депрессии, в том числе реактивные и невротические с тревожной симптоматикой, состояния возбуждения, связанные с ощущением страха и с напряжением, дисциркуляторная энцефалопатия, черепно-мозговые травмы, алкогольный делирий, нарушения сна, сопровождающие тревожное состояние, необходимость длительной терапии при состояниях возбуждения и тревоги, психосоматические, невротические и поведенческие расстройства у детей;

- в хирургии — премедикация, послеоперационный период, беспокойство у больных с ожогами; в дерматологии — дерматозы, сопровождающиеся упорным кожным зудом (нейродермит, красный плоский лишай, себорейный дерматит и др.);

- в гинекологии — депрессивное состояние в климактерический период;

- в терапии и педиатрии — нарушения сна при соматических заболеваниях, судорожный кашель, спастическое состояние пищеварительного тракта, рвота, аллергические реакции.

Применение: взрослым при неврозах назначают по 10-15 мг на ночь, в более тяжелых случаях — по 30 мг на ночь, в исключительных случаях дополнительно назначают утром 15 мг.

При психозах назначают по 100-600 мг/сут в 1 прием на ночь, при необходимости применения суточной дозы в течение дня ее распределяют так, чтобы прием самой высокой дозы происходил вечером. При кожном зуде назначают 15-100 мг/сут в 4 приема. Детям при неврозах назначают 5-30 мг/сут, при психозах —10-200 мг/сут. Больным пожилого возраста рекомендуется коррекция дозы.

Противопоказания: абсолютные — отравление алкоголем, барбитуратами и другими депримирующими средствами, повышенная чувствительность к хлорпротиксену.

Относительные — эпилепсия, склонность к коллапсам, паркинсонизм, пороки сердца с сердечной недостаточностью в фазе декомпенсации, тахикардия, атеросклероз сосудов головного мозга, выраженные нарушения функции печени и почек, кахексия, старческий возраст.

Побочные эффекты: возможны психомоторная заторможенность, слабовыраженный экстрапирамидный синдром, ортостатическая гипотензия, повышенная утомляемость, головокружение, помутнение роговицы и хрусталика с возможным нарушением зрения, желтуха, агранулоцитоз, лейкоцитоз, лейкопения, гемолитическая анемия, аменорея, галакторея, гинекомастия, нарушение углеводного обмена, снижение потенции и либидо, повышение аппетита, приводящее к увеличению массы тела, фотосенсибилизация, фото дерматит.

Побочные эффекты, обусловленные антихолинергическим действием: ощущение сухости во рту, тахикардия, усиление потоотделения, частые приливы, нарушение аккомодации, запор, расстройство мочеиспускания.

Особые указания: в редких случаях возможно парадоксальное беспокойство, особенно у больных с манией или шизофренией. В таких случаях рекомендуется перевести пациента на галоперидол.

Зуклопентиксол

(Клопиксол, Клопиксол-депо, Клопиксол-акуфаз )

Лекарственная форма

• Клопиксол - таблетки по 2 мг, 10 мг, 25 мг.

• Клопиксол-акуфаз - раствор для внутримышечного введения (масляный). Состав: каждый мл препарата содержит: активное вещество — зуклопентиксола ацетат 50 мг.

• Клопиксол-депо - раствор для внутримышечного введения (масляный). Состав: активное вещество — зуклопентиксола деканоат (по 200 и 500 мг в 1 мл).

Мощный нейролептик, обладающий седативным действием. Быстрое развитие седативного эффекта в начале терапии (до появления антипсихотического действия) является преимуществом при лечении острых и подострых психозов. Седативное действие зуклопентиксола особенно благоприятно при лечении пациентов с возбуждением, беспокойством, враждебностью и агрессивностью.

Показания: парентеральное введение показано для начального лечения острых психозов, маниакальных состояний и хронических психозов в фазе обострения. Депо-форма р-ра: острая и хроническая шизофрения и другие психотические расстройства, особенно с галлюцинациями, параноидным бредом и другими нарушениями мышления, а также состояния возбуждения, беспокойства, враждебности и агрессивности. Пероральное применение: острая и хроническая шизофрения и другие психотические расстройства, особенно с галлюцинациями, параноидным бредом и другими нарушениями мышления, а также состояния возбуждения, беспокойства, враждебности и агрессивности. Маниакальная фаза маниакально-депрессивного психоза. Олигофрения с явлениями психомоторного возбуждения, ажитацией, враждебностью и другими нарушениями поведения. Сенильное слабоумие с параноидными идеями, спутанностью сознания, дезориентацией, нарушениями поведения.

Применение: рекомендуемая доза для парентерального введения в острой фазе заболевания — 50-150 мг. При необходимости вводят повторно с интервалом 2-3 дня. Некоторым пациентам можно назначать дополнительную инъекцию через 24-48 ч после первого введения. Поддерживающую терапию продолжают зукпопентиксолом для перорального приема или введением депо-формы р-ра, руководствуясь следующей схемой:

1. При переходе на пероральный прием через 2-3 дня после заключительной инъекции зукпопентиксола пациенту назначают зукпопентиксол перорально ежедневно в дозе 40 мг, по возможности в несколько приемов. При необходимости дозу повышают на 10-20 мг каждые 2-3 дня до 75 мг/сут или более.

2. При переходе на лечение депо-формой р-ра одновременно с заключительной инъекцией обычной лекарственной формы зукпопентиксола вводят 200-400 мг р-ра зукпопентиксола в форме депо. Следующие дозы депо-формы и интервалы между инъекциями определяют с учетом состояния пациента.

При назначении зукпопентиксола внутрь дозу устанавливают индивидуально в зависимости от состояния пациента. Как правило, в начале лечения используют в низких дозах, быстро повышая их до достижения оптимального клинического эффекта. При острой шизофрении и других острых психозах, выраженных острых состояниях возбуждения, как правило, назначают в дозе 10-50 мг/сут. При тяжелых расстройствах и нарушениях умеренной степени тяжести начальную дозу 20 мг/сут можно при необходимости повышать на 10-20 мг каждые 2-3 дня до 75 мг/сут и выше. При хронической шизофрении и других хронических психозах поддерживающая доза составляет 20-40 мг/сут. При ажитации у пациентов с олигофренией обычно зукпопентиксол назначают в дозе 6-20 мг/сут. При необходимости дозу можно повысить до 25-40 мг/сут.

При ажитации и спутанности сознания у пациентов с сенильным слабоумием — 2-6 мг/сут (желательно вечером), при необходимости дозу можно повысить до 10-20 мг/сут.

При поддерживающем лечении диапазон доз депо-формы р-ра (200 мг/мл) обычно составляет 200-400 мг (1-2 мл) каждые 2-4 нед; некоторым пациентам может понадобиться введение в более высоких дозах или с более короткими интервалами между инъекциями. Если объем необходимого для введения р-ра превышает 2-3 мл, желательно использовать р-р более высокой концентрации (500 мг/мл), который обычно вводят по 250-750 мг (0,5-1,5 мл) каждые 2-4 нед.

Противопоказания: острое отравление алкоголем, барбитуратами и опиатами, коматозное состояние, период беременности и кормления грудью.

Побочные эффекты: Со стороны нервной системы — возможно развитие экстрапирамидных симптомов, особенно на начальном этапе лечения. В большинстве случаев они исчезают при снижении дозы и/ или назначении противопаркинсонических препаратов (регулярное профилактическое применение последних не рекомендуется). Иногда при длительной терапии может развиваться поздняя дискинезия, не купируемая применением противопаркинсонических препаратов; рекомендуется снижение дозы или если возможно прекращение терапии. Иногда наблюдается сонливость в начале лечения. Со стороны вегетативной нервной системы и сердечно-сосудистой системы— ксеростомия, нарушение аккомодации, задержка мочи, запор, тахикардия, ортостатическая гипотензия и головокружение. Прочие — иногда отмечаются незначительные преходящие изменения печеночных проб.

Флупентиксол

(Флюанксол, Флюанксол-депо)

Лекарственная форма

• Таблетки, покрытые оболочкой, флупентиксол дигидрохлорид 0,5 мг, 1 мг и 5 мг.

• Р-р для внутримышечного введения (масляный) - флупентиксол деканоат 20 мг/мл; 100 мг/мл.

Мощный нейролептик с активирующим эффектом

Показания: в дозах 0,5-1 мг — легкие и умеренно выраженные депрессивные состояния, сопровождаемые тревогой, астенией, потерей инициативы; хронические невротические расстройства с состоянием тревоги, депрессией, апатией; психосоматические расстройства с астеническими реакциями; острые, ситуативно обусловленные тревожные расстройства и состояния эмоционального напряжения, не требующие назначения се дативных и снотворных средств, особенно при подозрении на злоупотребление транквилизаторами.

В дозе 5 мг и в депо-форме — психотические расстройства, особенно с галлюцинациями, параноидным бредом и другими расстройствами мышления, которые сопровождаются апатией, анергией и аутизмом.

Применение: внутрь в начале лечения назначают в низких дозах, повышая их до получения оптимального клинического эффекта. Дозы до 3 мг/сут: в начале лечения обычно назначают внутрь по 1 мг/сут — 1 раз утром или по 0,5 мг 2 раза в сутки. При недостаточном терапевтическом эффекте через 1 нед дозу можно повысить до 2 мг/сут. Суточную дозу свыше 2 мг необходимо разделять на 2 приема. Максимальная доза — 3 мг/сут. Терапевтический эффект обычно отмечается через 2-3 дня после начала лечения, если после приема дозы 3 мг/сут эффект отсутствует, флупентиксол следует отменить. Дозы 3 мг/сут и выше: в начале лечения назначают внутрь по 3-15 мг/сут, разделенные на 2-3 приема. При необходимости дозу повышают до 40 мг/сут. Поддерживающая доза обычно составляет 5-20 мг/сут 1 раз в сутки утром. При использовании депо-формы дозу и интервал между инъекциями устанавливают индивидуально в зависимости от клинического эффекта и концентрации р-ра. Вводят только в/м. Поддерживающая доза при использовании р-ра в концентрации 20 мг/мл обычно составляет 20-40 мг (1-2 мл) 1 раз в 2-4 нед. При необходимости дозу можно повысить или сократить интервал между инъекциями. Если для назначения необходимой дозы объем р-ра превышает 2-3 мл, то следует использовать р-р в более высокой концентрации (100 мг/мл). При использовании р-ра более высокой концентрации (100 мг/мл) поддерживающая доза составляет 50-200 мг (0,5-2,0 мл) 1 раз в 2-4 нед. При обострении или рецидиве заболевания и при необходимости назначают не менее 400 мг 1 раз в 1-2 нед. При достижении клинического эффекта постепенно переходят на поддерживающую дозу — 20-200 мг 1 раз в 2-4 нед.

Противопоказания: повышенная чувствительность к флупентиксолу; острое отравление алкоголем, барбитуратами, опиатами; коматозное состояние; нарушение функции печени или почек, паркинсонизм, лихорадка; указания в анамнезе на злокачественный нейролептический синдром, гипертермию центрального происхождения, токсический агранулоцитоз. Не рекомендуется назначать пациентам с симптомами возбуждения или повышенной активностью (возможно увеличение выраженности симптомов); в период беременности или кормления грудью.

Побочные эффекты: возможно развитие экстрапирамидных симптомов, особенно на начальном этапе печения. В большинстве случаев они исчезают при снижении дозы и/ или назначении противопаркинсонических препаратов (регулярное профилактическое применение последних не рекомендуется). Иногда при длительной терапии может развиваться поздняя дискинезия, не купируемая применением противопаркинсонических препаратов (рекомендуется снижение дозы или если возможно прекращение терапии). Может наблюдаться преходящая бессонница, особенно если пациента переводят на флупентиксол после терапии седативными нейролептиками. При назначении флупентиксола в высоких дозах может отмечаться седативный эффект. Возможны транзиторные изменения функциональных печеночных проб.

Сульпирид

(Эглонил, Догматил, Рестфул)

Лекарственная форма

• Таблетки, покрытые оболочкой, 50 мг, 100 мг, 200 мг.

• Рестфул – р-р для инъекций 100 мг ампула 2 мл

Обладает умеренными антипсихотическими, стимулирующими, антидепрессивными и противорвотными свойствами.

Показания: Острые и хронические психозы (в т.ч. шизофрения), сопровождающиеся вялостью, апатией, заторможенностью; депрессия, мигрень, нарушения поведенческих функций у детей, неврозы с субкататоническими и субдепрессивными явлениями, посттравматическая энцефалопатия, головокружение; язвенная болезнь желудка и двенадцатипёрстной кишки, стрессовые язвы ЖКТ, лекарственные язвы, симптоматические язвы.

Применение: Внутрь, запивая небольшим количеством жидкости независимо от приёма пищи. Средние рекомендуемые дозы для взрослых при шизофрении составляют 200-1200 мг/сут (обычно от 400 до 800 мг) в начале лечения, затем дозу подбирают в зависимости от клинических симптомов. Более низкие дозы обычно эффективны в случае появления острых симптомов заболевания у больных, ранее не получавших лечения; больным, ранее получавшим лечение, сульпирид назначают в более высоких дозах.

При депрессии назначают в дозе до 800 мг/сут (до 1000мг/сут);

при синдроме Туретта — 200-1000 мг/сут;

при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки — 50-100 (до 150) мг/сут.

При головокружении — 150–300 мг/сут; при необходимости дозу увеличивают. Курс — не менее 14 дней.

Детям назначают из расчета 5-10 мг на 1 кг в сутки.

Принимают 2-3 раза в сутки за 1 ч до или через 2 ч после еды.

При почечной недостаточности дозу определяют с учетом клиренса креатинина: при клиренсе 30-60 мл/мин назначают 70%, 10-30 мл/мин —

50%, менее 10 мл/мин — 33% от средней терапевтической дозы.

В начальный период лечения обычно вводят в/м в дозе 200-600 мг/сут, в течение 2 нед, после чего назначают сульпирид внутрь.

Противопоказания: феохромоцитома, паркинсонизм, почечная недостаточность, АГ, период беременности и кормления грудью.

Побочные эффекты: Гиперпролактинемия (дисменорея, гинекомастия, галакторея, снижение потенции, фригидность, увеличение массы тела). Экстрапирамидный синдром (обычно встречается при назначении доз выше 400 мг/сут), тремор, ранние и поздние дискинезии (спастическая кривошея, глазодвигательные нарушения, спазм жевательной мускулатуры), акатизия (нарушение позы покоя), бессонница, сонливость, тревожность, раздражительность, возбуждение, головная боль, ЗНС (бледность кожных покровов, вегетативные расстройства, гипертермия).

Сухость во рту, изжога, тошнота, рвота, запоры, повышение активности “печёночных” трансаминаз и ЩФ.

Повышение АД (редко — снижение АД, ортостатическая гипотензия, головокружение), тахикардия, удлинение Q-T интервала, редко, аритмия типа “torsade de pointes”.

Аллергические реакции — кожная сыпь, экзематозные высыпания, зуд.

Нарушения остроты зрения.

Клозапин

(Азалептин, Азапин, Азалептол, Азалептин-Арпи, Лепонекс, Скизорил, Клозапин Сандоз)

Лекарственная форма

• Таблетки 25 мг, 100 мг.

• Раствор для инъекций 2,5%, раствор для инъекций в ампулах по 2 мл (50 мг) (в Украине не зарегистр.)

Производное дибензодиазипина. Оказывает антипсихотическое и седативное действие. Практически не вызывает экстрапирамидных расстройств.

Показания: Шизофрения (в т.ч. резистентная к терапии др. нейролептиками и/или при их непереносимости), маниакальные состояния, маниакально-депрессивный психоз, психомоторное возбуждение при психопатиях, эмоциональные и поведенческие расстройства (в т.ч. у детей), расстройства сна.

Применение: взрослым обычно назначают в 1-е сутки в дозе 25-50 мг. При хорошей переносимости дозу медленно повышают в течение 1-2 нед на 25-50 до 300 мг/ сут (возможны индивидуальные колебания суточной дозы от 200 до 450 мг). Кратность приема — несколько раз в сутки; причем большую дозу препарата можно назначать перед сном. Максимальная рекомендуемая доза — 600 мг/ сут, однако для некоторых больных может потребоваться доза до 900 мг/ сут; достичь такой дозы можно только при очень постепенном (не более чем 100 мг за один этап) ее повышении. После достижения максимального терапевтического эффекта рекомендуют перевести пациента на поддерживающее лечение клозапином в более низких дозах. Поддерживающую дозу следует подбирать индивидуально, проводя постепенное (в несколько этапов) снижение первоначальной дозы. Поддерживающая суточная доза составляет в среднем 150-300 мг, хотя для некоторых пациентов она может быть и ниже. В дозе не выше 200 мг/ сут клозапин можно принимать однократно вечером. В случае запланированного прекращения лечения рекомендуют постепенное снижение дозы в течение 1-2 нед. При необходимости в быстрой отмене необходимо контролировать психический статус пациента. При возобновлении прерванного лечения следует придерживаться рекомендаций по исходному постепенному повышению дозы. У больных с судорожным синдромом в анамнезе, а также у лиц с сердечно-сосудистыми заболеваниями и заболеваниями почек и/или печени начальная доза препарата должна быть низкой, а повышение дозы следует проводить очень медленно.

Противопоказания: гранулоцитопения или агранулоцитоз (вследствие имеющегося нарушения функции костного мозга либо вызванные приемом лекарственных препаратов, а также указания в анамнезе на агранулоцитоз); алкогольные и другие токсические психозы, интоксикация лекарственными препаратами; коматозное состояние; тяжелые заболевания печени, почек и сердца.

Побочные эффекты: риск возникновения и/или усиления побочных эффектов возрастает при назначении клозапина в суточной дозе, превышающей 450 мг.

Гематологические: грану лоцитопения, агранулоцитоз (обычно развиваются в течение первых 18 нед лечения); возможно развитие эозинофилии и/или лейкоцитоза неизвестной этиологии (особенно на протяжении первых недель лечения). Со стороны ЦНС: наиболее часто — сонливость, повышенная утомляемость; возможны головокружение, головная боль, сравнительно редко — экстрапирамидные симптомы, как правило, легкой степени выраженности. Имеются сообщения о развитии ригидности, тремора, акатизии, а также очень редкие сообщения о развитии злокачественного нейролептического синдрома. Со стороны вегетативной нервной системы: ощущение сухости во рту, нарушения аккомодации, потоотделения и терморегуляции, гипертермия, избыточное слюноотделение. Со стороны сердечно-сосудистой системы: возможны тахикардия, ортостатическая гипотензия, реже — обморок (особенно в первые недели лечения), сравнительно редко — АГ. В редких случаях сообщалось о коллапсе, сопровождавшемся угнетением или, остановкой дыхания. Имеются отдельные сообщения об изменениях на ЭКГ, развитии аритмии, миокардита. Со стороны пищеварительного тракта и печени: возможны тошнота, рвота, запор. Сообщалось о повышении активности ферментов печени, в редких случаях — о развитии холестаза. Со стороны органов мочевыделительной системы: имеются сообщения о случаях недержания мочи и задержки мочеиспускания. Прочие: увеличение массы тела; имеются отдельные сообщения о развитии кожных реакций. Описаны случаи внезапной смерти, отмечаемые с одинаковой частотой как среди лиц с психическими расстройствами, получающих антипсихотические препараты, так и среди больных, которые не получают этих препаратов.

Особые указания: учитывая высокий риск развития агранупоцитоза при печении клозапином, его надо назначать только тем больным с шизофренией, у которых отсутствует эффект от лечения классическими нейролептиками или в случае их непереносимости. Обязательным условием является также наличие у пациента исходно нормального количественного и качественного состава (лейкоцитарная формула) лейкоцитов в крови.

В процессе лечения клозапином необходим систематический контроль количества лейкоцитов и лейкоцитарной формулы: еженедельно на протяжении первых 18 нед и не менее 1 раза в месяц в дальнейшем в течение всего курса лечения. Следует соблюдать осторожность при назначении клозапина пациентам с гипертрофией предстательной железы, закрытоугольной глаукомой;

заболеваниями печени, почек, сердца. У этих пациентов необходим систематический контроль функции печени, почек, сердечно-сосудистой системы. В связи со способностью клозапина вызывать седативный эффект и понижать порог судорожной готовности больным следует избегать вождения транспортных средств или работы с потенциально опасными механизмы, особенно на протяжении первых недель лечения. Безопасность применения клозапина в период беременности не установлена. При назначении клозапина в период кормления грудью следует прервать грудное вскармливание.

Оланзапин

(Зипрекса, Золафрен)

Лекарственная форма

• Таблетки, покрытые плёночной оболочкой, 5 мг и 10 мг.

• Таблетки диспергируемые 5 мг и 10 мг.

• Порошок для приготовления раствора для внутримышечного введения 10 мг.Производное тиенобензодиазепина. Сильный антипсихотик с седирующим свойством.

Показания:

Шизофрения. Оланзапин показан для лечения обострений, поддерживающей и длительной противорецидивной терапии больных шизофренией и другими психотическими расстройствами с выраженной продуктивной (бред, галлюцинации, автоматизмы и др.) и/или негативной (эмоциональная уплощённость, снижение социальной активности, обеднение речи) симптоматикой, а также сопутствующими аффективными расстройствами.

Биполярное аффективное расстройство. Оланзапин в виде монотерапии или в комбинации с литием или вальпроатом показан для лечения острых маниакальных или смешанных эпизодов при биполярном аффективном расстройстве с/без психотических проявлений и с/без быстрой смены фаз. Оланзапин показан для предотвращения рецидивов у пациентов с биполярным расстройством, у которых оланзапин был эффективен при лечении маниакальной фазы.

В комбинации с флуоксетином оланзапин показан для лечения депрессивных состояний, связанных с биполярным расстройством.

Показание для оланзапина при внутримышечном введении: быстрое купирование ажитации (психомоторного возбуждения) у больных с шизофренией, биполярным аффективным расстройством и деменцией.

Применение: начальная доза —10 мг 1 раз в сутки независимо от приема пищи. Средняя суточная доза — 5-20 мг. Начинать печение больных с тяжелыми нарушениями функции печени и почек у лиц пожилого возраста следует с дозы 5 мг.

Противопоказания: повышенная чувствительность к оланзапину.

Побочные эффекты: сонливость, увеличение массы тела, транзиторное и в большинстве случаев бессимптомное повышение уровня пролактина в плазме крови, редко — головокружение, акатизия, повышение аппетита, периферические отеки, ортостатическая гипотензия, ощущение сухости во рту, запор, транзиторное и бессимптомное повышение уровней АлAT и AcAT, преходящая эозинофилия.

Рисперидон

(Рисполепт, Рилептид, Арис, Нейриспин Здоровье, Риспаксол, Риспен[1,2,3,4], Риспетрил, Риспон, Риспонд, Риссет, Сперидан, Торендо )

Лекарственная форма

• Таблетки, покрытые оболочкой, 0,5 мг (Нейриспин),1 мг, 2 мг, 3 мг, 4мг.

• Порошок для приготовления суспензии для в/м введения пролонгированного действия (в форме микрогранул пролонгированного высвобождения) 25 мг, 37,5 мг и 50 мг.

• Раствор для приёма внутрь 1 мг/мл.

• Таблетки для рассасывания 1 мг и 2 мг.

Один из лучших современных атипичных нейролептиков, который носит растормаживающе-активизирующий характер, купирует астению и апатико-абулию.

Показания: шизофрения и другие психотические состояния с выраженной продуктивной симптоматикой (галлюцинации, бред, расстройства мышления, агрессивность, враждебность, подозрительность) и/или отрицательной симптоматикой (эмоциональная и социальная отчужденность, скудость речи, притуплённый аффект); профилактика рецидивов острых психотических состояний; лечение маниакальных эпизодов при биполярных расстройствах (в составе комбинированной терапии); лечение поведенческих расстройств у пациентов с деменцией при проявлении симптомов агрессивности (вспышки гнева, физическое насилие), нарушениях психической деятельности (возбуждение, бред) или психотических симптомах;

лечение дисциплинарных нарушений и других нарушений поведения у подростков и взрослых с выраженными деструктивными симптомами (агрессией, инстинктивным поведением и аутоагрессией).

Применение:

Шизофрения

Взрослые, начальная доза составляет 2 мг/сут (2 таблетки по 1 мг 1-2 раза в сутки). На второй день дозу можно повысить до 4 мг (по 2 мг 2 раза в сутки). После этого дозу можно оставить на предыдущем уровне или изменять индивидуально при необходимости. У большинства больных наступает улучшение при суточных дозах 4-6 мг. Некоторым пациентам необходимо более медленное повышение дозы при более низкой начальной и поддерживающей дозах.

Доказано, что при применении рисперидона в дозе более 10 мг/сут не отмечают повышения эффективности по сравнению с более низкими дозами, но повышается риск развития экстрапирамидных симптомов. Максимальная суточная доза составляет 16 мг.

Больные пожилого возраста, начальная доза составляет 0,5 мг (Уг т аблетки по 1 мг) 2 раза в сутки. Дозу можно повышать в зависимости от состояния пациента на 0,5 мг/сут до достижения дозы 1-2 мг 2 раза в сутки. Как правило, рисперидон хорошо переносится больными пожилого возраста. При необходимости (отсутствии эффекта) при хорошей переносимости препарата можно применять препарат в максимальной дозе.

Пациенты с заболеванием печени и почек. Рекомендуется начальная доза 0,5 мг 2 раза в сутки. Дозу можно повышать в зависимости от состояния больного на 0,5 мг 2 раза в сутки до достижения дозы 1-2 мг 2 раза в сутки. Вследствие отсутствия достаточного опыта применения у этой группы пациентов Рилептид следует применять с осторожностью. Нарушение поведения у пациентов с деменцией Рекомендуется начальная доза 0,25 мг 2 раза в сутки. При необходимости эту дозу в индивидуальном порядке можно повышать на 0,25 мг 2 раза в сутки, но не чаще чем 1 раз в 2 дня. Для большинства пациентов оптимальной является доза 0,5 мг 2 раза в сутки, однако некоторым пациентам необходима доза 1 мг 2 раза в сутки. После достижения необходимого уровня дозы можно решить вопрос о применении препарата 1 раз в сутки.

Вспомогательное лечение маниакальных состояний. Начальная доза 2 мг (2 таблетки по 1 мг или 1 таблетка по 2 мг) 2 раза в сутки. При необходимости эту дозу можно повышать на 2 мг/сут, но не чаще чем 1 раз на протяжении 2 сут.

Дисциплинарные и другие аффективные нарушения поведения

- Пациенты с массой тела 50 кг и больше. Начальная доза составляет 0,5 мг 1 раз в сутки. Эту дозу можно повышать на 0,5 мг/сут, но не чаще чем 1 раз на протяжении 2 сут. Для большинства пациентов оптимальная доза — 1 мг 1 раз в сутки. Однако в некоторых случаях может быть необходим однократный прием 1,5 мг/сут.

- Пациенты с массой тела менее 50 кг. Рекомендуется начальная доза 0,25 мг (}М ^ аблетки по 1 мг) 1 раз в сутки. Эту дозу можно повышать на 0,25 мг/сут, но не чаще чем 1 раз на протяжении 2 сут. Для большинства пациентов оптимальной является доза 0,5 мг 1 раз в сутки. Однако некоторым пациентам достаточно разовой суточной дозы 0,25 мг, тогда как другим необходим однократный прием 0,75 мг/сут. Как и при других видах симптоматической терапии, необходимость и продолжительность применения препарата Рилептид следует регулярно оценивать.

Противопоказания: повышенная чувствительность к любому компоненту препарата; период беременности и кормления грудью.

Побочные эффекты: рисперидон, как правило, хорошо переносится. Следует отметить, что во многих случаях побочные эффекты в результате применения препарата трудно отличить от симптомов основного заболевания. Во время приема рисперидона чаще всего отмечают такие побочные эффекты:

ЦНС: часто — бессонница, тревожность, возбуждение, головокружение, сонливость и головная боль; редко — утомляемость, снижение способности к концентрации внимания, эпилептические приступы. Седативный эффект, как правило, преходящий, чаще отмечают у подростков, чем у взрослых. Частота и тяжесть экстрапирамидных симптомов достоверно ниже в случае применения рисперидона, чем при применении галоперидола или других классических антипсихотических препаратов. Однако иногда отмечают такие побочные эффекты: тремор, ригидность, повышенное слюноотделение, брадикинезию, акатизию, острую дистонию. Эти побочные эффекты обычно слабовыражены и носят обратимый характер. Они исчезают после снижения дозы или (при необходимости) после назначения антипаркинсонических препаратов. Как и после применения классических нейролептиков, у больных с психозами отмечали единичные случаи таких побочных явлений: поздней дискинезии, злокачественного нейролептического синдрома и нарушения терморегуляции.

Сердечно-сосудистая система: ортостатическая гипотензия и рефлекторная тахикардия, реже — АГ. В некоторых клинических исследованиях у пациентов пожилого возраста с деменцией, получающих лечение рисперидоном, отмечали нарушение мозгового кровообращения (инсульт или динамические нарушения).

ЖКТ: запор — относительно часто, реже — диспепсия, тошнота/рвота, боль в животе и сухость во рту. Редко — дисфагия и повышение показателей печеночных ферментов.

Кожа и соединительная ткань: возможны ксеродермия, гиперпигментация, фотосенсибилизация, кожные высыпания и другие аллергические реакции.

Эндокринная система: рисперидон может вызвать дозозависимое повышение уровня пролактина в плазме крови. В связи с этим возможны такие проявления: галакторея, гинекомастия, нарушение менструального цикла и аменорея. Могут также увеличиться масса тела и появиться периферические отеки.

Как и обычные антипсихотические средства, очень редко Рилептид может вызвать водную интоксикацию (связанную с полидипсией или гипонатриемией, вызванную нарушением секреции антидиуретического гормона) у пациентов с психозами. В отличие от других атипичных антипсихотических препаратов, Рилептид очень редко вызывает гипергликемию и обострение сахарного диабета.

Мочеполовая система: возможны эректильная дисфункция и нарушение эякуляции, аноргазмия, приапизм, дизурия, полиурия и недержание мочи.

Система кроветворения: в некоторых случаях — анемия, незначительное снижение количества нейтрофилов и/или тромбоцитов.

Органы чувств: нарушение аккомодации, снижение остроты зрения, ксерофтальмия, ринит.

Опорно-двигательный аппарат: боль в суставах и мышцах.

Амисульприд

(Солиан)

Лекарственная форма

• Таблетки 100 мг и 200 мг;

• Таблетки, покрытые оболочкой, 400 мг.

В меньшей степени вызывает экстрапирамидные побочные эффекты, что может быть связано с его преимущественной лимбической активностью. У больных шизофренией с острыми приступами действует как на вторичные негативные симптомы, так и на аффективные симптомы (депрессивное настроение и ретардация).

Показания: психозы, особенно острые и хронические шизофренические нарушения, сопровождающиеся позитивными (бред, галлюцинации, расстройства мышления) и/или негативными (аффективная тупость, отсутствие эмоциональности и уклонение от общения) симптомами, в том числе у пациентов с преобладанием негативных симптомов.

Применение: в дозе, превышающей 400 мг/сут, Солиан следует назначать в 2 приема; в дозе до 400 мг/сут препарат принимают в один прием. Пациентам с преимущественно негативными симптомами рекомендуется назначать препарат в дозе 50-300 мг/сут. Подбор дозы должен быть индивидуальным. Оптимальная доза составляет около 100 мг в сутки. Для пациентов со смешанными негативными и позитивными симптомами дозу следует подбирать таким образом, чтобы обеспечить максимальный контроль над позитивными симптомами (400-600 мг/сут). Поддерживающее лечение проводят в минимальной эффективной дозе, которую устанавливают индивидуально. При острых психотических эпизодах рекомендуется прием внутрь в дозе 400-600 мг/сут; максимальная суточная доза — не более 1200 мг.

Поддерживающее лечение проводят в минимально эффективной дозе, которую устанавливают индивидуально. Поскольку выведение амисульприда осуществляется почками, при почечной недостаточности суточную дозу препарата у пациентов с клиренсом креатинина 30-60 мл/мин следует снизить наполовину, а у пациентов с клиренсом креатинина 10-30 мл/мин — на 2/з.

Поскольку препарат слабо метаболизируется в организме, снижения его дозы при нарушении функции печени не требуется.

Противопоказания: повышенная чувствительность к амисульприду или другим компонентам препарата, диагностированная или предполагаемая феохромоцитома, возраст до 15 лет (ввиду отсутствия клинических данных), период беременности и кормления грудью, диагностированные или предполагаемые пролактинзависимые опухоли (например пролактинома гипофиза и рак молочной железы), тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина <10 мл/мин), одновременное применение агонистов дофаминергических рецепторов (амантадин, апоморфин, бромокриптин, каберголин, энтакапон, лизурид, перголид, пирибедил, прамипексол, хинаголид, ропинирол, селегилин), за исключением пациентов с болезнью Паркинсона, врожденная галактоземия, синдром нарушения абсорбции глюкозы или галактозы, дефицит лактазы (из-за содержания в составе препарата лактозы).

Побочные эффекты

Со стороны ЦНС Часто — бессонница, тревога, ажитация, экстрапирамидные симптомы (тремор, АГ, гиперсапивация, акатизия, гипокинезия). Выраженность этих симптомов обычно умеренная, они частично обратимы без отмены Солиана при назначении антихолинергической антипаркинсонической терапии. Частота развития экстрапирамидных симптомов зависит от дозы препарата и очень низкая у больных, принимающих препарат в дозе 50-30 мг/сут для лечения по поводу преимущественно негативных симптомов. В клинических исследованиях установлено, что частота развития экстрапирамидных симптомов ниже у больных, принимающих Со лиан, чем у больных, принимающих галоперидол. Редко — дневная сонливость.

Очень редко — острая дистония (спастическая кривошея, окулогирный криз, тризм), не требующая отмены Со лиана и проходящая при применении антихопинергических противопаркинсонических средств; поздняя дискинезия, характеризующаяся непроизвольными движениями преимущественно языка и/или мимических мышц лица, развивается обычно при длительном применении препарата (антихопинергические антипаркинсонические средства при ней неэффективны, они могут вызывать ухудшение состояния); судороги; злокачественный нейролептический синдром.

Со стороны обмена веществ Часто — обратимое повышение уровня пролактина в сыворотке крови (проходящее после отмены препарата), которое может вызвать галакторею, аменорею, гинекомастию, набухание молочных желез, импотенцию и фригидность; увеличение массы тела.

Со стороны ЖКТ Редко — запор, тошнота, рвота, сухость во рту.

Со стороны сердечно-сосудистой системы Очень редко — артериальная гипотензия и брадикардия, увеличение интервала Q-T на ЭКГ. В единичных случаях — желудочковая тахиаритмия по типу трепетания-мерцания.

Со стороны гепатобилизрной системы. Очень редко — повышение активности ферментов печени, особенно трансаминаз.

Со стороны иммунной системы Очень редко — аллергические реакции.

Кветиапин

(Кветирон, Сероквель, Кветилепт)

Лекарственная форма:

Таблетки, покрытые оболочкой, 25 мг, 100 мг, 200 мг.

Атипичный антипсихотический препарат с сидируюищм свойством.

Показания: острые и хронические психозы, шизофрения, маниакальные эпизоды, связанные с биполярными расстройствами.

Применение: взрослым внутрь 2 раза в сутки во время еды или между приемами пищи.

Лечение при шизофрении Суточная доза взрослым первые 4 дня терапии оставляет: 1-й день лечения — 50 мг/сут, 2-й день— 100 мг/сут, 3-й день — 200 мг/сут, 4-й день — 300 мг/сут. Начиная с 4-го дня дозу титруют до достижения необходимого клинического эффекта в пределах от 300 до 450 мг/сут. В зависимости от клинической эффективности и переносимости препарата доза может варьировать от 150 до 750 мг/сут.

Лечение при маниакальных эпизодах, связанных с биполярными расстройствами Суточная доза первых 4 дней лечения составляет: 1-й день — 100 мг/сут, 2-й день — 200 мг/сут, 3-й день — 300 мг/сут, 4-й день — 400 мг/сут. В дальнейшем дозу повышают не более чем на 200 мг ежедневно, вплоть до достижения дозы 800 мг/сут начиная с 6го дня лечения. В зависимости от клинической эффективности и переносимости препарата доза может варьировать от 200 до 800 мг/сут.

|  |  |  |
| --- | --- | --- |
| Частота | Орган и системы органов | Реакция |
| Очень часто (≥10%) | Нервная система | Головокружение, сонливость |
| Часто (>1 %, но <10%) | Кроветворная и лимфатическая системы | Лейкопения |
| Сердечно-сосудистая система | Тахикардия, ортостатическая гипотензия |
| Система пищеварения | Сухость во рту, запор, диспепсия |
| Общие нарушения | Астения легкой степени, периферические отеки, увеличение массы тела |
| Лабораторные показатели | Повышение активности сыворот. трансаминаз (АлТ, АсT) |
| Нервная система | Потеря сознания |
| Дыхательная система | Ринит |
| Редко (>0,1 %, но <1%) | Кроветворная и лимфатическая системы | Эозинофилия |
| Иммунная система | Гиперчувствительность |
| Лабораторные показатели | Повышение активности у-глутарилтрансферазы, уровня ТГ и общего ХС в сыворотке крови |
| Нервная система | Судороги |
| Общие нарушения | Злокачественный нейролептический синдром |
| Репродуктивная система | Приапизм |
| Очень редко (<0,01%) | Кроветворная и лимфатическая системы | Нейтропения |

Замечание: максимальная суточная доза Сероквеля для лечения шизофрении составляет 750 мг; для лечения маниакальных эпизодов, связанных с биполярными нарушениями, такая доза должна составлять 800 мг. Длительное лечение препаратом в высокой дозе возможно только в

случае, если ожидаемая польза превышает потенциальный риск.

Пациенты пожилого возраста, как и другие антипсихотические препараты, Сероквель нужно применять с осторожностью у больных пожилого возраста, особенно на начальном этапе терапии. У таких пациентов начальная доза препарата должна составлять 25 мг/сут. В дальнейшем дозу каждый день повышают на 25-50 мг до достижения эффективной дозы, которая обычно ниже, чем у пациентов молодого возраста.

Нарушения функции печени или почек. У пациентов с нарушением функции почек или печени клиренс кветиапина при пероральном применении снижается приблизительно на 25%. Кветиапин активно метаболизируется в печени и поэтому должен применяться с осторожностью у пациентов с нарушением функции печени. Таким пациентам препарат назначают в начальной дозе 25 мг/сут. Затем дозу повышают каждый день на 25-50 мг до достижения эффективной дозы.

Противопоказания: повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Зипразидон

(Зелдокс)

Лекарственная форма

• Капсулы 40 мг, 60 мг, 80 мг.

• Лиофилизат для приготовления раствора для внутримышечного введения 30 мг (после растворения 1 мл раствора для инъекций содержит 20 мг зипразидона в виде мезилата)

Показания: Профилактика и лечение шизофрении и других психических расстройств. Препарат эффективен в терапии продуктивных и негативных симптомов, а также аффективных расстройств (у больных, получавших зипразидон в дозе 60 мг и 80 мг 2 раза/сут отмечено статистически достоверное улучшение по шкале MADRS /р<0,05/ по сравнению с плацебо) при шизофрении, купирование психомоторного возбуждения у больных шизофренией (в/м).

Применение: Внутрь, во время еды. Рекомендуемая доза — 40 мг 2 раза в сутки. В последующем дозу подбирают с учётом клинического состояния, увеличивая до максимальной суточной дозы 160 мг (80 мг 2 раза в сутки). При необходимости суточная доза может быть повышена до максимальной в течение 3 дней.

Купирование психомоторного возбуждения: в/м, по 10 мг (каждые 2 ч) и 20 мг (каждые 4 ч); максимальная суточная доза 40 мг. Эффективность при в/м введении более 3 дней не изучена.

Коррекции дозы у пожилых людей (65 лет и старше), при почечной недостаточности, у курящих больных не требуется.

У больных с лёгкой или умеренно выраженной печёночной недостаточностью дозу препарата снижают.

Противопоказания

• Удлинение интервала Q-T (в том числе врождённый синдром удлинённого интервала Q-T).

• Недавно перенесённый острый инфаркт миокарда.

• Декомпенсированная сердечная недостаточность.

• Аритмии, требующие приёма антиаритмических средств IA и III класса.

• Беременность.

• Лактация (грудное вскармливание).

• Повышенная чувствительность к зипразидону или любому неактивному компоненту препарата.

• Возраст до 18 лет.

Побочное действие

Нежелательные явления, отмеченные в ходе клинических испытаний, встречавшиеся менее чем у 1% пациентов, принимавших зипрасидон.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: астения, головная боль, экстрапирамидный синдром, бессонница или сонливость, тремор, нечёткость зрения, психомоторное возбуждение, акатизия, головокружение, дистонические реакции. Крайне редко появлялись судороги (менее чем у 1% больных, получавших зипрасидон). Индекс нарушения движений (Movement Disorder Burden Score), отражающий выраженность экстрапирамидных симптомов при применении зипрасидона, значительно ниже (р<0,05), чем при применении галоперидола или рисперидона. Сопоставимые изменения наблюдались при применении шкалы оценки акатизии (Simpson Angus and Barnes akathisia scales). Кроме того, при лечении галоперидолом и рисперидоном была выше частота акатизии и применения антихолинергических средств, чем при лечении зипрасидоном. При длительном применении зипрасидона, как и других антипсихотических средств, существует риск развития дискинезий и других отдалённых экстрапирамидных синдромов. При появлении признаков дискинезии целесообразно снизить дозу зипрасидона или отменить его.

Сертиндол

(Сердолект)

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые оболочкой, 4 мг, 12 мг, 16 мг, 20 мг.

Сертиндол является атипичным нейролептиком, производным фенилиндола, селективно воздействующим на лимбические структуры. Обладает антипсихотическим действием.

Показания: шизофрения (за исключением острых психотических расстройств), при непереносимости как минимум одного антипсихотического средства.

Применение: принимают внутрь 1 раз в сутки. Начальная доза — 4 мг/сут. В зависимости от индивидуальной реакции дозу можно постепенно повышать до 20 мг/сут. В случае превышения дозы 20 мг/сут значительно повышается риск увеличения продолжительности интервала Q-T, У пациентов с легкой или умеренной печеночной недостаточностью, а также у лиц пожилого возраста сертиндол следует применять в низких дозах и проводить более медленное повышение дозы.

Противопоказания: гипокалиемия, гипомагниемия; тяжелые сердечно-сосудистые заболевания (в том числе в анамнезе), включая застойную сердечную недостаточность, гипертрофию миокарда, аритмию или брадикардию (менее 50 у д./мин), врожденный синдром удлиненного интервала £-7"или наличие этого синдрома у родственников больного, приобретенный удлиненный интервал Q-T (более 450 мс у мужчин и 470 мс у женщин); одновременный прием препаратов, удлиняющих интервал Q-T (в том числе антиаритмические препараты классов IA и III, некоторых антипсихотических средств, антибиотиков группы макролидов, фторхинолонов, антигистаминных средств, цизаприда, препаратов лития); одновременный прием препаратов, ингибирующих изоферменты CYP ЗА (в том числе противогрибковых средств, производных азола, антибиотиков группы макролидов, ингибиторов ВИЧ-протеазы, циметидина); тяжелая печеночная недостаточность; угнетение функции ЦНС различной этиологии; беременность, период кормления грудью; детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к сертиндолу.

Побочные эффекты: Со стороны дыхательной системы: часто — ринит, затруднение носового дыхания; редко — одышка. Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: редко — головокружение, парестезии, синкопальные состояния, судорожные расстройства, двигательные нарушения (включая позднюю дискинезию), злокачественный нейролептический синдром. Со стороны пищеварительной системы: редко — сухость во рту.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко — постуральная гипотензия, увеличение интервала Q-T, пароксизмы желудочковой аритмии (типа пируэт).

Со стороны мочевыделительной системы: редко — лейкоцитурия, гематурия.

Со стороны обмена веществ: редко — увеличение массы тела, гипергликемия.

Прочие: периферические отеки, уменьшение объема эякулята.

Особые указания: с осторожностью применяют у пациентов с эпилепсией, болезнью Паркинсона, при печеночной недостаточности, у лиц пожилого возраста. Не рекомендуется применять в экстренных случаях для купирования острых психотических расстройств.

Палиперидон

(Инвега)

Лекарственная форма

Таблетки – 3мг, 6мг, 9мг, 12мг.

Атипичный нейролептик, улучшает качество сна, обладает сидирующими свойтсвами.

Показания: шизофрения (в т.ч. в фазе обострения); профилактика обострений шизофрении.

Применение: Рекомендуемая доза составляет 6 мг 1 раз/сут, утром, независимо от приема пищи. Постепенное повышение начальной дозы не требуется. У некоторых пациентов терапевтический эффект вызывают более низкие или более высокие дозы в пределах рекомендуемого диапазона 3–12 мг 1 раз/сут. Таблетки следует проглатывать целиком, запивая жидкостью, их нельзя разжевывать, делить на части или измельчать.

Для пациентов с легким нарушением функции почек (КК ≥ 50 мл/мин, но <80 мл/мин) рекомендуемая доза составляет 6 мг 1 раз/сут. Для пациентов с умереннымили тяжелым нарушением функции почек (КК < 50 мл/мин) рекомендуемая доза препарата составляет 3 мг 1 раз/сут. Изменять дозу при наличии показаний следует после повторной оценки состояния пациента.

Пациентам с нарушениями функции печени не требуется снижения дозы.

Для пациентов пожилого возраста с нормальной функцией почек (КК ≥80 мл/мин) рекомендуются те же дозы препарата, что и для взрослых пациентов с нормальной функцией почек. Вместе с тем, у пожилых пациентов функция почек может быть снижена, и в этом случае дозу препарата следует подбирать в соответствии с функцией почек у конкретного пациента.

Противопоказания: Повышенная чувствительность к палиперидону, рисперидону, а также к любому вспомогательному ингредиенту препарата

Побочные эффекты: Наиболее частые побочные эффекты: головная боль, тахикардия, акатизия, синусовая тахикардия, экстрапирамидные симптомы, сонливость, головокружение, седативное действие, тремор, артериальная гипертензия, дистония, ортостатическая гипотензия, сухость во рту.

Дозозависимые побочные эффекты: увеличение массы тела, головная боль, гиперсаливация, рвота, дискинезия, акатизия, дистония, экстрапирамидные симптомы, артериальная гипертензия, паркинсонизм.

Литература

1. Информационная система “КОМПЕНДИУМ 2008 на CD” (электронный вариант справочника “КОМПЕНДИУМ 2008 — лекарственные препараты”, выпущенный издательством “МОРИОН” в 2008 г.)
2. Коркина М.В. - Психиатрия: Учебник для студ. мед. вузов / М.В. Коркина, Н.Д. Лакосина, А.Е. Личко, И.И. Сергеев. — 3-е изд. — М.: МЕДпрессинформ, 2006.
3. Кукес В.Г. Клиническая фармакология: Уч./Науч. ред. А.З. Байчурина. — 2 изд., перераб. и доп. - М: ГЭОТАР МЕДИЦИНА, 1999.
4. Лечение психических расстройств различной этиологии: Уч. Пособие/Под ред. Н.Е. Бачерикова, П.Т. Петрюка. – Х.: Основа, 1995.
5. Психиатрия: Национальное руководство / Под ред. Т.Б. Дмитриевой, В.Н. Краснова, Н.Г. Незнанова, В.Я. Семке, А.С. Тиганова. — М. : ГЭОТАР-Медиа, 2009.
6. Фармакотерапия в неврологии и психиатрии: [Пер с англ]/Под ред. С.Д. Энна и Дж.Т. Койла. — М.ЮОО “Медицинское информационное агентство”, 2007.