

НАЛТРЕКСОН

1. Налтрексон.
2. Антаксон, Налтрексон гидрохлорид, Налтрексон ФВ, Ревиа.
3. Средства, влияющие на центральную нервную систему (Средства для лечения алкоголизма и наркомании).
4. Антагонист наркотических анальгетиков. При одновременном длительном назначении предупреждает развитие физической зависимости к морфину, героину и другими опиатам. У пациентов с опиоидной зависимостью вызывает приступ абстиненции. При алкоголизме связывается с опиоидными рецепторами и блокирует эффекты эндорфинов.
5. Недостаточно данных для доказательства эффективности лечения алкоголизма, наркомании.
6. Цена за 1 таблетку (50 мг) – 63,83 руб.[3].
7. Наибольшее сродство имеет к μ - и κ -рецепторам. Устраняет эффекты опиоидов (в т.ч. эндогенных). В сравнении с налоксоном действует более сильно и длительно. Начало действия - через 1-2 ч. В дозе 50 мг блокирует фармакологические эффекты 25 мг в/в введенного героина в течение 24 ч, двойная доза (100 мг) - в течение 48 ч, а 150 мг - в течение 3 сут. Длительное назначение не вызывает толерантности и зависимости. Сочетание с большими дозами опиоидов приводит к повышению высвобождения гистамина с характерной клинической картиной (покраснение лица, зуд, сыпь).
Абсорбция после приема внутрь – 96%, TC_{max} налтрексона и его активного метаболита 6-бета-налтрексола в плазме - 1 ч.
При длительном применении налтрексон не кумулирует (при этом содержание 6-бета-налтрексола в плазме достигает 40%). Метаболизируется в печени на 95% с образованием фармакологически активных метаболитов, главный из которых - 6-бета-налтрексол также является антагонистом опиоидов. Второй метаболит - 2-гидрокси-3-метокси-6-бета-налтрексол.
 $T_{1/2}$ налтрексона – 3,9 ч, 6-бета-налтрексона – 12,9 ч; средний $T_{1/2}$ зависит от дозы и увеличивается при длительном применении. Налтрексон и его метаболиты выводятся почками (налтрексон - менее 1%, 6-бета-налтрексол - примерно 38%) и с каловыми массами (подвергается кишечно-печеночной циркуляции). Общий Cl – 1,5 л/мин.
8. Опиатзависимая наркомания (в качестве вспомогательного средства после отмены опиоидных анальгетиков), алкоголизм.
9. Гиперчувствительность (в т.ч. к налоксону), состояние абстиненции на фоне опиоидной зависимости, острый гепатит, печеночная недостаточность, положительная проба с налоксоном, беременность, период лактации, возраст до 18 лет.
С осторожностью - нарушения функции печени или почек.
Безопасность применения при беременности и в период лактации не установлена.
10. Прекращение употребления наркотиков. Снижение потребности в алкоголе и предотвращение рецидивов алкоголизма.
11. Лечение может быть начато после воздержания от приема наркотиков в течение 7-10 дней (идентифицируется по анализам мочи). У пациента должны отсутствовать синдром "отмены" и признаки абстиненции. Лечение не начинают до тех пор, пока провокационная проба с налоксоном не станет отрицательной. Начальная доза - 25 мг, за пациентом наблюдают 1 ч, при отсутствии абстиненции вводят оставшуюся часть суточной дозы. Средняя доза - 50 мг/сут, достаточна для блокады парентерально введенных опиатов (эта доза блокирует 25 мг героина, введенного в/в).
Поддерживающая терапия: 50 мг каждые 24 часа (этой дозы достаточно для блокирования действия 25 мг героина, вводимого в/в).
Существуют также и другие схемы: по 50 мг первые 5 дней недели и 100 мг - на шестые сутки; по 100 мг каждые два дня или по 150 мг - каждые три дня; 100 мг в понедельник, 100 мг во вторник и 150 мг в пятницу. Следует учитывать, что применение этих схем лечения увеличивает риск гепатотоксичности
Минимальный курс лечения – 3 мес, рекомендуемый – 6 мес.
DDD=50 мг (перорально).
12. Не имеется достаточно данных о передозировке препарата. Лечение – проведение симптоматической терапии в условиях специализированного стационара.
13. Лекарственное лечение алкоголизма следует сочетать с психосоциальной реабилитацией больного.
Для предотвращения развития острого абстинентного синдрома пациенты должны как минимум за 7-10 дней прекратить прием опиоидов и препаратов, их содержащих, обязательно определение опиоидов в моче и проведение провокационного теста с налоксоном; при несоблюдении этих требований абстинентный синдром может проявиться через 5 мин после введения и продолжаться в течение 48 ч.
Конкурентная блокада опиоидных рецепторов может быть преодолена введением более высокой дозы наркотического анальгетика.
Перед применением необходимо исключить субклиническую печеночную недостаточность, во время лечения следует периодически контролировать активность "печеночных" трансаминаз.
Налтрексон необходимо отменить не менее, чем за 48 ч до хирургического вмешательства, при котором потребуются применение опиоидных анальгетиков. В случае необходимости проведения экстренной анальгезии с осторожностью назначают опиаты в повышенной дозировке (для преодоления антагонизма), поскольку угнетение дыхания при этом будет более глубоким и продолжительным.
14. Безопасность применения при беременности и в период лактации не установлена.
15. Диарея или запор; редко - сухость во рту, метеоризм, усугубление симптомов геморроя, эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта, абдоминальные боли, повышение активности "печеночных" ферментов, повышение или снижение аппетита, увеличение массы тела; возбуждение, состояние протрации, раздражительность, головокружение; редко - депрессия, паранойя, чувство усталости, спутанность сознания, дезориентация во времени и пространстве, галлюцинации, "кошмарные" сновидения, сонливость, понижение остроты зрения, боль и чувство жжения в глазах, светобоязнь, боль и ощущение заложенности в ушах, шум в ушах; бронхообструкция, заложенность носа, ринорея, кашель, затруднение дыхания, одышка, носовое кровотечение, чиханье, сухость в горле, повышенное слезоотделение, синусит; редко - флебит, отеки, повышение АД, неспецифические изменения ЭКГ, тахикардия, чувство жара в конечностях, ощущение внезапного прилива крови к лицу; сыпь на коже; редко - повышение секреции сальных желез; покраснение лица, артралгия, миалгия, озноб, геморрой, акне, алопеция, зуд, генерализованная эритема; замедленная эякуляция, импотенция; редко - учащение или нарушение мочеиспускания, повышение или понижение либидо, патологическая зевота, лихорадка, боль в паховой области, увеличение лимфатических узлов, лимфоцитоз; описано развитие идиопатической тромбоцитопенической пурпуры.
16. Снижает эффективность препаратов, содержащих опиоиды (противокашлевые средства, анальгетики).

- Гепатотоксичные препараты увеличивают (взаимно) риск поражения печени. Возможна летаргия или повышенная сонливость при сочетании с тиоридазином.
17. Не применяется.
 18. Воздержание от приема наркотиков, алкоголя.
При обращении за медицинской помощью необходимо информировать медицинских работников о лечении налтрексоном.
В случае появления болей в животе, потемнения мочи, пожелтения склер, необходимо прекратить прием и обратиться к врачу.
При самостоятельном приеме опиоидных анальгетиков в малых дозах эффекта от их приема не будет, а дальнейшее увеличение дозы приведет к смертельному исходу – остановке дыхания.
 19. Пациент должен дать согласие на лечение возможных осложнений.
 20. Капсулы 50 мг (контейнеры пластиковые, упаковки ячейковые контурные).
Фирмы: Zambon Group S.p.A., Италия; Московская фабрика ОАО, Россия; Фармапол ООО, Россия; Du Pont Merck Pharmaceuticals Company, США.
 21. Хранить в недоступном для детей месте.