

Дроперидол

Латинское название: Droperidol

Действующее вещество: дроперидол

Код АТХ: N05AD08

Производитель: Норхим (Франция)

Условие отпуска из аптеки: по рецепту

Условия хранения: вдали от света и детей

Срок годности: 3 года

Введение в тему

Дроперидол – производное бутирофенона, которое используется в качестве антипсихотического препарата в анестезиологии. Лекарственный препарат также применяется для профилактики и лечения послеоперационной тошноты и рвоты. Потенциальные побочные эффекты – нарушения сердечного ритма, головокружение, расстройства свертывания крови и боль в животе. Взаимодействия возможны с атипичными нейролептиками и антидепрессантами.

Состав и форма выпуска

Действующее вещество в составе:

- Дроперидол.

«Дроперидол» выпускается в виде раствора (в ампулах) для инъекций по 0,025 г активного вещества.

Фармакологические свойства

Дроперидол относится к группе бутирофенонов. Бутирофеноны представляют собой группу препаратов, которые в основном используются в фармакологической терапии шизофрении. Дроперидол также обладает антипсихотическими свойствами. Поэтому в сочетании с противорвотным эффектом препарат подходит в качестве лекарства от тошноты после операции и в качестве седативного средства при нейроанестезии.

При комнатной температуре дроперидол находится в форме белого порошка. Порошок плохо растворим в воде. Препарат коммерчески доступен в виде инъекционного раствора. Как и большинство нейролептиков, дроперидол обладает аффинностью связывания с рецепторами D2 в центральной нервной системе.

Рецепторы D2 также называют дофаминовыми рецепторами. Они служат стыковочным узлом для дофамина. Дофамин ингибирует экстрапирамидную двигательную систему через рецепторы D2. Препарат действует в основном на рецепторы D2 в области ствола головного мозга, в котором располагается рвотный центр.

Нейромедиатор «дофамин» играет важную роль в развитии рвоты. Антагонисты дофаминовых рецепторов, такие как дроперидол, блокируют рвотный центр и, таким образом, приводят к торможению тошноты.

Дроперидол также обладает низким сродством к рецепторам D3. Рецепторы D3 обнаруживаются в основном в лимбической системе и в корковых областях мозга. Они играют роль в эмоциональных и когнитивных процессах. Ингибирование рецепторов D3 приводит к облегчению психотических симптомов.

Дроперидол также может связываться с 5-HT₂ рецепторами. Ингибирование рецепторов оказывает, среди прочего, анксиолитический эффект. Ранее нейролептический препарат дроперидол использовался, среди прочего, для анестезии и вместе с опиоидом, обычно фентанилом, для нейролептаналгезии.

При нейролептаналгезии пациенты свободны от беспокойства и в основном безразличны к окружающим процессам, но они не всегда спят. Также медикамент обладает слабым альфа-1-адренолитическим действием и не обладает ни антихолинергическим, ни антигистаминергическим действием.

Дроперидол обладает тем же противорвотным действием, что ондансетрон и дексаметазон. Все лекарства снижают относительный риск развития послеоперационной тошноты и рвоты примерно на 26%. Поскольку они не влияют друг на друга, комбинация с дексаметазоном или с антагонистами 5-HT₃ или обоими одновременно имеет смысл при особенно высоком риске послеоперационной рвоты.

Эффект однократной внутривенной дозы дроперидола начинается через 2-3 минуты после приема. Успокаивающий эффект может длиться от 2 до 4 часов, а внимание снижается до 12 часов.

Дроперидол быстро метаболизируется в печени и подвергается окислению. Метаболиты имеют нейролептическую активность. Метаболиты выводятся из организма через почки на 75%, только 1% препарата выводится из организма без изменений в моче. Период полувыведения составляет в среднем 134 минуты.

Показания к применению

Лекарственный препарат назначался вплоть до 1980-х годов до хирургического вмешательства вместе с препаратом таламонал. Однако многие пациенты жаловались на депрессию, панику и возбуждение с одновременной усталостью. Поэтому препарат применялся только в исключительных случаях анестезиологами.

В 2001 году пероральная лекарственная форма дроперидола была изъята с рынка. Длительная терапия высокими дозами имела побочные эффекты, которые повлияли на сердце. Только в 2008 году препарат снова был одобрен в Германии.

В настоящее время он доступен для профилактики и лечения тошноты и рвоты после операции. Может применяться у взрослых и у детей старше двух лет. Дроперидол может также использоваться для предотвращения тошноты и рвоты от опиоидов при управляемой анальгезии. Контролируемая пациентом анальгезия позволяет пациенту самостоятельно принимать обезболивающее.

Инструкция по применению

Согласно инструкции по применению, у взрослых от 0,625 до 1,25 мг дроперидола используется для профилактики и лечения послеоперационной тошноты и рвоты, а доза снижается у пожилых людей, детей старше 2 лет и у пациентов с печеночной или почечной недостаточностью.

Инструкция также гласит, что инъекция должна быть сделана за полчаса до ожидаемого окончания операции. Для предотвращения тошноты и рвоты, вызванных опиоидами, взрослые будут получать от 15 до 50 мкг дроперидола на мг морфина – максимум до 5 мг в день. Перед использованием рекомендуется проконсультироваться с врачом.

Противопоказания, побочные эффекты, передозировка, лекарственное взаимодействие

Абсолютные противопоказания:

- Гиперчувствительность к активному веществу
- Экстрапирамидные нарушения
- Кесарево сечение
- Возраст до 4 лет.

Дроперидол не следует использовать у пациентов с известными или подозреваемыми удлинненными интервалами QT. Лекарственные средства, которые приводят к увеличению интервала QTс, не должны использоваться одновременно с дроперидолом. Примеры включают антиаритмические средства класса IA.

Лекарственный препарат не обладает тератогенным действием на животных, но вызывает небольшое увеличение смертности новорожденных крыс. Препарат также способствует обезболиванию пациентов, перенесших кесарево сечение, не влияя на дыхание новорожденного. Лекарство также применяется для лечения сильной тошноты и рвоты, возникающих во время беременности.

Сообщений об использовании дроперидола в период лактации не обнаружено. Молекулярный вес достаточно низок, чтобы ожидать выведение с грудным молоком. Поскольку лекарственное средство доступно только в виде инъекционной композиции, вероятность воздействия препарата на младенца ограничена. Эффект воздействия на ребенка неизвестен.

Хотя в прошлом он широко использовался в качестве антипсихотического средства и анестезии, в настоящее время он одобрен FDA только для его применения в качестве противорвотного и противокашлевого средства. Недавно частота выписанных рецептов уменьшилась из-за его эффектов продления интервала QTс.

Согласно клиническим отчетам, наиболее распространенными побочными эффектами являются сонливость и усталость. Реже возникают гипотензия, сердечная аритмия, нейролептический злокачественный синдром и двигательные расстройства – дискинезию и беспокойство или психомоторное возбуждение.

Использование с лекарственными средствами, которые вызывают экстрапирамидные симптомы, такие как метоклопрамид и другие нейролептики, может увеличить частоту этих эффектов и поэтому их следует избегать. Особую осторожность следует соблюдать, когда пациенты принимают лекарства, которые могут вызвать электролитный дисбаланс – диуретики, слабительные и глюкокортикоиды.

Поскольку дроперидол блокирует дофаминовые рецепторы, действие агонистов дофамина – бромокриптин, лизурид и леводопа – может быть ослаблено. Вещества, которые ингибируют активность изоферментов цитохрома P450 CYP1A2 могут замедлять распад дроперидола и продлевать его продолжительность действия.