

Хлорохин - инструкция по применению

Латинское название

Chloroquine*

Фармакологическое действие

Тормозит синтез ДНК и вызывает гибель бесполой эритроцитарных форм всех видов плазмодий, дизентерийной амебы. Связывает свободные радикалы, стабилизирует клеточные и субклеточные мембраны, снижает высвобождение лизосомальных ферментов, подавляет реактивность лимфоцитов, тормозит хемотаксис лейкоцитов, образование дисульфидных связей, угнетает активность нейтральной протеазы и коллагеназы, снижает внутрикапиллярную агрегацию эритроцитов. За счет активного связывания с нуклеиновыми кислотами оказывает цитотоксическое влияние, которое лежит в основе иммунодепрессивного и неспецифического противовоспалительного действия. Снижая высвобождение некоторых лимфокинов, препятствует возникновению клонирования сенсibilизированных клеток, активации системы комплемента и Т-киллеров, подавляет аутоаллергический процесс и сопровождающее его воспаление (преимущественно фазу альтерации). Антиаритмическое действие обусловлено снижением возбудимости сердечной мышцы.

Быстро и почти полностью всасывается из ЖКТ, создавая C_{max} в крови через 2–6 ч. На 55% связывается с альбуминами плазмы крови. В больших концентрациях обнаруживается в органах и тканях (печень, почки, селезенка, легкие). Постоянный уровень в плазме крови создается через 7 дней после начала приема. Легко проникает через ГЭБ и плаценту. В небольшой степени (около 25%) метаболизируется в организме, 70% выводится в неизменном виде. Выделяется из организма медленно: концентрация в плазме крови снижается на 50% в течение 3 дней. Элиминирование осуществляется преимущественно путем экскреции в неизменном виде почками, поэтому при снижении их функции может накапливаться в организме. Подкисление мочи повышает скорость выведения, подщелачивание — снижает. $T_{1/2}$ — 30–60 суток.

Эффективен в отношении всех форм *Plasmodium vivax* и *Plasmodium malariae*, эритроцитарных форм большинства штаммов *Plasmodium falciparum*, тканевых форм дизентерийной амебы.

Показания

Малярия (профилактика и лечение всех видов), внекишечный амебиаз, амебный абсцесс печени, хроническая и подострая формы системной красной волчанки, склеродермия, ревматоидный артрит, фотодерматоз, поздняя кожная порфирия.

Противопоказания

Гиперчувствительность, печеночная и/или почечная недостаточность, угнетение костномозгового кроветворения, выраженные поражения сердечной мышцы (с нарушением ритма), нейтропения, псориатический артрит, порфиринурия, беременность.

С осторожностью

Дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, ретинопатия, эпилепсия, миастения, тяжелые заболевания ЖКТ, одновременный прием гепатотоксических средств.

Побочные действия

Со стороны органов ЖКТ: тошнота, рвота, снижение аппетита, боль в животе.

Со стороны нервной системы и органов чувств: головная боль, головокружение, расстройства сна, психоз, судорожные припадки; при длительном применении — помутнение роговицы, поражение сетчатки глаза, нарушение зрения, звон в ушах.

Со стороны сердечно-сосудистой системы и крови (кроветворение, гемостаз): поражение миокарда с изменениями на ЭКГ, снижение АД, лейкопения, тромбоцитопения.

Аллергические реакции: дерматит, фотосенсибилизация.

Прочие: миалгия, артралгия, изменение цвета кожи и волос, выпадение волос.

Взаимодействие

Антациды нарушают абсорбцию, циметидин повышает концентрацию в плазме крови. Сочетание с другими противомаларийными средствами может дать антагонистический эффект. Несовместим с препаратами золота, пеницилламином, фенилбутазоном, цитостатиками, левамизолом (возрастает нейротоксичность и вероятность возникновения кожных реакций). В комбинации с глюкокортикоидами увеличивает риск развития миопатии и кардиомиопатии, с ингибиторами МАО — токсичность, с этанолом — гепатотоксичность, с сердечными гликозидами — гликозидную интоксикацию.

Способ применения и дозы

Внутрь. Для профилактики малярии в первую неделю 2 раза, затем 1 раз в один и тот же день недели — по 500 мг. Для лечения малярии: 1-й день однократно — 1 г, затем, спустя 6–8 ч, — еще 500 мг, на 2-й и 3-й дни — по 750 мг ежедневно в 1 прием. Амебиаз — по 500 мг 3 раза в сутки в течение 7 дней, затем — по 250 мг 3 раза в сутки еще 7 дней, в дальнейшем в течение 2–6 мес — по 750 мг 2 раза в неделю; ревматоидный артрит — по 250 мг 2 раза в сутки в течение 7 дней, затем — по 250 мг ежедневно в течение 12 мес. При системной красной волчанке — по 250–500 мг ежедневно; фотодерматоз — в течение недели по 250 мг ежедневно, затем еженедельно — по 500–750 мг. Детям в возрасте до 1 года в 1-й день — 50 мг; во 2-й и 3-й дни — 25 мг. Детям 1–6 лет — в 1-й день 125 мг, во 2-й и 3-й дни — 50 мг. Детям 6–10 лет — в 1-й день 250 мг, во 2-й и 3-й дни — 125 мг. Детям 10–15 лет в 1-й день — 500 мг, во 2–3-й дни — 250 мг. При внекишечном амебиазе детям назначают в суточной дозе 6 мг/кг, после 2 нед лечения дозу уменьшают в 2 раза.

Передозировка

Симптомы: головная боль, нарушение сознания, рвота, расстройство зрения, судороги и коллапс. Смерть может наступить в течение 2 ч после приема от угнетения дыхания.

Лечение: промывание желудка; активированный уголь (в дозе, в 5 раз превышающей предполагаемую дозу хлорохина). Возможно применение рвотных средств. Перитонеальный диализ, плазмаферез.

Особые указания

В период лечения необходимо проведение систематических осмотров окулиста, контроль клеточного состава крови.