

УДК 615.242.5

А. Н. БЕЛОВОЛ, И. И. КНЯЗЬКОВА

/Харьковский национальный медицинский университет, Харьков, Украина/

Клиническая фармакология противорвотных средств (антиэметиков)

Резюме

Цель обзора – осветить вопросы клинической фармакологии, показания, побочные эффекты и противопоказания к применению противорвотных средств.

Основные положения. Противорвотное действие могут оказывать вещества, влияющие на разные звенья нервной регуляции. К противорвотным средствам (антиэметикам) относятся: антагонисты серотониновых рецепторов; антагонисты дофаминовых D_2 -рецепторов: производные бензамида (метоклопрамид, триметобензамид), производные фенотиазина (тиэтилперазин, перфеназин), производные бутирофенона (галоперидол); М-холиноблокаторы; антигистаминные (антагонисты H_1 -рецепторов); глюкокортикоиды; антагонисты NK_1 -рецепторов; другие (каннабиноиды, бензодиазепины и др.). В обзоре представлены представители основных классов противорвотных препаратов, их механизм действия, показания, побочные эффекты и противопоказания.

Заключение. Многообразие патогенетических механизмов возникновения тошноты и рвоты предполагает существование множества путей, воздействуя на которые можно целенаправленно проводить профилактику и лечение эметического синдрома. Выбор противорвотного лекарственного средства должен быть адаптирован к индивидуальным потребностям пациента; понимание фармакологических свойств при выборе противорвотного средства необходимо для повышения эффективности и снижения нежелательных побочных эффектов терапии.

Ключевые слова: противорвотные средства (антиэметики), фармакологическое действие, показания, противопоказания, побочные эффекты

Тошнота и рвота – симптомы многих заболеваний и состояний, они могут возникнуть в результате медицинских манипуляций или являться нежелательными эффектами медикаментозной терапии. С ними сталкиваются врачи всех специальностей: специалисты общей практики, педиатры, гастроэнтерологи, онкологи, неврологи, инфекционисты, хирурги, акушеры-гинекологи, оториноларингологи и др., как в условиях стационара, так и в амбулаторной практике, поэтому указанная проблема является междисциплинарной. В частности, в I триместре беременности с этой проблемой сталкиваются до 50–80 % женщин, а hyperemesis gravidarum (неукротимая рвота беременных) является второй по значимости причиной госпитализации пациенток во время беременности (11,4 % всех случаев госпитализаций, не связанных с родами) [1]. Установлено, что до 66 % операций кесарева сечения с применением спинальной анестезии осложняются тошнотой и рвотой различной степени выраженности [2]. Также тошнота и рвота относятся к наиболее частым осложнениям при проведении химиотерапии. Практически весь спектр цитостатических препаратов имеет ряд выраженных побочных эффектов. Причем, до 10 % больных в недавнем прошлом отказывались от химиотерапии или преждевременно прерывали лечение из-за развития непереносимой тошноты и рвоты [3].

Рвота – сложный процесс, включающий подготовительный этап (расслабление желудка и антиперистальтику), натуживание (ритмичные сокращения диафрагмы, межреберных мышц и мышц живота при замкнутой голосовой щели) и собственно рвоту (мощные сокращения мышц живота и расслабление верхнего пищеводного сфинктера). Все это сопровождается вегетативными реакциями, включая слюнотечение, дрожь и вазомоторные изменения. При длительной рвоте могут развиваться психические

нарушения – сонливость, депрессия, аутизм [4]. Рвоту регулирует рвотный центр в латеральной ретикулярной формации ствола мозга рядом с хеморецепторной триггерной зоной в самом заднем поле (area postrema) на дне IV желудочка, а также ядро одиночного пути блуждающего нерва. Отсутствие гематоэнцефалического барьера позволяет триггерной зоне улавливать появление в крови или спинномозговой жидкости токсичных веществ, после чего эта зона посылает импульсы в рвотный центр, куда поступают также импульсы из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) (по блуждающему нерву через ядро одиночного пути и, в меньшей степени, по чревным нервам). Кроме того, связи со рвотным центром образуют кора больших полушарий и вестибулярный аппарат, что имеет значение в патогенезе соответственно рефлекторной рвоты и рвоты при укачивании [5]. Из рвотного центра импульсы идут к сосудодвигательному и дыхательному центрам, слюноотделительным ядрам и, через соответствующие пути, к скелетным и гладким мышцам, участвующим в рвотном рефлексе. Триггерная зона содержит много $5-HT_3$ -рецепторов, D_2 -рецепторов и опиатных рецепторов, ядро одиночного пути – опиатные и H_1 -рецепторы, М-холинорецепторы, а также $5-HT_3$ -рецепторы [6]. В рвотном рефлексе участвует множество медиаторов; их исследование легло в основу рационального подхода к лечению тошноты и рвоты.

Рвоту и обычно сопутствующую ей тошноту рассматривают как защитный рефлекс, призванный очистить желудок и кишечник от токсичных веществ (в частности, при пищевом и алкогольном отравлении) и прекратить их всасывание в желудочно-кишечном тракте [7]. В то же время, особое место подавлению тошноты и рвоты отводится при лечении других состояний, включающих побочные эффекты химиотерапии, при проведении общей анестезии.

тезии, в послеоперационном периоде, во время беременности, при других заболеваниях (например, гастропарез, инфаркт миокарда задней стенки левого желудочка, мигрень, почечная недостаточность и др.).

Противорвотное действие могут оказывать вещества, влияющие на разные звенья нервной регуляции.

Классификация противорвотных средств (антиэметиков)

1. Антагонисты серотониновых рецепторов.
2. Антагонисты дофаминовых D_2 -рецепторов:
 - производные бензамида (метоклопрамид, триметобензамид);
 - производные фенотиазина (тиэтилперазин, перфеназин);
 - производные бутирофенона (галоперидол).
3. М-холиноблокаторы.
4. Антигистаминные (антагонисты H_1 -рецепторов).
5. Глюкокортикоиды.
6. Антагонисты NK_1 -рецепторов.
7. Другие (каннабиноиды, бензодиазепины и др.).

Представители основных классов противорвотных препаратов, их механизм действия приведены в таблице 1.

Показания к назначению противорвотных препаратов:

- тошнота и рвота любого происхождения;
- тошнота и рвота при лучевом лечении и химиотерапии онкологических больных;
- вестибулярное головокружение;
- морская болезнь;
- нарушения моторики желудочно-кишечного тракта (в частности, диабетический гастропарез);
- послеоперационные тошнота и рвота.

В таблице 2 суммированы показания к применению и основные побочные эффекты отдельных классов противорвотных препаратов.

Антагонисты серотониновых рецепторов (антагонисты $5-HT_3$ -рецепторов)

Этот класс препаратов занимает ведущее место среди

Таблица 1. Противорвотные препараты [7–9]

Класс препаратов	Представители	Механизм действия
Антагонисты серотониновых рецепторов (антагонисты $5-HT_3$ -рецепторов)	Доласетрон Ондансетрон Гранисетрон Палonosетрон	<ul style="list-style-type: none"> • антагонист $5-HT_3$-рецепторов • угнетает центральные звенья рвотного рефлекса, блокируя $5-HT_3$-рецепторы дна IV желудочка (area postrema) • блокирует пресинаптические мембраны серотониновых $5-HT_3$-рецепторов периферической нервной системы (афферентные волокна блуждающего нерва в кишечнике)
Антагонисты дофаминовых D_2 -рецепторов	Прохлорперазин	<ul style="list-style-type: none"> • антагонист D_2-рецепторов • центральный противорвотный эффект реализуется через area postrema
	Метоклопрамид	<ul style="list-style-type: none"> • антагонист D_2-рецепторов, антагонист серотониновых рецепторов • центральный противорвотный эффект реализуется через area postrema • периферический противорвотный эффект обусловлен блокадой периферических D_2-дофаминовых рецепторов, следствием чего является уменьшение восприятия сигналов с афферентных висцеральных нервов • прокинетическое действие на ЖКТ: стимулирует двигательную активность верхнего отдела ЖКТ (в т.ч. регулирует тонус нижнего пищеводного сфинктера в покое) и нормализует его моторную функцию. Усиливает тонус и амплитуду желудочных сокращений (особенно антрального отдела), расслабляет сфинктер привратника и луковицы двенадцатиперстной кишки, повышает перистальтику и ускоряет опорожнение желудка
	Домперидон	<ul style="list-style-type: none"> • антагонист D_2-рецепторов • центральный противорвотный эффект реализуется через area postrema • прокинетическое действие на ЖКТ
М-холиноблокаторы	Производные скопаламина (гиосцина бутилбромид)	<ul style="list-style-type: none"> • неспецифический мускариновый антагонист • центральный противорвотный эффект реализуется через area postrema и вестибулярную систему • периферический противорвотный эффект опосредуется ингибированием блуждающего нерва
Антигистаминные (антагонисты H_1 -рецепторов)	Меклизин Дифенгидрамин Дименгидринат Доксиламин Прометазин	<ul style="list-style-type: none"> • антагонисты H_1-рецепторов • центральный противорвотный эффект, по-видимому, опосредуется путем взаимодействия глюкокортикоидных рецепторов в nucleus solitarius (ядро одиночного пути)
Глюкокортикоиды	Дексаметазон Метилпреднизолон	<p>Окончательно механизм неизвестен</p> <ul style="list-style-type: none"> • центральный противорвотный эффект реализуется через area postrema и вестибулярную систему
Антагонисты NK_1 -рецепторов	Апрепитант Фозапрепитант	<ul style="list-style-type: none"> • антагонист NK_1-рецепторов • центральный противорвотный эффект реализуется через NK_1-рецепторы в nucleus solitarius
Каннабиноиды	Дронабинол Набилон	<ul style="list-style-type: none"> • агонист CB_1- и CB_2-рецепторов • центральный противорвотный эффект предполагается через area postrema • периферический противорвотный эффект, как предполагается, связан с влиянием на моторику ЖКТ
Бензодиазепины	Лоразепам	<ul style="list-style-type: none"> • агонист ГАМК-рецепторов • центральное противорвотное действие, как предполагается, обусловлено депрессией хеморецепторной триггерной зоны

Таблиця 2. Показания и побочные эффекты некоторых противорвотных препаратов [7–9]

Представители	Показания	Побочные эффекты
Антагонисты серотониновых рецепторов (антагонисты 5-HT₃-рецепторов)		
Ондансетрон	<ul style="list-style-type: none"> профилактика и купирование тошноты и рвоты, развивающихся на фоне химиотерапии, лучевой терапии профилактика и купирование послеоперационной тошноты и рвоты 	<ul style="list-style-type: none"> головная боль запор или диарея преходящее бессимптомное повышение активности печеночных трансаминаз удлинение интервала QT (torsades de pointes) аллергические реакции серотониновый синдром
Антагонисты дофаминовых D₂-рецепторов		
Прохлорперазин	<ul style="list-style-type: none"> антипсихотический препарат неукротимая рвота беременных (hyperemesis gravidarum) 	<ul style="list-style-type: none"> депрессия повышенная утомляемость диарея гиперпролактинемия
Метоклопрамид Домперидон	<ul style="list-style-type: none"> прокиннетическое действие, применяется при диабетическом и послеоперационном гастропарезе; неукротимая рвота беременных (hyperemesis gravidarum) 	<ul style="list-style-type: none"> передозировка приводит к обратимому экстрапирамидному синдрому (дистония, паркинсонизм, акатизия) и злокачественному нейролептическому синдрому Антидот: бипериден (антихолинергический препарат центрального действия) не рекомендуется комбинировать метоклопрамид с антипсихотиками, в связи с увеличением риска дискинезии Домперидон может приводить к развитию аритмий сердца
M-холиноблокаторы		
Гиосцина бутилбромид	<ul style="list-style-type: none"> морская болезнь тошнота и рвота при нарушениях вестибулярного аппарата 	<ul style="list-style-type: none"> холинолитические побочные эффекты: сухость во рту, мидриаз, нарушение зрения, уменьшение кишечных шумов, задержка мочи (антидот – физостигмин)
Антигистаминные (антагонисты H₁-рецепторов)		
Дифенгидрамин	<ul style="list-style-type: none"> при тошноте и рвоте, обусловленной вестибулярными нарушениями (морская и воздушная болезнь и др.) при тошноте и рвоте беременных 	<ul style="list-style-type: none"> холинолитические побочные эффекты: сухость во рту, мидриаз, тахикардия, затрудненное мочеиспускание Антидотом является физостигмин (ингибитор холинэстеразы)
Глюкокортикоиды		
Дексаметазон Метилпреднизолон	<ul style="list-style-type: none"> профилактика тошноты и рвоты, развивающихся на фоне химиотерапии профилактика и купирование послеоперационной тошноты и рвоты неукротимая рвота беременных (hyperemesis gravidarum) 	<ul style="list-style-type: none"> синдром Кушинга гипергликемия
Антагонисты NK₁-рецепторов		
Апрепитант Фозапрепитант	<ul style="list-style-type: none"> профилактика тошноты и рвоты, развивающихся на фоне химиотерапии 	<ul style="list-style-type: none"> гипертензивные реакции реакции в месте инфузии увеличение концентрации других препаратов вследствие ингибирования фермента CYP3A4
Каннабиноиды		
Дронабинол Набилон	<ul style="list-style-type: none"> купирование рвоты, развивающейся на фоне химиотерапии анорексия, приведшая к потере веса у больных СПИДом 	<ul style="list-style-type: none"> атаксия, головокружение, сухость во рту дисфория паранойя, галлюцинации абдоминальная боль парадоксальное ухудшение – возвратная тошнота и рвота
Бензодиазепины		
Лоразепам	<ul style="list-style-type: none"> профилактика и купирование тошноты и рвоты, развивающихся на фоне химиотерапии 	<ul style="list-style-type: none"> вялость, утомляемость, сонливость атаксия, головокружение эпизоды амнезии нарушение зрения угнетение дыхания

средств, применяемых для купирования эметогенного побочного действия противоопухолевых препаратов [10–12]. Препараты отличаются главным образом по строению, сродству к 5-HT₃-рецепторам и фармакокинетике.

Показана тенденция к увеличению эффективности у новых 5-HT₃-антагонистов (палонсетрон) [13], а также при совместном назначении с глюкокортикостероидами. Сообщается о повышении эффективности при сочетании с D₂-антагонистами (метоклопрамид, ализаприд, метопимазин) [14]. Также следует отметить анальгетический потенциал антагонистов 5-HT₃-

рецепторов. Отмечено, что ондансетрон уменьшает выраженность нейропатической боли [15]. Выявлена высокая антиноцицептивная активность трописетрона у пациентов с фибромиалгией [16], а рамосетрона – при диарейной форме синдрома раздраженной кишки [17].

Установлена высокая эффективность трописетрона, ондансетрона и гранисетрона при применении для профилактики интраоперационной и послеоперационной тошноты и рвоты, если ведущим механизмом их развития является стимуляция 5HT₃-рецепторов [18].

Антагонисты D₂-рецепторов

Фенотиазины (прохлорперазин, тиэтилперазин и хлорпромазин) – одни из наиболее распространенных противорвотных средств. Их действие сложно, но в первую очередь оно включает блокаду D₂-рецепторов в хеморецепторной триггерной зоне. При рвоте на фоне химиотерапии фенотиазины уступают метоклопрамиду и ондансетрону, однако их действие на H₁-рецепторы и M-холинорецепторы имеет значение при других видах тошноты и рвоты, например, при укачивании.

Долгие годы стандартным препаратом при рвоте на фоне химиотерапии оставался метоклопрамид. Его действие связывали с блокадой D₂-рецепторов в хеморецепторной триггерной зоне, позже был найден дополнительный механизм – блокада 5-HT₃-рецепторов. Вклад в действие препарата может вносить и стимуляция моторики ЖКТ. Домперидон – еще один блокатор D₂-рецепторов с противорвотным действием и прокинетиическими свойствами. Его основное преимущество перед метоклопрамидом – плохое проникновение в головной мозг и отсутствие побочного действия на ЦНС.

M-холиноблокаторы

Наиболее распространенным лекарством класса M-холиноблокаторов, используемым в качестве противорвотного средства, являются производные скопаламина (гиосцина бутилбромид).

Блокаторы гистаминовых H₁-рецепторов

Блокаторы гистаминовых H₁-рецепторов (циклизин, прометазин, дифенгидрамин и др.) применяются главным образом при рвоте в послеоперационном периоде и при укачивании. Антигистаминные препараты блокируют действие гистамина на H₁-рецепторы. Этот класс препаратов ограничивает стимуляцию рвотного центра вестибулярной системой (которая содержит гистамин в больших количествах), однако минимально воздействует на афферентную висцеральную стимуляцию. Циклизин в Украине не зарегистрирован.

Глюкокортикоиды

Глюкокортикоиды бывают полезным дополнением к противорвотным средствам у онкологических больных; действие этих препаратов связывают с уменьшением воспаления вокруг опухоли и подавлением синтеза простагландинов.

Антагонисты NK₁-рецепторов

Противорвотное действие обусловлено блокадой NK₁-рецепторов (субстанции P). Субстанция P относится к тахикининам (нейрокининам) и содержится в чувствительных волокнах блуждающего нерва, идущих к ядру одиночного пути (nucleus solitarius) и хеморецепторной триггерной зоне. Таким образом, нейрокининовые рецепторы – перспективная точка приложения новых противорвотных средств.

Каннабиноиды

Дронабинол – природный каннабинол, его синтезируют или выделяют из конопли посевной, *Cannabis sativa*. Механизм действия дронабинола не ясен, предполагается стимуляция каннабиноидных CB₁-рецепторов в нейронах рвотного центра и прилежащих отделов ЦНС. Дронабинол помогает предотвратить рвоту на фоне химиотерапии при неэффективности других средств. Кроме того, он улучшает аппетит и используется при

снижении аппетита у больных СПИДом. При алкоголизме или наркомании в анамнезе дронабинол назначают с крайней осторожностью, поскольку велик риск злоупотребления.

Бензодиазепины

Бензодиазепины обладают слабым противорвотным эффектом, но благодаря седативному, анксиолитическому и амнестическому действию они помогают при рефлекторной тошноте и рвоте.

Противопоказания к назначению противорвотных препаратов.

Антагонисты D₂-рецепторов:

- кишечная непроходимость;
 - пролактинзависимые опухоли;
 - болезнь Паркинсона.
- Антагонисты серотониновых рецепторов:
- тяжелые заболевания печени;
 - удлинённый интервал QT.

M-холиноблокаторы и антагонисты H₁-рецепторов:

- тахикардии, сердечная недостаточность;
- задержка мочи, доброкачественная гиперплазия предстательной железы;
- глаукома;
- пилорический стеноз.

Выводы

Многообразие патогенетических механизмов возникновения тошноты и рвоты предполагает существование множества путей, воздействуя на которые можно целенаправленно проводить профилактику и лечение эметического синдрома. Выбор противорвотного лекарственного средства должен быть адаптирован к индивидуальным потребностям пациента; понимание фармакологических свойств при выборе противорвотного средства необходимо для повышения эффективности и снижения нежелательных побочных эффектов терапии.

Дополнительная информация. Авторы заявляют об отсутствии конфликта интересов.

Список использованной литературы

1. King T. Evidence-Based Approaches to Managing Nausea and Vomiting in Early Pregnancy / T. King, P. Murphy // J. Midwifery Womens Health. – 2009. – No. 54 (6). – P. 430–444.
2. Preoperative intravenous fluid therapy decreases postoperative nausea and pain in high risk patients / C. H. Maharaj, S. R. Kallam, A. Malik, P. Hassett // Anaesthesia and Analgesia. – 2005. – Vol. 100, No. 3. – P. 675–682.
3. Consensus proposals for the prevention of acute and delayed vomiting and nausea following high – emetic-risk chemotherapy / M. G. Kris, P. J. Hesketh, J. Herrstedt [et al.] // Support Care Cancer. – 2005. – Vol. 13. – P. 85–96.
4. Гастроэнтерологія : підручник у 2-х томах / за ред. Харченко Н. В., Бабака О. Я. – 2-е вид., переробл., доповн. – Кіровоград : Поліум, 2016. – Т. 1. – 488 с.
5. Рациональная диагностика и фармакотерапия заболеваний внутренних органов [руководство] / Нац. акад. мед. наук України, ГУ «Ин-т терапии им. Л. Т. Малой НАМН України»; [авт. сост. Бабака О. Я. и др.]; под ред. акад. НАМНУ А. Н. Беловола. – К. : Здоров'я України, 2013. – 703 с.
6. Рациональная фармакотерапия заболеваний органов пищеварения : рук. для практикующих врачей / В. Т. Ивашкин, Т. Л. Лапина и др. – М. : Литера, 2003. – 1046 с.
7. Клінічна фармакологія : підручник / за ред. О. Я. Бабака, О. М. Біловола, І. С. Чекмана. – 2-ге вид., перероб. і доп. – К. : Медицина, 2013. – 774 с.
8. Сайт «Державний реєстр лікарських засобів України». – URL: <http://www.drz.kiev.ua/>
9. Клиническая фармакология по Гудману и Гилману / под общей редакцией А. Г. Гилмана. – М. : Практика, 2006. – 1648 с.

10. Thompson A. J. Recent developments in 5-HT₃ receptor pharmacology / A. J. Thompson // Trends Pharmacol. Sci. – 2013. – Vol. 34, No. 2. – P. 100–109.
11. Navari R. M. 5-HT₃ receptors as important mediators of nausea and vomiting due to chemotherapy / R. M. Navari // Biochim. Biophys. Acta. – 2015. – Vol. 1048, No. 10 (B). – P. 2738–2746.
12. Nakamura H. Theoretical evaluation of antiemetic effects of 5-HT₃ receptor antagonists for prevention of vomiting induced by cisplatin / H. Nakamura, H. Yokoyama, R. Takayanagi // Eur. J. Drug Metab. Pharmacokin. – 2015. – Vol. 4, No. 1. – P. 39–44.
13. Абрамов М. Е. Палонсетрон в профилактике тошноты и рвоты при проведении высоко и умеренно эметогенной химиотерапии [Текст] / М. Е. Абрамов, К. С. Лодыгина // Фарматека. – 2014. – Т. 8, № 281. – С. 29–34.
14. Oechsle K. Aprepitant as salvage therapy in patients with chemotherapy-induced nausea and emesis refractory to prophylaxis with 5-HT₃ antagonists and dexamethasone / K. Oechsle, M. R. Muller, J. T. Hartmann [et al.] // Oncologie. – 2006. – Vol. 29, No. 12. – P. 557–561.
15. McClean G. J. Does a single intravenous injection of the 5HT₃ receptor antagonist ondansetron have an analgesic effect in neuropathic pain? A double-blinded, placebo-controlled cross-over study / G. J. McClean, R. Suzuki, A. H. Dickenson // Anest. Analg. – 2003. – Vol. 97, No. 5. – P. 1474–1478.
16. Spath M. Efficacy and tolerability of intravenous tropisetron in the treatment of fibromyalgia / M. Spath, T. Stratz, G. Neeck [et al.] // Scand. J. rheumatol. – 2004. – Vol. 33, No. 4 – P. 267–370.
17. Min Y. W. The clinical potential of ramosetron in the treatment of irritable bowel syndrome with diarrhea (IBS-D) / Y. W. Min, P. L. Rhee // Therap. Adv. Gastroenterol. – 2015. – Vol. 8, No. 3. – P. 136–142.
18. A risk adapted approach reduces the overall institutional incidence of postoperative nausea and vomiting / A. Biedler [et al.] // Canadian journal of anaesthesia. – 2004. – Vol. 51, No. 1. – P. 13–19.

Резюме

Клінічна фармакологія протиблювотних засобів (антиеметиків)

О. М. Біловол, І. І. Князькова

Харківський національний медичний університет, Харків, Україна

Мета огляду – висвітлити питання клінічної фармакології, показання, побічні ефекти і протипоказання до застосування протиблювотних засобів.

Основні положення. Протиблювотну дію можуть чинити речовини, що впливають на різні ланки нервової регуляції. До протиблювотних засобів (антиеметиків) належать: антагоністи серотонінових рецепторів; антагоністи дофамінових D₂-рецепторів: похідні бензаміду (метоклопрамід, тримето-бензамід), похідні фенотіазину (тіетилперазин, перфеназин), похідні бутирофенону (галоперидол); М-холіноблокатори; антигістамінні (антагоністи H₁-рецепторів); глюкокортикоїди; антагоністи NK₁-рецепторів; інші (канабіноїди, бензодіазепіни тощо). В огляді проаналізовані представники основних класів протиблювотних препаратів, їх механізм дії, показання, побічні ефекти і протипоказання.

Висновок. Різноманіття патогенетичних механізмів виникнення нудоти і блювання передбачає існування безлічі шляхів, впливаючи на які можна цілеспрямовано проводити профілактику і лікування еметичного синдрому. Вибір протиблювотного лікарського засобу повинен бути адаптований до індивідуальних потреб пацієнта; розуміння фармакологічних властивостей при виборі протиблювотного засобу необхідне для підвищення ефективності і зниження небажаних побічних ефектів терапії.

Ключові слова: протиблювотні засоби (антиеметики), фармакологічна дія, показання, протипоказання, побічні ефекти

Summary

Clinical pharmacology of antiemetics (antiemetics)

A. N. Belovol, I. I. Knyazkova

Kharkov National Medical University, Kharkov, Ukraine

The purpose of the review – is to highlight the issues of clinical pharmacology, indications, side effects and contraindications for the use of antiemetics.

The main provisions. The antiemetic effect can be exerted by substances that affect different parts of the nervous regulation. Antiemetics (antiemetics) include: serotonin receptor antagonists; dopamine D₂ receptor antagonists: benzamide derivatives (metoclopramide, trimethobenzamide), phenothiazine derivatives (thiethylperazine, perphenazine), butyrophenone derivatives (haloperidol); M-anticholinergics; antihistamines (H₁ receptor antagonists); glucocorticoids; NK₁ receptor antagonists; others (cannabinoids, benzodiazepines, etc.). The review presents representatives of the main classes of antiemetic drugs, their mechanism of action, indications, side effects and contraindications.

Conclusion. The variety of pathogenetic mechanisms of the occurrence of nausea and vomiting suggests the existence of many paths, affecting which it is possible to purposefully prevent and treat the emetic syndrome. The choice of an antiemetic drug should be adapted to the individual needs of the patient; an understanding of the pharmacological properties when choosing an antiemetic is necessary to increase the effectiveness and reduce the undesirable side effects of therapy.

Key words: antiemetics (antiemetics), pharmacological action, indications, contraindications, side effects