Актасулид



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки круглые, ровные, светло-желтого цвета, с разделительной чертой с одной стороны.

	1 таб.
нимесулид	100 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, кремния диоксид, повидон К-30, магния стеарат.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВС из класса сульфон-анилидов. Является селективным конкурентным ингибитором циклооксигеназы-2 (ЦОГ-2) - фермента, участвующего в синтезе простагландинов - медиаторов отека, воспаления и боли. Оказывает противовоспалительное, анальгезирующее и выраженное жаропонижающее действие.

Обратимо ингибирует образование простагландина E_2 как в очаге воспаления, так и в восходящих путях ноцицептивной системы, включая пути проведения болевых импульсов спинного мозга.

Снижает концентрацию короткоживущего простагландина H_2, из которого под действием простагландин-изомеразы образуется простагландин E_2. Уменьшение концентрации простагландина EP ведет к снижению степени активации простаноидных рецепторов EP типа, что выражается в анальгетическом и противовоспалительном эффектах.

В незначительной степени действует на ЦОГ-1, практически не препятствуя образованию простагландина E_2 из арахидоновой кислоты в физиологических условиях, благодаря чему снижается количество побочных эффектов препарата. Препарат также подавляет агрегацию тромбоцитов путем ингибирования синтеза эндопероксидов и тромбоксана A_2, ингибирует синтез фактора агрегации тромбоцитов, тормозит активацию плазминогена путем увеличения концентрации ингибитора-1. Подавляет высвобождение гистамина, а также уменьшает степень бронхоспазма, вызванного воздействием гистамина и ацетальдегида. Ингибирует высвобождение фактора некроза опухолей α, обуславливающего образование цитокининов.

Показано, что нимесулид способен подавлять синтез интерлейкина-6 и урокиназы, тем самым препятствуя разрушению хрящевой ткани. Ингибирует синтез металлопротеаз (эластазы, коллагеназы), предотвращая разрушение протеогликанов и коллагена хрящевой ткани.

Обладает антиоксидантными свойствами, тормозит образование токсических продуктов распада кислорода за счет уменьшения активности миелопероксидазы. Взаимодействует с глюкокортикоидными рецепторами, активируя их путем фосфориляции, что также усиливает противовоспалительное действие препарата.

Фармакокинетика

Абсорбция при приеме внутрь - высокая. Прием пищи снижает скорость абсорбции, не оказывая влияния на ее степень. Время достижения C_{max} активного вещества в плазме крови - 1.5-2.5 ч. Связь с белками плазмы составляет 95%, с эритроцитами - 2%, с липопротеинами -1%, с кислыми α1-гликопротеидами - 1%.

Доза препарата не влияет на степень его связывания с белками крови. C_{max} нимесулида в плазме крови достигает 3.5-6.5 мг/л. V_d - 0.19-0.35 л/кг. Проникает в ткани женских половых органов, где после однократного приема его концентрация составляет около 40% от концентрации в плазме. Хорошо проникает в кислую среду очага воспаления (40%), синовиальную жидкость (43%). Легко проникает через гистогематические барьеры.

Метаболизируется в печени тканевыми монооксигеназами. Основной метаболит - 4-гидроксинимесулид (25%) обладает сходной фармакологической активностью.

$T_{1/2}$ нимесулида составляет 1.56-4.95 ч, 4-гидроксинимесулида - 2.89-4.78 ч. 4-гидроксинимесулид выводится почками (65%) и с желчью (35%). У больных с почечной недостаточностью (клиренс креатинина 1.8-4.8 л/ч или 30-80 мл/мин), а также у детей и лиц пожилого возраста фармакокинетический профиль нимесулида существенно не меняется.

Показания к применению:

— ревматоидный артрит;

— остеоартроз;

— артриты различной этиологии;

— артралгии;

— миалгии;

— послеоперационные и посттравматические боли;

— бурсит;

— тенденит;

— альгодисменорея;

— зубная и головная боль.

Относится к болезням:

- Альгодисменорея
- Артралгия
- Артрит
- Артроз
- Бурсит
- Головная боль
- Миалгия
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Ревматоидный артрит

Противопоказания:

— гиперчувствительность;

— эрозивно-язвенные поражения ЖКТ (в фазе обострения);

— кровотечения из ЖКТ;

— внутричерепные кровоизлияния;

— "аспириновая" астма;

— печеночная недостаточность;

— почечная недостаточность (КК менее 30 мл/мин);

— тяжелая сердечная недостаточность;

— беременность;

— период лактации;

— детский возраст (до 12 лет).

С осторожностью: артериальная гипертензия, сердечная недостаточность, сахарный диабет 2 типа.

Способ применения и дозы:

Внутрь по 1 таб. (100 мг) 2 раза/сут. Таблетки принимают с достаточным количеством воды предпочтительно до еды. При наличии заболеваний ЖКТ препарат желательно принимать в конце еды или после приема пищи.

Детям старше 12 лет назначают из расчета разовой дозы 1.5 мг/кг массы тела ребенка 2-3 раза/сут, максимальная суточная доза препарата - 5 мг/кг. **Подросткам с массой тела свыше 40 кг** - 100 мг не более 2 раз/сут.

Побочное действие:

Частота классифицируется по рубрикам, в зависимости от встречаемости случая: очень часто (>1/10), часто (<1/10, но >1/100), нечасто (<1/100, но >1/1000), редко (<1/1000, но >1/10000), очень редко (<1/10000).

Со стороны пищеварительной системы: часто - диарея, тошнота, рвота; нечасто - запор, метеоризм, гастрит; очень редко - боли в животе, стоматит, дегтеобразный стул, желудочно-кишечное кровотечение, язва и/или перфорация желудка или двенадцатиперстной кишки.

Со стороны ЦНС: нечасто - головокружение; редко - ощущение страха, нервозность, кошмарные сновидения; очень редко - головная боль, сонливость, энцефалопатия (синдром Рейе).

Со стороны дыхательной системы: нечасто - одышка; очень редко - бронхиальная астма, бронхоспазм.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - артериальная гипертензия; редко - тахикардия, геморрагии, «приливы».

Со стороны органов чувств: редко - нечеткость зрения, очень редко - головокружение.

Со стороны кожных и слизистых покровов: нечасто - зуд, сыпь, усиление потоотделения; редко - эритема, дерматит; очень редко - крапивница, ангионевротический отек, отечность лица, многоформная экссудативная эритема, в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Со стороны печени и желчевыводящей системы: часто - повышение печеночных трансаминаз; очень редко - гепатит, молниеносный гепатит, желтуха, холестаз.

Со стороны почек и мочевыводящей системы: нечасто - отеки; редко - дизурия, гематурия, задержка мочи, гиперкалиемия; очень редко - почечная недостаточность, олигурия, интерстициальный нефрит.

Со стороны системы кроветворения: редко - анемия, эозинофилия; очень редко - тромбоцитопения, панцитопения, пурпура, удлинение времени кровотечения.

Аллергические реакции: редко - реакции гиперчувствительности; очень редко - анафилактоидные реакции.

Общие реакции: редко - общая слабость; очень редко - гипотермия.

В случае появления других, не упомянутых выше побочных действий или ухудшения самочувствия следует незамедлительно обратиться к врачу.

Передозировка:

Симптомы: апатия, сонливость, тошнота, рвота. Они, как правило, обратимы при оказании поддерживающего ухода за больными. Может возникнуть желудочно-кишечное кровотечение, артериальная гипертензия, острая почечная недостаточность, угнетение дыхания.

Лечение: требуется симптоматическое лечение пациента и поддерживающий уход за ним. Специфического антидота нет. В случае, если передозировка произошла в течение последних 4 часов, необходимо вызвать рвоту, обеспечить прием активированного угля, (60-100 г на взрослого человека), осмотических слабительных. Форсированный диурез и гемодиализ не эффективны из-за высокой связи препарата с белками.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан во время беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Действие препаратов, уменьшающих свертываемость крови, усиливается при их одновременном применении с нимесулидом.

Нимесулид может снижать действие фуросемида.

Нимесулид может увеличивать возможность наступления побочных действий при одновременном приеме метотрексата.

Уровень лития в плазме повышается при одновременном приеме препаратов лития и нимесулида.

Из-за высокой степени связывания нимесулида с белками плазмы пациенты, которых одновременно лечат гидантоином и сульфаниламидами, должны находиться под наблюдением врача, проходя обследование через короткие промежутки времени.

Нимесулид может усиливать действие циклоспорина на почки.

Особые указания и меры предосторожности:

Актасулид следует применять с осторожностью пациентам, у которых наблюдалась склонность к кровотечениям, пациентам с заболеваниями верхних отделов ЖКТ или пациентам, получающим лекарственные средства, уменьшающие свертываемость крови, или препараты, подавляющие агрегацию тромбоцитов.

Поскольку Актасулид частично выводится почками, дозу для пациентов с нарушениями функции почек следует уменьшать в зависимости от уровня мочевыделения.

Учитывая сообщения о нарушениях зрения у пациентов, принимавших другие НПВС, лечение должно быть немедленно прекращено в случае появления любого нарушения зрения, и пациента должен обследовать врач-окулист.

Препарат может вызвать задержку жидкости в тканях, поэтому пациентам с высоким АД и с нарушениями сердечной деятельности Актасулид должен применяться с особой осторожностью. Пациентам следует проходить регулярный врачебный контроль, если они наряду с Актасулидом принимают препараты, оказывающие влияние на ЖКТ.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациенты, чья трудовая деятельность требует сосредоточенности (постоянного внимания), должны знать о том, что препарат может вызывать сонливость или головокружение.

При нарушениях функции почек

Препарат противопоказан при почечной недостаточности (КК менее 30 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям до 12 лет.

Детям старше 12 лет назначают из расчета разовой дозы 1.5 мг/кг массы тела ребенка 2-3 раза/сут, максимальная суточная доза препарата - 5 мг/кг. **Подросткам с массой тела свыше 40 кг** - 100 мг не более 2 раз/сут.

Условия хранения:

Хранить при температуре не выше 25°С, в защищенном от света и недоступном для детей месте.

Препарат не следует применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Aktasulid