Азатиоприн

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Азатиоприн

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки светло-желтого или светло-желтого с зеленоватым оттенком цвета.

	1 таб.
азатиоприн	50 мг

Вспомогательные вещества: желатин, крахмал картофельный, сахар молочный, кальция стеарат.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Иммунодепрессант из группы антиметаболитов. Являясь структурным аналогом аденина, гипоксантина и гуанина, входящих в состав нуклеиновых кислот, Азатиоприн блокирует клеточное деление и пролиферацию тканей.

Иммунодепрессивное действие Азатиоприна направлено преимущественно на реакции замедленной гиперчувствительности и клеточную цитотоксичность. Подавляет реакцию тканевой несовместимости. В меньшей степени действует на синтез антител. По сравнению с меркаптопурином обладает более выраженным иммунодепрессивным действием, при меньшей цитостатической активности.

Фармакокинетика

После приема внутрь Азатиоприн хорошо всасывается из ЖКТ. Связывание с белками низкое (примерно 30%). В организме биотрансформируется с образованием 6-меркаптопурина и 6-тиоинозиновой кислоты (активные метаболиты). Активное вещество проникает в ткани в небольших концентрациях; наименьшее количество азатиоприна определяется в мозге. $T_{1/2}$ для азатиоприна и его активных метаболитов - около 5 ч. C_{max} в плазме крови достигается через 1-2 ч после приема внутрь. Выводится практически полностью через печень с желчью, через почки - не более 1-2%.

Показания к применению:

— профилактика реакции отторжения трансплантата (в составе комбинированной терапии);

— ревматоидный артрит;

— хронический активный гепатит;

— системная красная волчанка;

— неспецифический язвенный колит;

— дерматомиозит;

— миастения;

— узелковый периартериит;

— вульгарная пузырчатка;

— аутоиммунный гломерулонефрит;

— идиопатическая тромбоцитопеническая пурпура;

— псориаз.

Относится к болезням:

- Артрит
- Артроз
- Волчанка
- Гепатит
- Гепатоз
- Дерматит
- Дерматомиозит
- Колит
- Периартериит
- Псориаз
- Пузырчатка
- Ревматоидный артрит
- Тромбоз

Противопоказания:

— беременность;

— повышенная чувствительность к азатиоприну и/или меркаптопурину.

Способ применения и дозы:

Устанавливают индивидуально с учетом показаний, тяжести течения заболевания, дозировки одновременно назначаемых препаратов.

Для *профилактики реакции отторжения трансплантата* применяют в комплексной терапии (как правило, совместно с циклоспорином и кортикостероидами) ударную дозу до 5 мг/кг внутрь в 2-3 приема в течение 1-2 месяцев. Затем назначают поддерживающую терапию от 1 мг/кг до 4 мг/кг внутрь в течение длительного срока (нескольких лет). При отмене препарата дозу необходимо снижать постепенно. В случае возникновения признаков отторжения трансплантата суточную дозу вновь повышают до 4 мг/кг.

При *других заболеваниях* обычно назначают по 1.5-2 мг/кг/сут в 3-4 приема.

В случае необходимости суточная доза может быть увеличена до 200-250 мг в 2-4 приема. Длительность курса лечения устанавливается индивидуально.

При *ревматоидном артрите* **-** по 1-2.5 мг/кг/сут в 1-2 приема. Курс лечения - не менее 12 недель. Поддерживающая доза составляет 0.5 мг/кг 1 раз/сут.

При *хроническом активном гепатите* суточная доза составляет 1-1.5 мг/кг.

Побочное действие:

Миелодепрессия (лейкопения, тромбоцитопения, анемия), развитие вторичных инфекций, мегалобластный эритропоэз и макроцитоз, тошнота, рвота, анорексия, кожная сыпь, артралгии, миалгии, эрозивно-язвенные поражения полости рта и губ, лекарственная аллергия, холестатический гепатит, токсический гепатит.

У реципиентов трансплантатов возможны панкреатит, эрозивно-язвенные поражения и кровотечения из ЖКТ, некроз и перфорация кишечника.

Имеются единичные сообщения о развитии острой почечной недостаточности, гемолитической анемии, острых легочных заболеваниях, менингеальных реакций.

В экспериментальных исследованиях установлено тератогенное, эмбриотоксическое и канцерогенное действие.

У больных возможны злокачественные новообразования.

Передозировка:

Симпотомы: панцитопения, нарушения функции печени (повышение концентрации билирубина и трансаминаз в плазме крови), усиление других побочных эффектов.

Лечение: симптоматическое, гемодиализ. При гемодиализе Азатиоприн выводится не полностью.

Применение при беременности и кормлении грудью:

В период лечения **женщины детородного возраста** должны использовать надежные методы контрацепции. При необходимости применения в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с:

— аллопуринолом - усиливается токсическое действие азатиоприна;

— ко-тримоксазолом - возможно усиление миелотоксического действия азатиоприна;

— ингибиторами АПФ - возможно развитие тяжелой лейкопении;

— другими иммунодепрессантами (кортикостероиды, циклоспорин, анти-CD3-антител) - увеличивается риск развития инфекции и возникновения опухолей;

Азатиоприн является антагонистом недеполяризуюших миорелаксантов.

При вакцинации одновременно с приемом Аатиоприна живыми вирусными вакцинами возможно усиление репликации вируса, инактивированными вакцинами - угнетение продукции антител.

Особые указания и меры предосторожности:

В течение первых 8 недель лечения показан еженедельный контроль картины периферической крови, в последующем - 1-2 раза в месяц, а также периодический контроль активности сывороточных печеночных трансаминаз, ЩФ и уровня билирубина.

При нарушениях функции почек и/или печени, а также при одновременном приеме аллопуринола Азатиоприн следует применять в более низких дозах (1/4 от средней дозы).

С осторожностью (с учетом соотношения польза-риск) применяют при ветряной оспе, опоясывающем герпесе, недостаточности ксантин-оксидазы, радиационной и цитотоксической терапии.

При нарушениях функции почек

При нарушениях функции почек Азатиоприн следует применять в более низких дозах (1/4 от средней дозы).

При нарушениях функции печени

При нарушениях функции печени Азатиоприн следует применять в более низких дозах (1/4 от средней дозы).

Условия хранения:

Список А. Хранить в защищенном от света и недоступном для детей месте. Не использовать по истечении срока годности препарата.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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