Флупиртин-Сз



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Капсулы твердые, непрозрачные, желатиновые №1: корпус желтого цвета с крышечкой коричневого цвета; содержимое капсул - порошок от белого до белого с желтоватым или зеленоватым оттенком цвета.

	1 капс.
флупиртина малеат	100 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфата дигидрат - 190.5 мг, коллидон CL (кросповидон) - 12 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 10 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 6.5 мг, магния стеарат - 1 мг.

Твердые непрозрачные желатиновые капсулы №1:
корпус: титана диоксид - 1%, железа оксид желтый - 0.192%, желатин - до 100%,
крышечка: железа оксид черный - 0.53%, железа оксид красный - 0.93%, титана диоксид - 0.3333%, железа оксид желтый - 0.2%, желатин - до 100%.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
30 шт. - банки (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Анальгетик центрального действия. Является селективным активатором нейрональных калиевых каналов. Не относится к опиоидам, не вызывает зависимости и привыкания.

Оказывает анальгетическое, миорелаксирующее и нейропротекторное действие, основанное на непрямом антагонизме по отношению NMDA-рецепторам, активации нисходящих механизмов модуляции боли и GABA-ергических процессов.

В терапевтических концентрациях флупиртин не связывается с α_1-, α_2-адренорецепторами, серотониновыми $5HT_1$-, $5HT_2$-рецепторами, допаминовыми, бензодиазепиновыми, опиоидными, центральными м- и н-холинорецепторами.

Антиспастическое действие на мышцы связано с блокированием передачи возбуждения на мотонейроны и промежуточные нейроны, приводящим к снятию мышечного напряжения. Это действие флупиртина проявляется при многих хронических заболеваниях, сопровождающихся болезненными мышечными спазмами (скелетно-мышечные

боли в шее и спине, артропатии, головные боли напряжения, фибромиалгия).

Благодаря нейропротекторным свойствам защищает нервные структуры от токсического действия высоких концентраций ионов внутриклеточного кальция, что связано, со способностью флупиртина вызывать блокаду нейрональных ионных кальциевых каналов и снижать внутриклеточный ток ионов кальция.

Фармакокинетика

После приема внутрь практически полностью (до 90%) и быстро всасывается из ЖКТ.

Метаболизируется в печени (до 75% от принятой дозы) с образованием активного метаболита М1 (2-амино-3-ацетамино-6-[4-фтор]-бензиламинопиридин). Метаболит М1 образуется в результате гидролиза уретановой структуры (1 фаза реакции) и последующего ацетилирования (2 фаза реакции). Этот метаболит обеспечивает в среднем 25% анальгезирующей активности флупиртина. Другой метаболит (М2 - биологически неактивный) образуется в результате реакции окисления (I фаза) п-фторбензила с последующей конъюгацией (2 фаза) п-фторбензойной кислоты с глицином.

$T_{1/2}$ составляет около 7 ч (10 ч для основного вещества и метаболита М1), что является достаточным для обеспечения анальгезирующего эффекта. Концентрация действующего вещества в плазме крови пропорциональна дозе.

Выводится в основном почками (69%): 27% выводится в неизмененном виде, 28% - в виде метаболита М1 (ацетил-метаболит), 12% - в виде метаболита М2 (пара-фторгиппуровая кислота) и остальная треть состоит из нескольких метаболитов с невыясненной структурой. Небольшая часть дозы выводится из организма с желчью и калом.

У пациентов в возрасте старше 65 лет по сравнению с молодыми пациентами наблюдается увеличение $T_{1/2}$ (до 14 ч при однократном приеме и до 18.6 ч при приеме в течение 12 дней) и C_{max} соответственно в плазме крови выше в 2-2.5 раза.

Показания к применению:

Острый и хронический болевой синдром при следующих заболеваниях и состояниях: мышечный спазм, злокачественные новообразования, первичная альгодисменорея, головная боль, посттравматические боли, боли при травматологических/ортопедических операциях и вмешательствах.

Относится к болезням:

- Альгодисменорея
- Болевой синдром
- Головная боль
- Мышечный спазм
- Спазмы
- Травмы

Противопоказания:

Печеночная недостаточность с явлениями энцефалопатии, холестаз, тяжелая миастения, хронический алкоголизм, беременность, детский и подростковый возраст до 18 лет, повышенная чувствительность к флупиртину.

Способ применения и дозы:

Дозу устанавливают индивидуально в зависимости от степени тяжести болевого синдрома и чувствительности больного к флупиртину.

Длительность применения также определяется индивидуально и зависит от динамики болевого синдрома и лечения.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: часто слабость в начале лечения; возможны депрессия, нарушения сна, потливость, беспокойство, нервозность, тремор, головная боль; редко - спутанность сознания, нарушения зрения.

Со стороны пищеварительной системы: возможны головокружение, изжога, тошнота, рвота, запор или диарея, метеоризм, боли в животе, сухость во рту, потеря аппетита; в отдельных случаях - повышение активности печеночных трансаминаз, гепатит (острый или хронический, протекающий с желтухой или без желтухи, с элементами холестаза или без них).

Аллергические реакции: редко - повышение температуры тела, крапивница и зуд.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан к применению при беременности.

При необходимости применения в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания на период лечения, т.к. показано, что незначительное количество флупиртина выделяется с грудным молоком.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Флупиртин усиливает действие седативных средств, миорелаксантов, а также этанола.

Следует учитывать возможность вытеснения флупиртина из связи с белками другими одновременно принимаемыми лекарственными средствами. Однако показано, что флупиртин способен вытеснять варфарин и диазепам из связи с белками, при одновременном приеме с данными препаратами это может привести к усилению их активности.

При одновременном применении флупиртина и производных кумарина возможно усиление антикоагулянтного действия.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять при нарушениях функции печени и/или почек, у пациентов старше 65 лет. Пациентам этих групп требуется коррекция режима дозирования.

Побочные эффекты в основном зависят от дозы. Во многих случаях они исчезают сами по себе по мере проведения терапии или после окончания лечения.

При лечении флупиртином возможны ложноположительные результаты теста с диагностическими полосками на билирубин, уробилиноген и белок в моче. Аналогичная реакция возможна при количественном определении уровня билирубина в плазме крови.

При применении в высоких дозах в отдельных случаях может отмечаться окрашивание мочи в зеленый цвет, что не является клиническим признаком какой-либо патологии.

У пациентов с нарушениями функцией печени или почек следует контролировать активность печеночных ферментов и содержание креатинина в моче.

При одновременном применении флупиртина с препаратами, которые также метаболизируются в печени, требуется регулярный контроль активности печеночных ферментов.

Следует избегать комбинированного применения флупиртина и лекарственных средств, содержащих парацетамол и карбамазепин.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и работе с механизмами

Учитывая, что флупиртин может ослаблять внимание и замедлять ответные реакции организма рекомендуется во время лечения препаратом воздерживаться от вождения транспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Источник: http://drugs.thead.ru/Flupirtin-Sz