Форсодол

Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированное анальгезирующее средство, содержащее трамадол и парацетамол.

Трамадол - обладает центральным действием и действием на спинной мозг (способствует открытию калиевых и кальциевых каналов, вызывает гиперполяризацию мембран и тормозит проведение болевых импульсов), усиливает действие седативных лекарственных средств. Активирует опиатные рецепторы (мю-, дельта-, каппа-) на пре- и постсинаптических мембранах афферентных волокон ноцицептивной системы в головном мозге и ЖКТ, тормозит обратный нейрональный захват катехоламинов в ЦНС.

Парацетамол - ненаркотический анальгетик, блокирует ЦОГ, преимущественно - в ЦНС, воздействуя на центры боли и терморегуляции. Не вызывает раздражение слизистой оболочки ЖКТ, не оказывает влияния на водно-солевой обмен, поскольку не воздействует на синтез простагландинов в периферических тканях. Благодаря парацетамолу наступает быстрое обезболивание, в то время как трамадол обеспечивает пролонгированный эффект.

Синергизм анальгезирующего действия двух активных веществ снижает риск возникновения побочных эффектов.

Фармакокинетика

При приеме внутрь препарат быстро и почти полностью всасывается из ЖКТ.

Всасывание

Всасывание трамадола происходит медленнее, чем парацетамола. Биодоступность трамадола - 75%, при повторном применении - увеличивается до 90%. Время достижения C_{max} парацетамола - 1 ч и не изменяется при совместном применении с трамадолом.

Распределение

Связь с белками тармадола и парацетамола - около 20%. V_d - 0.9 л/кг.

Метаболизм

Трамадол метаболизируется в печени путем N- и O-деметилирования с последующей конъюгацией с глюкуроновой кислотой. Выявлено 11 метаболитов, из которых моно-O-десметилтрамадол обладает фармакологической активностью. Парацетамол метаболизируется преимущественно в печени.

Выведение

$T_{1/2}$ трамадола - 4.7-5.1 ч, парацетамола - 2-3 ч. Трамадол (около 30%) и его метаболиты (около 60%) выводятся преимущественно почками. Парацетамол и его коньюгаты выводятся почками.

Показания к применению:

— болевой синдром средней и сильной интенсивности различной этиологии, в т.ч. воспалительного, травматического, сосудистого происхождения;

— обезболивание при проведении болезненных диагностических или терапевтических мероприятий.

Относится к болезням:

- Болевой синдром
- Травмы

Противопоказания:

— гиперчувствительность;

— острая алкогольная интоксикация;

— интоксикация лекарственными средствами, угнетающими ЦНС (снотворными, наркотическими анальгетиками и психотропными препаратами);

— одновременный прием ингибиторов МАО (и в течение 2 нед после их отмены);

— тяжелая печеночная и/или почечная недостаточность (КК менее 10 мл/мин);

— неконтролируемая терапией эпилепсия;

— синдром отмены наркотических лекарственных средств;

— детский возраст (до 14 лет);

— беременность;

— период лактации.

С *осторожностью:* шок, черепно-мозговая травма, внутричерепная гипертензия, склонность к судорожному синдрому (при контролируемой эпилепсии препарат может применяться только по жизненным показаниям), спутанность сознания неизвестной этиологии, дыхательная недостаточность, одновременный прием психотропных и анальгезирующих лекарственных средств центрального действия, местных анестетиков, заболевания желчевыводящих путей, доброкачественная гипербилирубинемия, вирусный гепатит, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, алкогольное поражение печени, алкоголизм, наркомания, симптомы "острого" живота неясного генеза, пожилой возраст (старше 75 лет).

Способ применения и дозы:

Внутрь, независимо от приема пищи, проглатывают целиком (нельзя разламывать или жевать), запивая жидкостью.

Режим дозирования и продолжительность лечения подбираются индивидуально, в зависимости от выраженности болевого синдрома. Для **взрослых** и **детей старше 14 лет** рекомендованная начальная разовая доза - 1-2 таб. с интервалом между приемами препарата - не менее 6 ч. Максимальная суточная доза - 8 таб. (300 мг трамадола и 2.6 г парацетамола).

У **пожилых пациентов** (в возрасте **75 лет и старше**) могут быть использованы обычные дозы. Однако в связи с возможностью замедленного выведения, интервал между приемами препарата может быть увеличен.

У пациентов с **почечной недостаточностью (КК 10-30 мл/мин)** интервал между приемом должен составлять не менее 12 ч.

Т.к. трамадол очень медленно выводится при проведении гемодиализа или гемофильтрации, применение препарата *после сеанса диализа* для поддержания анальгезирующего действия не требуется.

При **умеренном нарушении функции печени** следует увеличивать интервал между приемами препарата.

Побочное действие:

Аллергические реакции: крапивница, зуд, отек Квинке, экзантема, буллезная сыпь.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, заторможенность, парадоксальная стимуляция ЦНС (нервозность, ажитация, тревожность, тремор, спазмы мышц, эйфория, эмоциональная лабильность, галлюцинации), сонливость, нарушение сна, спутанность сознания, нарушение координации движения, судороги центрального генеза (при одновременном назначении антипсихотических средств), депрессия, амнезия, нарушение когнитивной функции, парестезии, неустойчивость походки.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, тошнота, рвота, метеоризм, абдоминальные боли, запор, диарея, затруднение при глотании; повышение активности печеночных ферментов, как правило, без развития желтухи.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, ортостатическая гипотензия, синкопе, коллапс.

Со стороны эндокринной системы: гипогликемия, вплоть до гипогликемической комы.

Со стороны мочевыделительной системы: затруднение мочеиспускания, дизурия, задержка мочи. При длительном приеме в дозах, значительно превышающих рекомендованные - нефротоксичность (интерстициальный нефрит, папиллярный некроз).

Со стороны органов чувств: нарушение зрения, вкуса.

Со стороны дыхательной системы: диспноэ.

Со стороны кожных покровов: мультиформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Со стороны органов кроветворения: сульфгемоглобинемия. При длительном приеме в дозах, значительно превышающих рекомендованные - апластическая анемия, панцитопения, агранулоцитоз.

Прочие: потливость, слабость, повышенная утомляемость, нарушение менструального цикла.

При длительном применении - развитие лекарственной зависимости (раздражительность, фобии, нервозность, нарушения сна, психотомоторная активность, тремор, дискомфорт в области желудка или кишечника).

При резком прекращении приема возможно развитие - синдрома отмены.

Передозировка:

Симптомы передозировки трамадола: миоз, рвота, коллапс, кома, судороги, угнетение дыхательного центра, апноэ.

Симптомы передозировки парацетамола: (острая передозировка развивается через 6-14 ч после приема парацетамола, хроническая - через 2-4 сут в случае превышения дозы).

Симптомы острой передозировки: диарея, снижение аппетита.

Симптомы хронической передозировки: отек мозга, гипокоагуляция, развитие ДВС-синдрома, гипогликемия, метаболический ацидоз, аритмия, коллапс; редко - нарушение функции печени, которое развивается молниеносно и может осложняться почечной недостаточностью (почечный тубулярный некроз).

Лечение: промывание желудка и прием энтеросорбентов (активированный уголь, полифепан), поддержание функций сердечно-сосудистой системы, обеспечить проходимость дыхательных путей. При угнетении дыхания (симптом передозировки трамадола) - налоксон, при судорогах - диазепам. Гемодиализ или гемофильтрация неэффективны при интоксикации трамадолом.

При появлении симптомов передозировки парацетамола: введение донаторов SH -групп и предшественников синтеза глутатиона - метионина через 8-9 ч после передозировки и N-ацетилцистеина - через 12 ч. Необходимость дальнейшего введения метионина, в/в введения N-ацетилцистеина определяется в зависимости от концентрации парацетамола в крови, а также от времени, прошедшего после его приема.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказания: беременность; период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Совместное применение с опиоидными агонистами-антагонистами (бупренорфином, налбуфином, пентазоцином) снижает анальгезирующий эффект в результате конкурирующего действия на рецепторы, а также возникает риск синдрома отмены.

Средства, угнетающие ЦНС (в т.ч. снотворные, транквилизаторы), этанол - усиливают побочные эффекты, характерные для трамадола.

Индукторы микросомального окисления (в т.ч. карбамазепин, фенитоин, этанол, барбитураты, рифампицин, фенилбутазон, трициклические антидепрессанты) уменьшают анальгезирующий эффект и его продолжительность.

Налоксон активирует дыхание, устраняя анальгезию, вызванную тарамадолом.

Длительное использование барбитуратов снижает эффективность парацетамола.

Этанол способствует развитию острого панкреатита.

Длительное совместное использование парацетамола и других НПВС повышает риск развития нефропатии и почечного папиллярного некроза, наступления терминальной стадии почечной недостаточности.

Одновременное длительное назначение парацетамола в высоких дозах и салицилатов повышает риск развития рака почки или мочевого пузыря. Дифлунисал повышает концентрацию в плазме крови парацетамола на 50% - риск развития гепатотоксичности.

Сопутствующее применение с лекарственными средствами, снижающими эпилептический порог (в т.ч. селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, трициклические антидепрессанты, нейролептики) - риск возникновения судорог.

Препараты, ингибирующие CYP3A4 (кетоконазол и эритромицин) могут замедлять метаболизм трамадола (N-деметилирование) и активного О-деметилированного метаболита.

Хинидин повышает концентрацию в плазме крови трамадола и снижает концентрацию О-деметилированного метаболита за счет конкурентного ингибирования изофермента CYP2D6.

Ингибиторы микросомального окисления (циметидин) снижают риск гепатотоксичности.

Скорость всасывания парацетамола увеличивается при приеме метоклопрамида или домперидона и снижается при приеме колестирамина.

Препарат при приеме в течение длительного времени усиливает эффект непрямых антикоагулянтов (варфарин и другие кумарины), что увеличивает риск развития кровотечений.

Особые указания и меры предосторожности:

У пациентов, склонных к злоупотреблению лекарственными средствами или возникновению лекарственной зависимости, лечение должно проводиться под тщательным врачебным наблюдением в течение короткого периода.

В период лечения препаратом рекомендуется избегать приема этанола. Риск развития гепатотоксичности и передозировки парацетамолом возрастает у пациентов с алкогольным гепатозом.

Во время длительного лечения необходим контроль картины периферической крови и функционального состояния печени.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Во время лечения следует воздержаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказание — тяжелая почечная недостаточность (КК менее 10 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказание — тяжелая печеночная недостаточность.

С *осторожностью:* заболевания желчевыводящих путей, доброкачественная гипербилирубинемия, вирусный гепатит, алкогольное поражение печени.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью:* пожилой возраст (старше 75 лет).

Применение в детском возрасте

Противопоказание — детский возраст (до 14 лет).

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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