Имуран

Код АТХ:

- L04AX01

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]

Фармакотерапевтическая группа:

- Иммунотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Иммунодепрессивное средство, имидазольное производное 6-меркаптопурина, конкурентный антагонист гипоксантина. По химическому строению близок к пуриновым основаниям. Оказывает иммунодепрессивное и цитостатическое действие. Включаясь в метаболические реакции, нарушает синтез нуклеиновых кислот, конкурирует с гипоксантином и гуанином за гипоксантин-гуанин-фосфорибозилтрансферазу, при участии которой происходит образование тиоинозиновой кислоты (ТИК) из меркаптопурина. ТИК ингибирует ряд реакций с участием инозиновой кислоты, включая ее превращение в ксантиновую и адениловую кислоты. В ходе метилирования ТИК образуется вещество, блокирующее глютамин-5-фосфорибозилпирофосфат аминотрансферазу - фермент, инициирующий путь пуринового синтеза рибонуклеотидов. В связи с потерей способности клеток образовывать ТИК, возможно развитие резистентности опухолевых клеток к азатиоприну.

По сравнению с меркаптопурином оказывает более выраженное иммунодепрессивное действие при меньшей цитостатической активности. В высоких дозах (10 мг/кг) угнетает функцию костного мозга, подавляет пролиферацию гранулоцитов, вызывает лейкопению.

Фармакокинетика

После приема внутрь азатиоприн хорошо всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается через 1-2 ч. В организме азатиоприн расщепляется с образованием 6-меркаптопуина и метилнитроимидазола.

При введении в средних терапевтических дозах в плазме крови создаются очень низкие концентрации активного вещества (менее 1 мг/мл), не коррелирующие с выраженностью и продолжительность клинического эффекта (что обусловлено содержанием тиопурина в тканях). Связывание с белками плазмы низкое.

Метаболизируется в эритроцитах и в печени с образованием фармакологически неактивного метаболита (6-тиомочевая кислота) под влиянием ксантиноксидазы. Основными путями метаболизма являются окисление и

метилирование.

Удаляется при проведении гемодиализа, быстро исчезает из кровеносного русла. Проникает через плацентарный барьер.

Показания к применению:

Профилактика реакции отторжения трансплантата (в составе комбинированной терапии). Ревматоидный артрит тяжелого течения, СКВ, дерматомиозит, узелковый периартериит, вульгарная пузырчатка, идиопатическая тромбоцитопеническая пурпура, приобретенная гемолитическая анемия, гангренозная пиодермия, хронический гепатит.

Относится к болезням:

- Артрит
- Артроз
- Гепатит
- Гепатоз
- Дерматит
- Дерматомиозит
- Периартериит
- Пузырчатка
- Тромбоз

Противопоказания:

Беременность, повышенная чувствительность к азатиоприну и/или меркаптопурину.

Способ применения и дозы:

Устанавливают индивидуально с учетом показаний, тяжести течения заболевания, режима дозирования одновременно назначаемых препаратов и гематологической переносимости. Суточная доза варьирует от 1 мг/кг до 5 мг/кг. Лечение длительное.

Побочное действие:

Со стороны системы кроветворения: миелодепрессия (лейкопения, тромбоцитопения, анемия); возможно развитие вторичных инфекций, мегалобластный эритропоэз и макроцитоз; в единичных случаях - гемолитическая анемия.

Со стороны пищеварительной системы: возможны тошнота, рвота, анорексия, холестатический гепатит; у реципиентов трансплантатов отмечены панкреатит, эрозивно-язвенные поражения и кровотечения из ЖКТ, некроз и перфорация кишечника.

Аллергические реакции: возможны кожная сыпь, артралгии, миалгии, лекарственная лихорадка.

Прочие: в единичных случаях - острая почечная недостаточность, острые легочные заболевания, менингеальные реакции.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Азатиоприн противопоказан к применению при беременности. В период лечения женщины детородного возраста должны использовать надежные методы контрацепции.

При необходимости применения в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

В *экспериментальных исследованиях* установлено тератогенное, эмбриотоксическое и канцерогенное действие азатиоприна.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с ко-тримоксазолом возможно усиление миелотоксического действия азатиоприна. Описаны случаи развития тяжелой лейкопении при одновременном применении с ингибиторами АПФ.

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 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.

При нарушениях функции почек

При нарушениях функции почек азатиоприн следует применять в более низких дозах.

При нарушениях функции печени

При нарушениях функции печени азатиоприн следует применять в более низких дозах.

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