Индометацин-Биосинтез



Код АТХ:

- M01AB01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Индометацин

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВС, производное индолуксусной кислоты. Оказывает противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие. Механизм действия связан с ингибированием фермента ЦОГ, что приводит к угнетению синтеза простагландинов из арахидоновой кислоты.

Подавляет агрегацию тромбоцитов.

При введении внутрь и парентерально способствует ослаблению болевого синдрома, особенно болей в суставах в покое и при движении, уменьшению утренней скованности и припухлости суставов, увеличению объема движений. Противовоспалительный эффект развивается к концу первой недели лечения.

При местном применении устраняет боль, уменьшает отек и эритему.

При наружном применении, кроме того, способствует уменьшению утренней скованности, увеличению объема движений.

Фармакокинетика

После приема внутрь индометацин быстро всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме достигается через 2 ч. Метаболизируется в печени. Подвергается кишечно-печеночной рециркуляции. Индометацин определяется в плазме крови в виде неизмененного вещества и несвязанных метаболитов - дезметильного, десбензоильного, дезметил-дезбензоильного.

$T_{1/2}$ составляет около 4.5 ч. Выводится с мочой - 60% в виде неизмененного вещества и метаболитов, и с калом - 33% главным образом в виде метаболитов.

Показания к применению:

Для системного применения: суставной синдром (в т.ч. ревматоидный артрит, остеоартрит, анкилозирующий спондилит, подагра), боли в позвоночнике, невралгии, миалгии, травматическое воспаление мягких тканей и суставов, ревматизм, диффузные болезни соединительной ткани, дисменорея. Как вспомогательное средство при инфекционно-воспалительных заболеваниях ЛОР-органов, аднексите, простатите, цистите.

Для местного применения: профилактика воспалительного процесса при хирургических вмешательствах по поводу катаракты и на переднем сегменте глаза, ингибирование миоза во время операции.

Для наружного применения: суставной синдром (в т.ч. ревматоидный артрит, остеоартрит, анкилозирующий спондилит, подагра), боли в позвоночнике, невралгии, миалгии, травматическое воспаление мягких тканей и суставов.

Относится к болезням:

- Аднексит
- Артрит
- Артроз
- Воспаление
- Дисменорея
- Инфекции
- Катаракта
- Миалгия
- Невралгия
- Неврит
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Подагра
- Простатит
- Ревматизм
- Ревматоидный артрит
- Травмы
- Цистит

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к индометацину, эрозивно-язвенные поражения ЖКТ в фазе обострения, "аспириновая триада", нарушения кроветворения, выраженные нарушения функции печени и/или почек, тяжелые формы хронической сердечной недостаточности, артериальной гипертензии, панкреатита, III триместр беременности, детский возраст до 14 лет; для ректального применения: проктит, недавнее кровотечение из прямой кишки.

Способ применения и дозы:

Устанавливают индивидуально с учетом тяжести течения заболевания. Для взрослых при приеме внутрь начальная доза - по 25 мг 2-3 раза/сут. При недостаточной выраженности клинического эффекта дозу увеличивают до 50 мг 3 раза/сут. Лекарственные формы пролонгированного действия применяют 1-2 раза/сут. Максимальная суточная доза: 200 мг.

При достижении эффекта лечение продолжают в течение 4 недель в той же или уменьшенной дозе. При длительном применении суточная доза не должна превышать 75 мг. Принимают после еды.

Для лечения острых состояний или купирования обострения хронического процесса вводят в/м по 60 мг 1-2 раза/сут. Продолжительность в/м введения - 7-14 дней. Затем индометацин применяют внутрь или ректально по 50-100 мг 2 раза/сут, при этом максимальная суточная доза не должна превышать 200 мг. Для поддерживающего лечения применяют ректально по 50-100 мг 1 раз/сут на ночь.

Для местного применения в офтальмологии доза частота и длительность применения определяются индивидуально.

Наружно применяют 2 раза/сут.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, анорексия, рвота, боли и неприятные ощущения в животе, запор

или диарея, эрозивно-язвенные поражения, кровотечения и перфорации ЖКТ; редко - стриктуры кишечника, стоматит, гастрит, метеоризм, кровотечение из сигмовидной кишки или из дивертикула, желтуха, гепатит.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, депрессия, чувство усталости; редко - тревога, обморок, сонливость, судороги, периферическая невропатия, мышечная слабость, непроизвольные мышечные движения, нарушения сна, психические расстройства (деперсонализация, психотические эпизоды), парестезии, дизартрия, паркинсонизм.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: отеки, повышение АД, тахикардия, боли в грудной клетке, аритмия, пальпитация, артериальная гипотензия, застойная сердечная недостаточность, гематурия.

Аллергические реакции: редко - зуд, крапивница, ангиит, узловатая эритема, кожная сыпь, эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона, многоформная эритема, токсический эпидермальный некролиз, выпадение волос, острый респираторный дистресс, резкое падение АД, анафилактические реакции, ангионевротический отек, диспноэ, бронхиальная астма, отек легких.

Со стороны системы кроветворения: редко - лейкопения, петехии или экхимозы, пурпура, апластическая и гемолитическая анемия, тромбоцитопения, синдром ДВС.

Со стороны органов чувств: редко - нарушение четкости зрительного восприятия, диплопия, орбитальные и периорбитальные боли, тиннит, нарушения слуха, глухота.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - протеинурия, нефротический синдром, интерстициальный нефрит, нарушения функции почек почечная недостаточность.

Со стороны обмена веществ: редко - гипергликемия, глюкозурия, гиперкалиемия.

Прочие: редко - вагинальное кровотечение, приливы, повышенное потоотделение, носовое кровотечение, увеличение и напряженность молочных желез, гинекомастия.

Местные реакции: в месте в/м введения в отдельных случаях - образование инфильтрата, абсцесса; при ректальном применении возможны раздражение слизистой оболочки прямой кишки, тенезмы, обострение хронического колита.

При наружном применении: зуд, покраснение, сыпь в месте аппликации.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Индометацин противопоказан в III триместре беременности. В I и II триместрах беременности, а также в период лактации (грудного вскармливания) применение не рекомендуется.

Индометацин в небольших количествах выделяется с грудным молоком.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении индометацин может уменьшать эффекты салуретиков, бета-адреноблокаторов; усиливать эффекты непрямых антикоагулянтов.

При одновременном применении индометацина и дифлунизала существует опасность возникновения сильного кровотечения из ЖКТ.

При одновременном применении с пробенецидом возможно повышение концентрации индометацина в плазме крови.

Индометацин может уменьшать канальцевую секрецию метотрексата, что приводит к повышению его токсичности.

При одновременном применении с НПВС повышается токсичность циклоспорина.

Индометацин в дозе по 50 мг 3 раза/сут повышает концентрацию лития в плазме крови и уменьшает клиренс лития из организма у пациентов с психическими заболеваниями.

При одновременном применении индометацина с дигоксином возможно повышение концентрации дигоксина в плазме крови и увеличение периода полувыведения дигоксина.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов пожилого возраста, а также при заболеваниях печени, почек, ЖКТ в анамнезе, при диспептических симптомах в момент применения, артериальной гипертензии, сердечной недостаточности, сразу после серьезных хирургических вмешательств, при паркинсонизме, эпилепсии.

При указаниях в анамнезе на аллергические реакции к НПВС применяют только в неотложных случаях.

В период лечения необходим систематический контроль за функцией печени и почек, картиной периферической крови.

Не рекомендуется одновременное применение с ацетилсалициловой кислотой и другими НПВС.

Не следует применять индометацин одновременно с дифлунизалом.

При одновременном применении индометацина с препаратами лития следует иметь в виду возможность появления симптомов токсического действия лития.

При местном применении не следует наносить на раневую поверхность кожи, а также избегать попадания в глаза или на слизистые оболочки.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения следует воздерживаться от потенциально опасных видов деятельности, связанных с необходимостью концентрации внимания и повышенной скорости психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при выраженных нарушениях функции почек. С осторожностью применяют при заболеваниях почек.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при выраженных нарушениях функции печени. С осторожностью применяют при заболеваниях печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью применяют у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 14 лет.

Источник: http://drugs.thead.ru/Indometacin-Biosintez