Кокстрал

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки круглые, двояковыпуклые, светло-желтые, с гравировкой "CX" на одной стороне.

	1 таб.
нимесулид	100 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, натрия крахмала гликолат, гидроксипропилцеллюлоза, натрия докузат, магния стеарат.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
100 шт. - флаконы полиэтиленовые (1) - пачки картонные.
100 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВС из класса сульфонанилидов. Является селективным конкурентным ингибитором циклооксигеназы-2 (ЦОГ-2) - фермента, участвующего в синтезе простагландинов - медиаторов отека, воспаления и боли. Оказывает противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие. Обратимо ингибирует образование простагландина E_2, как в очаге воспаления, так и в восходящих путях ноцицептивной системы, включая пути проведения болевых импульсов спинного мозга.

Снижает концентрацию короткоживущего простагландина H_2, из которого под действием простагландин-изомеразы образуется простагландин E_2. Уменьшение концентрации простагландина E_2 ведет к снижению степени активации простаноидных рецепторов EP типа, что выражается в анальгетическом и противовоспалительном эффектах. В незначительной степени действует на ЦОГ-1, практически не препятствуя образованию простагландина E_2 из арахидоновой кислоты в физиологических условиях, благодаря чему снижается количество побочных эффектов препарата.

Препарат также подавляет агрегацию тромбоцитов путем ингибирования синтеза эндопероксидов и тромбоксана A_2, ингибирует синтез фактора агрегации тромбоцитов, тормозит активацию плазминогена путем увеличения концентрации ингибитора активатора плазминогена-1. Подавляет высвобождение гистамина, а также уменьшает степень бронхоспазма, вызванного воздействием гистамина и ацетальдегида. Ингибирует высвобождение фактора некроза опухолей α, обуславливающего образование цитокининов.

Показано, что нимесулид способен подавлять синтез интерлейкина-6 и урокиназы, тем самым препятствуя разрушению хрящевой ткани. Ингибирует синтез металлопротеаз (эластазы, коллагеназы), предотвращая разрушение протеогликанов и коллагена хрящевой ткани.

Обладает антиоксидантными свойствами, тормозит образование токсических продуктов распада кислорода за счет

уменьшения активности миелопероксидазы. Взаимодействует с глюкокортикоидными рецепторами, активируя их путем фосфорилирования, что также усиливает противовоспалительное действие препарата.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь хорошо всасывается из ЖКТ. Одновременный прием пищи не влияет на абсорбцию препарата.

C_{max} активного вещества в плазме крови достигается через 1.5-2.5 ч после приема.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет 99%, в основном с альбумином - 96%.

Метаболизм

Нимесулид активно метаболизируется в печени. Основной метаболит - гидроксинимесулид, обладает сходной фармакологической активностью.

Выведение

$T_{1/2}$ нимесулида составляет примерно 2 ч, гидроксинимесулида – около 3 ч, выводится преимущественно с мочой и калом.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У больных с нарушением функции почек (КК 30-80 мл/мин), а также у детей и лиц пожилого возраста (старше 65 лет) фармакокинетический профиль нимесулида существенно не меняется.

Показания к применению:

— ревматоидный артрит;

— остеоартроз;

— артриты различной этиологии;

— артралгии;

— миалгии;

— послеоперационные и посттравматические боли;

— бурсит;

— тенденит;

— альгодисменорея;

— зубная и головная боль;

— лихорадка различного генеза.

Относится к болезням:

- Альгодисменорея
- Артралгия
- Артрит
- Артроз
- Бурсит
- Головная боль
- Лихорадка
- Миалгия
- Остеоартрит
- Остеоартроз

Противопоказания:

— эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (в фазе обострения);

— кровотечения из ЖКТ;

— "аспириновая триада";

— выраженные нарушения функции печени;

— выраженные нарушения функции почек (КК менее 30 мл/мин);

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— детский возраст до 12 лет;

— повышенная чувствительность к основному действующему веществу или к другим компонентам препарата.

С осторожностью следует применять при артериальной гипертензии, сердечной недостаточности, сахарном диабете 2 типа.

Способ применения и дозы:

Назначают внутрь **взрослым** по 100 мг (1 таб.) 2 раза/сут. Максимальная суточная доза - 400 мг.

Таблетки следует принимать предпочтительно до еды, запивая достаточным количеством воды. При наличии заболеваний ЖКТ препарат желательно принимать в конце еды или после приема пищи.

Детям старше 12 лет назначают из расчета разовой дозы 1.5 мг/кг массы тела 2-3 раза/сут. Максимальная суточная доза - 5 мг/кг.

Подросткам с массой тела более 40 кг – по 100 мг 2 раза/сут.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: изжога, тошнота, рвота, диарея, гастралгия, изъязвление слизистой оболочки ЖКТ, повышение активности печеночных трансаминаз, токсический гепатит.

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение.

Аллергические реакции: кожная сыпь, анафилактический шок, бронхоспазм.

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения, лейкопения, анемия, агранулоцитоз.

Со стороны свертывающей системы крови: удлинение времени кровотечения.

Прочие: задержка жидкости; гематурия.

Передозировка:

Случаи передозировки препарата не описаны. Специфического антидота не существует.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении наблюдается конкурирование за связь с белками плазмы между нимесулидом и дигоксином, фенитоином, препаратами лития, диуретиками, антигипертензивными средствами, другими НПВС, циклоспорином; метотрексатом, гипогликемическими средствами (данные комбинации следует применять с осторожностью).

Особые указания и меры предосторожности:

При назначении препарата пациентам пожилого возраста коррекции режима дозирования не требуется.

При длительном применении необходим систематический контроль функции печени и почек.

При появлении каких-либо побочных реакций пациент должен прекратить прием препарата и проконсультироваться с врачом.

При нарушениях функции почек

Препарат противопоказан при выраженных нарушениях функции почек (КК менее 30 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при выраженных нарушениях функции печени.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям до 12 лет.

Детям старше 12 лет назначают из расчета разовой дозы 1.5 мг/кг массы тела 2-3 раза/сут. Максимальная суточная доза - 5 мг/кг.

Подросткам с массой тела более 40 кг – по 100 мг 2 раза/сут.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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