Найзилат



Код АТХ:

- M01AB

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Амтолметин гуацил

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой от белого до почти белого цвета, капсуловидные, с характерным запахом.

	1 таб.
амтолметин гуацил	600 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 40.1 мг, лактозы моногидрат (Flowlac 100) - 120.3 мг, гипромеллоза (15 cps) - 6 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.6 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 24 мг, магния стеарат - 8 мг.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза (5 cps) - 12.5 мг, титана диоксид - 6.25 мг, макрогол 400 - 1.25 мг.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Амтолметин гуацил является НПВС, неселективным ингибитором циклооксигеназы (ЦОГ). Амтолметин гуацил является предшественником толметина. Оказывает противовоспалительное, анальгезирующее, жаропонижающее, десенсибилизирующее действие, обладает гастропротекторным эффектом. Подавляет провоспалительные факторы, снижает агрегацию тромбоцитов; угнетает ЦОГ-1 и ЦОГ-2, нарушает метаболизм арахидоновой кислоты, уменьшает образование простагландинов (в т.ч. в очаге воспаления), подавляет экссудативную и пролиферативную фазы воспаления. Уменьшает проницаемость капилляров; стабилизирует лизосомальные мембраны; тормозит синтез или инактивирует медиаторы воспаления (простагландины, гистамин, брадикинины, цитокины, факторы комплемента). Блокирует взаимодействие брадикинина с тканевыми рецепторами, восстанавливает нарушенную микроциркуляцию и снижает болевую чувствительность в очаге воспаления. Влияет на таламические центры болевой чувствительности; снижает концентрацию биогенных аминов, обладающих альгогенными свойствами; увеличивает порог болевой чувствительности рецепторного аппарата. Устраняет или уменьшает интенсивность болевого синдрома, уменьшает утреннюю скованность и отеки, увеличивает объем движений в пораженных суставах через 4 дня лечения.

Защитное действие амтолметин гуацил на слизистую оболочку желудка реализуется путем стимуляции рецепторов капсаицина (также их называют ваниллоидными рецепторами), присутствующих в стенках ЖКТ. Вследствие того, что в составе амтолметин гуацил присутствует ванилиновая группа, он может стимулировать капсаициновые рецепторы, что, в свою очередь, вызывает высвобождение пептида, кодируемого геном кальцитонина (ПКГК), и последующее увеличение продукции оксида азота (NO). Оба этих действия создают противовес отрицательному эффекту, вызываемому снижением количества простагландинов из-за ингибирования ЦОГ. Амтолметин гуацил хорошо переносился пациентами при длительном применении (в течение 6 месяцев).

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Всасывание амтолметин гуацил после приема внутрь является быстрым и полным. В основном, препарат концентрируется в стенках желудка и кишечника, где в течение 2 ч после приема поддерживается его очень высокая концентрация. Время достижения C_{max} после приема внутрь - 20-60 мин.

Связывание с белками плазмы - 99%.

Метаболизм

После всасывания амтолметин гуацил сразу подвергается гидролизу эстеразами плазмы крови с образованием трех метаболитов: MED5, толметин и гвиакол, которые трансформируются до активного метаболита толметина, который проникает в ткани, оказывая фармакологическое действие. Основной путь метаболизма толметина - окисление метальной группы у бензольного кольца в карбоксильную.

Выведение

$T_{1/2}$ у взрослых - около 5 ч. В течение 24 ч препарат практически полностью выводится из организма в форме глюкуронидов (с мочой - 80%, с желчью - 20%).

Показания к применению:

— ревматоидный артрит;

— остеоартроз;

— анкилозирующий спондилит;

— суставной синдром при обострении подагры;

— бурсит, тендовагинит;

— болевой синдром слабой и средней интенсивности (артралгия, миалгия, невралгия, мигрень, зубная и головная боль, альгодисменорея, боль при травмах, ожогах).

Предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент использования, на прогрессирование заболевания не влияет.

Относится к болезням:

- Альгодисменорея
- Артралгия
- Артрит

- Артроз
- Болевой синдром
- Бурсит
- Воспаление
- Головная боль
- Миалгия
- Мигрень
- Невралгия
- Неврит
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Подагра
- Ревматоидный артрит
- Тендовагинит
- Травмы

Противопоказания:

— полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других НПВС (в т.ч. в анамнезе);

— эрозивно-язвенные изменения слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки;

— активное желудочно-кишечное кровотечение;

— цереброваскулярное или иное кровотечение;

— воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, язвенный колит) в фазе обострения;

— гемофилия и другие нарушения свертываемости крови;

— декомпенсированная сердечная недостаточность;

— печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

— выраженная почечная недостаточность (КК менее 30 мл/мин);

— прогрессирующие заболевания почек, подтвержденная гиперкалиемия;

— период после проведения аорто-коронарного шунтирования;

— артериальная гипертензия;

— врожденный дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозно-галактозная мальабсорбция;

— дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;

— беременность;

— период лактации;

— детский возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к амтолметину, толметину.

С *осторожностью*

Гипербилирубинемия, хроническая сердечная недостаточность, ИБС, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, хроническая почечная недостаточность (КК 30-60 мл/мин), язвенные поражения ЖКТ в анамнезе, наличие инфекции Helicobacter pylori, длительное использование НПВС, алкоголизм, тяжелые соматические заболевания, пожилой возраст, одновременный прием пероральных ГКС (в т.ч. преднизолона), антикоагулянтов (в т.ч. варфарина), антиагрегантов (в т.ч. ацетилсалициловой кислоты, клопидогрела), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в т.ч. циталопрама, флуоксетина, пароксетина, сертралина).

Способ применения и дозы:

Рекомендуемая доза амтолметин гуацил составляет 600 мг 2 раза/сут. В зависимости от степени контроля симптомов заболевания поддерживающая доза может быть снижена до 600 мг 1 раз/сут. Максимальная суточная доза - 1800 мг. Для сохранения гастропротекторного действия препарата, амтолметин гуацил следует принимать натощак.

Побочное действие:

Частота побочных эффектов классифицируется в зависимости от частоты встречаемости случая: часто - (1-10%), нечасто (0.1-1%), редко (0.01-0.1%), очень редко (менее 0.01%), включая отдельные сообщения.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота; нечасто - диспепсия, дискомфорт в желудке и кишечнике, вздутие живота; редко - боли в животе, диарея, рвота, запоры, гастрит, очень редко - пептическая язва, нарушения функции печени.

Со стороны мочевыделительной системы: повышение содержания азота мочевины в крови, инфекции мочевыводящих путей.

Со стороны органов чувств: редко - шум в ушах, нарушения зрения.

Со стороны дыхательной системы: редко - бронхоспазм, одышка, ринит, отек гортани.

Со стороны ЦНС: часто - головокружение, головная боль сонливость; редко - депрессия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - подъем АД.

Со стороны органов кроветворения: редко - анемия, тромбоцитопения, агранулоцитоз, лейкопения.

Со стороны кожных покровов: нечасто - кожная сыпь (включая макуло-папулезную сыпь), пурпура; редко - эксфолиативный дерматит (лихорадка с ознобом или без, покраснение, уплотнение или шелушение кожи, опухание и/или болезненность небных миндалин), крапивница, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла.

Аллергические реакции: редко - анафилаксия или анафилактоидные реакции (изменение цвета кожи лица, кожная сыпь, крапивница, зуд кожи, тахипноэ или диспноэ, отеки век, периорбитальный отек, одышка, затрудненное дыхание, тяжесть в грудной клетке, свистящее дыхание).

Прочие: часто - слабость; нечасто - отеки (лица, голеней, лодыжек, пальцев, ступней, повышение массы тела); редко - повышенная потливость, лихорадка, лимфоаденопатия; очень редко - отек языка.

Передозировка:

Симптомы: боль в животе, тошнота, рвота, эрозивно-язвенное поражение желудочно-кишечного тракта, нарушение функции почек, метаболический ацидоз.

Лечение: промывание желудка, введение адсорбентов (активированный уголь) и проведение симптоматической терапии (поддержание жизненно важных функций организма). Специфического антидота не существует.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Индукторы микросомального окисления в печени (фенитоин, этанол, барбитураты, рифампицин, фенилбутазон, трициклические антидепрессанты) увеличивают продукцию гидроксилированных активных метаболитов.

Снижает эффективность урикозурических, гипотензивных лекарственных средств и диуретиков.

Усиливает гипогликемический эффект производных сульфонилмочевины, действие антикоагулянтов, антиагрегантов, фибринолитиков, побочные эффекты эстрогенов, ГКС и минералокортикоидов.

Антациды и колестирамин снижают абсорбцию.

Увеличивает концентрацию в крови препаратов лития, метотрексата.

У некоторых пациентов с нарушениями функции почек совместный прием НПВС и ингибиторов АПФ может привести к дальнейшему ухудшению функционирования почек.

Миелотоксичные лекарственные средства усиливают проявления гематотоксичности препарата.

Особые указания и меры предосторожности:

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

Лечение следует прекратить за 48 ч до определения 17-кетостероидов.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Во время лечения следует воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психических и двигательных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при выраженной почечной недостаточности (КК менее 30 мл/мин),прогрессирующих заболеваниях почек, подтвержденная гиперкалиемии.

С осторожностью следует назначать при хронической почечной недостаточности (КК 30-60 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказан при печеночной недостаточности или активном заболевании печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью назначается пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказано применение в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

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

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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