Рантудил Ретард



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы с модифицированным высвобождением	**1 капс.**
ацеметацин	90 мг

10 шт. - блистеры из ПВХ/ПВДХ/алюминиевой фольги (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры из ПВХ/ПВДХ/алюминиевой фольги (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры из ПВХ/ПВДХ/алюминиевой фольги (10) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ацеметацин - производное индолилуксусной кислоты. Его фармакологическое действие частично обусловлено воздействием индометацина, продукта метаболизма ацеметацина.

Ацеметацин является противовоспалительным, обезболивающим и жаропонижающим средством и, подобно другим противовоспалительным препаратам, подавляет агрегацию тромбоцитов.

Противовоспалительный эффект ацеметацина был продемонстрирован в экспериментах на животных на большом количестве моделей воспаления. Ацеметацин действует на различных стадиях воспалительного процесса. Было обнаружено, что он ингибирует синтез простагландинов и выброс гистамина, а также действует как антагонист брадикинина и серотонина. Он также ингибирует активность системы комплемента и высвобождение гиалуронидазы.

Мембраностабилизирующее свойство ацеметацина предотвращает высвобождение протеолитических ферментов, приводя к подавлению экссудативного и пролиферативного воспалительных процессов.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь ацеметацин всасывается быстро и полностью.

Распределение

Ацеметацин накапливается в зоне воспаления.

Было обнаружено, что после шести дней лечения ацеметацином (2 × 90 мг в день) или индометацином (3 × 50 мг в день) через шесть часов после последнего приема концентрации активного вещества были существенно выше в синовиальной жидкости, синовиальной оболочке и в мышцах (а также в костной ткани после лечения ацеметацином), по сравнению с концентрациями, обнаруженными в крови. Во всех изученных тканях, кроме синовиальной жидкости

и жировой ткани, после приема ацеметацина концентрации были выше, чем после приема индометацина.

Метаболизм

После приема одной дозы и после повторного приема препарата Рантудил Ретард, ацеметацин и индометацин, который образуется при метаболизме ацеметацина, присутствуют в крови в соотношении 1:1. Нет данных, свидетельствующих об индукции ферментов, которые разрушают ацеметацин.

Выведение

Ацеметацин выводится почками и с желчью. 40% принятого внутрь препарата выводится через почки, оставшаяся часть выводится кишечником. Ацеметацин выводится почками частично в неизменённом виде, частично в виде ацеметацина, конъюгированного с глюкуроновой кислотой, в виде метаболита индометацина (свободного и конъюгированного), образовавшегося при эстеролизе и после расщепления эфира (в метоксильной группе в положении 5) и деацилирования (разложение р-хлоробензоильной группы) в форме фармакологически неактивного соединения.

Связывание с белками и период полувыведения

Ацеметацин связывается с белками плазмы. Период полувыведения составляет приблизительно 4,5 часа.

Концентрации в крови

При применении препарата с контролируемым высвобождением максимальная концентрация в крови достигается значительно позже ($p<0,05$), чем при использовании других форм; концентрации в крови также существенно ниже ($p<0,01$) через два часа после приема внутрь. Однако, через 6 и 10 часов концентрации в плазме ацеметацина с контролируемым высвобождением существенно выше таковых у других рецептур ацеметацина.

Показания к применению:

Боль и нарушение двигательной активности являющиеся следствием следующих заболеваний:

— хронический ревматический артрит (хронический полиартрит), ревматоидный артрит;

— острый болевой синдром, связанный с дегенеративным заболеванием суставов, в частности крупных суставов и позвоночника (артроз, спондилоартроз);

— болезнь Бехтерева (ревматоидный спондилит);

— приступы подагры;

— воспаление суставов, мышц и сухожилий, тендосиновит, бурсит;

— люмбаго, ишиалгия;

— воспаление поверхностных вен (тромбофлебит) и васкулит;

— псориатический артрит;

— воспаления и отеки после операций и травм.

Относится к болезням:

- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Бурсит
- Васкулит
- Воспаление
- Воспаление суставов
- Ишиалгия
- Люмбаго
- Отеки
- Подагра
- Полиартрит
- Псориаз
- Ревматизм
- Ревматоидный артрит
- Спондилоартрит

- Травмы
- Тромбоз
- Тромбофлебит

Противопоказания:

— гиперчувствительность к активному веществу - ацеметацину или индометацину;

— нарушение кроветворения неясной этиологии;

— полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других НПВП (в том числе в анамнезе);

— цереброваскулярное или иное кровотечение, воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, неспецифический язвенный колит) в фазе обострения;

— любое активное заболевание печени, выраженная почечная недостаточность (КК менее 30 мл/мин);

— подтвержденная гиперкалиемия;

— эрозивно-язвенные изменения слизистой желудка и двенадцатиперстной кишки;

— острая или рецидивирующая пептическая язва в анамнезе/кровотечение (два или более явно выраженных эпизодов язвенного поражения или кровотечения);

— сердечно-сосудистая недостаточность III класса;

— период после проведения аортокоронарного шунтирования;

— в I и II триместрах беременности, а также женщинам, пытающимся забеременеть, следует принимать ацеметацин только в случае крайней необходимости; применение ацеметацина в последний триместр беременности и в период лактации противопоказано;

— детский и подростковый возраст (опыт применения у данной категории больных отсутствует).

С осторожностью:

— при наличии болезни Крона, язвенного колита или других заболеваний кишечника в анамнезе;

— при СКВ, болезнях соединительной ткани;

— в случае артериальной гииертензии и/или сердечной недостаточности;

— в случаях нарушения функции почек или печени;

— сообщалось о случаях гипокалиемии при применении индометацина, данный факт должен учитываться, когда рекомендован прием калийсберегающих диуретиков;

— при наличии эпилепсии, болезни Паркинсона и психических расстройств, в том числе в анамнезе;

— при гемофилии;

— у пожилых пациентов;

— в случае инфекций, вызванных вирусом ветряной оспы (ветряная оспа, опоясывающий лишай) в связи с возможным повышенным риском серьезных кожных осложнений.

Способ применения и дозы:

Капсулы следует проглатывать целиком, запивая достаточным количеством жидкости во время еды.

Рекомендуемая доза - по 1 капсуле 1-2 раза в день.

Режим дозирования при приступах подагры

Стандартная рекомендуемая доза для лечения острых приступов подагры, до ослабления симптомов, составляет 180 мг ацеметацина в день (что соответствует 2 капсулам Рантудил Ретард).

Продолжительность лечения зависит от клинической картины, но терапия в дозах, превышающих 2 капсулы препарата Рантудил Ретард в день, должна продолжаться не более 7 дней.

Побочное действие:

Частота развития побочных эффектов определена следующим образом (количество пациентов, у которых проявилась данная реакция): очень часто: >1/10; часто: <1/10 >1/100; нечасто: <1/100 >1/1000; редко: <1/1000 >1/10000; очень редко: <1/10000.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: очень часто - диспепсия: тошнота, рвота, метеоризм, боли в животе, потеря аппетита; часто: язвенные поражения в ЖКТ, иногда сопровождаемые кровотечениями и перфорацией; нечасто - наличие крови в рвотных массах, кале или при диарее; очень редко - стоматит, воспаление языка, поражения пищевода, обострение болезни Крона или язвенного колита, запор, панкреатит.

Со стороны нервной системы: часто - расстройства ЦНС, включая головную боль, вялость/ утомляемость, головокружение, сонливость; очень редко - мышечная астения, гипергидроз, дисгевзия, нарушения памяти, расстройства сна, конвульсии.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень редко - учащение сердцебиения, стенокардия, сердечная недостаточность, гипертензия.

Со стороны печени и желчных путей: часто - повышение уровня ферментов печени; нечасто - поражения печени (токсический гепатит с желтухой или без нее); очень редко - молниеносное течение и иногда без предшествующих симптомов).

Со стороны кровеносной системы: очень редко - анемия, вызванная потерей скрытой крови из ЖКТ, гемолитическая анемия, панцитопения (анемия, включая апластическую анемию, лейкопению, агранулоцитоз, тромбоцитопению). Начальные симптомы могут включать жар, боль в горле, поверхностные поражения в полости рта, гриппоподобные состояния, сильную утомляемость, носовые кровотечения и подкожные кровотечения. В указанных случаях необходимо немедленно прекратить прием препарата и обратиться к врачу. Нельзя самостоятельно принимать анальгетики и/или жаропонижающие средства. В случае длительного лечения должен регулярно выполняться анализ крови. Возможно влияние на агрегацию тромбоцитов и усиление геморрагического диатеза.

Со стороны иммунной системы: часто - реакции повышенной чувствительности (сыпь и зуд); нечасто - крапивница; очень редко - тяжелые реакции гиперчувствительности: отек лица или век, распухание языка, ангионевроз, респираторный дистресс, который может привести к приступу астмы, снижение АД; очень редко - аллергический васкулит и пневмонит.

Со стороны эндокринной системы: очень редко - гипергликемия и глюкозурия.

Со стороны органов зрения: нечасто - дегенерация ретинального пигмента, помутнении роговой оболочки глаз при длительном применении индометацина, основного метаболита ацеметацина.

Со стороны органов слуха: очень редко - шум в ушах и нарушения слуха.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: нечасто - алопеция; очень редко - экзема, энантема, эритема, фоточувствительность, эксфолиативный дерматит и буллезная сыпь, которые могут также иметь тяжелое течение, например, в виде синдрома Стивенса-Джонсона и токсического эпидермального некролиза (синдрома Лайелла).

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - развитие отека, в частности, у пациентов с гипертензией и/или нарушением функции почек; очень редко - нарушения мочеиспускания, повышение уровня мочевины в крови, острая почечная недостаточность, протеинурия, гематурия, интерстициальный нефрит, нефротический синдром, папиллярный некроз. В связи с этим показатели функции почек пациента должны регулярно контролироваться.

Передозировка:

Симптомы:

Учитывая механизм действия препарата, передозировка или неправильное применение могут вызывать расстройства центральной нервной системы, включая головную боль, головокружение, спутанность сознания, сонливость, судороги и потерю сознания вплоть до комы. Кроме того, возможны тошнота, рвота, боль в эпигастральной области, потливость, нарушение баланса электролитов, артериальная гипертензия, отек голеностопных суставов, олигурия, гематурия, угнетение дыхания.

Неотложная помощь:

При симптомах передозировки или в случае предполагаемой передозировки, рекомендовано провести симптоматическое лечение, включающее промывание желудка, индукцию диуреза при поддержании водного баланса, и, в случае необходимости, применение противошоковых мер.

Антидот:

Специфический антидот неизвестен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

В I и II триместрах беременности следует назначать ацеметацин только в случае крайней необходимости. Если ацеметацин применяется у женщин, пытающихся забеременеть, или в первом и втором триместрах беременности, доза должна быть настолько низкой и продолжительность лечения настолько короткой, насколько возможно. В III триместре беременности применение ацеметацина противопоказано.

Применение препарата противопоказано, так как малые количества активного вещества могут поступать в грудное молоко.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Были описаны следующие взаимодействия при применении препарата Рантудил Ретард в сочетании со следующими препаратами:

Дигоксин, литий, фенитоин:

Может иметь место повышение концентрации данных препаратов в плазме крови.

Антикоагулянты:

НПВП могут усиливать действие антикоагулянтов, например варфарина, поэтому при одновременном применении рекомендуется осуществлять мониторинг свертываемости крови пациента.

Кортикостероиды:

Повышен риск образования язвенных поражения ЖКТ или кровотечения.

Прочие НПВП, включая салицилаты:

Одновременный приём нескольких НПВП может повысить риск желудочно-кишечных изъязвлений или кровотечений из-за синергического эффекта, поэтому необходимо избегать одновременного приёма ацеметацина с другими НПВП.

Пробененид, сульфинпиразон:

Могут замедлять выведение ацеметацина.

Антибиотики пенициллинового ряда

Могут замедлять выведение ацеметацина.

Диуретики и антигипертензивные препараты:

Гипотензивный эффект препаратов может быть ослаблен. Фуросемид ускоряет выведение ацеметацина.

Калийсберегающие диуретики:

Могут повышать уровень калия в крови (гиперкалиемия); следует часто контролировать содержание калия.

Антиагреганты и селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (SSRIs):

Повышенный риск желудочно-кишечного кровотечения. Не было сообщений о взаимодействиях между ацеметацином и другими активными веществами, которые также связываются с белками плазмы.

Антацид:

Может снизить скорость всасывания ацеметацина.

Особые указания и меры предосторожности:

Рантудил Ретард должен применяться только если есть возможность оказания экстренной помощи:

- пациентам, у которых проявлялись реакции гиперчувствительности (например, приступы астмы, кожные реакции или острый ринит) на НПВС/анальгетики;

- пациентам, страдающим от астмы, сенной лихорадки, отека слизистой оболочки полости носа или хронического респираторного заболевания;

Особая осторожность необходима, когда Рантудил Ретард принимается одновременно с другими препаратами, действующими на ЦНС, или алкоголем.

У некоторых пациентов, принимавших Рантудил Ретард, наблюдалось повышение показателей функций печени и почек.

При длительном курсе лечения рекомендуется гемограмма, мониторинг свертываемости крови, а также офтальмологическое исследование.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Применение Рантудил Ретард может являться причиной побочных эффектов, включая действие на ЦНС, поэтому во время лечения следует воздержаться от потенциально опасной деятельности, требующей высокой скорости психических и физических реакций (управление транспортными средствами, работа с механизмами, работа на высоте и т.д.).

При нарушениях функции почек

Противопоказано при выраженной почечной недостаточности (КК менее 30 мл/мин). С осторожностью при нарушениях функции почек.

При нарушениях функции печени

Противопоказано при любом активном заболевании печени. С осторожностью при нарушениях функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью следует назначать пожилым пациентам.

Применение в детском возрасте

Противопоказано в детском и подростковом возрасте.

Условия хранения:

При температуре не выше 30°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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