Рупафин

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Рупатадина фумарат

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

◊ ***Таблетки*** светлого оранжево-розового цвета, круглые.

	1 таб.
рупатадина фумарат	12.8 мг,
что соответствует содержанию рупатадина	10 мг

Вспомогательные вещества: крахмал прежелатинизированный - 10 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 15 мг, краситель железа оксид красный (E172) - 25 мкг, краситель железа оксид желтый (E172) - 75 мкг, лактозы моногидрат - 61.1 мг, магния стеарат - 1 мг.

7 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Рупатадин относится ко второму поколению антигистаминных препаратов и представляет собой длительно и избирательно действующий блокатор периферических H_1-гистаминовых рецепторов. Некоторые из его метаболитов (дезлоратадин и 3-гидроксидезлоратадин) сохраняют антигистаминную активность и могут вносить свой вклад в общую эффективность препарата.

Рупатадин демонстрирует высокое сродство к H_1-гистаминовым рецепторам. Исследования рупатадина in vitro в высокой концентрации показали подавление дегрануляции тучных клеток, вызванной иммунологическими и не иммунологическими раздражителями, подавление хемотаксиса эозинофилов и нейтрофилов, а также высвобождения

цитокинов (интерлейкина (ИЛ)-5, ИЛ-6, ИЛ-8 (гранулоцитарно-макрофагального колониестимулирующего фактора), в частности ФНОα из тучных клеток и моноцитов человека. Кроме того рупатадин вызывал дозозависимое подавление экспрессии молекул адгезии нейтрофилов.

Вследствие селективности рупатадина в отношении периферических H_1-гистаминовых рецепторов он не оказывает значительного влияния на активность ЦНС в дозах 10 или 20 мг/сут.

Поскольку выброс гистамина является ключевым звеном патогенеза всех видов крапивницы, ожидается, что при назначении рупатадина в соответствии с клиническими рекомендациями он сможет эффективно уменьшать выраженность симптомов не только хронической идиопатической, но и других вариантов крапивницы.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Рупатадин быстро всасывается после приема внутрь, время достижения C_{max} составляет приблизительно 0.75 ч. Средняя C_{max} составляет 2.6 нг/мл после однократного приема внутрь 10 мг рупатадина и 4.6 нг/мл после однократного приема внутрь 20 мг рупатадина. Фармакокинетика рупатадина является линейной для доз от 10 до 40 мг.

После приема 10 мг 1 раз/сут в течение 7 дней средняя C_{max} составляет 3.8 нг/мл. Концентрация в плазме снижается по биэкспоненциальной кривой со средним $T_{1/2}$ 5.9 ч. Коэффициент связывания рупатадина с белками плазмы составляет 98.5-99%. Так как рупатадин никогда не применялся в/в у людей, данных о его абсолютной биологической доступности нет.

Прием пищи усиливает общее действие рупатадина на организм (AUC увеличивается примерно на 23%). Воздействие на один из его активных метаболитов и на основной неактивный метаболит является практически одинаковым (снижение примерно на 5% и на 3%, соответственно). Время, необходимое для достижения C_{max} рупатадина удлинялось на 1 ч. C_{max} в плазме не изменялась в результате одновременного приема с пищей. Эти различия не имели клинического значения.

Метаболизм и выведение

Рупатадин подвергается значительному пресистемному метаболизму при приеме внутрь. Неизмененная активная субстанция обнаруживается в моче и в кале лишь в незначительных количествах. Это означает, что рупатадин почти полностью метаболизируется. Исследования метаболизма in vitro в микросомах печени человека указывают на то, что рупатадин метаболизируется преимущественно цитохромом Р450 (изофермент CYP 3A4).

При исследовании экскреции у человека (40 мг ^{14}C-рупатадина) установлено, что 34.6% препарата выводится почками, а 60.9% - через кишечник в течение 7 дней. Средний $T_{1/2}$ составляет5.9 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

В исследовании у здоровых добровольцев при сравнении результатов, полученных у лиц молодого и пожилого возраста, величины AUC и C_{max} для рупатадина были выше у пожилых участников исследования. Вероятно, это обусловлено снижением печеночного метаболизма при "первом прохождении" через печень у пожилых людей. Эти различия отмечались только для рупатадина, а не для его метаболитов. Среднее значение $T_{1/2}$ рупатадина у пожилых и у молодых добровольцев составляло 8.7 ч и 5.9 ч соответственно. Поскольку результаты для рупатадина и для его метаболитов не были клинически значимыми, был сделан вывод, что при назначении препарата пожилым пациентам в дозе 10 мг коррекции дозы препарата не требуется.

Показания к применению:

Симптоматическое лечение у взрослых и подростков старше 12 лет:

— аллергического ринита;

— крапивницы.

Относится к болезням:

- Аллергия
- Крапивница
- Ринит

Противопоказания:

— почечная недостаточность;

— печеночная недостаточность;

— беременность;

— период лактации;

— детский возраст до 12 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— редкая наследственная непереносимость галактозы, дефицит лактазы или синдром недостаточности всасывания глюкозы-галактозы;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать пациентам с удлиненным интервалом QT, нескорректированной гипокалиемией, стойкими проаритмическими состояниями, такими как клинически значимая брадикардия, острая ишемия миокарда; пожилым пациентам (65 лет и старше); одновременно со статинами, одновременно с грейпфрутовым соком.

Способ применения и дозы:

Внутрь, независимо от приема пищи.

У **взрослых и детей старше 12 лет** рекомендуемая доза составляет 10 мг (1 таб.) 1 раз/сут.

Побочное действие:

Чаще всего у пациентов, получавших рупатадин, сообщалось о таких побочных реакциях на препарат, как сонливость, головная боль и усталость, проявившиеся у 9.5%, 6.9% и 3.2% пациентов соответственно. В большинстве случаев отмены препарата не требовалось.

Классификация побочных реакций по частоте развития (количество зарегистрированных случаев/количество пациентов): очень часто - более 1/10 случаев, часто - от 1/10 до 1/100 случаев, нечасто - от 1/100 до 1/1000 случаев.

Со стороны нервной системы: часто - сонливость, головная боль, головокружение, усталость, астения; нечасто - снижение концентрации внимания, раздражительность.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - носовое кровотечение, сухость слизистой оболочки носа, фарингит, кашель, сухость в горле, боли в глотке и в гортани, ринит.

Со стороны пищеварительной системы: часто - сухость во рту; нечасто - тошнота, диарея, диспепсия, рвота, боли в животе, запор.

Со стороны обмена веществ и питания: нечасто - повышение аппетита.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - сыпь.

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - боль в спине, артралгия, миалгия.

Со стороны организма в целом: нечасто - жажда, недомогание, лихорадка, увеличение массы тела.

Изменение лабораторных показателей: нечасто - повышение КФК, АЛТ, АСТ, изменение показателей функциональных печеночных проб.

Передозировка:

В литературе не описано случаев передозировки препарата. В исследовании по изучению клинической безопасности рупатадин хорошо переносился в суточной дозе 100 мг в течение 6 дней.

Симптомы: самой распространенной побочной реакцией является сонливость.

Лечение: при случайном приеме внутрь препарата в очень высоких дозах показано вызвать рвоту у пациента с последующим приемом активированного угля. Если данная манипуляция оказывается невозможной или неэффективной, необходимо промыть желудок изотоническим раствором натрия хлорида.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат Рупафин противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Взаимодействие с кетоконазолом и эритромицином

Совместное применение рупатадина в дозе 20 мг и кетоконазола или эритромицина усиливает системное воздействие рупатадина в 10 раз и последних - в 2-3 раза. Эти комбинации не сопровождаются изменениями интервала QT или увеличением частоты побочных реакций по сравнению с раздельным применением указанных препаратов.

Однако рупатадин необходимо применять с осторожностью совместно с этими лекарственными веществами и с другими ингибиторами изофермента CYP3A4.

Взаимодействие с грейпфрутовым соком

Одновременный прием рупатадина и грейпфрутового сока в 3.5 раза усиливает общее действие рупатадина. Не следует употреблять грейпфрутовый сок одновременно с приемом препарата.

Взаимодействие с этанолом

При одновременном применении с этанолом рупатадин в дозе 10 мг не вызывает более выраженного изменения когнитивной, психомоторной деятельности по сравнению с приемом только этанола. Рупатадин, принятый в дозе 20 мг, усиливает изменения, вызванные приемом этанола.

Взаимодействие с лекарственными средствами, угнетающими ЦНС

Нельзя исключить возможность взаимодействия рупатадина с другими антигистаминными препаратами и средствами, угнетающими ЦНС.

Взаимодействие со статинами

В связи с тем, что некоторые из статинов, также как рупатадин, метаболизируются изоферментом CYP3A4 цитохрома P450, нельзя исключить возможность повышения уровня КФК при их совместном применении. По указанным причинам рупатадин следует с осторожностью применять одновременно со статинами.

Особые указания и меры предосторожности:

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При применении препарата в дозе 10 мг не было отмечено влияния на способность к управлению автомобилем и другими механизмами. В то же время имеются сообщения о сонливости, отмечавшейся во время лечения Рупафином. В связи с этим рекомендуется проявлять осторожность при вождении автомобиля или занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, пока не будет установлена индивидуальная реакция пациента на рупатадин.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при почечной недостаточности

При нарушениях функции печени

Противопоказан при печеночной недостаточности

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует назначать пожилым пациентам (65 лет и старше).

Поскольку результаты для рупатадина и для его метаболитов не были клинически значимыми, был сделан вывод, чтопри назначении препарата пожилым пациентам в дозе 10 мг коррекции дозы препарата не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст до 12 лет (эффективность и безопасность не установлены);

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, недоступном для детей месте в оригинальной упаковке при температуре не выше 25°C. Срок годности **-** 3 года.

Условия отпуска в аптеке:

Без рецепта.

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