Трамаклосидол



Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Опиоидный анальгетик, производное циклогексанола. Неселективный агонист мю-, дельта- и каппа-рецепторов в ЦНС. Представляет собой рацемат (+) и (-) изомеров (по 50%), которые различным образом участвуют в обезболивающем воздействии. Изомер(+) является чистым агонистом опиоидных рецепторов, имеет невысокий тропизм и не обладает выраженной селективностью по отношению к различным подтипам рецепторов. Изомер(-), угнетая нейрональный захват норадреналина, активирует нисходящие норадренергические влияния. Благодаря этому нарушается передача болевых импульсов в желатиновую субстанцию спинного мозга.

Вызывает седативный эффект. В терапевтических дозах практически не угнетает дыхание. Оказывает противокашлевое действие.

Фармакокинетика

После приема внутрь быстро и почти полностью всасывается из ЖКТ (около 90%). C_{max} в плазме достигается через 2 ч после приема внутрь. Биодоступность при однократном приеме составляет 68% и увеличивается при многократном применении.

Связывание с белками плазмы - 20%. Трамадол широко распределяется в тканях. V_d после приема внутрь и в/в введения составляет 306 л и 203 л соответственно. Проникает через плацентарный барьер в концентрации, равной концентрации активного вещества в плазме. 0.1% выделяется с грудным молоком.

Метаболизируется путем деметилирования и конъюгации до 11 метаболитов, из которых только 1 является активным.

Выводится почками - 90% и через кишечник - 10%.

Показания к применению:

Умеренный и сильный болевой синдром различного генеза (в т.ч. при злокачественных опухолях, остром инфаркте миокарда, невралгиях, травмах). Проведение болезненных диагностических или терапевтических процедур.

Относится к болезням:

- Болевой синдром
- Миокардит

- Невралгия
- Неврит
- Опухоли
- Травмы

Противопоказания:

Острая интоксикация алкоголем и препаратами, оказывающими угнетающее влияние на ЦНС, детский возраст до 1 года, повышенная чувствительность к трамадолу.

Способ применения и дозы:

Взрослым и детям старше 14 лет разовая доза при приеме внутрь - 50 мг, ректально - 100 мг, в/в медленно или в/м - 50-100 мг. Если при парентеральном введении эффективность недостаточна, то через 20-30 мин возможен прием внутрь в дозе 50 мг.

Детям в возрасте от 1 до 14 лет дозу устанавливают из расчета 1-2 мг/кг.

Длительность лечения определяется индивидуально.

Максимальная доза: взрослым и детям старше 14 лет независимо от способа введения - 400 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: головокружение, слабость, сонливость, спутанность сознания; в отдельных случаях - приступы судорог церебрального генеза (при в/в введении в высоких дозах либо при одновременном назначении нейролептиков).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, ортостатическая гипотензия, коллапс.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, тошнота, рвота.

Со стороны обмена веществ: усиление потоотделения.

Со стороны костно-мышечной системы: миоз.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности следует избегать длительного применения трамадола из-за риска развития привыкания у плода и возникновения синдрома отмены в неонатальном периоде.

При необходимости применения в период лактации (грудного вскармливания) необходимо учитывать, что трамадол в незначительном количестве выделяется с грудным молоком.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с лекарственными средствами, оказывающими угнетающее влияние на ЦНС, с этанолом возможно усиление угнетающего влияния на ЦНС.

При одновременном применении с ингибиторами МАО существует вероятность развития серотонинового синдрома.

При одновременном применении с ингибиторами обратного захвата серотонина, трициклическими антидепрессантами, антипсихотическими средствами, другими средствами, снижающими порог судорожной готовности, повышается риск развития судорог.

При одновременном применении усиливается антикоагулянтный эффект варфарина и фенпрокумона.

При одновременном применении с карбамазепином уменьшается концентрация трамадола в плазме крови и его анальгезирующее действие.

При одновременном применении с пароксетином описаны случаи развития серотонинового синдрома, судорог.

При одновременном применении с сертралином, флуоксетином описаны случаи развития серотонинового синдрома.

При одновременном применении существует вероятность уменьшения обезболивающего действия опиоидных анальгетиков. Длительное применение опиоидных анальгетиков или барбитуратов стимулирует развитие перекрестной толерантности.

Налоксон активирует дыхание, устраняя анальгезию после применения опиоидных анальгетиков.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять при судорогах центрального генеза, наркотической зависимости, спутанном сознании, у пациентов с нарушениями функции почек и печени, а также при повышенной чувствительности к другим агонистам опиоидных рецепторов.

Трамадол не следует применять дольше срока, оправданного с терапевтической точки зрения. В случае длительного лечения нельзя исключить возможность развития лекарственной зависимости.

Не рекомендуется применять для терапии синдрома отмены наркотических веществ.

Необходимо избегать комбинации с ингибиторами МАО.

В период лечения не допускать употребления алкоголя.

Трамадол в виде лекарственных форм пролонгированного действия не следует применять у детей в возрасте до 14 лет.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период применения трамадола не рекомендуется заниматься видами деятельности, требующими повышенного внимания, высокой скорости психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять у пациентов с нарушениями функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять у пациентов с нарушениями функции печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте до 1 года. Детям в возрасте от 1 до 14 лет дозу устанавливают из расчета 1-2 мг/кг.

Трамадол в виде лекарственных форм пролонгированного действия не следует применять у детей в возрасте до 14 лет.

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