Залдиар

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой (пленочной) светло-желтого цвета, продолговатые, двояковыпуклые, с гравировкой "T5" на одной стороне и логотипом компании "Грюненталь" - на другой; на изломе - почти белого цвета.

	1 таб.
трамадола гидрохлорид	37.5 мг
парацетамол	325 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, крахмал прежелатинизированный, натрия крахмал гликолат, крахмал кукурузный, вода очищенная, магния стеарат.

Состав оболочки: опадрай светло-желтый YS-1-6382-G (гипромеллоза, титана диоксид, полиэтиленгликоль 400 (макрогол), краситель железа оксид желтый, полисорбат), воск карнаубский.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированный препарат с анальгезирующим действием.

Трамадол - синтетический опиоидный анальгетик, агонист опиоидных рецепторов. Активирует опиоидные рецепторы (мю-, дельта-, каппа-) на пре- и постсинаптических мембранах афферентных волокон ноцицептивной системы в головном мозге и ЖКТ. Обладает действием на головной и спинной мозг: способствует открытию K^+- и Ca^{2+}-каналов, вызывает гиперполяризацию мембран и тормозит проведение болевых импульсов. Усиливает действие седативных средств.

Парацетамол - анальгетик-антипиретик. Блокирует циклооксигеназу в ЦНС, воздействуя на центры боли и терморегуляции. Не вызывает раздражение слизистой оболочки желудка и кишечника, не оказывает влияния на водно-солевой обмен, поскольку не воздействует на синтез простагландинов в периферических тканях.

Парацетамол обеспечивает быстрое наступление анальгезирующего эффекта, в то время как трамадол - пролонгирование анальгезии. Синергизм анальгезирующего действия двух компонентов снижает риск возникновения побочных эффектов.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь активные компоненты быстро и почти полностью всасываются из ЖКТ. Всасывание трамадола происходит медленнее, чем парацетамола.

C_{max} парацетамола в плазме крови достигается в течение 1 ч и не изменяется при совместном применении с трамадолом. Биодоступность трамадола составляет примерно 75%, при повторном применении увеличивается до 90%.

Распределение

Связывание с белками плазмы трамадола - около 20%, V_d - около 0.9 л/кг. Относительно небольшая часть (до 20%) парацетамола связывается с белками плазмы.

Метаболизм

Трамадол метаболизируется в печени путем N- и O-деметилирования с последующей конъюгацией с глюкуроновой кислотой. Выявлено 11 метаболитов, из которых моно-O-десметилтрамадол (M_1) обладает фармакологической активностью.

Парацетамол метаболизируется преимущественно в печени.

Выведение

Средний $T_{1/2}$ метаболита трамадола составляет 4.7-5.1 ч, $T_{1/2}$ парацетамола - 2-3 ч.

Трамадол (около 30%) и его метаболиты (около 60%) выводятся преимущественно с мочой. Парацетамол и его конъюгаты выводятся также с мочой.

Показания к применению:

— болевой синдром средней и сильной интенсивности различной этиологии (в т.ч. воспалительного, травматического, сосудистого происхождения);

— обезболивание при проведении болезненных диагностических или терапевтических процедур.

Относится к болезням:

- Болевой синдром
- Травмы

Противопоказания:

— острая интоксикация алкоголем или препаратами, угнетающими ЦНС (снотворными средствами, опиоидными анальгетиками и психотропными препаратами);

— одновременное применение ингибиторов МАО и период в течение 2 недель после их отмены;

— тяжелая печеночная и/или почечная недостаточность (КК менее 10 мл/мин);

— эпилепсия, неконтролируемая терапией;

— синдром отмены наркотиков;

— детский возраст до 14 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять у пациентов в состоянии шока, при черепно-мозговой травме, внутричерепной гипертензии, склонности к судорожному синдрому (при эпилепсии, контролируемой терапевтически, Залдиар назначают только по жизненным показаниям), спутанности сознания неизвестной этиологии, нарушении дыхательной функции, одновременном применении психотропных препаратов, других анальгетиков центрального действия и местных анестетиков, заболеваниях желчевыводящих путей, доброкачественных гипербилирубинемиях, вирусном гепатите, дефиците глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, алкогольном поражении печени, алкоголизме, наркомании, при симптомокомплексе "острый" живот неясного генеза, у пациентов пожилого возраста (старше 75 лет).

Способ применения и дозы:

Режим дозирования и продолжительность лечения устанавливают индивидуально в зависимости от выраженности болевого синдрома и чувствительности больного. Не следует назначать препарат свыше оправданного с терапевтической точки зрения срока.

Для **взрослых и детей старше 14 лет** начальная разовая доза составляет 1-2 таб., интервал между приемами разовых доз - не менее 6 ч. Максимальная суточная доза - 8 таб. (300 мг трамадола и 2.6 г парацетамола).

Таблетки следует принимать вне зависимости от приема пищи, проглатывая целиком, не разламывая и не разжевывая, запивая жидкостью. Если пациент забыл принять очередную таблетку, то в следующий прием дозу удваивать не следует.

У **пожилых пациентов (в возрасте 75 лет и старше)** нет необходимости в коррекции разовой дозы. Однако в связи с возможностью замедленного выведения интервал между приемами разовых доз может быть увеличен.

У **пациентов с нарушениями функции почек (КК 30-10 мл/мин)** интервал между приемами разовых доз должен составлять не менее 12 ч. Так как трамадол очень медленно выводится при проведении гемодиализа или гемофильтрации, постдиализное применение для поддержания анальгезирующего действия обычно не требуется.

При **умеренном нарушении функции печени** интервал между приемами препарата следует увеличивать. При **выраженных нарушениях функции печени** препарат применять не следует.

Побочное действие:

Аллергические реакции: крапивница, зуд, отек Квинке.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, слабость, повышенная утомляемость, заторможенность, парадоксальная стимуляция ЦНС (нервозность, ажитация, тревожность, тремор, спазмы мышц, эйфория, эмоциональная лабильность, галлюцинации), сонливость, нарушение сна, спутанность сознания, нарушение координации движения, судороги центрального генеза (при одновременном назначении антипсихотических средств), депрессия, амнезия, нарушение когнитивной функции, парестезии, неустойчивость походки, нарушение зрения, вкуса.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, тошнота, рвота, метеоризм, боли в животе, запор, диарея, затруднение при глотании, повышение активности печеночных ферментов (как правило, без развития желтухи).

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

Со стороны эндокринной системы: гипогликемия вплоть до гипогликемической комы.

Со стороны мочевыделительной системы: затруднение мочеиспускания, дизурия, задержка мочи. При длительном приеме в дозах, значительно превышающих рекомендованные, - нефротоксичность (интерстициальный нефрит, папиллярный некроз).

Со стороны дыхательной системы: диспноэ.

Дерматологические реакции: экзантема, буллезная сыпь, многоформная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла).

Со стороны органов кроветворения: сульфгемоглобинемия. При длительном приеме в дозах, значительно превышающих рекомендованные, - апластическая анемия, панцитопения, агранулоцитоз.

Прочие: повышение потоотделения, нарушение менструального цикла.

Передозировка:

В случае острой передозировки препарата Залдиар, симптомы могут включать признаки и симптомы передозировки трамадола и/или парацетамола.

Симптомы передозировки трамадола: миоз, рвота, коллапс, кома, судороги, депрессия дыхательного центра, апноэ.

Симптомы передозировки парацетамола: острой - диарея, снижение аппетита; хронической - отек мозга, гипокоагуляция, развитие ДВС-синдрома, гипогликемия, метаболический ацидоз, аритмия, коллапс (острая передозировка развивается через 6-14 ч после приема парацетамола, хроническая - через 2-4 сут в случае превышения дозы). Редко молниеносно развивается нарушение функции печени, которое может осложняться почечной недостаточностью (почечный тубулярный некроз).

Лечение: промывание желудка, прием энтеросорбентов (активированный уголь, полифепан), поддержание функции

сердечно-сосудистой системы, обеспечение проходимости дыхательных путей.

При возникновении угнетения дыхания (как синдрома передозировки трамадола) показано введение налоксона; судороги могут быть устранены применением диазепама. Трамадол минимально выводится из сыворотки крови путем гемодиализа или гемофильтрации, поэтому проведение только данных мероприятий для терапии передозировки является неэффективным.

При появлении симптомов передозировки парацетамола показано введение донаторов SH-групп и предшественников синтеза глутатиона (метионина - через 8-9 ч после передозировки и N-ацетилцистеина - через 12 ч). Необходимость в проведении дополнительных мероприятий (дальнейшее введение метионина, в/в введение N-ацетилцистеина) определяется в зависимости от концентрации парацетамола в крови, а также от времени, прошедшего после его приема.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Не следует применять Залдиар при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При совместном применении Залдиара с опиоидными агонистами-антагонистами (бупренорфином, налбуфином, пентазоцином) анальгезирующий эффект снижается в результате конкурирующего действия на рецепторы и возникает риск синдрома отмены, поэтому использование данной комбинации не рекомендуется.

При терапии Залдиаром совместно с другими препаратами, оказывающими угнетающее влияние на ЦНС (например, снотворные средства или транквилизаторы), а также при одновременном приеме этанола побочные эффекты, характерные для трамадола, могут быть более выражены.

Налоксон, являясь антагонистом опиоидных рецепторов, активирует дыхание, устраняя вызываемую Залдиаром анальгезию.

Индукторы микросомального окисления (в т.ч. карбамазепин, фенитоин, этанол, барбитураты, рифампицин, фенилбутазон, трициклические антидепрессанты) уменьшают анальгезирующий эффект Залдиара и его длительность.

Ингибиторы микросомального окисления (в т.ч. циметидин) при одновременном применении снижают риск гепатотоксического действия Залдиара.

Длительное использование барбитуратов снижает эффективность парацетамола.

Длительное совместное использование парацетамола и НПВС повышает риск развития нефропатии и почечного папиллярного некроза, наступления терминальной стадии почечной недостаточности. Одновременное длительное назначение парацетамола в высоких дозах и салицилатов повышает риск развития рака почки или мочевого пузыря.

Сопутствующее применение Залдиара с препаратами, понижающими порог судорожной готовности (например с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина, трициклическими антидепрессантами, нейролептиками), может увеличить опасность возникновения судорог.

Залдиар при одновременном применении в течение длительного времени усиливает эффект непрямых антикоагулянтов (варфарин и другие кумарины), что увеличивает риск кровотечений.

Препараты, ингибирующие изофермент CYP3A4, такие как кетоконазол и эритромицин, могут замедлять метаболизм трамадола (N-деметилирование) и активного O-деметилированного метаболита.

Дифлунисал повышает концентрацию в плазме крови парацетамола на 50%, при этом усиливается риск развития гепатоксичности.

Хинидин повышает концентрацию в плазме крови трамадола и снижает концентрацию M_1 метаболита за счет конкурентного ингибирования изофермента CYP2D6.

Скорость всасывания парацетамола может быть увеличена при одновременном приеме метоклопрамида или домперидона и снижена при одновременном приеме колестирамина.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациенты должны быть проинформированы о необходимости строгого соблюдения режима дозирования. В период приема Залдиара не следует применять другие препараты, содержащие трамадол или парацетамол, без назначения врача.

При длительном неконтролируемом применении Залдиара могут появиться симптомы лекарственной зависимости (раздражительность, фобии, нервозность, нарушения сна, психомоторная активность, тремор, дискомфорт со стороны ЖКТ). При резкой отмене препарата возможно появление признаков синдрома отмены.

У пациентов, имеющих склонность к злоупотреблению или возникновению зависимости, лечение должно проводиться под тщательным врачебным наблюдением в течение короткого периода времени.

В период лечения Залдиаром запрещается прием алкоголя. Риск развития нарушений функции печени возрастает у больных с алкогольным гепатозом.

Во время длительного приема препарата Залдиар необходим контроль картины периферической крови и функционального состояния печени.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Во время лечения препаратом Залдиар следует воздержаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

У пациентов с **нарушениями функции почек (КК 30-10 мл/мин)** интервал между приемами разовых доз должен составлять не менее 12 ч. Так как трамадол очень медленно выводится при проведении гемодиализа или гемофильтрации, постдиализное применение для поддержания анальгезирующего действия обычно не требуется.

При нарушениях функции печени

При **умеренном нарушении функции печени** интервал между приемами препарата следует увеличивать. При **выраженных нарушениях функции печени** препарат применять не следует.

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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