

Зелмак



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Средство, регулирующее моторную функцию ЖКТ, частичный агонист серотониновых 5-HT₄-рецепторов.

Оказывает избирательное действие на ЖКТ. Стимулирует серотониновые 5-HT₄-рецепторы в окончаниях чувствительных (афферентных) нейронов ЖКТ и вызывает высвобождение целого ряда медиаторов (в частности, пептида, связанного с геном кальцитонина). Способствует усилению перистальтики, повышает базальную двигательную активность и нормализует нарушенную пропульсивную активность на протяжении всего ЖКТ. Благодаря повышению образования циклического АМФ под действием тегасерода происходит повышение секреции ионов хлора и воды криптами кишечника. Под влиянием тегасерода уменьшается число импульсов, генерируемых афферентными нейронами в ответ на растяжение прямой кишки.

Тегасерод обладает высоким сродством к серотониновым 5-HT₄-рецепторам человека, при этом не имеет сколь угодно существенного сродства к 5-HT₃ и допаминовым рецепторам.

У больных с синдромом раздраженного кишечника с преобладанием запора тегасерод ускоряет прохождение кишечного содержимого по тонкой и толстой кишке. Способствует нормализации консистенции стула и увеличивает число опорожнений кишечника; уменьшает выраженность совокупности симптомов (дискомфорт/боли в животе, запор), характерных для синдрома раздраженного кишечника.

Фармакокинетика

После приема внутрь тегасерод быстро всасывается из ЖКТ. Время достижения C_{max} составляет около 1 ч. При приеме натощак биодоступность составляет около 10%. Пища снижает биодоступность тегасерода на 40-65% и C_{max} - примерно на 20-40%.

Связывание с белками плазмы составляет 98%. Проникает через ГЭБ в незначительной степени.

Метаболизируется преимущественно путем пресистемного гидролиза в желудке с участием кислой каталазы и путем прямой глюкуронизации.

В исследованиях *in vitro* было показано, что тегасерод не ингибирует изоферменты CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP2E1 и CYP3A4. В то же время нельзя исключить ингибирования изоферментов CYP1A2 и CYP2D6. При изучении метаболизма у человека показано, что тегасерод не подавляет активность ни одного из вышеперечисленных изоферментов системы цитохрома P₄₅₀.

Около 2/3 принятой внутрь дозы выводится в неизменном виде с калом; оставшаяся часть дозы выводится с мочой, преимущественно в виде основного метаболита.

Существенной кумуляции тегасерода в плазме не наблюдается.

У лиц со слабо или умеренно выраженными нарушениями функции печени было отмечено увеличение, по сравнению со здоровыми лицами, среднего значения AUC на 43% и C_{max} на 18%.

Показания к применению:

Синдром раздраженного кишечника.

Противопоказания:

Тяжелая печеночная недостаточность, детский возраст, беременность, период лактации, повышенная чувствительность к тегасероду.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь перед едой. Рекомендуемая доза - по 6 мг 2 раза/сут.

Побочное действие:

Возможно: диарея, боли в животе, тошнота, метеоризм, головная боль, головокружение, боли в спине, гриппоподобные симптомы.

В плацебо-контролируемых исследованиях по безопасности установлено, что у пациентов, получающих тегасерод, повышается риск развития приступа стенокардии, инсульта, усиления боли в грудной клетке, которое может привести к развитию ангинозного приступа. В связи с этим препарат не применяется на рынке в настоящее время.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности, в период лактации.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять у пациентов с легкой или умеренной печеночной недостаточностью.

В связи с риском развития серьезных побочных эффектов тегасерод снят с продажи в США!!!!

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности. С осторожностью применять у пациентов с легкой или умеренной печеночной недостаточностью.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Zelmak>