

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

НАЙЗИЛАТ®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Найзилат®

Международное непатентованное наименование: амтолметин гуацил.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Действующее вещество: амтолметин гуацил 600 мг;

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, гипромеллоза 15 cps, лактозы моногидрат (Flowlac 100), кремния диоксид коллоидный, карбоксиметилкрахмал натрия (тип-А), магния стеарат; *пленочная оболочка:* гипромеллоза 5 cps, титана диоксид, макрогол 400.

Описание

Капсуловидные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой от белого до почти белого цвета, с характерным запахом.

Фармакотерапевтическая группа: противовоспалительные и противоревматические препараты; нестероидные противовоспалительные и противоревматические препараты; производные уксусной кислоты и родственные соединения.

Код АТХ: M01AB

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Амтолметин гуацил является нестероидным противовоспалительным препаратом (НПВП), неселективным ингибитором циклооксигеназы (ЦОГ). Амтолметин гуацил является предшественником толметина. Оказывает противовоспалительное, анальгезирующее, жаропонижающее, десенсибилизирующее действие, обладает гастропротективным эффектом. Подавляет провоспалительные факторы, снижает агрегацию тромбоцитов; угнетает ЦОГ-1 и ЦОГ-2, нарушает метаболизм арахидоновой кислоты, уменьшает образование простагландинов (в том числе в очаге воспаления), подавляет экссудативную и пролиферативную фазы воспаления. Уменьшает

проницаемость капилляров; стабилизирует лизосомальные мембраны; тормозит синтез или инактивирует медиаторы воспаления (простагландины, гистамин, брадикинины, цитокины, факторы комплемента). Блокирует взаимодействие брадикинина с тканевыми рецепторами, восстанавливает нарушенную микроциркуляцию и снижает болевую чувствительность в очаге воспаления. Влияет на таламические центры болевой чувствительности; снижает концентрацию биогенных аминов, обладающих альгогенными свойствами; увеличивает порог болевой чувствительности рецепторного аппарата. Устраняет или уменьшает интенсивность болевого синдрома, уменьшает утреннюю скованность и отеки, увеличивает объем движений в пораженных суставах через 4 дня лечения.

Защитное действие амтолметин гуацила на слизистую оболочку желудка реализуется путем стимуляции рецепторов капсаицина (также их называют ваниллоидными рецепторами), присутствующих в стенках желудочно-кишечного тракта. Вследствие того, что в составе амтолметин гуацила присутствует ванилиновая группа, он может стимулировать капсаициновые рецепторы, что в свою очередь вызывает высвобождение пептида, кодируемого геном кальцитонина (ПКГК), и последующее увеличение продукции оксида азота (NO). Оба этих действия создают противовес отрицательному эффекту, вызываемому снижением количества простагландинов из-за ингибирования ЦОГ. Амтолметин гуацил хорошо переносился пациентами при длительном применении (в течение 6 месяцев).

Фармакокинетика

Всасывание амтолметин гуацила после перорального приема является быстрым и полным. В основном препарат концентрируется в стенках желудка и кишечника, где в течение 2 часов после приема поддерживается его очень высокая концентрация. После всасывания амтолметин гуацил сразу подвергается гидролизу эстеразами плазмы крови с образованием трех метаболитов: MED-5, толметин и гвиакол, которые трансформируются до активного метаболита толметина, который проникает в ткани, оказывая фармакологическое действие. Основной путь метаболизма толметина – окисление метильной группы у бензольного кольца в карбоксильную.

Время достижения максимальной концентрации (T_{Cmax}) после приема внутрь – 20-60 мин. Связь с белками плазмы – 99 %. Период полувыведения ($T_{1/2}$) у взрослых – около 5 часов. В течение 24 часов препарат практически полностью выводится из организма в форме глюкуронидов (с мочой – 80 %, с желчью – 20 %).

Показания к применению

Ревматоидный артрит, остеоартроз, анкилозирующий спондилит, суставной синдром при обострении подагры, бурсит, тендовагинит.

Болевой синдром (слабой и средней интенсивности): артралгия, миалгия, невралгия, мигрень, зубная и головная боль, альгодисменорея; боль при травмах, ожогах.

Предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент использования, на прогрессирование заболевания не влияет.

Противопоказания

Гиперчувствительность к амтолметину, толметину; полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других НПВП (в том числе в анамнезе); эрозивно-язвенные изменения слизистой оболочки желудка и 12-перстной кишки, активное желудочно-кишечное кровотечение; цереброваскулярное или иное кровотечение; воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, язвенный колит) в фазе обострения; гемофилия и другие нарушения свертываемости крови; декомпенсированная сердечная недостаточность; печеночная недостаточность или активное заболевание печени; выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек, подтвержденная гиперкалиемия; период после проведения аорто-коронарного шунтирования; артериальная гипертензия; врожденный дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция; дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы; беременность, период лактации, детский возраст до 18 лет.

С осторожностью

Гипербилирубинемия, хроническая сердечная недостаточность, ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия / гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина 30-60 мл/мин), язвенные поражения желудочно-кишечного тракта в анамнезе, наличие инфекции *H. pylori*, длительное использование НПВП, алкоголизм, тяжелые соматические заболевания, пожилой возраст, одновременный прием пероральных глюкокортикостероидов (в том числе преднизолона), антикоагулянтов (в том числе варфарина), антиагрегантов (в том числе ацетилсалициловой кислоты, клопидогрела), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в том числе циталопрама, флуоксетина, пароксетина, сертралина).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Безопасность применения препарата при беременности или в период грудного вскармливания не установлена.

Препарат противопоказан при беременности и в период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Рекомендуемая доза амтолметин гуацила составляет 600 мг дважды в сутки. В зависимости от степени контроля симптомов заболевания поддерживающая доза может быть снижена до 600 мг один раз в сутки. Максимальная суточная доза – 1800 мг. Для сохранения гастропротективного действия препарата Найзилат® следует принимать на голодный желудок.

Побочное действие

Частота побочных эффектов классифицируется в зависимости от частоты встречаемости случая: часто (1-10 %); нечасто (0,1-1 %); редко (0,01-0,1 %); очень редко (менее 0,01 %), включая отдельные сообщения и частота неизвестна.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – тошнота; нечасто – диспепсия, дискомфорт в желудке и кишечнике, вздутие живота; редко – боли в животе, диарея, рвота, запоры, гастрит; очень редко – пептическая язва, нарушения функции печени.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: частота неизвестна – повышение содержания азота мочевины в крови, инфекции мочевыводящих путей.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – нарушения зрения.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: редко – шум в ушах.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: редко – бронхоспазм, одышка, ринит, отек гортани.

Нарушения со стороны нервной системы: часто – головокружение, головная боль сонливостью; редко – депрессия.

Нарушения со стороны сосудов: часто – подъем артериального давления.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: редко – анемия, тромбоцитопения, агранулоцитоз, лейкопения.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – кожная сыпь (включая макулопапулезную сыпь), пурпура, редко – эксфолиативный дерматит (лихорадка с ознобом или без, покраснение, уплотнение или шелушение кожи, опухание и/или болезненность небных миндалин), крапивница, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла.

Нарушения со стороны иммунной системы: редко – анафилаксия или анафилактоидные реакции (изменение цвета кожи лица, кожная сыпь, крапивница, зуд кожи, тахипноэ или диспноэ, отеки век, периорбитальный отек, одышка, затрудненное дыхание, тяжесть в грудной клетке, свистящее дыхание).

Общие расстройства: часто – слабость; нечасто – отеки (лица, голеней, лодыжек, пальцев, ступней, повышение массы тела); редко – повышенная потливость, лихорадка, лимфаденопатия; очень редко – отек языка.

Передозировка

Симптомы: боль в животе, тошнота, рвота, эрозивно-язвенное поражение желудочно-кишечного тракта, нарушение функции почек, метаболический ацидоз.

Лечение: промывание желудка, введение адсорбентов (активированный уголь) и проведение симптоматической терапии (поддержание жизненно важных функций организма). Специфического антидота не существует.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Индукторы микросомального окисления в печени (фенитоин, этанол, барбитураты, рифампицин, фенилбутазон, трициклические антидепрессанты) увеличивают продукцию гидроксилированных активных метаболитов.

Снижает эффективность урикозурических, гипотензивных лекарственных средств и диуретиков.

Усиливает гипогликемический эффект производных сульфонилмочевины, действие антикоагулянтов, антиагрегантов, фибринолитиков, побочные эффекты эстрогенов, глюкокортикостероидов и минералкортикоидов.

Антациды и колестирамин снижают абсорбцию.

Увеличивает концентрацию в крови препаратов лития, метотрексата.

У некоторых пациентов с нарушениями функции почек совместный прием НПВП и ингибиторов ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) может привести к дальнейшему ухудшению функционирования почек.

Миелотоксичные лекарственные средства усиливают проявления гематотоксичности препарата.

Особые указания

Во время лечения необходим контроль картины периферической крови и функционального состояния печени и почек. Лечение следует прекратить за 48 ч до определения 17-кетостероидов. Во время лечения следует воздерживаться от занятий

потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психических и двигательных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 600 мг.

По 10 таблеток в блистере из непрозрачной ПВХ/ПВДХ пленки/алюминиевой фольги.

По 2 блистера с инструкцией по применению в пачку картонную.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Держатель регистрационного удостоверения / Производитель

Д-р Редди'с Лабораторис Лтд., Индия

Dr. Reddy's Laboratories Ltd., India

Адрес места производства

Производственное подразделение-II, Участки № 42р, 43, 44р, 45р, 46р, 53, 54 и 83, Бачупалли Вилладж, Бачупалли Мандал, Медчал Малкаджгири Дистрикт – 500090, штат Телангана, Индия

Организация, принимающая претензии потребителей:

Представительство фирмы «Д-р Редди'с Лабораторис Лтд.»:

115035, г. Москва, Овчинниковская наб., д. 20, стр. 1

Тел.: +7 (495) 795-39-39

E-mail: adverse@drreddys.com