

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Найзилат, 600 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: амтолметин гуацил.

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит 600 мг амтолметин гуацила.

Вспомогательные вещества, наличие которых необходимо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. разделы 4.3, 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

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

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. 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.

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования

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.

Способ применения

Внутрь.

Для сохранения гастропротективного действия препарата Найзилат следует принимать на голодный желудок.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к амтолметину, толметину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других нестероидных противовоспалительных препаратов (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 и период лактации (см. раздел 4.6);
- детский возраст до 18 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

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 *Helicobacter 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).

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.

Вспомогательные вещества

Препарат Найзилат содержит лактозы моногидрат. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы лопарей или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Безопасность применения препарата при беременности не установлена.

Препарат противопоказан при беременности.

Лактация

Безопасность применения препарата в период грудного вскармливания не установлена.

Препарат противопоказан в период грудного вскармливания.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Во время лечения следует воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психических и двигательных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Частота возникновения нежелательных реакций определялась в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Редко – анемия, тромбоцитопения, агранулоцитоз, лейкопения.

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).

Нарушения со стороны нервной системы

Часто – головокружение, головная боль, сонливость; редко – депрессия.

Нарушения со стороны органа зрения

Редко – нарушения зрения.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта

Редко – шум в ушах.

Нарушения со стороны сосудов

Часто – подъем артериального давления.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Редко – бронхоспазм, одышка, ринит, отек гортани.

Желудочно-кишечные нарушения

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 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 почек и мочевыводящих путей

Частота неизвестна – повышение содержания азота мочевины в крови, инфекции мочевыводящих путей.

Общие нарушения и реакции в месте введения

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

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Тел.: +7 800 550-99-03

E-mail: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. 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.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

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

Код АТХ: M01AB

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Амтолметин гуацил является 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).

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

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.

Время достижения максимальной концентрации (T_{Cmax}) после приема внутрь – 20–60 мин.

Распределение

Связь с белками плазмы – 99 %.

Биотрансформация

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.

Элиминация

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 %).

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Ядро таблетки

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

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

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

По 2 блистера с инструкцией по применению в пачку картонную.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Индия

Д-р Редди'с Лабораторис Лтд. / Dr. Reddy's Laboratories Ltd.

8-2-337, Роад № 3, Банжара Хиллс, Хайдерабад, Телангана-500034, Индия / 8-2-337, Road No. 3, Banjara Hills, Hyderabad, Telangana-500034, India

Тел.: +91 40 4900 2900

Факс: +91 40 4900 2999

E-mail: mail@drreddys.com

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

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

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Найзилат доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org/>