

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

КАТАДОЛОН®

Регистрационный номер: П N015611/01-270409

Торговое название препарата: Катадолон®

Международное непатентованное название (МНН): флупиртин

Лекарственная форма: капсулы

Состав: Одна капсула содержит:

Активное вещество: флупиртина малеат 100 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфата дигидрат, коповидон, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный;

Оболочка: желатин, вода очищенная, краситель железа оксид красный (E172), титана диоксид, натрия лаурилсульфат.

Описание: непрозрачные твердые желатиновые капсулы (тело - красно-коричневого цвета, крышечка - красно-коричневого цвета) размера 2.

Содержимое капсул: порошок от белого до светло-желтого или серовато-желтого или светло-зеленого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: Анальгезирующее ненаркотическое средство.

Код АТХ N02BG07

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Флупиртин является представителем класса лекарственных препаратов селективных активаторов нейрональных калиевых каналов («Selective Neuronal Potassium Channel Opener» - SNEPCO). По своим фармакологическим эффектам препарат представляет собой неопиоидный анальгетик центрального действия, не вызывающий зависимости и привыкания, кроме того, оказывает миорелаксирующее и нейропротективное действие.

В основе действия флупиртина лежит активация потенциалнезависимых калиевых каналов, которая приводит к стабилизации мембранного потенциала нейрона. Влияние на ток ионов калия опосредован воздействием препарата на систему регуляторного G-белка. Обезболивающее действие основано как на непрямом антагонизме по отношению к NMDA (N-metil-D-aspartat)-рецепторам, так и посредством модуляции механизмов боли, связанных с влиянием на ГАМК-ергические системы.

В терапевтических концентрациях флупиртин не связывается с альфа1-, альфа2-адренорецепторами, серотониновыми 5HT1, 5HT2-рецепторами, дофаминергическими,

бензодиазепиновыми, опиатными, центральными мускаринергическими или никотинергическими рецепторами.

Центральное действие флупиртина основано на 3 основных эффектах:

Обезболивающее действие

Флупиртин активирует (открывает) потенциалнезависимые калиевые каналы, что приводит к стабилизации мембранного потенциала нервной клетки. При этом происходит торможение активности NMDA-рецепторов и, как следствие, блокада нейрональных ионных каналов кальция, снижение внутриклеточного тока ионов кальция. Вследствие развивающегося подавления возбуждения нейрона в ответ на ноцицептивные стимулы, ингибирование ноцицептивной активации, реализуется обезболивающий эффект. При этом происходит торможение нарастания нейронального ответа на повторные болевые стимулы. Такое действие предотвращает усиление боли и переход ее в хроническую форму, а при уже имеющемся хроническом болевом синдроме ведет к снижению его интенсивности. Установлено также модулирующее влияние флупиртина на восприятие боли через нисходящую норадренергическую систему.

Миорелаксирующее действие

Антиспастическое действие на мышцы связано с блокированием передачи возбуждения на мотонейроны и промежуточные нейроны, приводящим к снятию мышечного напряжения. Это действие флупиртина проявляется при многих хронических заболеваниях, сопровождающихся болезненными мышечными спазмами (скелетно-мышечные боли в шее и спине, артропатии, тензионные головные боли, фибромиалгия).

Нейропротективное действие

Нейропротективные свойства препарата обуславливают защиту нервных структур от токсического действия высоких концентраций ионов внутриклеточного кальция, что связано с его способностью вызывать блокаду нейрональных ионных кальциевых каналов и снижать внутриклеточный ток ионов кальция.

Фармакокинетика

После приема внутрь препарат быстро и практически полностью (90 %) всасывается в желудочно-кишечном тракте. До 75% принятой дозы метаболизируется в печени с образованием метаболитов М1 и М2. Активный метаболита М1 (2-амино-3-ацетамино-6-[4-фтор]-бензиламинопиридин) образуется в результате гидролиза уретановой структуры (1 фаза реакции) и последующего ацетилирования (2 фаза реакции) обеспечивает в среднем 25% обезболивающей активности флупиртина. Другой метаболит М2 - не является биологически активным, образуется в результате реакции окисления (1 фаза) п-фторбензила с последующей конъюгацией (2 фаза) п-фторбензойной кислоты с глицином.

Период полувыведения препарата из плазмы крови составляет около 7 часов (10 часов для основного вещества и метаболита М1), что является достаточным для обеспечения обезболивающего эффекта.

Концентрация действующего вещества в плазме крови пропорциональна дозе.

У лиц пожилого возраста (старше 65 лет) по сравнению с молодыми пациентами наблюдается увеличение периода полувыведения препарата (до 14 ч при однократном приеме и до 18,6 ч при приеме в течение 12 дней), и максимальная концентрация препарата в плазме крови соответственно в 2 -2,5 раза выше.

Большей частью выводится почками (69%): 27% - в неизменном виде, 28% - в виде метаболита М1 (ацетил-метаболит), 12% - в виде метаболита М2 (пара-фторгиппуровая кислота); 1/3 введенной дозы выводится в виде метаболитов невыясненной структуры. Небольшая часть дозы выводится из организма с желчью и калом.

Показания к применению

Острая и хроническая боль при следующих состояниях:

мышечные спазмы (скелетно-мышечные боли в шее и спине, артропатии, фибромиалгия),

головные боли,

злокачественные новообразования,

дисменорея,

посттравматическая боль,

болевым синдромом при травматологических/ортопедических операциях и вмешательствах

Противопоказания

Повышенная чувствительность к действующему веществу или любому другому компоненту препарата, заболевания печени в анамнезе, холестаза, выраженная миастения, алкоголизм, беременность, период кормления грудью, детский возраст до 18 лет.

С осторожностью: нарушения функции печени и/или почек, возраст старше 65 лет, гипоальбуминемия.

Способ применения и дозы:

Внутрь, не разжевывая и запивая небольшим количеством жидкости (100 мл).

Взрослым: По 1 капсуле 3-4 раза в день с равными интервалами между приемами. При выраженных болях - по 2 капсулы 3 раза в день. Максимальная суточная доза - 600 мг (6 капсул).

Дозы подбирают в зависимости от интенсивности боли и индивидуальной чувствительности больного к препарату.

Больным старше 65 лет: в начале лечения по 1 капсуле утром и вечером. Доза может быть увеличена до 300 мг в зависимости от интенсивности боли и переносимости препарата.

У больных с выраженными признаками почечной недостаточности или при гипоальбуминемии суточная доза не должна превышать 300 мг (3 капсулы).

У больных со сниженной функцией печени суточная доза не должна превышать 200 мг (2 капсулы).

При необходимости назначения более высоких доз препарата за больными устанавливают тщательное наблюдение.

Длительность терапии определяется лечащим врачом и зависит от динамики болевого синдрома и переносимости. При длительном применении следует контролировать активность печеночных ферментов с целью выявления ранних симптомов гепатотоксичности.

Побочное действие:

Наиболее часто (>10% случаев): усталость/слабость (у 15% больных), особенно в начале лечения.

Часто (от 1% до 10%): головокружение, изжога, тошнота, рвота, запор, расстройство пищеварения, метеоризм, боль в животе, сухость во рту, потеря аппетита, депрессия, нарушения сна, потливость, беспокойство, нервозность, тремор, головная боль, диарея.

Редко (от 0,1% до 1%): спутанность сознания, нарушения зрения и аллергические реакции (сыпь, крапивница и зуд, иногда с повышением температуры тела).

Очень редко (менее 0,01%): преходящее повышение активности «печеночных» трансаминаз (при снижении дозы или отмене препарата возвращается к нормальным показателям), острый или хронический лекарственный гепатит (с желтухой или без, с элементами холестаза или без них).

Побочные действия в основном зависят от дозы препарата (за исключением аллергических реакций). Во многих случаях они исчезают сами по себе по мере проведения или после окончания лечения.

Передозировка

Симптомы: тошнота, тахикардия, состояние протрации, плаксивость, спутанность сознания, сухость во рту.

Лечение: симптоматическое (промывание желудка, форсированный диурез, введение активированного угля и электролитов). Специфического антидота нет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Усиливает действие алкоголя, седативных средств и миорелаксантов.

В связи с тем, что флупиртин связывается с белками, следует учитывать возможность взаимодействия его с другими одновременно принимаемыми лекарственными средствами, (например, ацетилсалициловой кислотой, бензилпенициллином, дигоксином, глибенкламидом, пропранололом, клонидином, варфарином и диазепамом), которые могут вытесняться флупиртином из связи с белками, что может приводить к усилению их активности. Особенно этот эффект может быть выражен при одновременном приеме варфарина или диазепама с флупиртином.

При одновременном назначении флупиртина и производных кумарина рекомендуется регулярно контролировать протромбиновый индекс, чтобы своевременно скорректировать дозу кумарина. Данных о взаимодействии с другими антикоагулянтами или антиагрегантами нет (ацетилсалициловая кислота и др.).

При одновременном применении флупиртина с препаратами, которые метаболизируются в печени, требуется регулярный контроль уровня «печеночных» ферментов. Следует избегать комбинированного применения флупиртина и лекарственных средств, содержащих парацетамол и карбамазепин.

Особые указания

У больных со сниженной функцией печени или почек следует контролировать активность печеночных ферментов и содержание креатинина в моче.

У больных старше 65 лет или с выраженными признаками почечной и/или печеночной недостаточности или гипоальбуминемии необходимо проводить коррекцию дозы.

При лечении флупиртина возможны ложноположительные реакции теста с диагностическими полосками на билирубин, уробилиноген и белок в моче.

Аналогичная реакция возможна при количественном определении уровня билирубина в плазме крови.

При применении препарата в высоких дозах в отдельных случаях может отмечаться окрашивание мочи в зелёный цвет, что не является клиническим признаком какой-либо патологии.

Влияние на способность управлять автотранспортом и работу с механизмами

Учитывая, что Катадолон® может ослаблять внимание и замедлять скорость реакции, во время лечения рекомендуется воздерживаться от вождения транспортом и занятий потенциально опасными видами деятельности.

Форма выпуска

Капсулы по 100 мг.

По 10 капсул в блистер из ПВХ/алюминиевой фольги.

По 1, 3, 5 блистеров помещают в картонную пачку вместе с инструкцией по применению.

Условия хранения

При температуре не выше 25° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет. Не применять препарат по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель:

АВД.фарма ГмбХ и Ко. КГ Вазаштрассе 50, 01445 Радебойль, Германия

Произведено

Плива Краков, Фармацевтический завод А.О.

80 ул. Могильска, 31-546 Краков, Польша

Представительство/организация, принимающая претензии:

Представительство компании "Плива Хрватска д.о.о."

117418, Москва, ул. Новочеремушкинская, 61