

Состав

действующее вещество: амтолметин гуацил;

1 таблетка содержит амтолметину гуацилу 600 мг;

вспомогательные вещества: лактоза моногидрат, гипромеллоза; кремния диоксид коллоидный натрия крахмала (тип А); магния стеарат титана диоксид (Е 171) полиэтиленгликоль.

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: белые или почти белые капсулоподобные, покрытые пленочной оболочкой таблетки с гладкой поверхностью с обеих сторон.

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидные противовоспалительные лекарственные средства. Код АТХ М01А.

Фармакодинамика

Амтолметин гуацил - нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП) с противовоспалительным, обезболивающим и жаропонижающим эффектом, что обусловлено угнетением синтеза простагландинов за счет неселективного ингибирования ферментов циклооксигеназы (ЦОГ), но, в отличие от традиционных НПВП, за счет своей структуры обеспечивает гастропротекторный, антисекреторный, антиоксидантный эффекты.

Защитные эффекты обусловлены, как минимум, двумя путями. Вследствие структуры амтолметину гуацилу при его приеме внутрь повышается уровень антиоксидантных ферментов в слизистой оболочке желудка - супероксиддисмутазы (СОД), каталазы, глутатиона, - в то же время уменьшается уровень супероксид-анионов, пероксинитрита или пероксихлорида и малонового диальдегида, что наблюдается преимущественно в условиях перекисного окисления липидов. Один из метаболитов амтолметина гуацила - гваякол (2-метоксифенол) - повышает уровень желудочной синтазы оксида азота (NO). Известная существенная роль оксида азота в механизмах защиты гастродуоденальной слизистой оболочки, важно в период, когда синтез простагландинов подавлен. Амтолметин гуацил действует на периферические

рецепторы капсаицина, тем самым обеспечивая локальный обезболивающий эффект.

Фармакокинетика

Всасывание амтолметина гуацила после перорального применения происходит быстро и полностью. Он преимущественно оседает на стенках желудочно-кишечного тракта, где самый высокий уровень концентрации сохраняется в течение 2 часов после применения. Его трансформация в активные метаболиты начинается после попадания препарата в плазму крови, поэтому сам амтолметин гуацил трудно определить в плазме и тканях. Амтолметин гуацил гидролизуется эстеразой плазмы крови в следующие метаболиты: толметин-глицинамид (MED5), который преобладает в плазме крови, толметин и гваякол (2-метоксифенол). Непосредственно толметин-глицинамид (MED5) далее метаболизируется до толметина. Активные метаболиты достигают высокого уровня концентрации в тканях. Выводится почти полностью в течение 24 часов с мочой (77% дозы) в форме глюкуронидов, в несколько меньших количествах выводится желчью (9,4%) и калом (7,5%).

Показания

Болевой и воспалительный синдром при заболеваниях опорно-двигательного аппарата: при остеоартрите, ревматоидном артрите; при посттравматическом боли.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к амтолметину, толметин; полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других нестероидных противовоспалительных препаратов (в том числе в анамнезе);
- эрозивно-язвенные изменения слизистой оболочки желудка и 12-перстной кишки, активное желудочно-кишечное кровотечение; цереброваскулярные или другая кровотечения воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, язвенный колит) в фазе обострения;
- выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек;
- подтверждена гиперкалиемия;
- декомпенсированная сердечная недостаточность;

- печеночная недостаточность или активное заболевание печени; гемофилия и другие нарушения свертываемости крови;
- период после проведения аортокоронарного шунтирования; артериальная гипертензия;
- врожденный дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция; дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;
- беременность, период лактации;
- детский возраст.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Диуретики и антигипертензивные средства. Амтолметин гуацил, как и другие НПВП, при одновременном применении с диуретиками или антигипертензивными препаратами (например, бета-блокаторами кальциевых каналов, ингибиторами АПФ (АПФ)) может снижать их антигипертензивный эффект. Поэтому комбинацию таких препаратов следует назначать с осторожностью, а пациентам (особенно пожилого возраста) следует периодически контролировать артериальное давление. Необходимо должным образом поддерживать уровень содержания воды в организме и следить за функцией почек в начале и в течение комбинированного лечения. Одновременное применение калийсберегающих диуретиков может приводить к повышению уровня калия в сыворотке крови, в случае такого сочетания лекарственных средств этот показатель следует держать под контролем.

Антикоагулянты и антитромбоцитарные препараты. Существуют отдельные сообщения о повышении риска кровотечений у пациентов, принимавших одновременно НПВП и эти препараты.

Поэтому в случае такого сочетания лекарственных средств рекомендуется тщательное и регулярное наблюдение за больными.

Другие НПВП и кортикостероиды. Одновременное применение амтолметина гуацила и других системных НПВП может повысить частоту побочных реакций со стороны желудочно-кишечного тракта. Следует избегать одновременного применения с системными НПВП, в том числе селективными ингибиторами ЦОГ-2. Амтолметин гуацил усиливает действие кортикостероидов, ГКС, минералокортикоидов.

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

Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (СИОЗС).

Одновременное применение системных НПВП и СИПЗС может повысить риск желудочно-кишечного кровотечения.

Амтолметин гуацил усиливает гипогликемическое действие производных сульфонилмочевины, действие фибринолитиками, побочное действие эстрогенов.

Миелотоксические лекарственные средства усиливают проявления гематоксичности препарата.

Антациды и колестирамин уменьшают абсорбцию амтолметин гуацилу.

Совместный прием амтолметин гуацил с препаратами лития, метотрексатом повышает их концентрацию в крови.

Особенности применения

Амтолметин гуацил пациентам, страдающим на печеночные и почечные заболевания, необходимо применять под наблюдением врача с периодическими лабораторными исследованиями почечной и печеночной функций и контролем картины периферической крови. Если при длительной терапии нарушения со стороны функциональных показателей почек и печени, картина крови ухудшаются, лечение следует прекратить. Следует иметь в виду, что гепатит при приеме НПВП может возникнуть без продромальных явлений.

Пациентам с нарушенной функцией свертывания крови или пациентам, которым проводилась антикоагулянтная терапия, необходимо применять препарат под наблюдением врача.

НПВП могут временно ингибировать агрегацию тромбоцитов. Поэтому пациентам с нарушениями гемостаза необходим тщательный контроль соответствующих лабораторных показателей.

При возникновении нарушений зрительных функций вследствие применения амтолметину гуацилу лечение следует прекратить и провести офтальмологическое обследование.

Пациентам пожилого возраста (от 65 лет), в которых обычно возбуждено почечной и/или печеночной функции, следует применять с осторожностью меньше суточные дозы для предотвращения возникновения нежелательных явлений.

Хотя амтолметин гуацил имеет гастропротекторное безопасност, следует учитывать, что этот препарат относится к НПВП (активный метаболит -

толметин), то есть существует вероятность возникновения характерных для всех НПВП желудочно-кишечных кровотечений, язв, перфорации, которые могут сопровождаться предупреждающими симптомами, или в случае их отсутствия. Такие явления наиболее опасны для пациентов пожилого возраста. В случае их выявления препарат следует отменить.

В вышеуказанных пациентах и пациентов, нуждающихся сопутствующего применения лекарственных средств, содержащих малые дозы ацетилсалициловой кислоты (аспирина) или других препаратов, которые могут повышать риск развития нежелательных реакций со стороны желудочно-кишечного тракта, следует рассмотреть целесообразность комбинированной терапии в сочетании с защитными препаратами (например, ингибиторами «протонной помпы»).

НПВП могут увеличить риск возникновения серьезных сердечно-сосудистых тромботических явлений, инфаркта миокарда и инсульта, которые могут оказаться летальными.

В связи с применением НПВП очень редко сообщалось про кожные реакции, включая эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз. Самый высокий риск этих реакций существует в начале терапии, а развитие этих реакций отмечается в большинстве случаев в первый месяц лечения.

У пациентов с астмой, сезонным аллергическим ринитом, отеком слизистой оболочки носа, хроническими обструктивными заболеваниями легких или хроническими инфекциями дыхательного тракта аллергические реакции на НПВП отмечаются чаще, чем у других пациентов. Поэтому при лечении таких пациентов нужна особая осторожность.

Поскольку простагландины играют важную роль в поддержании почечного кровотока, особая осторожность необходима при лечении пациентов с нарушениями функции сердца или почек, пациентов с артериальной гипертензией в анамнезе, пациентов пожилого возраста, больных, получающих диуретики, а также больных, у которых наблюдается значительное уменьшение объема циркулирующей плазмы любой этиологии, например, в период до и после хирургических вмешательств.

НПВП могут временно ингибировать агрегацию тромбоцитов. Поэтому пациентам с нарушениями гемостаза необходим тщательный контроль соответствующих лабораторных показателей.

Особое внимание следует уделить пациентам, которые применяют другие лекарственные средства, которые могут повысить риск образования язв, кровотечений, в том числе препараты, применяемые перорально (кортикостероиды, антикоагулянты, селективные ингибиторы повторного поглощения серотонина, антиагреганты). При обнаружении каких-либо проявлений нежелательных явлений препарат следует отменить.

Благодаря своим фармакодинамическим свойствам НПВП могут маскировать симптомы, характерные для инфекционно-воспалительных заболеваний.

Препарат содержит лактозу. Если у пациента установлено непереносимость некоторых сахаров, следует проконсультироваться с врачом, прежде чем принимать этот препарат.

Лечение следует прекратить при любых аллергических реакций и/или симптомов побочных реакций. Лечение следует прекратить за 48 часов до определения 17-кетостероидов. Во время лечения следует воздержаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и скорости психических и двигательных реакций.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

При применении амтолметина возможно нарушение зрительных функций. Поэтому рекомендуется воздержаться от управления автотранспортом и/или работы с другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Безопасность применения амтолметина беременным не изучали, поэтому противопоказано применение препарата в период беременности. Неизвестно, что экскрегутся метаболиты амтолметина гуасила в грудное молоко, поэтому противопоказано применять препарат женщинам в период кормления грудью.

Способ применения и дозы

Применять внутрь натощак.

Рекомендуемая доза взрослым - по 1 таблетке 1-2 раза в сутки в зависимости от интенсивности болевого синдрома и течения заболевания. Не следует превышать рекомендуемую суточную дозу. Срок лечения зависит от фармакологического эффекта и общего состояния пациента.

Дети

Противопоказано.

Передозировка

Известны случаи передозировки амтолметина, как и методы лечения в таких случаях. Специального антидота не установлено. В случае передозировки следует промыть желудок, ввести адсорбент (активированный уголь) и провести симптоматическую терапию.

Симптомы при передозировке: боль в животе, тошнота, рвота, эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта, нарушение функции почек, метаболический ацидоз.

Побочные реакции

Побочные реакции классифицированы по частоте возникновения: часто ($\leq 1/100$, $<1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $<1/100$) редко ($\geq 1/10000$, $<1/1000$); очень редко ($<1/10000$).

Со стороны пищеварительной системы: благодаря гастропротекторным свойствам амтолметина гуацила применения препарата обеспечивает минимальный риск проявлений побочных реакций в желудочно-кишечном тракте; редко - тошнота, рвота, диарея, диспепсия, боль в животе, метеоризм, анорексия; очень редко - гастриты, гастроинтестинальная кровотечение, рвота с кровью, геморрагическая диарея, мелена, язва желудка или кишечника (с кровотечением или перфорацией или без них), колиты (в том числе геморрагический колит и обострение язвенного колита или болезни Крона), запор, стоматит, глоссит, расстройства со стороны пищевода, диафрагмоподобные стриктуры кишечника, панкреатит.

Со стороны системы крови и лимфатической системы: очень редко - тромбоцитопения, лейкопения, анемия, агранулоцитоз.

Со стороны иммунной системы: редко - реакции гиперчувствительности, анафилактические/анафилктоидные реакции (изменение цвета кожи лица, кожная сыпь, крапивница, зуд кожи, тахипноэ или диспноэ, отеки век, голеней, пальцев, перорбитальный отек, одышка, замедление дыхания, тяжесть в грудной клетке, свистящее дыхание), включая гипотензию и анафилактический шок очень редко - ангионевротический отек (включая отек лица) часто - повышенная потливость, лимфаденопатия.

Со стороны центральной и нервной системы: часто - головная боль, головокружение редко - сонливость очень редко - дезориентация, депрессия, бессонница, ночные кошмары, раздражительность, психотические расстройства, парестезии, нарушения памяти, судороги, тревожность, тремор, асептический менингит, нарушения вкуса, нарушения мозгового кровообращения.

Со стороны органов чувств: редко - шум в ушах, нарушения зрения, очень редко - нечеткость зрения, диплопия, шум в ушах, расстройства слуха.

Со стороны сердца: очень редко - сердцебиение, грудной боль, сердечная недостаточность, инфаркт миокарда.

Со стороны сосудов: очень редко - артериальная гипертензия, васкулит.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: редко - астма (включая одышку), бронхоспазм, ринит, отек гортани очень редко - пневмониты.

Со стороны пищеварительной системы: часто - повышенный уровень трансаминаз; редко - гепатит, желтуха;

Со стороны кожи и ее производных: часто - кожная сыпь (включая макулопапулезная сыпь) редко - крапивница очень редко - буллезные высыпания; экзема, эритема, мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), эксфолиативный дерматит (лихорадка с ознобом или без, покраснение, уплотнение или шелушение кожи, опухание и/или болезненность небных миндалин), алоpecia, фотосенсибилизация, пурпура, зуд.

Со стороны мочевыделительной системы: очень редко - острая почечная недостаточность, гематурия, протеинурия, нефротический синдром, интерстициальный нефрит, почечный папиллярный некроз, повышение содержания азота мочевины в крови, инфекции мочевыводящих путей.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °C.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, по 1 блистеру в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Д-р Редди'с Лабораторис Лтд, Производственный участок - II.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Участок № 42, 45, 46, с. Бачупали, округ Медчал Малкайгири, штат Телангана, Бачупали Мандал, Индия.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).