

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

КАТАДОЛОН® (KATADOLON®)

Регистрационный номер

Торговое название: КАТАДОЛОН®

Международное непатентованное название: 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 капсулы: желатин, вода очищенная, краситель железа оксид красный, титана диоксид, натрия лаурилсульфат.

Описание

Непрозрачные твердые желатиновые капсулы 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

Флупиртин является прототипом нового класса веществ SNEPCO («Selective Neuronal Potassium Channel Opener» - «селективных активаторов нейрональных калиевых

каналов»). Относится к неопиоидным анальгетикам центрального действия, не вызывающим зависимости и привыкания.

Фармакодинамика

Флупиртин оказывает анальгезирующее, миорелаксирующее и нейропротективное действие, основанное на непрямом антагонизме по отношению NMDA (N-метил-D-аспарат) – рецепторам, на активации нисходящих механизмов модуляции боли и ГАМК-ергических процессов.

В терапевтических концентрациях флупиртин не связывается с альфа₁-, альфа₂-, 5HT₁, 5HT₂-, допаминовыми, бензодиазепиновыми, опиатными, центральными мускаринергическими или никотинергическими рецепторами.

Анальгезирующее действие

Флупиртин в терапевтических дозах 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, торможение возбуждения нейрона в ответ на ноцицептивные стимулы (анальгезия). В результате этих процессов сдерживается формирование ноцицептивной сенситизации (болевого чувствительности) и феномена «wind up» («взвинчивания» - нарастания нейронального ответа на повторные болевые стимулы), что предотвращает усиление боли, переход ее в хроническую форму, а при уже имеющемся хроническом болевом синдроме ведет к снижению ее интенсивности. Установлено также модулирующее влияние флупиртина на перцепцию (чувствительность) 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 практически полностью (до 90 %) и быстро всасывается в желудочно-кишечном тракте. Метаболизируется в печени (до 75% от принятой дозы) с образованием активного метаболита М1. Метаболит М1 (2-амино-3-ацетамино-6-[4-фтор]-бензиламинопиридин) образуется в результате гидролиза уретановой структуры (1 фаза реакции) и последующего ацетилирования (2 фаза реакции). Этот метаболит обеспечивает в среднем 25% анальгетической активности флупиртина. Другой метаболит (М2) - биологически не активный, образуется в результате реакции окисления (I 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 час при однократном приеме и до 18, 6 час при приеме в течение 12 дней) и максимальная концентрация препарата в плазме крови соответственно в 2 -2,5 раза выше.

Выводится в основном (69 %) почками: 27 % выводится в неизменном виде, 28 % - в виде метаболита М1 (ацетил-метаболит), 12 % - в виде второго метаболита М2 (пара-фторгиппуровая кислота) и остальная треть состоит из нескольких метаболитов с невыясненной структурой. Небольшая часть дозы выводится из организма вместе с желчью и калом.

Показания к применению

Для лечения острой и хронической боли, вызванной мышечным спазмом, злокачественными новообразованиями, дисменореей, при головной боли, посттравматических болях, травматологических/ортопедических операциях и вмешательствах.

Противопоказания

Повышенная чувствительность, «печёночная» недостаточность с явлениями

энцефалопатии, холестаза, выраженная миастения, алкоголизм, беременность, детский возраст до 18 лет.

С осторожностью:

назначать препарат больным, имеющим нарушения функции печени и/или почек больным старше 65 лет.

В случае необходимости назначения препарата в период лактации необходимо решить вопрос о прекращении грудного вскармливания на период лечения, т.к. показано, что незначительное количество активного вещества может проникать в материнское молоко.

Способ применения и дозы

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

Взрослым: По 1 капсуле 3-4 раза в день с равным интервалом между приемами. При выраженных болях – по 2 капсулы 3 раза в день. Максимальная суточная доза не должна превышать 600 мг (что соответствует 6 капсулам).

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.

Побочное действие

Наиболее часто (>10% случаев): слабость (около 15 % больных) встречающаяся в начале лечения.

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

Редко (от 0,1 % до 1 %): спутанность сознания, нарушения зрения и аллергические реакции (повышенная температура тела, крапивница и зуд).

Очень редко (менее 0,01 %): повышение активности «печеночных» трансаминаз (после отмены препарата возвращаются к норме), гепатит (острый или хронический, протекающий с желтухой или без желтухи, с элементами холестаза или без).

Побочные действия в основном зависят от дозы препарата. 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: промывание желудка, форсированный диурез, введение активированного угля и электролитов. Симптоматическое лечение. 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 вытеснения его другими одновременно принимаемыми лекарственными средствами. Так, показано, что варфарин и диазепам вытесняются флупиртином из белковых связей, что при одновременном их приеме может приводить к усилению их активности.

При одновременном назначении флупиртина и производных кумарина рекомендуется регулярно контролировать показатель Квика (протромбиновый индекс) для того, чтобы исключить возможное действие или снизить дозу кумарина. Данных о взаимодействии с другими антикоагулянтными и антиагрегантными средствами нет (ацетилсалициловая кислота и др.).

При одновременном применении флупиртина с препаратами, которые также метаболизируются в печени, требуется регулярный контроль за уровнем «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 Катадолон® 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.

Учитывая, что Катадолон® может ослаблять внимание и замедлять ответные реакции организма, рекомендуется во время лечения препаратом воздерживаться от вождения транспортом и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Капсулы по 100 мг. По 10 штук в блистер из ПВХ/алюминиевой фольги.

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

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

Лейпцигер Штрассе 7-13, D-01097 Дрезден, Германия

произведено

Плива Краков, Фармацевтический завод А.О.

80 ул. Могильска, 31-546 Краков, Польша

Претензии потребителей направлять по адресу представительства в РФ:

Представительство компании «Плива Хрватска д.о.о.»

117418 г. Москва, ул. Новочеремушкинская, д. 61

тел. (495) 937-23-20; факс (495) 937-23-21