Аколат



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "ACCOLATE 20" на одной стороне.

	1 таб.
зафирлукаст	20 мг

Вспомогательные вещества: натрия кроскармеллоза, лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, магния стеарат, гипромеллоза, титана диоксид.

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Блокатор лейкотриеновых рецепторов. Синтез лейкотриенов и их взаимодействие с рецепторами относится к звеньям патогенеза бронхиальной астмы (характеризующейся наличием воспалительного процесса) и проявляется в сокращении гладкой мускулатуры и отеке слизистой бронхов, изменении клеточной активности, включая повышение уровня миграции эозинофилов в легочную ткань.

Зафирлукаст - конкурентный, высокоселективный и мощный антагонист пептидных рецепторов лейкотриенов LTC4, LTD4, LTE4 - компонентов медленно реагирующей субстанции анафилаксии. Зафирлукаст действует как противовоспалительный агент, уменьшающий эффект медиаторов воспаления.

Зафирлукаст в одинаковой степени предотвращает бронхоспазм, вызываемый всеми тремя пептидными лейкотриенами (лейкотриены C4, D4 и E4).

Исследования на животных показали, что Аколат эффективно предотвращает вызываемое лейкотриенами повышение проницаемости сосудов, приводящее к отеку, и вызываемое лейкотриенами повышение уровня эозинофилов в легочной ткани.

Специфичность Аколата была доказана в клинических исследованиях, где было показано, что Аколат взаимодействует только с рецепторами лейкотриенов и не действует на простагландиновые, тромбоксановые, холинергические и гистаминовые рецепторы.

Аколат уменьшает клеточный и неклеточный компоненты воспаления в воздухоносных путях, вызываемого антигенной провокацией, с последующим бронхиальным лаважем через 48 ч; зафирлукаст снижает подъем уровня базофилов, лимфоцитов и гистамина, и уменьшает стимулированную продукцию супероксидов альвеолярными макрофагами. Аколат ослаблял возрастающую после провокации ингаляционными аллергенами бронхиальную гиперреактивность и бронхоконстрикцию, индуцированную фактором, активирующим тромбоциты. В дальнейшем чувствительность к метахолину уменьшалась при длительном приеме Аколата в дозе 20 мг 2 раза/сут.

В ходе клинических исследований на фоне длительного приема Аколата было продемонстрировано продолжительное улучшение показателей функции легких по сравнению с началом лечения даже на фоне остаточной концентрации зафирлукаста в плазме.

Исследования у детей 5-11 лет (включительно) показали, что применение Аколата по 10 мг 2 раза/сут существенно улучшает функцию легких ($ОФВ_1$ утренняя и вечерняя ПСВ, частота приема β_2-агонистов) по сравнению с плацебо. Это улучшение сохранялось или увеличивалось при приеме Аколата 10 мг2 раза/сут в течение 1 года.

Установлено дозозависимое ингибирование бронхоконстрикции, вызываемой ингалируемым лейкотриеном D4. Пациенты, страдающие бронхиальной астмой, приблизительно в 10 раз чувствительнее к бронхоконстрикции, вызываемой ингалируемым лейкотриеном D4. Одноразовый прием Аколата позволяет пациентам с бронхиальной астмой ингалировать в 100 раз больше лейкотриена D4 и обеспечивает защиту от 12 до 24 ч.

Аколат ингибирует бронхоконстрикцию, вызываемую несколькими видами провокаций, например, сульфурдиоксидом, физической нагрузкой, холодным воздухом. Аколат ослабляет раннюю и позднюю фазы воспалительных реакций, вызываемых различными антигенами, такими как растения, перхоть животных, амброзия и смешанные антигены.

Аколат облегчает симптомы бронхиальной астмы (уменьшает дневные и ночные симптомы бронхиальной астмы), улучшает функцию легких, уменьшает потребность в приеме бета- адреномиметиков и уменьшает частоту обострений заболевания.

Начальное улучшение симптомов бронхиальной астмы возникает в течение первых недель, а иногда и первых дней приема Аколата.

Аколат предназначен для приема внутрь и, следовательно, удобен для приема пациентам, которые испытывают трудности с применением лекарственных средств в виде аэрозолей.

Фармакокинетика

После приема внутрь всасывается быстро, но недостаточно полно, прием пищи богатой жиром или белком снижает биодоступность на 40%. Время достижения C_{max} - 3 ч. Величина C_{ss} в плазме пропорциональна дозе и прогнозируема по фармакокинетике разовой дозы. Связь с белками (альбумином) - 99%. Кумуляция - низкая.

Экстенсивно метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов. $T_{1/2}$- 10 ч. Выводится с почками на 10%, через кишечник - 89%; частично - с грудным молоком в виде метаболитов. Зафирлукаст не определяется в моче. Метаболиты, определяемые в плазме крови, оказались в 90 раз менее активны, чем зафирлукаст в стандартных тестах активности in vitro.

Фармакокинетика зафирлукаста у подростков и взрослых, страдающих астмой, была схожей с фармакокинетикой у здоровых взрослых мужчин. После коррекции по весу тела не наблюдается сильных отличий между фармакокинетикой зафирлукаста у мужчин и у женщин.

У пациентов пожилого возраста и у лиц, имеющих алкогольный цирроз печени, C_{max} и AUC увеличиваются в 2 раза.

Показания к применению:

— профилактика приступов бронхиальной астмы;

— поддерживающая базисная терапия бронхиальной астмы.

Относится к болезням:

- Бронхит

Противопоказания:

— детский возраст до 7 лет;

— повышенная чувствительность к зафирлукасту или другим ингредиентам препарата.

Аколат не рекомендуется принимать больным, у которых выявлены нарушения функции печени, в т.ч. больным с циррозом печени.

Способ применения и дозы:

Аколат показан для профилактики приступов бронхиальной астмы и поэтому должен приниматься длительно.

Взрослые и **дети старше 12 лет**

Внутрь 20 мг 2 раза/сут. Обычная поддерживающая доза также составляет 20 мг 2 раза/сут. Не следует превышать рекомендованную дозу. Прием более высокой дозы препарата может быть связан с повышением уровня одного или более печеночных ферментов и развитием гепатотоксичности.

Аколат не следует принимать одновременно с пищей, так как пища уменьшает биодоступность зафирлукаста.

Дети от 7 до 11 лет (включительно)

Рекомендуется начинать лечение с дозы 10 мг 2 раза/сут. Рекомендуемая поддерживающая доза составляет 10 мг 2 раза/сут.

Пожилые

Клиренс зафирлукаста у пожилых (старше 65 лет) значительно снижен. C_{max} и AUC приблизительно в 2 раза больше, чем у молодых людей. Однако кумуляции зафирлукаста у пожилых людей при этом не происходит. В клинических исследованиях у пожилых пациентов, получавших Аколат 20 мг 2 раза/сут, не наблюдалось увеличения общей частоты неблагоприятных явлений. Клинический опыт применения Аколата у пожилых пациентов (старше 65 лет) ограничен, в связи с чем рекомендуется проявлять осторожность при назначении препарата данной группе пациентов.

Нарушения функции почек

Не требуется коррекции дозы у пациентов с нарушениями функции почек.

Нарушения функции печени

Клиренс зафирлукаста снижен у пациентов с алкогольным циррозом, так что C_{max} и AUC приблизительно в 2 раза больше, чем у здоровых. Терапию можно начинать с приема 20 мг 2 раза/сут и корректировать дозу в зависимости от клинического ответа. Не проводили клинических исследований с использованием Аколата у больных гепатитом. Также отсутствуют данные о продолжительном применении Аколата у больных с циррозом печени.

Рекомендуется контроль протромбинового времени при одновременном приеме с варфарином.

Побочное действие:

Со стороны ЖКТ: тошнота, рвота, боли в животе (часто).

Со стороны печени и желчевыводящих путей: симптоматический гепатит с и без гипербилирубинемией (редко), гипербилирубииемия без повышенного содержания печеночных ферментов (редко), печеночная недостаточность (очень редко), фульминантный гепатит (очень редко).

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, миалгия (редко).

Со стороны кожных покровов: сыпь, включая везикулярную сыпь, кожный зуд, реакции гиперчувствительности, включая крапивницу и ангионевротический отек (редко), отек (не часто).

Со стороны ЦНС: бессонница, головная боль (часто).

Со стороны гематологической системы: образование гематом при ушибах (редко), кровотечения, включая гиперменнорею (редко), тромбоцитопения (редко) и агранулоцитоз (очень редко).

Со стороны организма в целом: слабость (часто).

Указанные симптомы обычно проходили после прекращения терапии. Отмеченные при приеме Аколата головная боль и нарушения со стороны ЖКТ обычно носили умеренный характер и не требовали отмены препарата.

Наблюдалось увеличение частоты инфекций у пожилых пациентов, получавших Аколат (7.8% против 1.4%). Инфекции обычно протекали легко, преимущественно затрагивали респираторный тракт и не требовали прекращения терапии.

Передозировка:

Имелись отдельные сообщения о случаях передозировки Аколата у людей.

В случае передозировки необходимо проводить поддерживающую терапию. Возможно промывание желудка.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность приема Аколата женщинами во время беременности не установлена. Применение препарата в период беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Зафирлукаст экскретируется с грудным молоком, Аколат не должен назначаться кормящим матерям.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Аколат можно применять одновременно с другими видами медикаментозной терапии, применяемой для лечения аллергии и бронхиальной астмы. Например, Аколат применялся одновременно с ингаляционными ГКС, ингаляционной и пероральной терапией бронходилятаторами, антибиотиками и антигистаминными препаратами без признаков нежелательного взаимодействия.

Аколат можно применять одновременно с пероральными контрацептивами без нежелательного взаимодействия.

Прием Аколата одновременно с ацетилсалициловой кислотой (650 мг 4 раза/сут) может привести к повышению уровня зафирлукаста в плазме приблизительно на 45%.

Прием Аколата одновременно с эритромицином может привести к снижению уровня зафирлукаста в плазме примерно на 40%.

В клинических исследованиях прием Аколата одновременно с теофиллином приводил к снижению уровня зафирлукаста в плазме примерно на 30% без влияния на плазменный уровень теофиллина. Однако в ходе постмаркетинговых исследований были отмечены редкие случаи повышения у пациентов уровня теофиллина при его одновременном приеме с Аколатом.

Прием Аколата одновременно с терфенадином приводит к уменьшению AUC для зафирлукаста на 54%, но без влияния на уровень терфенадина в плазме.

Прием Аколата одновременно с варфарином приводит к увеличению максимального протромбинового времени примерно на 35%. Поэтому рекомендуется контролировать протромбиновое время в случае, если Аколат применяется одновременно с варфарином. Очевидно это взаимодействие является результатом иигибирования зафирлукастом изоферментной системы цитохрома P450 2C9.

У курящих возможно увеличение клиренса зафирлукаста приблизительно на 20%.

Особые указания и меры предосторожности:

Чтобы получить эффект от лечения, Аколат необходимо принимать регулярно, даже если симптомы бронхиальной астмы не беспокоят. Как правило, терапию Аколатом следует продолжать во время обострений бронхиальной астмы.

Так же как ингаляционные ГКС, динатрия кромогликат и недокромил натрия, Аколат не используют для купирования бронхоспазма при острых астматических приступах.

Избегать резкой отмены ингаляционных или пероральных ГКС при переходе к терапии Аколатом.

Применение Аколата не изучалось при лечении интермиттирующей или нестабильной бронхиальной астмы.

При приеме Аколата отмечали случаи развития эозинофильных состояний, включая синдром Churg-Strauss и эозинофильную пневмонию. Проявления могут касаться различных органов и систем, в т.ч. возможно появление васкулита, ухудшение функции легких, сердечные осложнения или невропатия. При этом не удалось подтвердить или отвергнуть причинно-следственную связь с приемом Аколата. При развитии эозинофильного состояния или синдрома Churg-Strauss следует прекратить прием Аколата. Впоследствии не следует возобновлять лечение Аколатом и принимать Аколат с целью установления причинно-следственной связи с развившейся зозинофилией.

Во время терапии Аколатом возможно повышение уровня трансаминаз сыворотки крови. Обычно эти явления носят проходящий характер и протекают бессимптомно, но могут быть и ранними симптомами гепатотоксичности, и в крайне редких случаях ассоциируются с более серьезными гепатоцеллюлярными нарушениями, молниеносным течением гепатита и печеночной недостаточностью. В ходе постмаркетинговых исследований имелись очень редкие сообщения о случаях острых нарушений функции печени, которым не предшествовали клинические симптомы или признаки дисфункции.

В случае возникновения клинических признаков или симптомов, указывающих на дисфункцию печени (например, анорексия, тошнота, рвота, боль в правом верхнем квадранте живота, повышенная утомляемость, вялость, апатия,

гриппоподобные симптомы, увеличение печени, зуд и желтуха), прием препарата следует отменить. Рекомендуется незамедлительно определить уровень сывороточных трансаминаз, в особенности АЛТ сыворотки. Врачи могут учитывать значения, полученные в ходе рутинных исследований печеночных ферментов. Периодический контроль уровня сывороточных трансаминаз не предотвращает возникновения серьезных печеночных нарушений, но своевременное выявление нарушений функции печени, вызванное приемом препарата, наряду с немедленной отменой препарата может способствовать улучшению состояния пациента. Если в ходе проведения исследований функции печени выявлены признаки гепатотоксичности, следует немедленно прекратить прием препарата. Пациентам, у которых Аколат был отменен по причине развития гепатотоксичности, развитие которой не было связано с какой-либо другой причиной, повторное назначение Аколата противопоказано.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Нет сведений, что Аколат приводит к ухудшению этих видов деятельности.

При нарушениях функции почек

Не требуется коррекции дозы у пациентов с нарушениями функции почек.

При нарушениях функции печени

Клиренс зафирлукаста снижен у пациентов с алкогольным циррозом, так что C_{max} и AUC приблизительно в 2 раза больше, чем у здоровых. Терапию можно начинать с приема 20 мг 2 раза/сут и корректировать дозу в зависимости от клинического ответа. Не проводили клинических исследований с использованием Аколата у больных гепатитом. Также отсутствуют данные о продолжительном применении Аколата у больных с циррозом печени.

Применение в пожилом возрасте

Клиренс зафирлукаста у пожилых (старше 65 лет) значительно снижен; C_{max} и AUC приблизительно в 2 раза больше, чем у молодых людей. Однако кумуляции зафирлукаста у пожилых людей при этом не происходит. В клинических исследованиях у пожилых пациентов, получавших Аколалт 20 мг 2 раза/сут, не наблюдалось увеличения общей частоты неблагоприятных явлений. Клинический опыт применения Аколата у пожилых пациентов (старше 65 лет) ограничен, в связи с чем рекомендуется проявлять осторожность при назначении препарата данной группе пациентов.

Применение в детском возрасте

Применение Аколата противопоказано детям в возрасте до 7 лет.

Дети от 7 до 11 лет (включительно): рекомендуется начинать лечение с дозы 10 мг 2 раза/сут. Рекомендуемая поддерживающая доза составляет 10 мг 2 раза/сут.

Условия хранения:

Список Б. Хранить при температуре ниже 30°C в местах, недоступных для детей.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Akolat