Актонель

Код АТХ:

- M05BA07

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ризедроновая кислота

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	**1 таб.**
ризедронат натрия	5 мг,
что соответствует содержанию ризедроновой кислоты	4.64 мг

14 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (6) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ризедроновая кислота является пиридинил бисфосфонатом, которая связывается с кристаллами гидроксиапатита костной ткани. Влияние ризедроновой кислоты на костный обмен связано с ингибированием остеокластов и снижением опосредуемой ими резорбции костной ткани. При этом сохраняется активность остеобластов и процесс образования и минерализации костной ткани. При применении ризедроновой кислоты дозозависимо увеличивается плотность костной ткани и улучшаются ее биомеханические свойства. Ингибирование резорбции костной ткани ризедроновой кислотой является обратимым и прекращается после отмены препарата.

Уже после одного месяца приема ризедроновой кислоты наблюдается снижение уровня биохимических маркеров костного обмена, которое через 3-6 месяцев лечения достигает максимального уровня.

Ризедроновая кислота уменьшает риск развития компрессионных переломов тел позвонков и проксимального отдела бедренной кости при остеопорозе у женщин в постменопаузе и у женщин и мужчин, длительно принимающих глюкокортикостероидные препараты системного действия. Кроме этого она замедляет скорость снижения роста у женщин с постменопаузальным остеопорозом. Кость, образующаяся в течение 2-3-летнего лечения ризедроновой

кислотой, имеет обычную пластинчатую структуру и нормальную степень минерализации.

Фармакокинетика

Абсорбция

После приема внутрь ризедроновая кислота абсорбируется в верхней части тонкого кишечника, его абсорбция происходит относительно быстро (время достижения C_{max} составляет примерно 1 ч) и не зависит от дозы (при использовании в дозах от 2.5 до 30 мг). Биодоступность ризедроновой кислоты из таблетки при ее приеме внутрь в среднем составляет 0.63% и снижается при приеме препарата вместе с пищей. Биодоступность у мужчин и женщин является одинаковой.

Распределение

V_d ризедроновой кислоты при достижении равновесной концентрации составляет 6.3 л/кг, а ее связь с белками плазмы - около 24%.

Метаболизм

Отсутствуют признаки системного метаболизма ризедроновой кислоты.

Выведение

После в/в введения ризедроновой кислоты ее кривая концентрация - время имеет три фазы элиминации с конечным периодом полувыведения, составляющим около 480 ч.

Приблизительно половина абсорбированной дозы выводится почками за 24 ч.

Почечный клиренс в среднем составляет 105 мл/мин, а общий клиренс - 122 мл/мин. Различие между ними, вероятно, отражает клиренс ризедроновой кислоты вследствие его абсорбции костной тканью.

Почечный клиренс не зависит от концентрации препарата в плазме, однако, наблюдается линейная зависимость между почечным клиренсом ризедроновой кислоты и клиренсом креатинина. Неабсорбированный препарат выделяется с калом в неизмененном виде.

Показания к применению:

— лечение постменопаузального остеопороза (для снижения риска переломов бедренной кости и вертебральных переломов);

— профилактика постменопаузального остеопороза;

— профилактика и лечение остеопороза у женщин в постменопаузе, подвергающихся систематическому и продолжительному лечению глюкокортикостероидными препаратами.

Относится к болезням:

- Остеопороз

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к ризедроновой кислоте или к любому другому из компонентов препарата;

— тяжелые нарушения минерального обмена, включая гипокальциемию;

— тяжелое нарушение функции почек (клиренс креатинина < 30 мл/мин);

— период беременности и грудного вскармливания;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— наследственная непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция (из-за наличия в составе препарата лактозы в качестве вспомогательного вещества).

С осторожностью: при эрозивно-язвенных поражениях пищевода и желудка (в т. ч. в анамнезе); при сужении или ахалазии пищевода (недостаточность опыта применения препарата); при невозможности стоять или сидеть, как минимум, в течение 30 мин (недостаточность опыта применения препарата).

Способ применения и дозы:

Рекомендуемая доза препарата Актонель для взрослых составляет 5 мг/сут (1 таблетка). Препарат принимается внутрь, таблетку рекомендуется принимать целиком, не рассасывая и не разжевывая, находясь в вертикальном положении, и запивать стаканом питьевой воды (≥120 мл). Нельзя принимать горизонтальное положение в течение 30 мин после приема таблетки (см. "Особые указания").

На всасывание препарата существенно влияет пища, поэтому для обеспечения оптимальных условий для абсорбции препарата рекомендуется:

— принимать препарат перед завтраком, как минимум за 30 мин до первого в течение этого дня приема пищи, других лекарств или напитков (кроме обычной питьевой воды).

В отдельных случаях, когда прием препарата перед завтраком не возможен, Актонель можно принимать в одно и то же время или между приемами пищи, или вечером с соблюдением следующих рекомендаций, обеспечивающих прием препарата на пустой желудок:

— между приемами пищи - как минимум за 2 ч до приема и через 2 ч после приема любой пищи, медицинских препаратов или напитков (кроме питьевой воды),

— вечером - Актонель должен приниматься, как минимум, через 2 ч после последнего приема пищи, лекарственных препаратов или напитков (кроме питьевой воды) и, как минимум, за 30 мин до отхода ко сну.

При случайном пропуске дозы препарат может быть принят перед завтраком, или между приемами пищи, или вечером в соответствии с вышеуказанными рекомендациями.

В случае недостаточного поступления с пищей кальция и витамина D следует обеспечить их дополнительный прием.

Пожилой возраст

Коррекции дозы не требуется, так как биологическая доступность и распределение препарата у пациентов пожилого возраста (старше 60 лет) и у более молодых лиц одинаковы.

Почечная недостаточность

Коррекции дозы не требуется у пациентов с клиренсом креатинина ≥30 мл/мин. Имеются ограниченные клинические данные о применении препарата Актонель у пациентов с тяжелой формой почечной недостаточности (клиренс креатинина < 30 мл/мин), поэтому не представляется возможным дать какие-либо рекомендации относительно дозы препарата у этой категории пациентов.

Дети

Безопасность и эффективность применения препарата Актонель у детей и подростков не изучена.

Побочное действие:

Данные по побочным эффектам были получены из клинических исследований III фазы у женщин с остеопорозом в постменопаузе, получавших до 36 месяцев лечение ризедронатом в дозе 5 мг/день (5020 пациенток) или плацебо (5048 пациенток). Указанные ниже нежелательные эффекты даются по системам органов в сооветствии со следующими градациями частоты их возникновения:

Очень часто: (≥10%);

Часто: (≥1%-<10%);

Нечасто: (≥0.1%-<1%);

Редко: (≥0.01% - <0.1%);

Очень редко:(<0.01%)

В скобках указывается частота нежелательных эффектов при приеме ризедроновой кислоты в сравнении с плацебо, а знаком «*» отмечено отсутствие соответствующих данных из исследований III фазы (при остеопорозе) о частоте неблагоприятных эффектов, которые указываются, исходя из данных более ранних клинических исследований.

Большинство нежелательных эффектов имели легкую и среднюю степень тяжести и обычно не требовали прекращения лечения.

Со стороны нервной системы

Часто: головная боль (1.8% против 1.4%), головокружение, астения, депрессия, бессонница.

Со стороны глаз

Не часто: острый ирит *.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: запор (5.0% против 4.8%), диспепсия (4.5% против 4.1%), тошнота (4.3% против 4.0%) , боли в животе (3.5% против 3.3%), диарея (3.0% против 2.7%).

Не часто: гастрит (0.9% против 0.7%), эзофагит (0.9% против 0.9%), дисфагия (0.4% против 0.2%), дуоденит (0.2% против 0.1%) , язва пищевода (0.2% против 0.2%).

Редко: глоссит (<0.1% против 0.1%), стриктура пищевода (<0.1% против 0.0%)

Со стороны мышечно-скелетной системы и соединительной ткани

Часто: мышечно-скелетные боли (2.1% против 1.9%).

Со стороны показателей функционального состояния печени

Редко: отклонения от нормы показателей функционального состояния печени*.

Со стороны лабораторных показателей

У некоторых пациентов наблюдалось раннее, преходящее, бессимптомное и незначительное снижение сывороточных концентраций кальция и фосфата.

В ходе постмаркетингового использования наблюдались указанные ниже дополнительные неблагоприятные реакции.

Со стороны глаз

Увеит (воспаление сосудистой оболочки глазного яблока).

Со стороны мышечно-скелетной системы и соединительной ткани

Остеонекроз верхней и/или нижней челюсти.

Описаны случаи развития остеонекроза верхней и нижней челюсти в основном у онкологических пациентов на фоне противоопухолевого лечения, включающего бисфосфонаты. Факторами риска развития остеонекроза являются онкологические заболевания, химиотерапия, лучевая терапия, лечение кортикостероидными препаратами, недостаточная гигиена ротовой полости, местный инфекционно-воспалительный процесс, включая остеомиелит. В большинстве описанных случаев больным на фоне лечения бисфосфонатами была проведена экстракция зубов. Причинная взаимосвязь остеонекроза верхней и нижней челюсти с приемом бисфосфонатов остается неясной.

Кожные реакции

Очень редко: аллергические и кожные реакции, включая ангионевротический отек, генерализованную сыпь и буллезные кожные реакции, иногда тяжелые.

Прочие

Инфекции (в т. ч. мочевыводящих путей), повышение артериального давления.

Передозировка:

Симптомы передозировки:

У ряда пациентов после значительной передозировки можно ожидать существенное снижение уровня кальция в плазме. У некоторых из этих пациентов могут также наблюдаться признаки и симптомы гипокальциемии.

Лечение передозировки:

Нет какой-либо специальной информации по лечению острой передозировки таблетками Актонель 5 мг. При значительной передозировке для удаления неабсорбированного препарата рекомендуется провести промывание желудка. Для связывания ризедроновой кислоты и уменьшения ее абсорбции можно давать молоко или антациды, содержащие магний, кальций или алюминий.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Запрещено использовать препарат во время беременности.

Запрещено использовать препарат в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Официальных исследований по изучению взаимодействия не проводилось, однако во время клинических исследований не наблюдалось клинически значимых взаимодействий с другими лекарственными средствами, а именно, нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП), H_2-гистаминоблокаторами, ингибиторами протонного насоса, антацидными средствами, блокаторами медленных кальциевых каналов, бета-адреноблокаторами, тиазидными диуретиками, глюкокортикостероидами, антикоагулянтами, противосудорожными препаратами, сердечными гликозидами.

При одновременном приеме ризедроновой кислоты и ацетилсалициловой кислоты или НПВП (3 или более дня в неделю) частота побочных эффектов со стороны желудочно-кишечного тракта не увеличивалась.

При необходимости возможно использование ризедроновой кислоты в сочетании с заместительной гормонотерапией эстрогенами.

Лекарственные средства, содержащие поливалентные катионы, такие как кальций, магний, железо и алюминий могут снижать абсорбцию ризедроновой кислоты (см. "Особые указания").

Ризедроновая кислота не подвергается системному метаболизму, не индуцирует изоферменты цитохрома 450, а также слабо связывается с белками, в связи с чем маловероятно наличие у нее фармакокинетических взаимодействий на уровне метаболизма или связи с белком.

Особые указания и меры предосторожности:

Эффективность бисфосфонатов при постменопаузальном остеопорозе установлена при низкой минеральной плотности костной ткани (МПКТ) (Т-критерий МПКТ в проксимальном отделе бедра или поясничном отделе позвоночника ≤-2.5 SD) и/или наличии переломов в анамнезе. Пожилой возраст или клинические факторы риска развития переломов не являются достаточными основаниями для начала лечения остеопороза бисфосфонатами.

Эффективность бисфосфонатов (включая ризедроновую кислоту) в отношении предотвращения переломов при остеопорозе у женщин очень пожилого возраста (более 80 лет) меньше, чем у женщин более молодого возраста, что возможно объясняется ростом значимости других (помимо остеопороза) факторов возникновения переломов, обусловленных старением организма.

Одновременно с препаратом Актонель нельзя принимать пищевые продукты, напитки (кроме обычной питьевой воды) и лекарственные средства, содержащие поливалентные катионы (такие как кальций, магний, железо и алюминий), так как это может повлиять на абсорбцию ризедроната натрия.

Некоторые бисфосфонаты ассоциируются с эзофагитом и язвами пищевода. Поэтому пациенты должны точно следовать инструкции по режиму дозирования и способу применения (смотри раздел "Способ применения и дозы"). Особую значимость рекомендации по приему препарата имеют для пациентов с заболеваниями пищевода, нарушающими проходимость пищевода, такими как стриктура пищевода и ахалазия пищевода.

Особую осторожность следует соблюдать при приеме препарата пациентами, неспособными находиться в вертикальном положении, как минимум, в течение 30 мин после приема препарата (отсутствие достаточного опыта приема препарата у таких пациентов).

Перед началом лечения таблетками Актонель 5 мг следует устранить гипокальциемию, а также и другую патологию, оказывающую влияние на костный и минеральный метаболизм (например, нарушения функции паращитовидных желез, недостаток витамина D). При недостаточном поступлении с пищей кальция и витамина D необходим их дополнительный прием.

У онкологических больных, в курс лечения которых включались бисфосфонаты (преимущественно вводимые в/в), наблюдалось развитие челюстного остеонекроза, обычно при удалении зуба и/или при местной инфекции (включая остеомиелит). Многие из этих пациентов получали химиотерапию и глюкокортикостероидные препараты. У пациентов с факторами риска развития челюстного остеонекроза, такими как наличие онкологического заболевания, проведение химиотерапии и/или облучения, прием глюкокортикостероидов, плохая гигиена полости рта, рекомендуется консультация стоматолога перед назначением бисфосфонатов. Кроме этого у таких пациентов следует по возможности избегать проведения хирургических вмешательств на челюсти. В случае развития остеонекроза у пациентов, получающих лечение бисфосфонатами, хирургическое вмешательство на челюсти может приводить к ухудшению состояния.

Нет сведений о том, что отмена лечения бисфосфонатами у пациентов, нуждающихся в хирургическом вмешательстве на челюсти, снижает риск развития челюстного остеонекроза.

При нарушениях функции почек

Противопоказание: тяжелое нарушение функции почек (клиренс креатинина < 30 мл/мин).

Применение в пожилом возрасте

Коррекции дозы не требуется, так как биологическая доступность и распределение препарата у пациентов пожилого возраста (старше 60 лет) и у более молодых лиц одинаковы.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Препарат следует хранить при температуре не выше 25°C в недоступном для детей месте!

Не использовать препарат после окончания срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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