Альвеско



Код АТХ:

- R03BA08

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Циклесонид

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Аэрозоль для ингаляций дозированный в виде бесцветного прозрачного раствора.

	1 распыление
циклесонид	40 мкг

Вспомогательные вещества: норфлуран (HFA-134a) - 54.51 мг, этанол - 4.74 мг.

5 мл (60 распылений) - баллончики алюминиевые (1) с дозирующим клапаном и мундштуком с защитной крышкой - пачки картонные.
8 мл (120 распылений) - баллончики алюминиевые (1) с дозирующим клапаном и мундштуком с защитной крышкой - пачки картонные.

Аэрозоль для ингаляций дозированный в виде бесцветного прозрачного раствора.

	1 распыление
циклесонид	80 мкг

Вспомогательные вещества: норфлуран (HFA-134a) - 54.46 мг, этанол - 4.74 мг.

5 мл (60 распылений) - баллончики алюминиевые (1) с дозирующим клапаном и мундштуком с защитной крышкой - пачки картонные.
8 мл (120 распылений) - баллончики алюминиевые (1) с дозирующим клапаном и мундштуком с защитной крышкой - пачки картонные.

Аэрозоль для ингаляций дозированный в виде бесцветного прозрачного раствора.

	1 распыление
циклесонид	160 мкг

Вспомогательные вещества: норфлуран (HFA-134a) - 54.37 мг, этанол - 4.73 мг.

5 мл (60 распылений) - баллончики алюминиевые (1) с дозирующим клапаном и мундштуком с защитной крышкой - пачки картонные.
8 мл (120 распылений) - баллончики алюминиевые (1) с дозирующим клапаном и мундштуком с защитной крышкой - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Гормоны и их антагонисты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

ГКС для местного применения в виде ингаляций. Циклесонид проявляет низкое сродство к глюкокортикоидным рецепторам. После ингаляции при участии ферментов превращается в легких в основной метаболит (дезциклесонид, С21-дезметилпропионилциклесонид), который обладает выраженной противовоспалительной активностью и поэтому считается активным метаболитом. Циклесонид подавляет воспалительные реакции в дыхательных путях и, таким образом, ослабляет симптомы бронхиальной астмы, улучшает функцию легких.

Фармакокинетика

Всасывание

Пероральное или в/в введение меченного радиоактивным изотопом циклесонида показало, что степень абсорбции составляет 24.5%. При приеме препарата внутрь биодоступность как циклесонида, так и активного метаболита незначительна (<0.5% для циклесонида, и <1% для метаболита) в связи со значительным влиянием пресистемного метаболизма.

Накопление циклесонида у здоровых пациентов в легких - свыше 50%. В соответствии с этой цифрой системная биодоступность для активного метаболита после ингаляционной дозы – свыше 50%. Т.к. биодоступность активного метаболита при приеме циклесонида внутрь менее 1%, препарат, принятый ингаляционно не оказывает системного воздействия.

Распределение

После в/в введения здоровым добровольцам циклесонид быстро распределяется вследствие его высокой липофильности. V_d составляет в среднем 2.9 л/кг для циклесонида и 12.1 л/кг для дезциклесонида.

Связывание циклесонида с белками плазмы составляет около 99%, активного метаболита - 98-99%.

Метаболизм

Циклесонид гидролизуется до биологически активного метаболита посредством фермента эстеразы в легких. Активный метаболит циклесонида, главным образом, метаболизируется до гидроксилированных неактивных метаболитов посредством катализа с участием изофермента CYP3A4. Клиренс циклесонида составляет около 152 л/ч и дезциклесонида - около 228 л/ч, что свидетельствует о высокой степени экстракции вещества печенью.

Выведение

Циклесонид выводится, главным образом, с калом, как после приема внутрь, так и после в/в введения, что говорит о преимущественном выделении его с желчью.

Фармакокинетика у отдельных групп пациентов

Пациенты с почечной и печеночной недостаточностью, пожилые пациенты

Коррекция дозы у данной группы пациентов не требуется.

Т.к. активный метаболит не выводится почками, исследования у пациентов с ослабленной почечной функцией почек не проводились.

У пациентов с печеночной недостаточностью были отмечены удлиненный $T_{1/2}$ и небольшое увеличение времени удержания дезциклесонида (активного метаболита) в крови. Вследствие этого не исключается накопление данного вещества при приеме препарата в высоких дозах.

Дети

Фармакокинетические параметры дезциклесонида идентичны для детей и взрослых.

Показания к применению:

— бронхиальная астма.

Относится к болезням:

- Астма
- Бронхиальная астма
- Бронхит

Противопоказания:

— возраст до 6 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов с легочным туберкулезом в активной или хронической форме; у пациентов с бактериальными, вирусными или грибковыми инфекциями дыхательных путей.

Способ применения и дозы:

Альвеско применяют только для пероральной ингаляции. Препарат следует принимать ежедневно в течение длительного периода времени.

Альвеско дозируют индивидуально. Начальную дозу следует подбирать в зависимости от тяжести состояния. При достижении желаемого клинического эффекта, дозу следует снизить до минимальной, необходимой для контролирования проявлений заболевания.

Взрослым и подросткам старше 12 лет, пациентам пожилого возраста при *бронхиальной астме от легкой до средней степени тяжести* рекомендованная ежедневная доза составляет от 160 мкг до 640 мкг; дозу 640 мкг следует делить на 2 приема в сут. При *бронхиальной астме тяжелой степени* доза может быть увеличена максимально до 640 мкг 2 раза/сут ежедневно.

Улучшение проявлений заболевания наступает в течение 24 ч после приема Альвеско. Предполагается, что максимальный эффект от лечения - как и с другими ингаляционными ГКС - достигается после 2-3 месячного применения препарата.

Пациенты не должны прекращать лечение, даже при отсутствии симптомов бронхиальной астмы.

Пациентам пожилого возраста коррекция дозы не требуется.

Детям старше 6 лет рекомендованная ежедневная доза составляет 80-160 мкг 1 раз/сут или по 80 мкг 2 раза/сут.

Альвеско можно применять со спейсером или без него. Если использование спейсера необходимо, рекомендуется применять спейсер AeroChamberPlus.

Пациентам с почечной или печеночной недостаточностью коррекция дозы не требуется.

Взрослые и подростки, постоянно принимающие пероральные ГКС: у пациентов с тяжелым течением бронхиальной астмы, которые зависят от пероральной терапии ГКС (например, преднизолоном), доза Альвеско составляет 640 мкг 2 раза/сут. Перевод пациентов с перорального ГКС на Альвеско возможен в стадии ремиссии. Альвеско в дозе 640 мкг 2 раза/сут следует применять в течение 10 дней в комбинации с пероральным ГКС. Дозу перорального ГКС следует затем постепенно снижать каждую неделю до минимальной эффективной дозы, с уменьшением ежедневной дозы не более, чем на 2.5 мг каждый раз.

Инструкция по использованию ингалятора

Пациенты должны быть проинструктированы о правильном обращении с ингалятором.

Если ингалятор новый или не использовался более одной недели, то первые три нажатия клапана должны быть выполнены в воздух. Нет никакой необходимости встряхивания баллона, т.к. это растворенный аэрозоль.

1. Следует снять защитный колпачок с пульверизатора и проверить мундштук внутри и снаружи. Убедиться, что он чистый и сухой.

2. Следует перевернуть ингалятор дном вверх (дном баллона вверх), расположить свой указательный палец на дне баллона, а большой палец – под мундштуком.

3. Сделать максимальный выдох настолько, насколько это возможно. Не следует выдыхать в ингалятор.

4. Поместить мундштук в рот и сомкнуть губы вокруг него.

5. Только после того, как начался вдох, нажать указательным пальцем на верхушку ингалятора для высвобождения лекарства во время медленного и глубокого вдоха. Следует позаботиться о том, чтобы лекарство не могло пройти через пространство между губами и мундштуком.

6. Задержать дыхание, удалить мундштук изо рта и снять палец с верхушки ингалятора. Нужно продолжать задерживать дыхание в течение приблизительно 10 сек или насколько возможно дольше. Медленно выдохнуть через рот. Следует избегать выдыхать через мундштук.

Важно не торопиться во время проведения пунктов 3-6.

7. Если необходимо сделать дополнительный вдох, нужно подождать 30 сек и повторить пункты 3-6.

8. После использования всегда нужно надевать защитный колпачок для предохранения от пыли. Плотно закрыть и зафиксировать на месте.

9. В целях гигиены:

— следует очищать регулярно мундштук снаружи и внутри сухой салфеткой;

— используя сухую сложенную салфетку, нужно протереть поверхность с маленьким отверстием, откуда выходит лекарство;

— не следует использовать воду или какую-либо другую жидкость.

Побочное действие:

Частота/Система органов	**Нечасто (>1/1000, < 1/100)**	**Редко (>1/10 000, < 1/1000)**
Со стороны сердечно-сосудистой системы		Усиленное сердцебиение** Повышение АД
Со стороны пищеварительной системы	Тошнота, рвота* Неприятный вкус	Боль в животе* Диспепсия*
Местные реакции	Ощущение раздражения и першения в горле Сухость слизистой оболочки полости рта и глотки	
Аллергические реакции		Ангионевротический отек Гиперчувствительность
Инфекционные и паразитарные заболевания	Грибковые инфекции полости рта*	
Со стороны нервной системы	Головная боль*	
Со стороны дыхательной системы	Дисфония Кашель после ингаляции* Парадоксальный бронхоспазм*	
Со стороны кожных покровов	Экзема и кожная сыпь	

* идентичный или более низкий процент по сравнению с плацебо

** сердцебиение наблюдалось во время клинических исследований в случаях одновременного применения с препаратами, которые могут оказывать побочное действие на сердечный ритм (например, теофиллин или сальбутамол).

Парадоксальный бронхоспазм может встречаться непосредственно после ингаляции и являться неспецифической острой реакцией на любые ингаляционные медицинские препараты, которая может быть связана с активным веществом, вспомогательными веществами или охлаждением вследствие испарения пропеллента в случае применения дозируемых ингаляторов. В большинстве случаев это умеренно неблагоприятная реакция, которая не требует прекращения лечения Альвеско и может пройти самостоятельно.

Ингаляционные ГКС могут вызывать системные эффекты, особенно при применении в высоких дозах в течение длительного времени. Возможные системные эффекты включают синдром Кушинга и кушингоподобные симптомы, такие как подавление надпочечников, замедление роста у детей и подростков, уменьшение плотности кости, катаракту и глаукому. Именно поэтому важно, чтобы доза ингаляционного ГКС снижалась до минимальной эффективной, которая позволяет удовлетворительно контролировать симптомы заболевания.

Передозировка:

Острая передозировка

Симптомы: ингаляционное применение однократной дозы 2880 мкг циклесонида у здоровых добровольцев переносилось хорошо. Возможность острых токсических эффектов вслед за передозировкой ингаляционного циклесонида низка. Возможно усиление сухости слизистой оболочки полости рта и глотки, ощущения раздражения

или першения в горле, дисфонии.

Лечение: после острой передозировки необходимость специфического лечения отсутствует.

Хроническая передозировка

Симптомы: после продолжительного введения 1280 мкг циклесонида не наблюдалось клинических признаков подавления надпочечников. Однако если превышение рекомендованной дозы продолжается в течение сверхдлительного периода времени, некоторая степень подавления надпочечников не может быть исключена.

Лечение: рекомендуется контролировать функцию надпочечников. В случаях передозировки Альвеско терапия может быть продолжена дозой, достаточной для поддержания терапевтического эффекта.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Контролируемые исследования у беременных женщин не проводились. Тем не менее, после ингаляционного приема препарата концентрация циклесонида в сыворотке крови очень низкая, следовательно, воздействие на эмбрион и потенциальная токсичность для репродукции незначительны.

Выделение циклесонида или его метаболитов с грудным молоком не исследовалось.

Как и другие ингаляционные ГКС, Альвеско можно применять при беременности и лактации по назначению врача, если ожидаемый лечебный эффект превышает риск развития возможных побочных эффектов. Новорожденные, матери которых при беременности получали ГКС, должны находиться под наблюдением врача для исключения гипофункции надпочечников.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

По данным in vitro CYP3A4 является основным ферментом, вовлеченным в метаболизм активного метаболита циклесонида - M1 (дезциклесонида) у человека.

В исследованиях лекарственного взаимодействия между циклесонидом и кетоконазолом, в качестве сильного ингибитора CYP3A4, влияние на активный метаболит дезциклесонид увеличивалось примерно в 3.5 раза, тогда как влияния на циклесонид отмечено не было. Исходя из этого, следует избегать одновременного применения потенциальных ингибиторов CYP3A4 и циклесонида.

Исследование взаимодействия циклесонида и субстрата CYP3A4 эритромицина не показало никакого взаимодействия между ними.

Особые указания и меры предосторожности:

Альвеско не показан для лечения астматического статуса или других острых приступов бронхиальной астмы, требующих проведения интенсивных терапевтических мер.

Доза Альвеско может быть уменьшена у пациентов, нуждающихся в пероральных ГКС.

Для пациентов, переведенных с пероральной терапии ГКС на ингаляционное лечение препаратом Альвеско, может сохраняться снижение функции коры надпочечников в течение значительного периода времени после перевода. Возможность развития нежелательных эффектов от применения пероральных ГКС может сохраняться в течение некоторого времени после их отмены. В подобных случаях рекомендуется проводить контроль резервной функции коры надпочечников. Всегда следует принимать во внимание возможность остаточного ухудшения функции коры надпочечников в критической ситуации (терапевтической или хирургической) и в других индивидуальных случаях, которые могут быть вызваны стрессовой реакцией, вследствие этого следует начинать соответствующее лечение ГКС.

В случае недостаточности функции коры надпочечников или серьезных обострений дозу препарата Альвеско следует увеличить; если необходимо, то следует применять пероральные ГКС.

В случае развития инфекции следует применять антибиотики.

Парадоксальный бронхоспазм с усилением хрипов и другие симптомы сужения бронхов, появившиеся непосредственно после ингаляции, следует лечить с помощью быстродействующего бронхорасширяющего средства, что обычно приводит к быстрому облегчению. Пациента необходимо осмотреть, и продолжать терапию препаратом Альвеско только в том случае, если после взвешенного рассмотрения ожидаемый эффект выше, чем возможный риск. Следует принимать во внимание взаимосвязь между степенью тяжести астмы и общей предрасположенностью к острым бронхиальным реакциям.

Перевод пациентов, принимавших пероральные ГКС, на Альвеско

При переводе на Альвеско и последующем ведении пациентов, получавших лечение пероральными ГКС, требуется контроль врача, т.к. восстановление сниженной функции надпочечников, вызванной продолжительной систематической терапии ГКС, может занять некоторое время.

У пациентов, получавших системные ГКС в течение длительного времени или в высокой дозе, может наблюдаться подавление функции надпочечников. Функцию надпочечников этих пациентов необходимо контролировать регулярно, и дозу системных ГКС следует уменьшать постепенно.

После приблизительно одной недели может быть начато постепенное исключение системных ГКС с уменьшением их ежедневной дозы на 1 мг преднизолона, или его эквивалент. При поддерживающей дозе преднизолона более 10 мг ежедневно, может оказаться целесообразным более значительное снижение дозы в течение недельных интервалов, при этом необходима осторожность.

Некоторые пациенты могут плохо себя чувствовать во время отмены препарата, несмотря на сохранение или даже улучшение дыхательной функции. Их необходимо обследовать на наличие адренокортикальной недостаточности.

При переводе пациентов с приема системных ГКС на ингаляционную терапию могут проявляться аллергические реакции (например, аллергический ринит, экзема), которые раньше были подавлены системными препаратами. В таких случаях следует проводить симптоматическую терапию антигистаминными средствами, в т.ч. препаратами для наружного и местного применения, содержащими ГКС.

Использование в педиатрии

Применение препарата у **детей в возрасте до 6 лет** противопоказано.

Действие ингаляционных ГКС при длительном применении у детей до конца не выяснено. Врач должен постоянно наблюдать за развитием роста детей, принимающих ГКС в течение длительного периода. Если рост замедляется, то терапию следует пересмотреть с целью уменьшения дозы ингаляционного ГКС, по возможности, до минимальной эффективной, которая позволяет контролировать симптомы бронхиальной астмы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Данных о влиянии препарата на способность к управлению транспортными средствами и механизмами не имеется.

При нарушениях функции почек

Пациентам с почечной недостаточностью коррекции дозы не требуется.

При нарушениях функции печени

Пациентам с печеночной недостаточностью коррекции дозы не требуется.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста коррекция дозы не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказано применение у **детей в возрасте до 6 лет**. **Детям старше 6 лет** рекомендованная ежедневная доза составляет 80-160 мкг 1 раз/сут или по 80 мкг 2 раза/сут.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Содержимое баллона находится под давлением. Баллон нельзя вскрывать и подвергать нагреванию выше 50°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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