Дексаметазон



Код АТХ:

- S01BA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Дексаметазон

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный или бледно-желтого цвета.

	1 амп.
дексаметазона натрия фосфат (в пересчете на дексаметазона фосфат)	4 мг

Вспомогательные вещества: метилпарабен, пропилпарабен, натрия метабисульфит, динатрия эдетат, натрия гидроксид, вода д/и.

1 мл - ампулы темного стекла (25) - коробки картонные.
1 мл - флаконы темного стекла (25) - коробки картонные.

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный или бледно-желтого цвета.

	1 мл	**1 амп.**
дексаметазона натрия фосфат (в пересчете на дексаметазона фосфат)	4 мг	8 мг

Вспомогательные вещества: метилпарабен, пропилпарабен, натрия метабисульфит, динатрия эдетат, натрия гидроксид, вода д/и.

2 мл - ампулы темного стекла (25) - коробки картонные.
2 мл - флаконы темного стекла (25) - коробки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Гормоны и их антагонисты
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Синтетический глюкокортикоид (ГКС), метилированное производное фторпреднизолона. Оказывает противовоспалительное, противоаллергическое, иммунодепрессивное действие, повышает чувствительность бета-адренорецепторов к эндогенным катехоламинам.

Взаимодействует со специфическими цитоплазматическими рецепторами (рецепторы для ГКС есть во всех тканях, особенно их много в печени) с образованием комплекса, индуцирующего образование белков (в т.ч. ферментов, регулирующих в клетках жизненно важные процессы.)

Белковый обмен: уменьшает количество глобулинов в плазме, повышает синтез альбуминов в печени и почках (с повышением коэффициента альбумин/глобулин), снижает синтез и усиливает катаболизм белка в мышечной ткани.

Липидный обмен: повышает синтез высших жирных кислот и триглицеридов, перераспределяет жир (накопление жира происходит преимущественно в области плечевого пояса, лица, живота), приводит к развитию гиперхолестеринемии.

Углеводный обмен: увеличивает абсорбцию углеводов из желудочно-кишечного тракта; повышает активность глюкозо-6-фосфатазы (повышение поступления глюкозы из печени в кровь); увеличивает активность фосфоэнолпируваткарбоксилазы и синтез аминотрансфераз (активация глюконеогенеза); способствует развитию гипергликемии.

Водно-электролитный обмен: задерживает Na^+ и воду в организме, стимулирует выведение K^+ (минералокортикоидная активность), снижает абсорбцию Ca^+ из ЖКТ, снижает минерализацию костной ткани.

Противовоспалительный эффект связан с угнетением высвобождения эозинофилами и тучными клетками медиаторов воспаления; индуцированием образования липокортинов и уменьшения количества тучных клеток, вырабатывающих гиалуроновую кислоту; с уменьшением проницаемости капилляров; стабилизацией клеточных мембран (особенно лизосомальных) и мембран органелл. Действует на все этапы воспалительного процесса: ингибирует синтез простагландинов (Pg) на уровне арахидоновой кислоты (липокортин угнетает фосфолипазу А2, подавляет либерацию арахидоновой кислоты и ингибирует биосинтез эндоперекисей, лейкотриенов, способствующих процессам воспаления, аллергии и др.), синтез "провоспалительных цитокинов" (интерлейкин 1, фактор некроза опухоли альфа и др.); повышает устойчивость клеточной мембраны к действию различных повреждающих факторов.

Иммунодепрессивный эффект обусловлен вызываемой инволюцией лимфоидной ткани, угнетением пролиферации лимфоцитов (особенно Т-лимфоцитов), подавлением миграции В-клеток и взаимодействия Т- и В- лимфоцитов, торможением высвобождения цитокинов (интерлейкина-1, 2; гамма-интерферона) из лимфоцитов и макрофагов и снижением образования антител.

Противоаллергический эффект развивается в результате снижения синтеза и секреции медиаторов аллергии, торможения высвобождения из сенсибилизированных тучных клеток и базофилов гистамина и других биологически активных веществ, уменьшения числа циркулирующих базофилов, Т- и В- лимфоцитов, тучных клеток; подавления развития лимфоидной и соединительной ткани, снижения чувствительности эффекторных клеток к медиаторам аллергии, угнетения антителообразования, изменения иммунного ответа организма.

При обструктивных заболеваниях дыхательных путей действие обусловлено, главным образом, торможением воспалительных процессов, предупреждением или уменьшением выраженности отека слизистых оболочек, снижением эозинофильной инфильтрации подслизистого слоя эпителия бронхов и отложении в слизистой бронхов циркулирующих иммунных комплексов, а также торможением эрозирования и десквамации слизистой. Повышает чувствительность бета-адренорецепторов бронхов мелкого и среднего калибра к эндогенным катехоламинам и экзогенным симпатомиметикам, снижает вязкость слизи за счет уменьшения ее продукции.

Подавляет синтез и секрецию АКТГ и вторично - синтез эндогенных ГКС.

Тормозит соединительнотканные реакции в ходе воспалительного процесса и снижает возможность образования рубцовой ткани.

Особенность действия - значительное ингибирование функции гипофиза и практически полное отсутствие минералокортикостероидной активности.

Дозы 1-1.5 мг/сут угнетают функцию коры надпочечников; биологический период полувыведения - 32-72 ч (продолжительность угнетения системы гипоталамус-гипофиз-корковое вещество надпочечников).

По силе глюкокортикоидной активности 0.5 мг дексаметазона соответствуют примерно 3.5 мг преднизона (или преднизолона), 15 мг гидрокортизона или 17.5 мг кортизона.

Фармакокинетика

В крови связывается (60-70%) со специфическим белком-переносчиком - транскортином. Легко проходит через гистогематические барьеры (в т.ч. через гемато-энцефалический и плацентарный).

Метаболизируется в печени (в основном путем конъюгации с глюкуроновой и серной кислотами) до неактивных метаболитов.

Выводится почками (небольшая часть - лактирующими железами). $T_{1/2}$ дексаметазона из плазмы - 3-5 ч.

Показания к применению:

Заболевания, требующие введения быстродействующего ГКС, а также случаи, когда пероральный прием препарата невозможен:

— эндокринные заболевания: острая недостаточность коры надпочечников, первичная или вторичная недостаточность коры надпочечников, врожденная гиперплазия коры надпочечников, подострый тиреоидит;

— шок (ожоговый, травматический, операционный, токсический) - при неэффективности сосудосуживающих средств, плазмозамещающих препаратов и другой симптоматической терапии;

— отек головного мозга (при опухоли головного мозга, черепно-мозговой травме, нейрохирургическом вмешательстве, кровоизлиянии в мозг, энцефалите, менингите, лучевом поражении);

— астматический статус; тяжелый бронхоспазм (обострение бронхиальной астмы, хронического обструктивного бронхита);

— тяжелые аллергические реакции, анафилактический шок;

— ревматические заболевания;

— системные заболевания соединительной ткани;

— острые тяжелые дерматозы;

— злокачественные заболевания: паллиативное лечение лейкоза и лимфомы у взрослых пациентов; острая лейкемия у детей; гиперкальциемия у пациентов, страдающих злокачественными опухолями, при невозможности перорального лечения;

— заболевания крови: острые гемолитические анемии, агранулоцитоз, идиопатическая тромбоцитопеническая пурпура у взрослых;

— тяжелые инфекционные заболевания (в сочетании с антибиотиками);

— в офтальмологической практике (субконънктивальное, ретробульбарное или парабульбарное введение): аллергический конъюнктивит, кератит, кератоконъюнктивит без повреждения эпителия, ирит, иридоциклит, блефарит, блефароконъюнктивит, склерит, эписклерит, воспалительный процесс после травм глаза и оперативных вмешательств, симпатическая офтальмия, иммуносупрессивное лечение после трансплантации роговицы;

— локальное применение (в область патологического образования): келоиды, дискоидная красная волчанка, кольцевидная гранулема.

Относится к болезням:

- Агранулоцитоз
- Аденоиды (гипертрофия глоточной миндалины)
- Аллергия
- Астма
- Блефарит
- Блефароконъюнктивит
- Близорукость (миопия)
- Бронхит
- Бронхоспазм
- Волчанка
- Дерматит
- Инфекции
- Иридоциклит
- Ирит
- Кератит
- Кератоконус
- Конъюнктивит
- Лейкемия
- Лейкоз
- Лимфома
- Менингит
- Опухоли
- Отек головного мозга
- Ревматизм
- Ревматические заболевания

- Склерит
- Травмы
- Тромбоз
- Черепно-мозговая травма
- Шок
- Энцефалит
- Эписклерит

Противопоказания:

Для кратковременного применения по жизненным показаниям единственным противопоказанием является повышенная чувствительность к дексаметазону или компонентам препарата.

У детей в период роста ГКС должны применяться только по абсолютным показаниям и под особо тщательным наблюдением лечащего врача.

С *осторожностью* препарат следует назначать при следующих заболеваниях и состояниях:

— заболевания ЖКТ - язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, эзофагит, гастрит, острая или латентная пептическая язва, недавно созданный анастомоз кишечника, неспецифический язвенный колит с угрозой перфорации или абсцедирования, дивертикулит;

— паразитарные и инфекционные заболевания вирусной, грибковой или бактериальной природы (в настоящее время или недавно перенесенные, включая недавний контакт с больным) - простой герпес, опоясывающий герпес (виремическая фаза), ветряная оспа, корь; амебиаз, стронгилоидоз; системный микоз; активный и латентный туберкулез. Применение при тяжелых инфекционных заболеваниях допустимо только на фоне специфической терапии.

— пре- и поствакцинальный период (8 недель до и 2 недели после вакцинации), лимфаденит после прививки БЦЖ;

— иммунодефицитные состояния (в т.ч. СПИД или ВИЧ-инфицирование);

— заболевания сердечно-сосудистой системы (в т.ч. недавно перенесенный инфаркт миокарда - у больных с острым и подострым инфарктом миокарда возможно распространение очага некроза, замедление формирования рубцовой ткани и, вследствие этого, - разрыв сердечной мышцы), тяжелая хроническая сердечная недостаточность, артериальная гипертензия, гиперлипидемия);

— эндокринные заболевания - сахарный диабет (в т.ч. нарушение толерантности к углеводам), тиреотоксикоз, гипотиреоз, болезнь Иценко- Кушинга, ожирение (III-IV ст.)

— тяжелая хроническая почечная и/или печеночная недостаточность, нефроуролитиаз;

— гипоальбуминемия и состояния, предрасполагающие к ее возникновению;

— системный остеопороз, миастения gravis, острый психоз, полиомиелит (за исключением формы бульбарного энцефалита), открыто- и закрытоугольная глаукома;

— беременность.

Способ применения и дозы:

Режим дозирования является индивидуальным и зависит от показаний, состояния больного и его реакции на терапию. Препарат вводят в/в медленно струйно или капельно (при острых и неотложных состояниях); в/м; возможно также локальное (в патологическое образование) введение. С целью приготовления раствора для в/в капельной инфузии следует использовать изотонический раствор натрия хлорида или 5% раствор декстрозы.

В остром периоде при различных заболеваниях и в начале терапии Дексаметазон применяют в более высоких дозах. В течение суток можно вводить от 4 до 20 мг Дексаметазона 3-4 раза.

*Дозы препарата для **детей** (в/м):*

Доза препарата при проведении заместительной терапии (при недостаточности коры надпочечников) составляет 0.0233 мг/кг массы тела или 0.67 мг/м^2 площади поверхности тела, разделенная на 3 дозы, каждый 3-й день или 0.00776 - 0.01165 мг/кг массы тела или 0.233 - 0.335 мг/м^2 площади поверхности тела ежедневно. При других показаниях рекомендуемая доза составляет от 0.02776 до 0.16665 мг/кг массы тела или 0.833 - 5 мг/м^2 площади поверхности тела каждые 12-24 ч.

При достижении эффекта дозу снижают до поддерживающей или до прекращения лечения. Продолжительность парентерального применения обычно составляет 3-4 дня, затем переходят на поддерживающую терапию дексаметазоном в таблетках.

Длительное применение высоких доз препарата требует постепенного снижения дозы с целью предотвращения развития острой недостаточности коры надпочечников.

Побочное действие:

Обычно Дексаметазон хорошо переносится. Он обладает низкой минералокортикоидной активностью, т.е. его влияние на водно-электролитный обмен невелико. Как правило, низкие и средние дозы Дексаметазона не вызывают задержки натрия и воды в организме, повышенной экскреции калия. Описаны следующие побочные эффекты:

Со стороны эндокринной системы: снижение толерантности к глюкозе, стероидный сахарный диабет или манифестация латентного сахарного диабета, угнетение функции надпочечников, синдром Иценко-Кушинга (лунообразное лицо, ожирение гипофизарного типа, гирсутизм, повышение артериального давления, дисменорея, аменорея, мышечная слабость, стрии), задержка полового развития у детей.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, панкреатит, стероидная язва желудка и двенадцатиперстной кишки, эрозивный эзофагит, желудочно-кишечные кровотечения и перфорация стенки желудочно-кишечного тракта, повышение или снижение аппетита, нарушение пищеварения, метеоризм, икота. В редких случаях - повышение активности печеночных трансаминаз и щелочной фосфатазы.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмии, брадикардия (вплоть до остановки сердца); развитие (у предрасположенных пациентов) или усиление выраженности сердечной недостаточности, изменения на электрокардиограмме, характерные для гипокалиемии, повышение артериального давления, гиперкоагуляция, тромбозы. У больных с острым и подострым инфарктом миокарда - распространение очага некроза, замедление формирования рубцовой ткани, что может привести к разрыву сердечной мышцы.

Со стороны нервной системы: делирий, дезориентация, эйфория, галлюцинации, маниакально-депрессивный психоз, депрессия, паранойя, повышение внутричерепного давления, нервозность или беспокойство, бессонница, головокружение, вертиго, псевдоопухоль мозжечка, головная боль, судороги.

Со стороны органов чувств: задняя субкапсулярная катаракта, повышение внутриглазного давления с возможным повреждением зрительного нерва, склонность к развитию вторичных бактериальных, грибковых или вирусных инфекций глаз, трофические изменения роговицы, экзофтальм, внезапная потеря зрения (при парентеральном введении в области головы, шеи, носовых раковин, кожи головы возможно отложение кристаллов препарата в сосудах глаза).

Со стороны обмена веществ: повышенное выведение кальция, гипокальциемия, повышение массы тела, отрицательный азотистый баланс (повышенный распад белков), повышенная потливость.

Обусловленные минералокортикоидной активностью - задержка жидкости и натрия (периферические отеки), гипсрнатрнемия, гипокалиемнческийсиндром (гипокалиемия, аритмия, миалгия или спазм мышц, необычная слабость и утомляемость).

Со стороны опорно-двигательного аппарата: замедление роста и процессов окостенения у детей (преждевременное закрытие эпифизарных зон роста), остеопороз (очень редко - патологические переломы костей, асептический некроз головки плечевой и бедренной кости), разрыв сухожилий мышц, стероидная миопатия, снижение мышечной массы (атрофия).

Со стороны кожных покровов и слизистых оболочек: замедленное заживление ран, петехии, экхимозы, истончение кожи, гипер- или гипопигментация, стероидные угри, стрии, склонность к развитию пиодермии и кандидозов.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, анафилактический шок, местные аллергические реакции.

Местные при парентеральном введении: жжение, онемение, боль, покалывание в месте введения, инфекции в месте введения, редко - некроз окружающих тканей, образование рубцов в месте инъекции; атрофия кожи и подкожной клетчатки при в/м введении (особенно опасно введение в дельтовидную мышцу).

Прочие: развитие или обострение инфекций (появлению этого побочного эффекта способствуют совместно применяемые иммунодепрессанты и вакцинация), лейкоцитурия, "приливы" крови к лицу, синдром "отмены".

Передозировка:

Возможно усиление описанных выше побочных явлений.

Необходимо уменьшить дозу Дексаметазона. Лечение симптоматическое.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности (особенно в I триместре) препарат может быть применен только тогда, когда ожидаемый лечебный эффект превышает потенциальный риск для плода. При длительной терапии в период беременности не исключена возможность нарушения роста плода. В случае применения в конце беременности существует опасность возникновения атрофии коры надпочечников у плода, что может потребовать проведения заместительной терапии у новорожденного.

Если необходимо проводить лечение препаратом во время грудного вскармливания, то кормление грудью следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Возможна фармацевтическая несовместимость дексаметазона с другими в/в вводимыми препаратами - его рекомендуется вводить отдельно от других препаратов (в/в болюсно, либо через др. капельницу, как второй раствор). При смешивании раствора дексаметазона с гепарином образуется осадок.

Одновременное назначение дексаметазона с:

— *индукторами печеночных микросомальных ферментов* (фенобарбитал, рифампицин, фенитоин, теофиллин, эфедрин) приводит к снижению его концентрации;

— *диуретиками* (особенно тиазидными и ингибиторами карбоангидразы) *и амфотерицином В* **-** может привести к усилению выведения из организма K^+ и увеличению риска развития сердечной недостаточности;

— *с натрийсодержащими препаратами* - к развитию отеков и повышению артериального давления;

— *сердечными гликозидами* **-** ухудшается их переносимость и повышается вероятность развития желудочковой экстраситолии (из-за вызываемой гипокалиемии);

— *непрямыми антикоагупянтами* - ослабляет (реже усиливает) их действие (требуется коррекция дозы);

— *антикоагулянтами и тромболитиками* **-** повышается риск развития кровотечений из язв в ЖКТ;

— *этанолом и НПВП* - усиливается риск возникновения эрозивно-язвенных поражений в желудочно-кишечном тракте и развития кровотечений (в комбинации с НПВП при лечении артритов возможно снижение дозы глюкокортикостероидов из-за суммации терапевтического эффекта);

— *парацетамолом* - возрастает риск развития гепатотоксичности (индукция печеночных ферментов и образования токсичного метаболита парацетамола);

— *ацетилсалициловой кислотой* **-** ускоряет ее выведение и снижает концентрацию в крови (при отмене дексаметазона уровень салицилатов в крови увеличивается и возрастает риск развития побочных явлений);

— *инсулином и пероралъными гипогликемическими препаратами, гипотензивными средствами* **-** уменьшается их эффективность;

— *витамином D* **-** снижается его влияние на всасывание Ca^{2+} в кишечнике;

— *соматотропным гормоном* **-** снижает эффективность последнего, а с *празиквантелом* **-** его концентрацию;

— *М-холиноблокаторами* (включая антигистаминные препараты и трициклические антидепрессанты) *и нитратами* **-** способствует повышению внутриглазного давления;

— *изониазидом и мексилетином* - увеличивает их метаболизм (особенно у "медленных" ацетилаторов), что приводит к снижению их плазменных концентраций.

Ингибиторы карбоангидразы и "петлевые" диуретики могут увеличивать риск развития остеопороза.

Индометацин, вытесняя дексаметазон из связи с альбуминами, увеличивает риск развития его побочных эффектов.

АКТГ усиливает действие дексаметазона.

Эргокальциферол и паратгормон препятствуют развитию остеопатии, вызываемой дексаметазоном.

Циклоспорин и кетоконазол, замедляя метаболизм дексаметазона, могут в ряде случаев увеличивать его токсичность.

Одновременное назначение андрогенов и стероидных анаболических препаратов с дексаметазоном способствует развитию периферических отеков и гирсутизма, появлению угрей.

Эстрогены и пероральные эстрогенсодержащие контрацептивы снижают клиренс дексаметазона, что может сопровождаться усилением выраженности его действия.

Митотан и другие ингибиторы функции коры надпочечников могут обусловливать необходимость повышения дозы дексаметазона.

При одновременном применении с живыми противовирусными вакцинами и на фоне других видов иммунизации увеличивает риск активации вирусов и развития инфекций.

Антипсихотические средства (нейролептики) и азатиоприн повышают риск развития катаракты при назначении дексаметазона.

При одновременном применении с антитиреоидными препаратами снижается, а с тиреоидными гормонами - повышается клиренс дексаметазона.

Особые указания и меры предосторожности:

Во время лечения Дексаметазоном (особенно длительного) необходимо наблюдение окулиста, контроль АД и состояния водно-электролитного баланса, а также картины периферической крови и уровня глюкозы крови.

С целью уменьшения побочных явлений можно назначать антациды, а также следует увеличить поступление K^+ в организм (диета, препараты калия). Пища должна быть богатой белками, витаминами, с ограничением содержания жиров, углеводов и поваренной соли.

Действие препарата усиливается у больных с гипотиреозом и циррозом печени. Препарат может усиливать существующие эмоциональную нестабильность или психотические нарушения. При указании на психозы в анамнезе Дексаметазон в высоких дозах назначают под строгим контролем врача.

С осторожностью следует применять при остром и подостром инфаркте миокарда - возможно распространение очага некроза, замедление формирования рубцовой ткани и разрыв сердечной мышцы.

В стрессовых ситуациях во время поддерживающего лечения (например, хирургические операции, травма или инфекционные заболевания) следует провести коррекцию дозы препарата в связи с повышением потребности в глюкокортикостероидах. Следует тщательно наблюдать за больными в течение года после окончания длительной терапии Дексаметазоном в связи с возможным развитием относительной недостаточности коры надпочечников в стрессовых ситуациях.

При внезапной отмене, особенно в случае предшествующего применения высоких доз, возможно развитие синдрома "отмены" (анорексия, тошнота, заторможенность, генерализованные мышечно-скелетные боли, общая слабость), а также обострение заболевания, по поводу которого был назначен Дексаметазон.

Во время лечения Дексаметазоном не следует проводить вакцинацию в связи со снижением ее эффективности (иммунного ответа).

Назначая Дексаметазон при интеркуррентных инфекциях, септических состояниях и туберкулезе, необходимо одновременно проводить лечение антибиотиками бактерицидного действия.

У детей во время длительного лечения Дексаметазоном необходимо тщательное наблюдение за динамикой роста и развития. Детям, которые в период лечения находились в контакте с больными корью или ветряной оспой, профилактически назначают специфические иммуноглобулины.

Вследствие слабого минералокортикоидного эффекта для заместительной терапии при надпочечниковой недостаточности Дексаметазон используют в комбинации с минералокортикоидами.

У больных сахарным диабетом следует контролировать содержание глюкозы крови и при необходимости корригировать терапию.

Показан рентгенологический контроль за костно-суставной системой (снимки позвоночника, кисти).

У больных с латентными инфекционными заболеваниями почек и мочевыводящих путей Дексаметазон способен вызвать лейкоцитурию, что может иметь диагностическое значение.

Дексаметазон повышает содержание метаболитов 11- и 17-оксикетокортикостероидов.

При нарушениях функции почек

Противопоказание: тяжелая хроническая почечная недостаточность, нефроуролитиаз.

При нарушениях функции печени

Противопоказание: тяжелая хроническая печеночная недостаточность.

Применение в детском возрасте

У детей в период роста ГКС должны применяться только по абсолютным показаниям и под особо тщательным наблюдением лечащего врача.

Условия хранения:

Список Б. Хранить при температуре не выше 25°С в недоступном для детей месте. Не замораживать. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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