# Флостерон



## Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Бетаметазон

## Полезные ссылки:

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

## Форма выпуска:

| ***Суспензия для инъекций*** | **1 мл** |
|---|---|
| бетаметазона динатрия фосфат | 2 мг |
| бетаметазона дипропионат | 5 мг |

1 мл - ампулы (5) - упаковки контурные пластиковые (1) - пачки картонные.

## Фармакологические свойства:

***Фармакодинамика***

Бетаметазон - синтетический ГКС, тормозит высвобождение интерлейкина-1, интерлейкина-2, гамма-интерферона из лимфоцитов и макрофагов. Оказывает противовоспалительное, противоаллергическое, десенсибилизирующее, противошоковое, антитоксическое и иммунодепрессивное действие. Подавляет высвобождение гипофизом АКТГ и бета-липотропина, но не снижает уровень циркулирующего бета-эндорфина. Угнетает секрецию тиреотропного гормона (ТТГ) и фоллихулостимулирующего гормона (ФСГ).

Повышает возбудимость ЦНС, снижает количество лимфоцитов и эозинофилов. Увеличивает количество эритроцитов (за счет усиления выработки эритропоэтинов).

Взаимодействует со специфическими цитоплазматическими рецепторами и образует комплекс, проникающий в ядро клетки, и стимулирует синтез матричной РНК; последняя индуцирует образование белков, в т.ч. липокортина, опосредующих клеточные эффекты. Липокортин угнетает фосфолипазу А2, подавляет высвобождение арахидоновой кислоты и подавляет синтез эндоперекисей, простагландина (Pg), лейкотриенов, способствующих процессам воспаления, аллергии и др.

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

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

*Углеводный обмен:* увеличивает всасывание углеводов из ЖКТ; повышает активность глюкозо-6-фосфатазы, приводящей к повышению поступления глюкозы из печени в кровь; повышает активность фосфоэнолпируваткарбоксилазы и синтез аминотрансфераз, приводящих к активации глюконеогенеза.

*Водно-электролитный обмен:* задерживает Na+ и воду в организме, стимулирует выведение $K^+$ (минералокортикостероидная активность), снижает всасывание $Ca^{2+}$ из ЖКТ, "вымывает" $Ca^{2+}$ из костей, повышает выведение $Ca^{2+}$ почками. Противовоспалительный эффект связан с угнетением высвобождения эозинофилами медиаторов воспаления; индуцированием образования липокортина и уменьшения количества тучных клеток, вырабатывающих гиалуроновую кислоту; с уменьшением проницаемости капилляров; стабилизацией клеточных мембран и мембран органелл (особенно лизосомальных).

*Противоаллергический эффект* развивается в результате подавления синтеза и секреции медиаторов аллергии, торможения высвобождения из сенсибилизированных тучных клеток и базофилов гистамина и др. биологически активных веществ, Т- и В-лимфоцитов, тучных клеток, снижения чувствительности эффекторных клеток к медиаторам аллергии, угнетения антителообразования, изменения иммунного ответа организма.

При ХОБЛ действие основывается, главным образом, на торможении воспалительных процессов, угнетении развития или предупреждении отека слизистых оболочек, торможении эозинофильной инфильтрации подслизистого слоя эпителия бронхов, отложении в слизистой оболочке бронхов циркулирующих иммунных комплексов, а также на торможении эрозирования и десквамации слизистой оболочки. Повышает чувствительность β-адренорецепторов бронхов мелкого и среднего калибра к эндогенным катехоламинам и экзогенным симпатомиметикам, снижает вязкость слизи за счет угнетения или сокращения ее продукции.

*Противошоковое и антитоксическое действие* связано с повышением АД (за счет увеличения концентрации циркулирующих катехоламинов и восстановления чувствительности к ним адренорецепторов, а также вазоконсггоихции), снижением проницаемости сосудистой стенки, мембранопротекторными свойствами, активацией ферментов печени, участвующих в метаболизме эндо- и ксенобиотиков. Иммунодепрессивный эффект обусловлен торможением высвобождения цитокинов (интерлейкина-1, интерлейкина-2; интерферона гамма) из лимфоцитов и макрофагов. Подавляет синтез и секрецию адренокортикотропного гормона (АКТГ) и вторично синтез эндогенных ГКС. Тормозит соединительнотканные реакции в ходе воспалительного процесса и снижает возможность образования рубцовой ткани. Бетаметазона натрия фосфата является легко растворимым соединением, которое хорошо всасывается после парентерального введения в ткани и обеспечивает быстрый эффект. Бетаметазона дипропионата имеет более медленную абсорбцию. Комбинированием этих солей возможно создание лекарственного средства (ЛС) как с кратковременным (но быстрым), так и длительным действием. В зависимости от способа применения (в/в, в/м, внутриартикулярно, периартикулярно, в/к) достигается общий или местный эффект.

***Фармакокинетика***

После внутрисуставного введения $C_{max}$ в плазме достигается через 30 мин. В плазме связывается с белками. Легко проходит гистогематические барьеры, включая плацентарный. Метаболизируется в печени с образованием преимущественно неактивных метаболитов. Выводится почками, небольшое количество - желчью, частично - с грудным молоком.

## Показания к применению:

*Местное лечение:*

— внутрисуставное и околосуставное введение при воспалительных ревматических заболеваниях (ревматоидный артрит, серонегативные спондилоартриты, артриты при системных заболеваниях соединительной ткани), при посттравматическом артрите, при псориатическом артрите с множественным поражением суставов и тендосиновитом, при кристаллических артритах;

— внутрисуставное введение при дегенеративных ревматических заболеваниях, особенно при наличии синовита (не применяется при артрозе тазобедренного сустава);

— воспалительные поражения околосуставных тканей (бурсит, тендинит, тендосиновиит, эпикондилит, плангарные фасцииты);

— введение в очаг поражения для лечения кожных заболеваний в редких случаях (если нет реакции на другие способы местной терапии): склерозирующий фолликулит, келоиды, кольцевидная гранулема, саркоидоз кожи, диабетическая липодистрофия (липонекроз), псориаз, очаговая алопеция, плоский красный лишай, нейродермит, монетовидная экзема, дискоидная красная волчанка.

*Системное лечение:*

— системный эффект Флостерона используется при некоторых выраженных аллергических заболеваниях: аллергический ринит, астматический статус, отек Квинке, аллергические реакции на лекарственные средства и сыворотки, укусы насекомых.

## Относится к болезням:

- Аллергический ринит

- Аллергия
- Артрит
- Артроз
- Астма
- Бурсит
- Волчанка
- Липодистрофия
- Липодистрофия
- Липома
- Лишай
- Нейродермит
- Псориаз
- Ревматизм
- Ревматические заболевания
- Ревматоидный артрит
- Ринит
- Саркоидоз
- Синовит
- Склерит
- Спондилоартрит
- Тендинит
- Фолликулит
- Экзема
- Эпикондилит

## Противопоказания:

— пептическая язва желудка или двенадцатиперстной кишки, недавно созданный кишечный анастамоз, дивертикулит;

— остеопороз;

— туберкулез;

— глаукома;

— сахарный диабет;

— тромбофлебит;

— острые вирусные, бактериальные, грибковые системные инфекции (в случаях, когда не проводится соответствующая терапия);

— синдром Иценко-Кушинга;

— состояния после хирургических операций и тяжелых травм;

— поствакцинальный период (за 8 недель до и в течение 2 недель после вакцинации);

— идиопатическая тромбоцитопеническая пурпура (в/м введение);

— инфекционный (септический) воспалительный процесс в суставе и периартрикулярные инфекции (в т.ч. в анамнезе);

— отсутствие признаков воспаления в суставе (так называемый, "сухой" сустав, например, при остеоартрозе без синовиита);

— предшествующая артро пластика;

— чрезсуставной перелом кости;

— выраженная костная деструкция и деформация сустава (резкое сужение суставной щели, анкилоз);

— нестабильность сустава как исход артрита;

— введение в область ахиллова сухожилия;

— асептический некроз формирующих сустав эпифизов костей;

— патологическая кровоточивость (эндогенная или вызванная применением антикоагулянтов);

— период лактации;

— Флостерон содержит бензиловый спирт, поэтому препарат противопоказан новорожденным и детям до 3-х лет;

— повышенная чувствительность к бетаметазону или любому другому ингредиенту препарата.

С *осторожностью:* хроническая почечная недостаточность, цирроз печени или хронический гепатит, гипотиреоз, гипертиреоз, эзофагит, гастрит, неспецифический язвенный колит, психоз или психоневроз, иммунодефицитные состояния (в т.ч. СПИД или ВИЧ инфицирование), заболевания сердечно-сосудистой системы, в т. ч. артериальная гипертензия, сердечная недостаточность, недавно перенесенный инфаркт миокарда, тромбоэмболия, пациенты, ранее не болевшие ветряной оспой, гиперлипидемия, нефроуролитиаз, гипоальбуминемия и состояния, предрасполагающие к ее возникновению (нефротический синдром), миастения, эпилепсия, ожирение (III-IV степени), полиомиелит (за исключением формы бульбарного энцефалита), бронхиальная астма или аллергия в анамнезе, детский и пожилой возраст, беременность.

## Способ применения и дозы:

Путь введения - парентеральный (внутрисуставное, околосуставное, внутрикожное введение, введение в область пораженных тканей и, в исключительных ситуациях, в/м введение).

Доза для **взрослых и детей** должна определяться индивидуально в зависимости от размера сустава, тяжести, характера заболевания и реакции больного.

*Внутрисуставное и околосуставное введение:*

— очень крупные суставы (тазобедренный) - 1-2 мл;

— крупные суставы (колештый, плечевой, голеностопный) - 1 мл;

— суставы среднего размера (локтевой, запястный) - 0.5-1 мл;

— мелкие суставы (грудинно-ключичный, пястно-фаланговые, межфаланговые) - 0.25-0.5 мл. При остром подагрическом артрите применяется от 0.5 до 1 мл.

Инъекции в крупные суставы - не чаще 3-4 раз/год в один сустав. Введение в очаг поражения (в/к, но не п/к):

Разовая доза не должна превышать 0.2 мл/см$^2$, а общая еженедельная доза, вводимая во все пораженные участки, не должна быть больше 1 мл/неделю.

*Местная инфильтрация*:

— бурсит - 0.25-1 мл (в острой стадии до 2 мл),

— тендосиновиит, тендинит - 0.5 мл,

— фиброзит - 0.5-1 мл.

Введение препарата повторяют каждые 1-2 недели.

При необходимости препарат может быть смешан в одном шприце с местным анестетиком.

Системное введение при выраженных аллергических заболеваниях.

Может быть использована только однократная доза от 1 до 2 мл (в/м, но не в/в)

Препарат следует вводить глубоко в мышцу в ягодичную область.

**Детям в возрасте от 3 до 5 лет** начальная доза - 2 мг, что соответствует 0.3 мл препарата, **6-12 лет** - 4 мг, что соответствует 0.5-0.6 мл препарата.

## Побочное действие:

Частота развития и выраженность побочных эффектов зависит от длительности применения, величины используемой дозы и возможности соблюдения циркадного ритма назначения.

*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, "бычий горб"», гирсутизм, повышение АД, дисменорея, аменорея, мышечная слабость, стрии), задержка полового развития у детей.

*Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, рвота, панкреатит, эрозивный эзофагит, стероидная язва 12-ти

перстной кишки, кровотечения и перфорация ЖКТ (черный стул, рвота "кофейной гущей"), повышение или снижение аппетита, метеоризм, икота, повышение активности печеночных трансаминаз и щелочной фосфатазы, ротоглоточный кандидоз, боль в животе,

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

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

*Со стороны органов чувств:* внезапная потеря зрения (возможно отложение кристаллов препарата в камерах глаза), задняя субкалсулярная катаракта, повышение внутриглазного давления с возможным повреждением зрительного нерва, склонность к развитию вторичных бактериальных, грибковых или вирусных инфекций глаз, трофические изменения роговицы, экзофтальм, диплопия.

*Со стороны обмена веществ:* гипокальциемия, повышение массы тела, отрицательный азотистый баланс. Обусловленная минералокортикоидной активностью - задержка жидкости и натрия (периферические отеки), гипернатриемия, гипокалиемический синдром (гшюкалиемия, аритмия, миалгия или спазм мышц, необычная слабость и утомляемость).

*Со стороны костно-мышечной системы:* 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), слабость проксимальных мышц, особенно в руках и ногах.

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

*Аллергические реакции:* генерализованные реакции (кожная сыпь, зуд, анафилактический шок), местные аллергические реакции, бронхоспазм (у пациентов с бронхиальной астмой за счет содержания метабисульфитов), эозинофилия.

*Прочие:* боль в спине, развитие оппортунистических инфекций (появлению этого побочного эффекта способствует совместно применяемые иммунодепрессанты и вакцинация), лейкоцитурия, лейкоцитоз, синдром «отмены» после резкого прекращения использования препарата.

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

## Передозировка:

*Симптомы:* тошнота, рвота, расстройства сна, эйфория, возбуждение, депрессия. При длительном применении в высоких дозах - остеопороз, задержка жидкости в организме, повышение АД, миопатия, синдром Иценко-Кушинга, угнетение функции коры надпочечников. Эффекты передозировки могут сохраняться несколько недель.

*Лечение:* в таких случаях дозу необходимо снизить до постепенной отмены препарата и проводить симптоматическое лечение, поддержание жизненно-важных функций, коррекция электролитного баланса, антациды, фенотиазины, препараты лития. При синдроме Иценко-Кушинга - аминоглутетимид. Специфического антидота нет. Гемодиализ не эффективен.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

Использовать только тогда, когда потенциальная польза от их применения для матери превышает потенциальный риск терапии для плода. При беременности обычно рекомендуется использование наименьших доз ГКС, обеспечивающих контроль того или иного заболевания. Дети, родившиеся у матерей, получавших ГКС в течение беременности, должны быть тщательно обследованы для выявления возможных признаков надпочечниковой недостаточности. ГКС проникают через плацентарный барьер и могут достигать высоких концентраций в организме плода.

В небольших количествах ГКС проникают в грудное молоко. Поэтому кормление грудью в течение терапии ГКС препаратами не рекомендуется.

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Сочетанное применение с НПВП и этанолом повышает риск возникновения желудочно-кишечных кровотечений и образования язв.

Повышает риск гепатотоксического действия парацетамола.

Эффективность бетаметазона уменьшается, если он вводится одновременно с рифампицином, карбамазепином, фенобарбиталом, фенитоином (дифенилгидантоином), примидоном, эфедрином и аминоглутетимидом.

Увеличивают риск: антипсихотические лекарственные средства, иммунодепрессанты (повышение вероятности развития инфекции, а так же лимфом и др. лимфопролиферативных заболеваний), карбутамид, азатиоприн (катаракта), М-холиноблокаторы, антигистаминные лекарственные средства, трициклические антидепрессанты, нитраты (повышение внутриглазного давления), гликозиды наперстянки (аритмии, связанные с гипокалиемией).

ГКС снижают терапевтический эффект противодиабетических средств, антигипертензивных средств, антикоагулянтов (производные кумарина и индандиона и натриуретиков.

Снижает эффективность антикоагулянтов (в т.ч. гепарина, стрептокиназы и урокиназы), албендазола и калиуретиков.

При одновременном применении ГКС в высоких дозах и бета$_2$-адреномиметиков возрастает риск развития гипокалиемии.

ГКС повышают почечный клиренс салицилатов, в связи с чем на фоне их действия иногда сложно достигнуть терапевтическую концентрацию салицилатов в сыворотке крови.

При одновременном приеме с андрогенами, эстрогенами, стероидными анаболиками, пероральными контрацептивами $T_{1/2}$ ГКС может удлиняться, их эффект усиливаться, а частота побочных эффектов (гирсутизм, угревая сыпь) возрастать.

Совместное применение ритодрина и ГКС противопоказано, поскольку при подобном сочетании возможно развитие отека легких.

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

Уменьшает концентрацию празиквантела в сыворотке крови.

Амфотерицин В и ингибиторы карбангидразы увеличивают риск развития остеопороза.

Повышает токсичность аспарагиназы (возможно усиление ее гипогликемического действия и риска развития невропатии и нарушения эритропоэза).

Снижает метаболизм циклоспорина, увеличивают его токсичность.

Повышает (при длительном применении) содержание фолиевой кислоты. Увеличивает метаболизм изониазида, мексилетина (особенно у "быстрых ацетиляторов"), что приводит к снижению их плазменных концентраций.

Митотан и др ингибиторы функции коры надпочечников могут обусловливать необходимость повышения доз ГКС.

Гипокалиемия, вызываемая ГКС, может увеличивать выраженность и длительность мышечной блокады на фоне миорелаксантов.

Снижает эффект соматотропина.

Повышает выраженность гипергликемического действия стрептозоцина.

## Особые указания и меры предосторожности:

Суспензию Флостерона нельзя вводить в/в

Внутрисуставное и околосуставное введение должно проводиться специально обученным специалистом.

При местном применении препарата во всех случаях необходимо оценить его совместимость с одновременно вводимыми местными анестетиками. Допускается смешивание с равным объемом растворов местных анестетиков (1% раствор прокаина гидрохлорида или 1% раствор лидокаина гидрохлорида) в шприце, но не в ампуле.

Нельзя использовать для лечения гиалиново-мембранной болезни новорожденных, вводить в инфицированные зоны и межпозвонковые пространства.

При местном (внутрисуставном) введении ГКС возможны как местные, так и системные эффекты.

До начала и во время стероидной терапии необходимо контролировать общий анализ крови, гликемию и глюкозурию, содержание электролитов в плазме крови.

Необходимо соответствующее исследование синовиальной жидкости в каждом суставе для исключения септического процесса. Значительное усиление болей, сопровождающееся местным отеком, дальнейшим ограничением подвижности сустава, лихорадкой и недомоганием, дает основание предположить септический артрит. Если диагноз сепсиса подтвердился, необходимо проведение соответствующей антимикробной терапии. При терапии во время интеркуррентных инфекций, септических состояний, туберкулезе - одновременно проводят лечение антибиотиками.

Не следует вводить в "нестабильные" суставы, в область ахиллова сухожилия из-за риска разрыва этого сухожилия.

Вакцинация живыми вирусными вакцинами противопоказана в течение терапии ГКС. Иммунизация убитыми вирусными или бактериальными вакцинами на фоне применения ГКС не обеспечивает ожидаемый рост количества антител и не дает ожидаемый защитный эффект. Поэтому подобные препараты не следует назначать за 8 недель до и в течение 2 недель после вакцинации.

У больных, не болевших ветряной оспой и получающих лечение ГКС, возрастает риск заболевания ветряной оспой или герпетической инфекцией при случайном контакте с инфицированными лицами. В таких случаях рекомендуется пассивная иммунизация.

Осторожность необходима у больных после операций и переломов костей, поскольку ГКС могут замедлять заживление ран и переломов.

Действие ГКС усиливается у больных с циррозом печени или гипотиреозом.

При применении Флостерона на фоне артериальной гипертензии, сердечной недостаточности, сахарного диабета, эпилепсии, тромбоэмболии, миастении, глаукомы, гипотиреоза и тяжелых поражений печени повышается риск гипокалиемии.

Применение Флостерона может изменять показатели тестов на гиперчувствительность.

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

У больных с острым и подострим инфарктом миокарда возможно распространение очага некроза, замедление формирования рубцовой ткани и, вследствие этого - разрыв сердечной мышцы.

Метабисульфиты у больных бронхиальной астмой или при наличии аллергии в анамнезе могут вызвать реакции аллергического типа, включая анафилаксию и бронхоспазм.

0.6 мг бетаметазона эквивалентны 0.75 мг дексаметазона, 4 мг триамциналона, 4 мг метилпреднизолона и 20 мг гидрокортизона (по данным AMA, 1994).

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

В период лечения необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

***При нарушениях функции почек***

С *осторожностью:* хроническая почечная недостаточность.

***При нарушениях функции печени***

С осторожностью.

***Применение в пожилом возрасте***

С осторожностью.

***Применение в детском возрасте***

С осторожностью.

Флостерон содержит бензиловый спирт, поэтому препарат противопоказан новорожденным и детям до 3-х лет.

## Условия хранения:

Хранить препарат в защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей

месте.

Не использовать препарат после истечения срока годности.

## Срок годности:

3 года.

## Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

**Источник:** http://drugs.thead.ru/Flosteron