Флутиказон



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Спрей назальный дозированный в виде суспензии белого или почти белого цвета.

	1 доза
флутиказона пропионат (микронизированный)	50 мкг

Вспомогательные вещества: бензалкония хлорид - 10 мкг, фенилэтанол - 250 мкг, полисорбат 80 - 100 мкг, авицел RC-591 - 1250 мкг, декстроза безводная - 5000 мкг, вода очищенная - 0.1 мл.

12 мл (120 доз) - флаконы темного стекла (1) с дозирующим устройством - поддоны пластиковые (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Механизм действия

Флутиказона пропионат вещество, обладающее сильным противовоспалительным действием. При интраназальном введении не отмечается сколько-нибудь выраженного системного действия и угнетения гипоталамо-гипофизарно-адреналовой системы.

Значимого изменения суточной площади по фармакокинетической кривой сывороточного кортизола не выявлено после введения флутиказона пропионата в дозе 200 мкг/сут. по сравнению с плацебо (соотношение: 1,01, 90 % ДИ - доверительный интервал от 0,9 до 1,14).

Флутиказона пропионат оказывает противовоспалительный эффект за счет взаимодействия с рецепторами глюкокортикостероидов. Подавляет пролиферацию тучных клеток, эозинофилов, лимфоцитов, макрофагов, нейтрофилов; уменьшает выработку медиаторов воспаления и других биологических активных веществ (гистамина, простагландинов, лейкотриенов, цитокинов) во время ранней и поздней фазы аллергической реакции. Флутиказона пропионат оказывает быстрое противовоспалительное действие на слизистую оболочку носа, а его противоаллергический эффект проявляется уже через 2-4 ч после первого применения. Уменьшает чиханье, зуд в носу, насморк, заложенность носа, неприятные ощущения в области придаточных пазух и ощущение давления вокруг носа и глаз. Кроме того, облегчает глазные симптомы, связанные с аллергическим ринитом. Уменьшение выраженности симптоматики (особенно заложенности носа) сохраняется в течение 24 ч после однократного введения спрея в дозе 200 мкг. Флутиказона пропионат улучшает качество жизни пациентов, включая физическую и социальную активность.

Фармакокинетика

Всасывание

После интраназапьного введения флутиказона пропионата в дозе 200 мкг/сут. максимальные равновесные концентрации в плазме количественно не определяются у большинства пациентов (составляют менее 0,01 нг/мл). Самая высокая концентрация в плазме была зарегистрирована на уровне 0,017 нг/мл. Непосредственное всасывание из носовой полости маловероятно вследствие низкой водорастворимости и проглатывания большей части препарата. Абсолютная пероральная биодоступность низкая (менее 1 %) в результате сочетания неполного всасывания из желудочно-кишечного тракта и активного метаболизма при первом прохождении через печень. Общее системное всасывание, таким образом, крайне низкое.

Распределение

Флутиказона пропионат имеет большой объем распределения в равновесном состоянии (приблизительное 318 л). Связь с белками плазмы крови высокая (91 %).

Метаболизм

Флутиказона пропионат выводится быстро из системного кровотока преимущественно за счет метаболизма в печени с образованием неактивной карбоновой кислоты посредством изофермента CYP3A4 системы цитохрома P450. Метаболизм проглоченной фракции флутиказона пропионата при первом прохождении через печень происходит таким же образом.

Выведение

Выведение флутиказона пропионата носит линейный характер в диапазоне доз от 250 до 1000 мкг и характеризуется высоким значением плазменного клиренса (1.1 л/мин). Максимальная концентрация в плазме снижается приблизительно до 98 % в течение 3-4 часов, и только при очень низких концентрациях в плазме наблюдался конечный период полувыведения 7,8 ч. Почечный клиренс флутиказона пропионата незначителен (менее 0,2 %), а неактивного метаболита - карбоновой кислоты - менее 5 %. Флутиказона пропионат и его метаболиты, в основном, выводятся с желчью через кишечник.

Показания к применению:

— профилактика и лечение сезонного и круглогодичного аллергического ринита.

Относится к болезням:

- Аллергия
- Ринит

Противопоказания:

— гиперчувствительность к флутиказона пропионату или любому другому компоненту препарата;

— детский возраст до 4 лет.

С осторожностью:

— одновременный прием с сильными ингибиторами изофермента CYP3A4, такими как ритонавир и кетоконазол, может вызывать повышение концентрации флутиказона пропионата в плазме;

— при одновременном применении с другими лекарственными формами глюкокортикостероидов;

— при наличии инфекций носовой полости или придаточных пазух носа. При этом инфекционные заболевания носа требуют соответствующего лечения, но не являются противопоказанием к применению назального спрея;

— после недавно перенесенной травмы носа или операции в полости носа или же при наличии изъязвлений слизистой оболочки носа.

Способ применения и дозы:

Только интраназально.

Для достижения полного терапевтического эффекта необходимо применять препарат регулярно. Максимальный терапевтический эффект может достигаться после 3-4 дней терапии.

Взрослые и дети старше 12 лет

Для профилактики и лечения сезонного и круглогодичного аллергического ринита по 2 впрыскивания в каждую ноздрю 1 раз в день, лучше утром (200 мкг в сутки). В некоторых случаях можно применять по 2 впрыскивания в каждую ноздрю 2 раза в день (400 мкг в сутки) в течение непродолжительного времени с целью достижения контроля над симптомами, после чего дозу снизить.

Максимальная суточная доза - 400 мкг (не более 4 впрыскиваний в каждую ноздрю).

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Обычная доза для взрослых.

Дети от 4 до 12 лет

Для профилактики и лечения сезонного и круглогодичного аллергического ринита по 1 впрыскиванию (50 мкг) в каждую ноздрю 1 раз в день, лучше утром. В некоторых случаях может потребоваться назначение по 1 впрыскиванию в каждую ноздрю 2 раза в день. Максимальная суточная доза - 200 мкг (не более 2 впрыскиваний в каждую ноздрю).

Использование ингалятора

Перед употреблением следует осторожно встряхнуть флакон, взять его, поместив указательный и средний пальцы по обе стороны от наконечника, а большой палец - под донышко.

При первом использовании препарата или перерыве в его использовании более 1 недели следует проверить исправность распылителя: направить наконечник от себя, произвести несколько нажатий, пока из наконечника не появится небольшое облачко. Далее необходимо прочистить нос (высморкаться). Закрыть одну ноздрю и ввести наконечник в другую ноздрю. Наклонить голову немного вперед, продолжая держать флакон вертикально. Затем следует начать делать вдох через нос и, продолжая вдыхать, произвести однократное нажатие пальцами для распыления препарата. Выдохнуть через рот. Повторить процедуру для второго распыления в ту же ноздрю, если необходимо. Далее полностью повторить описанную процедуру, введя наконечник в другую ноздрю. После использования следует промокнуть наконечник чистой салфеткой или носовым платком и закрыть его колпачком. Распылитель следует промывать не менее 1 раза в неделю. Для этого осторожно снять наконечник и промыть его в теплой воде. Стряхнуть избыток воды и оставить для просушивания в теплом месте. Избегать перегрева. Затем осторожно установить наконечник на прежнее место в верхней части флакона. Надеть защитный колпачок. Если отверстие наконечника засорилось, наконечник следует снять описанным выше способом и оставить на некоторое время в теплой воде. Затем промыть под струей холодной воды, просушить и снова надеть на флакон. Нельзя прочищать отверстие наконечника булавкой или другими острыми предметами.

Побочное действие:

Нежелательные явления, представленные ниже, перечислены в зависимости от анатомо-физиологической классификации и частоты встречаемости. Частота встречаемости определяется следующим образом: очень часто (≥ 1/10), часто (≥ 1/100 и < 1/10), нечасто (≥ 1/1 000 и < 1/100), редко (≥ 1/10 000 и < 1/1 000), очень редко (≥ 1/10 000, включая отдельные случаи). Очень часто, часто и нечасто возникающие нежелательные явления в основном установлены на основании данных клинических исследований. Явления, возникающие редко и очень редко, в основном определены из спонтанных сообщений. При формировании частоты встречаемости нежелательных явлений, фоновые показатели в группе плацебо не принимались во внимание, поскольку они были в целом сопоставимы с группой активного лечения.

Со стороны иммунной системы:

Очень редко: реакции гиперчувствительности (в том числе бронхоспазм, сыпь, отек лица и языка, анафилактические реакции), анафилактоидные реакции.

Со стороны нервной системы:

Часто: головная боль, ощущение неприятного вкуса и запаха. О появлении головной боли, неприятного вкуса и запаха также сообщалось при использовании других назальных спреев.

Со стороны органа зрения:

Очень редко: глаукома, повышение внутриглазного давления, катаракта. Причинно-следственная связь между интраназальным приемом флутиказона пропионата и этими явлениями в ходе клинических исследований длительностью до года не была выявлена.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:

Очень часто: носовое кровотечение.

Часто: сухость в полости носа и глотки, раздражение слизистой носовой полости и глотки (сообщалось, как и при использовании других интраназальных препаратов).

Очень редко: перфорация носовой перегородки (сообщалось при приеме интраназальных глюкокортикостероидов).

Передозировка:

Нет данных об острой или хронической передозировке флутиказона пропионата.

У здоровых добровольцев интраназальное введение 2 мг флутиказона пропионата два раза в сутки на протяжении 7 дней не оказывало влияния на функцию гипоталамо-гипофизарно-адреналовой системы (дозы в 20 раз выше терапевтической). Применение препарата в дозах, выше рекомендованных, в течение длительного периода времени может привести к временному угнетению функции надпочечников.

У таких пациентов лечение флутиказона пропионатом должно быть продолжено в дозах, необходимых для контроля симптоматики; восстановление функции надпочечников занимает несколько дней, ее мониторинг осуществляется измерением уровня кортизола в плазме.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Беременным и кормящим женщинам препарат можно назначить только в тех случаях, когда ожидаемая польза для пациентки превышает любой возможный риск для плода или ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Вследствие очень низких концентраций флутиказона пропионата в плазме после применения назального спрея клинически значимые взаимодействия маловероятны.

Ритонавир (высокоактивный ингибитор кофермента CYP3A4 ферментной системы цитохрома P450) способен значительно повышать концентрации в плазме флутиказона пропионата, в результате чего резко снижаются уровни кортизола в сыворотке, возникают системные побочные эффекты, включая синдром Кушинга и угнетение функции надпочечников.

Ингибиторы изофермента CYP3A4 ферментной системы цитохрома P450 вызывают ничтожно малое (эритромицин) или незначительное (кетоконазол) повышение концентраций флутиказона пропионата в плазме, которые не влекут за собой сколько-нибудь заметного снижения концентраций сывороточного кортизола. Тем не менее, следует соблюдать осторожность при сочетанном применении ингибиторов изофермента CYP3A4 ферментной системы цитохрома P450 (например, кетоконазол) и флутиказона пропионата ввиду возможного повышения плазменной концентрации последнего. При пострегистрационном наблюдении сообщалось о случаях появления системных эффектов кортикостероидов, таких как синдром Кушинга и угнетение функции надпочечников, при сочетанном использовании флутиказона пропионата и ритонавира. Таким образом, одновременного применения ритонавира и флутиказона пропионата следует избегать, за исключением тех случаев, когда потенциальная польза для пациента превысит возможный риск развития побочных системных эффектов кортикостероидов.

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат показан только для интраназального применения.

Без наблюдения врача назальный спрей не следует постоянно применять более 6 месяцев.

При длительном применении необходим регулярный контроль функции коры надпочечников.

Имеются сообщения о проявлении системных эффектов при использовании назальных глюкокортикостероидов в очень высоких дозах в течение длительного времени. Эти эффекты гораздо менее вероятны, чем при применении пероральных форм глюкокортикостероидов, и могут варьироваться у отдельных пациентов, а также между различными глюкокортикостероидными препаратами.

Возможные системные эффекты могут включать синдром Иценко-Кушинга, подавление функции надпочечников, катаракту, глаукому, и, в еще более редких случаях, расстройства психики или поведенческие расстройства, включая психомоторную гиперактивность, нарушение сна, тревожное состояние, депрессию или агрессию.

У детей, получавших глюкокортикостероиды интраназально, наблюдалось снижение скорости роста. Поэтому в качестве поддерживающей дозы у детей должна использоваться наименьшая доза, обеспечивающая адекватный контроль симптомов заболевания.

Полностью эффект назального спрея флутиказона пропионата может проявиться лишь через несколько дней лечения. Для достижения максимального терапевтического эффекта необходимо придерживаться регулярной схемы применения.

Необходимо соблюдать осторожность при переводе пациентов с системной глюкокортикостероидной терапии на лечение назальным спреем флутиказона пропионата, если есть основания предполагать нарушение функции надпочечников.

У большинства пациентов назальный спрей флутиказона пропионата устраняет симптомы сезонного аллергического ринита, но в некоторых случаях, при очень высокой концентрации в воздухе аллергенов, может понадобиться дополнительная терапия.

Для купирования офтальмологических проявлений на фоне успешной терапии сезонных аллергических ринитов может потребоваться дополнительная терапия.

При пострегистрационном наблюдении сообщалось о случаях появления системных эффектов кортикостероидов, таких как синдром Кушинга и угнетение функции надпочечников, при сочетанном использовании флутиказона пропионата и ритонавира. Таким образом, одновременного применения ритонавира и флутиказона пропионата следует избегать, за исключением тех случаев, когда потенциальная польза для пациента превысит возможный риск развития побочных системных эффектов кортикостероидов.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Данных о влиянии препарата на способность управлять транспортными средствами не получено, однако следует учитывать побочные действия, которые может вызвать препарат.

Применение в пожилом возрасте

Обычная доза для взрослых.

Применение в детском возрасте

Для профилактики и лечения сезонного и круглогодичного аллергического ринита по 1 впрыскиванию (50 мкг) в каждую ноздрю 1 раз в день, лучше утром. В некоторых случаях может потребоваться назначение по 1 впрыскиванию в каждую ноздрю 2 раза в день. Максимальная суточная доза - 200 мкг (не более 2 впрыскиваний в каждую ноздрю). Противопоказано детям до 4 лет.

Условия хранения:

Хранить в сухом месте при температуре не выше 25°С. Не замораживать. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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