Фосаванс

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки от белого до почти белого цвета, капсуловидной формы, с оттиском "710" на одной стороне и рисунком в виде кости - на другой.

	1 таб.
алендронат натрия	91.37 мг,
что соответствует содержанию алендроновой кислоты	70 мг
колекальциферол в виде гранул*	26.67 мг,
что соответствует содержанию колекальциферола	70 мкг

Вспомогательные вещества: лактоза безводная, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный, натрия кроскармеллоза, магния стеарат.

* гранулы содержат колекальциферол (вит. D_3), триглицериды, желатин, сахарозу, крахмал модифицированный пищевой, бутилгидрокситолуол, натрия алюмосиликат.

4 шт. - блистеры (1) - обложки картонные (1) - пачки картонные.
4 шт. - блистеры (1) - обложки картонные (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ингибитор костной резорбции при остеопорозе.

Натрия алендронат относится к бисфосфонатам - соединениям, которые локализуясь в зонах активной резорбции кости, под остеокластами, ингибируют процесс резорбции костной ткани, обусловленный остеокластами, не оказывая прямого влияния на процесс образования новой костной ткани. Поскольку резорбция кости и образование новой костной ткани взаимосвязаны, образование костной ткани также снижается, но в меньшей степени, чем резорбция, что приводит к прогрессирующему увеличению костной массы. Во время лечения натрия алендронатом формируется нормальная костная ткань, в матрикс которой встраивается алендронат, оставаясь фармакологически неактивным. В терапевтических дозах алендронат не вызывает остеомаляцию.

Колекальциферол продуцируется в коже путем превращения 7-дегидроколекальциферола в витамин D_3 при воздействии ультрафиолета. В отсутствии солнечного света, витамин D_3 является незаменимым компонентом пищи. Витамин D_3 метаболизируется до 25-гидроксивитамина D в печени, где и происходит его накопление. Превращение его в активный кальций-мобилизирующий гормон 1,25-дигидровитамин D (кальцитриол), происходит в почках и тщательно регулируется. Принципиальный механизм действия 1,25-дигидровитамина D заключается в увеличении кишечной абсорбции кальция и фосфатов, а также регуляции уровня кальция плазмы, выведения кальция и фосфатов почками, формирования костной ткани и ее резорбции.

Витамин D

$_3$ необходим для нормального формирования костной ткани. Недостаточность витамина D развивается при неадекватной экспозиции солнечного света и/или погрешностях в диете. Недостаточность витамина D ассоциирована с отрицательным балансом кальция, потерей костной массы, повышенным риском переломов. В острых случаях недостаточность витамина ассоциирована со вторичным гипопаратиреозом, гипофосфатемией, миастенией, остеомаляцией, дальнейшим возрастанием риска падений и переломов у пациентов с остеопорозом.

Фармакокинетика

Всасывание

Натрия алендронат

Биодоступность натрия алендроната в дозе 5-70 мг при приеме внутрь натощак не позднее, чем за 2 ч до стандартного завтрака, составляет 0.64% у женщин и 0.6% у мужчин.

При приеме натрия алендроната натощак за 1-1.5 ч до стандартного завтрака биодоступность снижается приблизительно на 40%.

У пациентов с остеопорозом натрия алендронат эффективен при применении натощак, не позднее, чем за 30 мин до первого приема пищи или жидкости.

Биодоступность натрия алендроната незначительна при его назначении одновременно с приемом пищи или в течение 2 ч после приема пищи.

Одновременный прием с кофе или апельсиновым соком снижает биодоступность препарата приблизительно на 60%.

При приеме преднизолона в дозе 20 мг 3 раза/сут в течение 5 дней не происходит клинически значимого изменения биодоступности натрия алендроната.

Колекальциферол

При применении Фосаванса после утреннего сна натощак за 2 ч до стандартного завтрака, средняя величина $AUC_{0-120\ ч}$ для витамина D_3 составляет 296.4 нг х ч/мл.

C_{max} витамина D_3 в плазме крови составляет 5.9 нг/мл. Среднее время достижения C_{max} витамина D_3 в плазме крови составляет 12 ч.

Биодоступность 2800 МЕ витамина D_3 в таблетке Фосаванс сходна с биодоступностью 2800 МЕ витамина D_3 при изолированном приеме.

Распределение

Натрия алендронат

Средний V_d в равновесном состоянии (за исключением костной ткани) составляет по меньшей мере 28 л. При приеме в терапевтических дозах концентрация препарата в плазме крови незначительна (менее 5 нг/мл). Связывание натрия алендроната с белками плазмы составляет приблизительно 78%.

Колекальциферол

После абсорбции в кишечнике витамин D_3 поступает в кровь в составе хиломикронов и быстро распределяется, в основном, в печень. Меньшие количества витамина D_3 распределяются в жировую и мышечную ткани, где кумулируются в нативном виде для дальнейшего постепенного выброса в кровоток. Витамин D_3 циркулирует в кровотоке, связанный с витамин-D-связывающим белком.

Метаболизм

Натрия алендронат

Нет данных о том, что натрия алендронат подвергается метаболизму в организме человека или животных.

Колекальциферол

Витамин D_3 быстро метаболизируется путем гидроксилирования в печени до 25-гидроксивитамина D_3 (основная форма накопления витамина) и постепенно метаболизируется в почках до 1.25-дигидроксивитамина D_3, который и является активной формой витамина. Перед выведением витамина происходит его дальнейшее гидроксилирование. Незначительное количество витамина D_3 перед выведением подвергается глюкуронированию.

Выведение

Натрия алендронат

После однократного в/в введения натрия алендроната, меченного ^{14}C, приблизительно 50% препарата выводится с мочой в течение 72 ч. Выведение меченного препарата с калом было незначительным или не определялось. После

однократного в/в введения натрия алендроната в дозе 10 мг его почечный клиренс составляет 71 мл/мин. Через 6 ч после в/в ведения концентрация в плазме крови снижается более, чем на 95%. Конечный $T_{1/2}$ превышает 10 лет, что отражает высвобождение препарата из костной ткани.

Колекальциферол

При приеме радиоактивного витамина D_3 у здоровых лиц средняя экскреция радиоактивного препарата с мочой спустя 48 ч составляла 2.4%, с калом – 4.9% спустя 4 сут. В обоих случаях препарат выводился преимущественно в виде его метаболитов. $T_{1/2}$ витамина D_3 после перорального применения Фосаванса составляет приблизительно 24 ч.

Показания к применению:

— лечение остеопороза у женщин в постменопаузе с целью предупреждения развития переломов, в т.ч. переломов бедра и компрессионных переломов позвоночника, а также обеспечения адекватного поступления витамина D;

— лечение остеопороза у мужчин с целью предотвращения возникновения переломов, а также обеспечения адекватного поступления витамина D.

Относится к болезням:

- Остеопороз

Противопоказания:

— заболевания пищевода, замедляющие его опорожнение (например, стриктуры или ахалазия);

— неспособность больного оставаться в вертикальном положении в течение 30 мин;

— гипокальциемия;

— почечная недостаточность тяжелой степени (КК < 35 мл/мин);

— тяжелый гипопаратиреоз;

— тяжелый дефицит витамина D;

— мальабсорбция кальция;

— беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— гиперчувствительность к любому компоненту препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при обострении заболеваний верхних отделов ЖКТ (дисфагия, заболевания пищевода, гастрит, дуоденит или язва желудка /в т.ч. анамнестические сведения о пептической язве, активном желудочно-кишечном кровотечении, хирургическом вмешательстве на верхних отделах желудочно-кишечного тракта в течение года до приема Фосаванса/), при заболеваниях, ассоциированных с гиперпродукцией кальцитриола (лейкемия, лимфома, саркоидоз) и сопутствующей гиперкальциемией и/или гиперкальциурией.

Способ применения и дозы:

Препарат назначают по 1 таб., по крайней мере, за 30 мин до первого приема пищи, жидкости или лекарственных средств (включая антациды, препараты кальция и витамины), запивая полным стаканом простой воды (не минеральной водой). Другие напитки (включая минеральную воду), пища и некоторые лекарственные средства могут снизить всасывание Фосаванса.

Рекомендуемая доза составляет 1 таб. (70 мг/70 мкг) 1 раз в неделю.

Пациентам следует дополнительно принимать препараты кальция и/или витамина D, если поступление этих веществ с пищей недостаточно. Фосаванс обеспечивает недельную потребность в витамине D, основанную на ежедневной дозе 400 МЕ.

Для **пациентов пожилого возраста и пациентов с почечной недостаточностью легкой и средней степени**

тяжести (КК от 35 до 60 мл/мин) коррекции доз не требуется.

При случайном пропуске приема препарата, необходимо принять 1 таблетку утром ближайшего дня. Не следует принимать 2 дозы в один день, но в последующем надо вернуться к приему препарата 1 раз в неделю в тот день недели, который был выбран в начале лечения.

Для уменьшения риска возникновения раздражения пищевода Фосаванс следует принимать, выполняя следующие правила:

1. Препарат следует принимать утром сразу после подъема с постели, по крайней мере, за 30 мин до первого приема пищи, жидкости или лекарственных средств, запивать полным стаканом воды (не минеральной) для облегчения поступления таблетки в желудок.

2. Таблетки не разжевывать и не рассасывать во рту из-за возможного образования язв в полости рта и глотке. Пациентам не следует принимать горизонтальное положение до первого приема пищи, который следует производить как минимум через 30 мин после приема Фосаванса.

3. Фосаванс не следует принимать перед сном или перед подъемом с постели.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: боли в животе, диспепсия, язва пищевода, дисфагия, метеоризм, запор, диарея, кислая отрыжка, тошнота, искажение вкуса, гастрит; редко (1/10 000, <1/1000) - эзофагит, эрозии пищевода, язва желудка, в т.ч. язвенная болезнь желудка, осложненная кровотечением (мелена), локальный остеонекроз челюсти, ассоциированный главным образом с предшествующей экстракцией зуба и/или локальной инфекцией из-за несвоевременного лечения.

Со стороны костно-мышечной системы: миалгия, боли в костях, суставах; редко (1/10 000, <1/1000) - мышечные судороги.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружения.

Со стороны органа зрения: редко (1/10 000, <1/1000) - увеит, склерит, эписклерит.

Дерматологические реакции: редко (1/10 000, <1/1000) - кожная сыпь, эритема, фотосенсибилизация, зуд, тяжелые кожные реакции, включая синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз.

Аллергические реакции: реакции повышенной чувствительности, включая крапивницу; редко (1/10 000, <1/1000) - ангионевротический отек, преходящие симптомы, напоминающие фазу острой реакции (миалгия, недомогание, редко - лихорадка).

Со стороны обмена веществ: гипокальциемия; также отмечалось снижение уровня кальция и фосфатов в сыворотке крови (обычно легкое, бессимптомное и транзиторное) на 18% и 10% соответственно.

Передозировка:

Симптомы: гипокальциемия, гипофосфатемия, нежелательные явления со стороны верхнего отдела ЖКТ (изжога, эзофагит, гастрит, язва желудка и пищевода).

Лечение: специфическая информация отсутствует. Пациенту следует принять молоко или антациды для связывания натрия алендроната. Для предотвращения раздражения пищевода не следует вызывать рвоту. Пациенты должны сохранять вертикальное положение.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Фосаванс не следует назначать при беременности и в период грудного вскармливания в связи с отсутствием опыта применения у данной категории пациентов.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Всасывание препарата может нарушаться при одновременном приеме с препаратами кальция, антацидами и другими лекарственными средствами для перорального применения. В связи с этим интервал между приемом Фосаванса и другими лекарственными препаратами, принимаемыми внутрь, должен составлять не менее 30 мин.

При совместном использовании Фосаванса с гормонозаместительной терапией (эстроген + прогестин) безопасность и

переносимость комбинированной терапии соответствуют таковым при применении каждого из этих препаратов в отдельности.

Олестра, минеральные масла, орлистат, а также секвестранты желчных кислот (колестирамин, колестипол) могут затруднять всасывание витамина D.

Противосудорожные препараты, циметидин, тиазидные диуретики могут ускорять катаболизм витамина D.

Особые указания и меры предосторожности:

Фосаванс, как и другие бисфосфонаты, может вызывать местное раздражение слизистой оболочки верхних отделов ЖКТ.

У пациентов, получающих лечение Фосавансом, могут отмечаться такие побочные реакции, как эзофагит, язва и эрозия пищевода, изредка приводящие к возникновению стриктур или перфорации пищевода. В некоторых случаях данные нежелательные явления могут быть тяжелыми и требовать госпитализации. В связи с этим, врачи должны быть особенно внимательны к любым признакам или симптомам, указывающим на возможные нарушения со стороны пищевода, а пациенты должны быть предупреждены о необходимости прекратить прием Фосаванса и обратиться к врачу в случае появления у них дисфагии, боли при глотании или за грудиной, появлении или усилении изжоги.

Риск возникновения тяжелых нежелательных явлений со стороны пищевода выше у тех пациентов, которые нарушают рекомендации по приему препарата и/или продолжают принимать его при появлении симптомов раздражения пищевода. Особенно важно, чтобы пациент имел рекомендации по приему препарата, понимал их и был информирован, что риск развития поражения пищевода возрастает в случае невыполнения данных рекомендаций.

Известны редкие случаи появления язвы желудка и двенадцатиперстной кишки, иногда тяжелой и осложненной. Однако, в данных случаях причинно-следственная связь с приемом препарата не установлена.

Фосаванс следует назначать с осторожностью пациентам с обострениями заболеваний верхних отделов ЖКТ, такими, как дисфагия, заболевания пищевода, гастрит, дуоденит и язвы из-за возможного раздражающего действия препарата на слизистую оболочку верхних отделов ЖКТ и ухудшением течения основного заболевания.

Известны случаи появления локального остеонекроза челюсти, ассоциированного главным образом с предшествующей экстракцией зуба и/или локальной инфекцией, из-за несвоевременного лечения, при приеме внутрь бисфосфонатов. Большинство таких случаев было зарегистрировано у пациентов, больных раком, при лечении которых проводилось внутривенное введение бисфосфонатов. К известным факторам риска развития некроза челюсти относятся выявление рака, проведение соответствующего лечения (химиотерапия, радиотерапия, кортикостероиды), плохая гигиена полости рта и сопутствующие заболевания (болезнь зубов, анемия, коагулопатия, инфекции). Пациенты, у которых обнаружен локальный остеонекроз челюсти, должны обратиться к челюстно-лицевому хирургу.

Фосаванс не рекомендуется назначать пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК<35 мл/мин) в связи с отсутствием опыта применения у данной категории пациентов.

Следует принимать во внимание и другие причины остеопороза, помимо дефицита эстрогенов, возраста и использования ГКС.

При наличии гипокальциемии уровень кальция в крови необходимо нормализовать до начала лечения Фосавансом. Другие нарушения минерального обмена (например, дефицит витамина D) также должны быть устранены. У пациентов с данными нарушениями необходимо наблюдать за уровнем кальция в крови и симптомами гипокальциемии.

Поскольку натрия алендронат увеличивает содержание минеральных веществ в костях, может наблюдаться небольшое бессимптомное снижение уровня кальция и фосфора в сыворотке крови.

Дополнительный прием витамина D может рассматриваться индивидуально.

Витамин D_3 может способствовать повышению выраженности гиперкальциемии и/или гиперкальциурии при использовании у пациентов с заболеваниями, ассоциированными с гиперпродукцией кальцитриола (лейкемия, лимфома, саркоидоз). У таких пациентов следует мониторировать содержание кальция в плазме и моче.

У пациентов с мальабсорбцией может отмечаться нарушение всасывания витамина D.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Нет данных о том, что Фосаванс влияет на способность управлять автомобилем или использовать другие механизмы.

При нарушениях функции почек

Для пациентов с почечной недостаточностью легкой и умеренной степени тяжести (КК от 35 до 60 мл/мин) коррекции доз не требуется.

При почечной недостаточности тяжелой степени (клиренс креатинина < 35 мл/мин) препарат противопоказан в связи с отсутствием опыта применения у данной категории пациентов.

Применение в пожилом возрасте

Для **пациентов пожилого возраста** коррекции доз не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте, при температуре не выше 25°C. Срок годности - 18 месяцев.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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