Клобир (капсулы)



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Клодроновая кислота

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы твердые желатиновые, №1, непрозрачные, с зеленой крышечкой и белым корпусом; содержимое капсул - частично гранулированный порошок белого цвета.

	1 капс.
клодронат динатрия тетрагидрат	500 мг,
что соответствует содержанию клодроната динатрия	400 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 28.2 мг, глицерил дипальмитостеарат измельченный тип I (Precirol ATO 5) - 10.8 мг, кремния диоксид - 1 мг.

Состав корпуса капсулы: титана диоксид (E171) - 2%, желатин - до 100%.
Состав крышечки капсулы: титана диоксид (E171) - 0.6666%, индигокармин - FD&C Blue 2 (E132) - 0.08%, краситель железа оксид желтый (E172) - 0.55%, желатин - до 100%.

100 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Клодроновая кислота относится к группе бисфосфонатов и является аналогом естественного пирофосфата. Действие бисфосфонатов основано на высоком сродстве к минеральным компонентам костной ткани. Основным механизмом действия клодроновой кислоты является подавление активности остеокластов и уменьшение опосредованной ими резорбциии костной ткани.

Способность клодроновой кислоты ингибировать резорбцию костной ткани у людей была подтверждена в процессе гистологических, кинетических и биохимических исследований. Тем не менее, точные механизмы этого процесса до конца не изучены.

Клодроновая кислота подавляет активность остеокластов, уменьшая концентрацию кальция в сыворотке крови, а также выделение кальция и гидроксипролина с мочой.

In vitro бисфосфонаты тормозят преципитацию фосфата кальция, блокируют его трансформации в гидроксиапатит, задерживают агрегацию кристаллов апатитов в более крупные кристаллы и замедляют растворение этих кристаллов.

При использовании клодроновой кислоты в монотерапии в дозах, достаточных для ингибирования резорбции костной ткани, влияния на нормальную минерализацию кости у человека не наблюдалось. У больных раком молочной железы и множественной миеломой отмечалось снижение вероятности переломов костей.

Клодроновая кислота снижает частоту развития метастазов в кости при первичном раке молочной железы. У больных с операбельным раком молочной железы для профилактики метастазов в кости также отмечалось снижение смертности.

Фармакокинетика

Всасывание клодроновой кислоты в ЖКТ происходит быстро и составляет приблизительно 2%. C_{max} в сыворотке крови после приема внутрь одной дозы препарата достигается через 30 мин. Благодаря выраженному сродству клодроновой кислоты к кальцию и другим двухвалентным катионам всасывание клодроновой кислоты значительно снижается при приеме препарата с пищей или лекарственными средствами, содержащими двухвалентные катионы. При приеме клодроновой кислоты внутрь за 1 ч до приема пищи относительная биодоступность составляет 91%, за 30 мин - *69%* соответственно (снижение биодоступности при этом статистически не значимо). Существенные колебания в показателях всасывания клодроновой кислоты в ЖКТ также наблюдаются, как среди различных пациентов, так и у одного и того же пациента. Несмотря на значительные колебания в показателях всасывания у одного и того же пациента, количество подучаемой в ходе длительного лечения клодроновой кислоты, остается постоянным. Объем распределения - 20 л. Связь с белками плазмы крови низкая - около 30%.

Выведение клодроновой кислоты из сыворотки крови характеризуется двумя фазами: фазой распределения с $T_{1/2}$ около 2 ч и фазой элиминации, протекающей очень медленно, поскольку клодроновая кислота прочно связывается с костной тканью. Клодроновая кислота выводится из организма главным образом почками. Около 80% определяется в моче в течение нескольких дней после приема препарата. Клодроновая кислота, связанная с костной тканью выводится из организма более медленно. Почечный клиренс составляет приблизительно 75% от плазменного клиренса. Так как клодроновая кислота прочно связывается с костной тканью, явная связь между концентрациями клодроновой кислоты в плазме крови и терапевтическим эффектом или побочными реакциями препарата отсутствует.

Фармакокинетический профиль препарата не зависит от возраста, метаболизма препарата или функциональных нарушений, за исключением почечной недостаточности, вызывающей снижение почечного клиренса клодроновой кислоты.

Показания к применению:

— остеолитические метастазы злокачественных опухолей в кости и миеломная болезнь (множественная миелома);

— профилактика развития костных метастазов первичного рака молочной железы;

— гиперкальциемия, обусловленная злокачественными опухолями.

Относится к болезням:

- Миелома
- Опухоли
- Рак

Противопоказания:

— беременность и период кормления грудью;

— сопутствующая терапия другими бисфосфонатами;

— детский возраст (в связи с отсутствием клинического опыта);

— повышенная чувствительность к клодроновой кислоте, другим бисфосфонатам или любым другим компонентам, входящим в состав препарата.

С осторожностью: хроническая почечная недостаточность; недостаточность лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (в состав препарата входит лактоза).

Способ применения и дозы:

Внутрь. Капсулы по 400 мг следует глотать, не разжевывая. Суточную дозу в 1600 мг рекомендуется принимать однократно утром натощак, запивая стаканом воды. После приема препарата больной должен в течение часа

воздерживаться от приема пищи, питья (за исключением обыкновенной воды) и приема других лекарственных средств.

При превышении суточной дозы 1600 мг её принимают в два приема. Первую дозу нужно принять, как рекомендовано выше. Вторую дозу следует принять в промежутке между приемами пищи, через 2 ч после или за 1 ч до еды, питья (кроме обыкновенной воды) или приема внутрь других лекарственных средств.

Клодроновую кислоту нельзя принимать с молоком, пищей, а также с препаратами, содержащими кальций или другие двухвалентные катионы, поскольку все они нарушают всасывание клодроновой кислоты.

Гиперкальциемия. обусловленная злокачественными новообразованиями.

При невозможности в/в введения препарата, клодроновую кислоту назначается внутрь в начальной дозе 2400-3200 мг ежедневно. При снижении содержания кальция в крови до нормального уровня дозу постепенно уменьшают до 1600 мг.

Профилактика развития костных метастазов первичного рака молочной железы.

По 1600 мг ежедневно внутрь.

Остеолитические изменения костей, обусловленные злокачественными опухолями без гиперкальциемии.

Дозировка в каждом случае определяется индивидуально. Рекомендуемая начальная доза составляет 1600 мг/сут. По клиническим показаниям она может быть увеличена, максимально до 3200 мг/сут.

Больные с почечной недостаточностью.

Внутрь клодроновую кислоту в дозах, превышающих 1600 мг/сут, не следует принимать в течение длительного периода времени.

Побочное действие:

Наиболее часто, приблизительно у 10% пациентов, наблюдаются такие побочные реакции как тошнота, рвота, диарея; эти реакции проявляются обычно в легкой форме и возникают чаще всего при использовании препарата в высоких дозах.

Со стороны эндокринной системы: повышение концентрации паратиреоидного гормона в сыворотке (обычно в сочетании с гипокальциемией).

Со стороны дыхательной системы: очень редко - у пациентов с бронхиальной астмой, с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте в анамнезе наблюдались нарушения функции дыхания, бронхоспазм.

Со стороны системы пищеварения: часто - тошнота, рвота и диарея обычно в легкой форме.

Со стороны кожи и кожных придатков: редко - кожные реакции, по клинической картине соответствующие аллергическим реакциям (зуд, крапивница, эксфолиативный дерматит).

Со стороны мочевыделительной системы: редко - нарушение функции почек (повышение содержания креатинина в сыворотке и протеинурия), тяжелая почечная недостаточность.

Со стороны лабораторных показателей; часто - бессимптомная гипокальциемия, редко - гипокальциемия, сопровождающаяся клиническими проявлениями. Повышение уровня щелочной фосфатазы, аминотрансфераз и лактатдегидрогеназы в сыворотке крови. У пациентов с метастазами уровень щелочной фосфатазы также может повышаться из-за наличия метастазов в печени и костях.

Передозировка:

Симптомы: гиперкреатининемия, нарушение функции почек.

В случае передозировки следует проводить симптоматическое лечение. Необходимо обеспечить больному поступление достаточного количества жидкости, а также контролировать функцию почек и содержание кальция в сыворотке крови.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Имеются данные о связи между приемом клодроновой кислоты и нарушением функции почек при одновременном

назначении нестероидных противовоспалительных средств, чаще всего диклофенака.

Вследствие большой вероятности развития гипокальциемии, следует соблюдать осторожность при назначении клодроновой кислоты вместе с аминогликозидами. Сообщалось, что одновременный прием эстрамустина вместе с клодроновой кислотой, приводит к увеличению концентрации эстрамустина в сыворотке крови до 80%. Клодроновая кислота образует с двухвалентными катионами (кальция, железа и др.) плохо растворимые комплексы, поэтому одновременный прием пищевых продуктов или лекарств, содержащих данные катионы (например, антацидами или препаратами железа), ведет к значительному снижению биодоступности клодроновой кислоты.

Особые указания и меры предосторожности:

До и во время лечения следует обеспечить достаточное поступление жидкости больному, а также контролировать функцию почек и концентрацию кальция в сыворотке крови.

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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