Локацид



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Третиноин

Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ретиноид. Структурно близок к витамину А, является естественным метаболитом ретинола. При приеме внутрь подавляет дифференциацию и рост клона измененных клеток крови, включая миелолейкозные клетки человека. Механизм действия при остром промиелоцитарном лейкозе, вероятно, обусловлен повреждениями, вызванными связью третиноина с ядерными рецепторами ретиноевой кислоты.

При наружном применении усиливает пролиферацию клеток в сосочковом слое кожи, снижает адгезию клеток, участвующих в образовании вульгарных угрей. При обработке открытых угрей способствует выравниванию поверхности кожи без признаков воспаления. При обработке закрытых угрей способствует их переходу в открытые угри или папулы, которые затем заживают без рубцевания после удаления кератиновой пробки. Предотвращает образование новых угрей.

Фармакокинетика

Третиноин является естественным метаболитом ретинола, который в норме присутствует в плазме. После приема внутрь третиноин всасывается из ЖКТ. Концентрация в плазме возвращается к исходному эндогенному уровню через 7-12 ч после приема однократной дозы 40 мг.

Связывание с белками плазмы высокое. Не кумулирует.

$T_{1/2}$ составляет 0.7 ч. После приема внутрь меченого радиоактивностью третиноина около 60% выводится с мочой и около 30% с калом. Метаболиты образуются путем окисления и глюкуронизации.

При длительном применении третиноина наблюдается уменьшение его концентрации в плазме, что может быть обусловлено индукцией изоферментов системы CYP.

Показания к применению:

Для приема внутрь: острый промиелоцитарный лейкоз (для индукции ремиссии) как у пациентов, не получавших ранее терапии, так и при рецидивах или рефрактерности к проводимой стандартной терапии (дауномицином или цитарабином).

Для наружного применения: вульгарные угри (в т.ч. с образованием комедонов, папул, пустул), сливные угри.

Болезнь Фавра-Ракушо (узелковый кистозный эластоз кожи с комедонами).

Относится к болезням:

- Лейкоз
- Угри

Противопоказания:

Беременность, кожная эпителиома в анамнезе (в т.ч. в семейном), повышенная чувствительность к третиноину.

Для наружного применения: острые воспалительные (в т.ч. экзематозные) поражения кожи, раны, ожоги.

Способ применения и дозы:

Устанавливают индивидуально, в зависимости от показаний и стадии заболевания, схемы противоопухолевой терапии.

Побочное действие:

Синдром ретиноевой кислоты: часто - лихорадка, диспноэ, одышка, острый респираторный дистресс-синдром, легочный инфильтрат, гиперлейкоцитоз, артериальная гипотензия, плевральный выпот, почечная и печеночная недостаточность.

Дерматологические реакции: возможны ксеродермия, сыпь, хейлит; редко - эритема, зуд, повышенное потоотделение, целлюлит, алопеция, эксфолиативный дерматит, сухость слизистых оболочек, ксерофтальмия.

Со стороны пищеварительной системы: возможны сухость во рту, тошнота, рвота, повышение активности трансаминаз печени; редко - боли в животе, диарея, запор, буллезный стоматит.

Со стороны ЦНС: редко - головокружение, нарушение сознания, повышение внутричерепного давления, тревожность, депрессия, нарушения зрения и слуха.

Со стороны обмена веществ: возможны повышение концентрации триглицеридов плазмы, холестерола, изменения массы тела.

Со стороны дыхательной системы: редко - кашель, плевральный выпот, отек слизистой носа, одышка, фарингиты, хрипы в легких, стридорозное дыхание.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - аритмии.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - боли в мышцах и костях.

Со стороны системы кроветворения: редко - повышенная кровоточивость.

Прочие: возможны отеки; редко - лихорадка, озноб, присоединение инфекций (в т.ч. пневмонии, септицемии), общая слабость и сонливость, боли в грудной клетке и в спине.

При наружном применении: возможны покраснение, чувство жжения, шелушение кожи в месте аппликации; в единичных случаях - отечность, образование волдырей или корки, фотосенсибилизация.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности. Женщинам детородного возраста необходимо применять эффективные методы контрацепции по крайней мере за 1 месяц до начала лечения, во время терапии и 1 месяц после отмены третиноина. Применение начинают на 2-3-й день нормального менструального цикла. За 2 недели до начала лечения отсутствие беременности должно быть подтверждено лабораторными тестами. Подобные тесты следует проводить 1 раз в месяц.

При необходимости приема внутрь в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Третиноин метаболизируется в печени при участии изоферментов системы CYP450. Поэтому при одновременном применении с препаратами, которые влияют на эти ферменты, нельзя исключить изменение фармакокинетических параметров.

Третиноин уменьшает контрацептивное действие прогестеронов.

При одновременном применении с тетрациклинами возможно повышение внутричерепного давления.

При одновременном применении с витамином А наблюдаются симптомы гипервитаминоза.

Особые указания и меры предосторожности:

Внутрь третиноин может назначать только врач, имеющий опыт лечения гематологических/онкологических заболеваний.

Для предотвращения синдрома ретиноевой кислоты при значительном увеличении количества лейкоцитов или появлении других признаков этого синдрома назначают полную химиотерапию в адекватных дозах. При возникновении самых ранних признаков немедленно следует начать курс лечения дексаметазоном.

При наружном применении следует избегать попадания третиноина в глаза, рот, на слизистые оболочки; в случае попадания - немедленно смыть водой.

При проведении лечения рекомендуется избегать пребывания на солнце. При загорелой коже можно начать лечение после ослабления загара.

В первую неделю лечения возможно усиление угревой сыпи.

Третиноин нельзя применять одновременно с препаратами, вызывающими десквамацию кожи, а также с косметическими и гигиеническими средствами, вызывающими сухость и раздражение кожи.

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