

Метилпреднизолон Софарма



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

ГКС. При системном применении оказывает противовоспалительное, противоаллергическое, десенсибилизирующее, противошоковое, антитоксическое и иммунодепрессивное действие.

При наружном и местном применении терапевтическая активность метилпреднизолона обусловлена противовоспалительным, противоаллергическим и антиэкссудативным (благодаря вазоконстрикторному эффекту) действием.

По противовоспалительной активности превышает гидрокортизон в 5 раз, практически не обладает минералокортикоидной активностью.

Подавляет функции лейкоцитов и тканевых макрофагов. Тормозит высвобождение интерлейкина-1, интерлейкина-2, интерферона гамма из лимфоцитов и макрофагов.

Метилпреднизолон подавляет высвобождение гипофизом АКТГ (и вторично - синтез эндогенных ГКС) и β -липотропина, но не снижает уровень циркулирующего β -эндорфина. Угнетает секрецию ТТГ и ФСГ.

Взаимодействует со специфическими цитоплазматическими рецепторами и образует комплекс, проникающий в ядро клетки, и стимулирует синтез мРНК; последняя индуцирует образование белков (в т.ч. липокортина), опосредующих клеточные эффекты. Липокортин ингибирует активность фосфолипазы A_2 , что приводит к подавлению высвобождения арахидоновой кислоты, ингибированию синтеза простагландинов, эндоперекисей, лейкотриенов, являющихся факторами воспаления и аллергических реакций. Подавляет высвобождение ЦОГ (главным образом ЦОГ-2), что также способствует уменьшению выработки простагландинов.

Способствует стабилизации лизосомальных мембран, снижая тем самым концентрацию протеолитических ферментов в области воспаления. Уменьшает проницаемость капилляров, обусловленную высвобождением гистамина.

Метилпреднизолон обладает выраженным дозозависимым действием на метаболизм белков, жиров и углеводов.

Уменьшает содержание белка в плазме (за счет глобулинов) с повышением коэффициента альбумин/глобулин, повышает синтез альбуминов в печени и почках.

Оказывает катаболическое действие в лимфоидной и соединительной ткани, мышцах, жировой ткани, коже, костной ткани. Остеопороз и синдром Иценко-Кушинга являются главными факторами, ограничивающими длительную терапию ГКС. В результате катаболического действия возможно подавление роста у детей.

Стимулирует синтез высших жирных кислот и ТГ, перераспределяет жировую ткань (происходит накопление жира преимущественно в области плечевого пояса, лица, живота), приводит к развитию гиперхолестеринемии.

Повышает абсорбцию углеводов из ЖКТ; повышает активность глюкозо-6-фосфатазы, что приводит к усилению

поступления глюкозы из печени в кровь; стимулирует глюконеогенез.

Задерживает ионы натрия и воду в организме, стимулирует выведение калия, уменьшает абсорбцию кальция из ЖКТ, способствует вымыванию кальция из костей, повышает выведение кальция почками.

В высоких дозах метилпреднизолон может повышать возбудимость тканей мозга и способствует понижению порога судорожной готовности.

Противовоспалительный эффект связан с угнетением высвобождения эозинофилами медиаторов воспаления; индуцированием образования липокортинов 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 сенсibilизированных тучных клеток и базофилов гистамина и других биологически активных веществ, уменьшения числа циркулирующих базофилов, подавления развития лимфоидной и соединительной ткани, снижения циркулирующих лимфоцитов (Т- и В-клеток), тучных клеток, снижения чувствительности эффекторных клеток к медиаторам аллергии, угнетения продукции антител, 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 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 вазоконстрикции), 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 активность фибробластов и образование коллагена, снижает возможность образования рубцовой ткани.

Стимулирует избыточную продукцию соляной кислоты и пепсина в желудке, что повышает риск развития пептической язвы.

Фармакокинетика

После приема внутрь хорошо всасывается из ЖКТ. Метаболизируется в печени. $T_{1/2}$ составляет около 2 ч. Выводится в виде метаболитов в основном с мочой.

Показания к применению:

Для приема внутрь, в/в введения (формы обычной продолжительности действия) и в/м введения (депо-формы): первичная или вторичная недостаточность функции надпочечников, врожденная гиперплазия надпочечников, негнойный тиреодит, гиперкальциемия вследствие опухолевого заболевания, ревматические заболевания, коллагеновые болезни, пузырчатка, буллезный герпетический дерматит, тяжелая многоформная эритема, эксфолиативный дерматит, тяжелый псориаз, тяжелый себорейный дерматит, тяжелые аллергические заболевания, тяжелые острые и хронические аллергические и воспалительные процессы с поражением глаз, симптоматический саркоидоз, синдром Леффлера (не поддающийся другой терапии), бериллиоз, очаговый или диссеминированный легочный туберкулез (одновременно с соответствующей противотуберкулезной химиотерапией), идиопатическая тромбоцитопеническая пурпура у взрослых, вторичная тромбоцитопения у взрослых, приобретенная (аутоиммунная) гемолитическая анемия, эритробластопения (эритроцитарная анемия), врожденная (эритроидная) гипопластическая анемия, острые лейкозы у детей, паллиативная терапия при злокачественных опухолях; для достижения ремиссии при нефротическом синдроме, в критическом периоде при язвенном колите и регионарном энтерите, рассеянном склерозе в фазе обострения; отек мозга вследствие опухоли или связанный с хирургическим вмешательством, лучевой терапией, черепно-мозговой травмой; шок вследствие недостаточности коры надпочечников или резистентный к стандартной терапии, туберкулезный менингит с субарахноидальным блоком или с его угрозой (совместно с противотуберкулезной химиотерапией), трихинеллез с поражением нервной системы или миокарда, трансплантация органов; кратковременная терапия при заболеваниях опорно-двигательного аппарата ревматического и неспецифического генеза.

Для введения в синовиальную жидкость или мягкие ткани (депо-форма): вспомогательная терапия в остром периоде синовита, ревматоидного артрита, подагрического артрита, эпикондилита, неспецифического тендосиновита, посттравматического остеоартроза.

Для введения в патологические очаги (депо-форма): келоидные рубцы, локализованные гипертрофические,

инфильтративные и воспалительные очаги при плоском лишае, псориатических бляшках, кольцевидных гранулемах, нейродермите, дискоидной красной волчанке, диабетическом липоидном некробиозе, гнездной алопеции; кистозные опухоли апоневроза или сухожилия.

Относится к болезням:

- [Аллергия](#)
- [Артрит](#)
- [Артроз](#)
- [Бериллиоз](#)
- [Волчанка](#)
- [Герпес](#)
- [Гиперплазия надпочечников](#)
- [Дерматит](#)
- [Инфильтраты](#)
- [Колит](#)
- [Лейкоз](#)
- [Липома](#)
- [Менингит](#)
- [Миокардит](#)
- [Нейродермит](#)
- [Нефрит](#)
- [Опухоли](#)
- [Остеоартрит](#)
- [Остеоартроз](#)
- [Отек мозга](#)
- [Подагра](#)
- [Псориаз](#)
- [Пузырчатка](#)
- [Рассеянный склероз](#)
- [Ревматизм](#)
- [Ревматические заболевания](#)
- [Саркоидоз](#)
- [Себорея](#)
- [Синовит](#)
- [Склерит](#)
- [Травмы](#)
- [Тромбоз](#)
- [Туберкулез](#)
- [Черепно-мозговая травма](#)
- [Шок](#)
- [Энтерит](#)
- [Эпикондилит](#)
- [Эритема](#)

Противопоказания:

Для кратковременного применения по жизненным показаниям - повышенная чувствительность к метилпреднизолону.

Для внутрисуставного введения и введения непосредственно в очаг поражения: предшествующая артропластика, патологическая кровоточивость (эндогенная или вызванная применением антикоагулянтов), внутрисуставной перелом кости, инфекционный (септический) воспалительный процесс в суставе и периартикулярные инфекции (в т.ч. в анамнезе), а также общее инфекционное заболевание, выраженный околосуставной остеопороз, отсутствие признаков воспаления в суставе ("сухой" сустав, например, при остеоартрозе без синовита), выраженная костная деструкция и деформация сустава (резкое сужение суставной щели, анкилоз), нестабильность сустава как исход артрита, асептический некроз формирующих сустав эпифизов костей.

Для наружного применения: бактериальные, вирусные, грибковые кожные заболевания, туберкулез кожи, кожные проявления сифилиса, опухоли кожи, поствакцинальный период, нарушение целостности кожных покровов (язвы, раны), детский возраст (до 2 лет, при зуде в области ануса - до 12 лет), розацеа, вульгарные угри, периоральный дерматит.

Для применения в офтальмологии: бактериальные, вирусные, грибковые заболевания глаз, туберкулезное поражение глаз, трахома, нарушение целостности глазного эпителия.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный, в зависимости от показаний, схемы лечения, применяемой лекарственной формы, возраста пациента, клинической ситуации.

Побочное действие:

Со стороны эндокринной системы: нарушения менструального цикла, угнетение функции надпочечников, синдром Иценко-Кушинга, подавление функции гипофизарно-надпочечниковой системы, снижение толерантности к углеводам, стероидный диабет или манифестация латентного сахарного диабета, замедление роста у детей, задержка полового развития у детей.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, стероидная язва желудка и двенадцатиперстной кишки, панкреатит, эзофагит, кровотечения и перфорация ЖКТ, повышение или снижение аппетита, метеоризм, икота. В редких случаях - повышение активности печеночных трансаминаз и ЩФ.

Со стороны обмена веществ: отрицательный азотистый баланс из-за катаболизма белков, повышенное выведения кальция из организма, гипокальциемия, повышение массы тела, повышенное потоотделение.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: потеря калия, гипокалиемический алкалоз, аритмия, брадикардия (вплоть до остановки сердца); стероидная миопатия, сердечная недостаточность (развитие или усиление симптомов), изменения на ЭКГ, характерные для гипокалиемии, повышение АД, гиперкоагуляция, тромбозы. У пациентов с острым инфарктом миокарда - распространение очага некроза, замедление формирования рубцовой ткани, что может привести к разрыву сердечной мышцы.

Со стороны костно-мышечной системы: замедление роста и процессов окостенения у детей (преждевременное закрытие эпифизарных зон роста), остеопороз (очень редко - патологические переломы, асептический некроз головки плечевой и бедренной кости), разрыв сухожилий мышц, мышечная слабость, стероидная миопатия, уменьшение мышечной массы (атрофия).

Со стороны ЦНС: головная боль, повышение внутричерепного давления, делирий, дезориентация, эйфория, галлюцинации, маниакально-депрессивный психоз, депрессия, нервозность или беспокойство, бессонница, головокружение, вертиго, псевдоопухоль мозжечка, судорожные припадки.

Со стороны органа зрения: задняя субкапсулярная катаракта, повышение внутриглазного давления (с возможным повреждением зрительного нерва), трофические изменения роговицы, экзофтальм, склонность к развитию вторичной инфекции (бактериальной, грибковой, вирусной).

Дерматологические реакции: петехии, экхимозы, истончение и хрупкость кожи, гипер- или гипопигментация, угри, стрии, склонность к развитию пиодермии и кандидозов.

Реакции, обусловленные иммунодепрессивным действием: замедление процессов регенерации, снижение устойчивости к инфекциям.

При парентеральном введении: в единичных случаях анафилактические и аллергические реакции, гипер- или гипопигментация, атрофия кожи и подкожной клетчатки, обострение после интрасиновиального применения, артропатия типа Шарко, стерильные абсцессы, при введении в очаги на голове - слепота.

Применение при беременности и кормлении грудью:

В I триместре применяют в случаях, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает потенциальный риск для плода. Длительное применение при беременности вызывает нарушение роста плода. В III триместре беременности имеется опасность возникновения атрофии коры надпочечников у плода, что может потребовать проведения заместительной терапии у новорожденного.

В период лактации применяют в случаях, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает потенциальный риск для грудного ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с барбитуратами возможно уменьшение эффективности метилпреднизолона.

При одновременном применении с НПВС возможно повышение риска эрозивно-язвенных поражений ЖКТ.

При одновременном применении метилпреднизолона с пероральными антикоагулянтами, гепарином усиливается или уменьшается антикоагулянтное действие; с салицилатами - возможно уменьшение действия салицилатов; с тиазидными диуретиками, фуросемидом - возможно потенцирование гипокалиемии.

При одновременном применении с глибенкламидом, метформином, инсулинами уменьшается эффективность гипогликемических средств; с кетоконазолом, итраконазолом - повышается концентрация метилпреднизолона в плазме крови; с метотрексатом - синергизм иммунодепрессивного действия; с неостигмином, пиридостигмином -

возможно развитие миастенического криза; с панкуронием - уменьшение нервно-мышечной блокады; с сальбутамолом - увеличение эффективности и потенциальной токсичности сальбутамола; с рифампицином - увеличение клиренса метилпреднизолона.

При одновременном применении с фенитоином, фенобарбиталом повышается клиренс метилпреднизолона и уменьшается его эффективность.

При одновременном применении возможно уменьшение действия фенитоина; с циклоспорином - ингибирование метаболизма циклоспорина и метилпреднизолона; с эритромицином - существует вероятность ингибирования метаболизма метилпреднизолона.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять при паразитарных и инфекционных заболеваниях вирусной, грибковой или бактериальной природы (в настоящее время или недавно перенесенные, включая недавний контакт с больным) - простой герпес, опоясывающий герпес (виремическая фаза), ветряная оспа, корь, амебиаз, стронгилоидоз (установленный или подозреваемый), системный микоз; активный и латентный туберкулез. Применение при тяжелых инфекционных заболеваниях допустимо только на фоне специфической терапии.

С осторожностью применять в течение 8 недель до и 2 недель после вакцинации), при лимфадените после прививки БЦЖ, при иммунодефицитных состояниях (в т.ч. СПИД или ВИЧ-инфицирование).

С осторожностью применять при заболеваниях ЖКТ: язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, эзофагите, гастрите, острой или латентной пептической язве, недавно созданном анастомозе кишечника, неспецифическом язвенном колите с угрозой перфорации или абсцедирования, дивертикулите.

С осторожностью применять при заболеваниях сердечно-сосудистой системы, в т.ч. после недавно перенесенного инфаркта миокарда (у больных с острым и подострым инфарктом миокарда возможно распространение очага некроза, замедление формирования рубцовой ткани и вследствие этого разрыв сердечной мышцы), при декомпенсированной хронической сердечной недостаточности, артериальной гипертензии, гиперлипидемии), при эндокринных заболеваниях - сахарном диабете (в т.ч. нарушении толерантности к углеводам), тиреотоксикозе, гипотиреозе, болезни Иценко-Кушинга, при тяжелой хронической почечной и/или печеночной недостаточности, нефроуролитиазе, при гипоальбуминемии и состояниях, предрасполагающих к ее возникновению, при системном остеопорозе, миастении, остром психозе, ожирении (III-IV степени), при полиомиелите (за исключением формы бульбарного энцефалита), открыто- и закрытоугольной глаукоме.

При необходимости внутрисуставного введения с осторожностью применять у пациентов с общим тяжелым состоянием, при неэффективности (или кратковременности) действия 2 предыдущих введений (с учетом индивидуальных свойств применявшихся ГКС).

Не эффективен при септическом шоке (возможно повышение летальности).

При стрессах во время терапии ГКС показано увеличение дозы.

При туберкулезе применение возможно только в сочетании с соответствующей противотуберкулезной терапией.

После приема в течение нескольких дней отмену следует производить постепенно.

Внутрикожное введение не должно быть глубоким. Депо-формы не вводить нерекондованными способами (в т.ч. в/в).

В период лечения не проводить никаких видов вакцинации.

У детей в период роста применение ГКС возможно только по абсолютным показаниям и под особо тщательным наблюдением врача.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применять при тяжелой хронической почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применять при тяжелой хронической печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Противопоказание для наружного применения - детский возраст (до 2 лет, при зуде в области ануса - до 12 лет).

У детей в период роста применение ГКС возможно только по абсолютным показаниям и под особо тщательным наблюдением врача.

Метилпреднизолон Софарма

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

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