Преднизолон (раствор)



Код АТХ:

- H02AB06

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Преднизолон

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный или слегка желтоватого или зеленовато-желтоватого цвета.

	1 мл
преднизолон натрия фосфат (в пересчете на преднизолон)	30 мг

Вспомогательные вещества: никотинамид, натрия метабисульфит, динатрия эдетат, натрия гидроксид, вода д/и.

1 мл - ампулы (3) - поддоны пластиковые (1) - коробки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Гормоны и их антагонисты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Синтетический глюкокортикоидный препарат, дегидрированный аналог гидрокортизона. Оказывает противовоспалительное, противоаллергическое, иммунодепрессивное действие, повышает чувствительность бета-адренорецепторов к эндогенным катехоламинам.

Взаимодействует со специфическими цитоплазматическими рецепторами (рецепторы для ГКС есть во всех тканях, особенно их много в печени) с образованием комплекса, индуцирующего образование белков (в т.ч. ферментов, регулирующих в клетках жизненно важные процессы.)

Белковый обмен: уменьшает количество глобулинов в плазме, повышает синтез альбуминов в печени и почках (с повышением коэффициента альбумин/глобулин), снижает синтез и усиливает катаболизм белка в мышечной ткани.

Липидный обмен: повышает синтез высших жирных кислот и триглицеридов, перераспределяет жир (накопление жира происходит преимущественно в области плечевого пояса, лица, живота), приводит к развитию гиперхолестеринемии.

Углеводный обмен: увеличивает абсорбцию углеводов из ЖКТ; повышает активность глюкозо-6-фосфатазы (повышение поступления глюкозы из печени в кровь); увеличивает активность фосфоэнолпируваткарбоксилазы и синтез аминотрансфераз (активация глюконеогенеза); способствует развитию гипергликемии.

Водно-электролитный обмен: задерживает Na^+ и воду в организме, стимулирует выведение K^+ (минералокортикоидная активность), снижает абсорбцию Ca^{2+} из ЖКТ, снижает минерализацию костной ткани.

Противовоспалительный эффект связан с угнетением высвобождения эозинофилами и тучными клетками медиаторов воспаления; индуцированием образования липокортинов и уменьшения количества тучных клеток, вырабатывающих гиалуроновую кислоту; с уменьшением проницаемости капилляров; стабилизацией клеточных мембран (особенно лизосомальных) и мембран органелл. Действует на все этапы воспалительного процесса: ингибирует синтез простагландинов на уровне арахидоновой кислоты (липокортин угнетает фосфолипазу А2, подавляет либерацию арахидоновой кислоты и ингибирует биосинтез эндоперекисей, лейкотриенов, способствующих процессам воспаления, аллергии и др.), синтез "провоспалительных цитокинов" (интерлейкин 1, фактор некроза опухоли альфа и др.); повышает устойчивость клеточной мембраны к действию различных повреждающих факторов.

Иммунодепрессивный эффект обусловлен вызываемой инволюцией лимфоидной ткани, угнетением пролиферации лимфоцитов (особенно Т-лимфоцитов), подавлением миграции В-клеток и взаимодействия Т- и В- лимфоцитов, торможением высвобождения цитокинов (интерлейкина-1, 2; гамма-интерферона) из лимфоцитов и макрофагов и снижением образования антител.

Противоаллергический эффект развивается в результате снижения синтеза и секреции медиаторов аллергии, торможения высвобождения из сенсибилизированных тучных клеток и базофилов гистамина и др. биологически активных веществ, уменьшения числа циркулирующих базофилов, Т- и В- лимфоцитов, тучных клеток; подавления развития лимфоидной и соединительной ткани, снижения чувствительности эффекторных клеток к медиаторам аллергии, угнетения антителообразования, изменения иммунного ответа организма.

При обструктивных заболеваниях дыхательных путей действие обусловлено, главным образом, торможением воспалительных процессов, предупреждением или уменьшением выраженности отека слизистых оболочек, снижением эозинофильной инфильтрации подслизистого слоя эпителия бронхов и отложении в слизистой бронхов циркулирующих иммунных комплексов, а также торможением эрозирования и десквамации слизистой. Повышает чувствительность бета-адренорецепторов бронхов мелкого и среднего калибра к эндогенным катехоламинам и экзогенным симпатомиметикам, снижает вязкость слизи за счет уменьшения ее продукции.

Подавляет синтез и секрецию АКТГ и вторично - синтез эндогенных ГКС.

Тормозит соединительнотканные реакции в ходе воспалительного процесса и снижает возможность образования рубцовой ткани.

Фармакокинетика

До 90% препарата связывается с белками плазмы: транскортином (кортизолсвязывающим глобулином) и альбуминами.

Преднизолон метаболизируется в печени, частично в почках и других тканях, в основном путем конъюгации с глюкуроновой и серной кислотами. Метаболиты неактивны.

Выводится с желчью и с мочой путем клубочковой фильтрации и на 80-90% реабсорбируется канальцами. 20% дозы выводится почками в неизмененном виде. $T_{1/2}$ из плазмы после в/в введения 2-3 ч.

Показания к применению:

Преднизолон применяют для экстренной терапии при состояниях, требующих быстрого повышения концентрации ГКС в организме:

— шоковые состояния (ожоговый, травматический, операционный, токсический, кардиогенный) - при неэффективности сосудосуживающих средств, плзмазамещающих препаратов и другой симптоматической терапии;

— аллергические реакции (острые тяжелые формы), гемотрансфузионный шок, анафилактический шок, анафилактоидные реакции;

— отек мозга (в т.ч. на фоне опухоли мозга или связанный с хирургическим вмешательством, лучевой терапией или травмой головы);

— бронхиальная астма (тяжелая форма), астматический статус;

— системные заболевания соединительной ткани (системная красная волчанка, ревматоидный артрит);

— острая надпочечниковая недостаточность;

— тиреотоксический криз;

— острый гепатит, печеночная кома;

— уменьшение воспалительных явлений и предупреждение рубцовых сужений (при отравлении прижигающими жидкостями).

Относится к болезням:

- Аллергия
- Артрит
- Артроз
- Астма
- Бронхиальная астма
- Бронхит
- Волчанка
- Гепатит
- Гепатоз
- Кардит
- Кома
- Опухоли
- Отек мозга
- Печеночная кома
- Ревматоидный артрит
- Системная красная волчанка
- Тиреотоксический криз
- Травмы
- Шок

Противопоказания:

Для кратковременного применения по жизненным показаниям единственным противопоказанием является повышенная чувствительность к преднизолону или компонентам препарата.

У детей в период роста ГКС должны применяться только по абсолютным показаниям и под особо тщательным наблюдением лечащего врача.

С *осторожностью* препарат следует назначать при следующих заболеваниях и состояниях:

— заболевания ЖКТ - язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, эзофагит, гастрит, острая или латентная пептическая язва, недавно созданный анастомоз кишечника, неспецифический язвенный колит с угрозой перфорации или абсцедирования, дивертикулит;

— паразитарные и инфекционные заболевания 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; системный микоз; активный и латентный туберкулез. Применение при тяжелых инфекционных заболеваниях допустимо только на фоне специфической терапии.

— пре- и поствакцинальный период (8 недель до и 2 недели после вакцинации), лимфаденит после прививки БЦЖ;

— иммунодефицитные состояния (в т.ч. СПИД или ВИЧ-инфицирование);

— заболевания сердечно-сосудистой системы (в т.ч. недавно перенесенный инфаркт миокарда - у больных с острым и подострым инфарктом миокарда возможно распространение очага некроза, замедление формирования рубцовой ткани и, вследствие этого, - разрыв сердечной мышцы), тяжелая хроническая сердечная недостаточность, артериальная гипертензия, гиперлипидемия);

— эндокринные заболевания - сахарный диабет (в т.ч. нарушение толерантности к углеводам), тиреотоксикоз, гипотиреоз, болезнь Иценко- Кушинга, ожирение (III - IV ст.);

— тяжелая хроническая почечная и/или печеночная недостаточность, нефроуролитиаз;

— гипоальбуминемия и состояния, предрасполагающие к ее возникновению;

— системный остеопороз, миастения gravis, острый психоз, полиомиелит (за исключением формы бульбарного энцефалита), открыто- и закрытоугольная глаукома;

— беременность.

Способ применения и дозы:

Доза Преднизолона и продолжительность лечения устанавливается врачом индивидуально в зависимости от показаний и тяжести заболевания.

Преднизолон вводят в/в (капельно или струйно) или в/м. В/в препарат обычно вводят сначала струйно, затем капельно.

При *острой недостаточности надпочечников* разовая доза 100-200 мг в течение 3-16 дней.

При *бронхиальной астме* препарат вводят в зависимости от тяжести заболевания и эффективности комплексного лечения от 75 до 675 мг на курс лечения от 3 до 16 дней; в тяжелых случаях доза может быть повышена до 1400 мг на курс лечения и более с постепенным снижением дозы.

При *астматическом статусе* Преднизолон вводят в дозе 500-1200 мг/сут с последующим снижением до 300 мг/сут и переходом на поддерживающие дозы.

При *тиреотоксическом кризе* вводят по 100 мг препарата в суточной дозе 200-300 мг; при необходимости суточная доза может быть увеличена до 1000 мг. Длительность введения зависит от терапевтического эффекта, обычно до 6 дней.

При *шоке, резистентном к стандартной терапии*, Преднизолон в начале терапии обычно вводят струйно, после чего переходят на капельное введение. Если в течение 10-20 мин АД не повышается, повторяют струйное введение препарата. После выведения из шокового состояния продолжают капельное введение до стабилизации АД. Разовая доза составляет 50-150 мг (в тяжелых случаях - до 400 мг). Повторно препарат вводят через 3-4 ч. Суточная доза может составлять 300-1200 мг (с последующим снижением дозы).

При *острой печеночно-почечной недостаточности* (при острых отравлениях, в послеоперационном и послеродовом периодах и др.), Преднизолон вводят по 25-75 мг/сут; при наличии показаний суточная доза может быть увеличена до 300-1500 мг/сут и выше.

При *ревматоидном артрите и системной красной волчанке* Преднизолон вводят дополнительно к системному приему препарата в дозе 75 -125 мг/сут не более 7-10 дней.

При *остром гепатите* Преднизолон вводят по 75-100 мг/сут в течение 7- 10 дней.

При *отравлениях прижигающими жидкостями с ожогами пищеварительного тракта и верхних дыхательных путей* Преднизолон назначают в дозе 75-400 мг/сут в течение 3-18 дней.

При невозможности в/в введения Преднизолон вводят в/м в тех же дозах. После купирования острого состояния назначают внутрь Преднизолон в таблетках, с последующим постепенным уменьшением дозы.

При длительном приеме препарата суточную дозу следует снижать постепенно. Длительную терапию нельзя прекращать внезапно!

Побочное действие:

Частота развития и выраженность побочных эффектов зависит от длительности применения, величины используемой дозы и возможности соблюдения циркадного ритма назначения Преднизолона.

При применении Преднизолона могут отмечаться:

Со стороны эндокринной системы: снижение толерантности к глюкозе, стероидный сахарный диабет или манифестация латентного сахарного диабета, угнетение функции надпочечников, синдром Иценко-Кушинга (лунообразное лицо, ожирение гипофизарного типа, гирсутизм, повышение артериального давления, дисменорея, аменорея, мышечная слабость, стрии), задержка полового развития у детей.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, панкреатит, стероидная язва желудка и двенадцатиперстной кишки, эрозивный эзофагит, желудочно-кишечные кровотечения и перфорация стенки желудочно-кишечного тракта, повышение или снижение аппетита, нарушение пищеварения, метеоризм, икота. В редких случаях - повышение активности печеночных трансаминаз и щелочной фосфатазы.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмии, брадикардия (вплоть до остановки сердца); развитие (у предрасположенных пациентов) или усиление выраженности сердечной недостаточности, изменения на электрокардиограмме, характерные для гипокалиемии, повышение АД, гиперкоагуляция, тромбозы. У больных с острым и подострым инфарктом миокарда - распространение очага некроза, замедление формирования рубцовой ткани, что может привести к разрыву сердечной мышцы.

Со стороны нервной системы: делирий, дезориентация, эйфория, галлюцинации, маниакально-депрессивный психоз,

депрессия, паранойя, повышение внутричерепного давления, нервозность или беспокойство, бессонница, головокружение, вертиго, псевдоопухоль мозжечка, головная боль, судороги.

Со стороны органов чувств: задняя субкапсулярная катаракта, повышение внутриглазного давления с возможным повреждением зрительного нерва, склонность к развитию вторичных бактериальных, грибковых или вирусных инфекций глаз, трофические изменения роговицы, экзофтальм, внезапная потеря зрения (при парентеральном введении в области головы, шеи, носовых раковин, кожи головы возможно отложение кристаллов препарата в сосудах глаза).

Со стороны обмена веществ: повышенное выведение кальция, гипокальциемия, повышение массы тела, отрицательный азотистый баланс (повышенный распад белков), повышенная потливость.

Обусловленные минералокортикоидной активностью: задержка жидкости и натрия (периферические отеки), гипернатриемия, гипокалиемический синдром (гипокалиемия, аритмия, миалгия или спазм мышц, необычная слабость и утомляемость).

Со стороны опорно-двигательного аппарата: замедление роста и процессов окостенения у детей (преждевременное закрытие эпифизарных зон роста), остеопороз (очень редко - патологические переломы костей, асептический некроз головки плечевой и бедренной кости), разрыв сухожилий мышц, стероидная миопатия, снижение мышечной массы (атрофия).

Со стороны кожных покровов и слизистых оболочек: замедленное заживление ран, петехии, экхимозы, истончение кожи, гипер- или гипопигментация, стероидные угри, стрии, склонность к развитию пиодермии и кандидозов.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, анафилактический шок, местные аллергические реакции.

Местные при парентеральном введении: жжение, онемение, боль, покалывание в месте введения, инфекции в месте введения, редко - некроз окружающих тканей, образование рубцов в месте инъекции; атрофия кожи и подкожной клетчатки при в/м введении (особенно опасно введение в дельтовидную мышцу).

Прочие: развитие или обострение инфекций (появлению этого побочного эффекта способствуют совместно применяемые иммунодепрессанты и вакцинация), лейкоцитурия, синдром "отмены".

Передозировка:

Возможно усиление описанных выше побочных явлений.

Необходимо уменьшить дозу Преднизолона. Лечение симптоматическое.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности (особенно в I триместре) применяют только по жизненным показаниям. При длительной терапии в период беременности не исключена возможность нарушения роста плода. В случае применения в III триместре беременности существует опасность возникновения атрофии коры надпочечников у плода, что может потребовать проведения заместительной терапии у новорожденного.

Поскольку ГКС проникают в грудное молоко, в случае необходимости применения препарата в период грудного вскармливания, кормление грудью рекомендуется прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Возможна фармацевтическая несовместимость Преднизолона с другими внутривенно вводимыми препаратами - его рекомендуется вводить отдельно от других препаратов (в/в болюсно, либо через другую капельницу, как второй раствор). При смешивании раствора преднизолона с гепарином образуется осадок.

Одновременное назначение преднизолона с:

индукторами печеночных микросомальных ферментов (фенобарбитал, рифампицин, фенитоин, теофиллин, эфедрин) приводит к снижению его концентрации;

диуретиками (особенно "тиазидными" и ингибиторами карбоангидразы) *и амфотерицином В* - может привести к усилению выведения из организма K^+ и увеличению риска развития сердечной недостаточности;

с натрийсодержащими препаратами - к развитию отеков и повышению артериального давления;

сердечными гликозидами - ухудшается их переносимость и повышается вероятность развития желудочковой экстраситолии (из-за вызываемой гипокалиемии);

непрямыми антикоагулянтами - ослабляет (реже усиливает) их действие (требуется коррекции дозы);

антикоагулянтами и тромболитиками - повышается риск развития кровотечений из язв в ЖКТ;

этанолом и НПВП - усиливается риск возникновения эрозивно-язвенных поражений в ЖКТ и развития кровотечений (в комбинации с НПВП при лечении артритов возможно снижение дозы ГКС из-за суммации терапевтического эффекта);

парацетамолом **-** возрастает риск развития гепатотоксичности (индукция печеночных ферментов и образования токсичного метаболита парацетамола);

ацетилсалициловой кислотой **-** ускоряет ее выведение и снижает концентрацию в крови (при отмене преднизолона уровень салицилатов в крови увеличивается и возрастает риск развития побочных явлений);

инсулином и пероральными гипогликемическими препаратами, гипотензивными средствами **-** уменьшается их эффективность;

витамином D **-** снижается его влияние на всасывание Ca^{2+} в кишечнике;

соматотропным гормоном **-** снижает эффективность последнего, а с *празиквантелом* **-** его концентрацию;

М-холиноблокаторами (включая антигистаминные препараты и трициклические антидепрессанты) *и нитратами* - способствует повышению внутриглазного давления;

изониазидом и мексилетином - увеличивает их метаболизм (особенно у "медленных" ацетилаторов), что приводит к снижению их плазменных концентраций.

Ингибиторы карбоангидразы и "петлевые" диуретики могут увеличивать риск развития остеопороза.

Индометацин, вытесняя преднизолон из связи с альбуминами, увеличивает риск развития его побочных эффектов.

АКТГ усиливает действие преднизолона.

Эргокальциферол и паратгормон препятствуют развитию остеопатии, вызываемой преднизолоном.

Циклоспорин и кетоконазол, замедляя метаболизм преднизолона, могут в ряде случаев увеличивать его токсичность.

Одновременное назначение андрогенов и стероидных анаболических препаратов с преднизолоном способствует развитию периферических отеков и гирсутизма, появлению угрей.

Эстрогены и пероральные эстрогенсодержащие контрацептивы снижают клиренс преднизолона, что может сопровождаться усилением выраженности его действия.

Митотан и другие ингибиторы функции коры надпочечников могут обусловливать необходимость повышения дозы преднизолона.

При одновременном применении с живыми противовирусными вакцинами и на фоне других видов иммунизации увеличивает риск активации вирусов и развития инфекций.

Антипсихотические средства (нейролептики) и азатиоприн повышают риск развития катаракты при назначении преднизолона.

При одновременном применении с антитиреоидкыми препаратами снижается, а с тиреоидными гормонами - повышается клиренс преднизолона.

Особые указания и меры предосторожности:

Во время лечения Преднизолоном (особенно длительного) необходимо наблюдение окулиста, контроль АД, состояния водно-электролитного баланса, а также картины периферической крови и уровня глюкозы крови.

С целью уменьшения побочных явлений можно назначать антациды, а также увеличить поступление K^+ в организм (диета, препараты калия). Пища должна быть богатой белками, витаминами, с ограничением содержания жиров, углеводов и поваренной соли.

Действие препарата усиливается у больных с гипотиреозом и циррозом печени. Препарат может усиливать существующие эмоциональную нестабильность или психотические нарушения. При указании на психозы в анамнезе Преднизолон в высоких дозах назначают под строгим контролем врача.

С осторожностью следует применять при остром и подостром инфаркте миокарда - возможно распространение очага некроза, замедление формирования рубцовой ткани и разрыв сердечной мышцы.

В стрессовых ситуациях во время поддерживающего лечения (например, хирургические операции, травма или инфекционные заболевания) следует провести коррекцию дозы препарата в связи с повышением потребности в ГКС.

При внезапной отмене, особенно в случае предшествующего применения высоких доз, возможно развитие синдрома отмены (анорексия, тошнота, заторможенность, генерализованные мышечно-скелетные боли, общая слабость), а также обострение заболевания, по поводу которого был назначен Преднизолон.

Во время лечения Преднизолоном не следует проводить вакцинацию в связи со снижением ее эффективности (иммунного ответа).

Назначая Преднизолон при интеркуррентных инфекциях, септических состояниях и туберкулезе, необходимо одновременно проводить лечение антибиотиками бактерицидного действия.

У детей во время длительного лечения Преднизолоном необходимо тщательное наблюдение за динамикой роста и развития. Детям, которые в период лечения находились в контакте с больными корью или ветряной оспой, профилактически назначают специфические иммуноглобулины.

Вследствие слабого минералокортикоидного эффекта для заместительной терапии при надпочечниковой недостаточности Предкизолон используют в комбинации с минералокортикоидами.

У больных сахарным диабетом следует контролировать содержание глюкозы крови и при необходимости корригировать терапию.

Показан рентгенологический контроль за костно-суставной системой (снимки позвоночника, кисти).

Преднизолон у больных с латентными инфекционными заболеваниями почек и мочевыводящих путей способен вызвать лейкоцитурию, что может иметь диагностическое значение.

Преднизолон повышает содержание метаболитов 11- и 17-оксикетокортикостероидов.

При нарушениях функции почек

С осторожностью - тяжелая хроническая почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

С осторожностью - тяжелая хроническая печеночная недостаточность.

Применение в детском возрасте

У детей в период роста ГКС должны применяться только по абсолютным показаниям и под особо тщательным наблюдением лечащего врача.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить при температуре не выше 25°С в недоступном для детей месте. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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