Преднизолона Гемисукцинат



Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

ГКС. Подавляет функции лейкоцитов и тканевых макрофагов. Ограничивает миграцию лейкоцитов в область воспаления. Нарушает способность макрофагов к фагоцитозу, а также к образованию интерлейкина-1. Способствует стабилизации лизосомальных мембран, снижая тем самым концентрацию протеолитических ферментов в области воспаления. Уменьшает проницаемость капилляров, обусловленную высвобождением гистамина. Подавляет активность фибробластов и образование коллагена.

Ингибирует активность фосфолипазы A_2, что приводит к подавлению синтеза простагландинов и лейкотриенов. Подавляет высвобождение ЦОГ (главным образом ЦОГ-2), что также способствует уменьшению выработки простагландинов.

Уменьшает число циркулирующих лимфоцитов (Т- и В-клеток), моноцитов, эозинофилов и базофилов вследствие их перемещения из сосудистого русла в лимфоидную ткань; подавляет образование антител.

Преднизолон подавляет высвобождение гипофизом АКТГ и β-липотропина, но не снижает уровень циркулирующего β-эндорфина. Угнетает секрецию ТТГ и ФСГ.

При непосредственной аппликации на сосуды оказывает вазоконстрикторный эффект.

Преднизолон обладает выраженным дозозависимым действием на метаболизм углеводов, белков и жиров. Стимулирует глюконеогенез, способствует захвату аминокислот печенью и почками и повышает активность ферментов глюконеогенеза. В печени преднизолон усиливает депонирование гликогена, стимулируя активность гликогенсинтетазы и синтез глюкозы из продуктов белкового обмена. Повышение содержания глюкозы в крови активизирует выделение инсулина.

Преднизолон подавляет захват глюкозы жировыми клетками, что приводит к активации липолиза. Однако вследствие увеличения секреции инсулина происходит стимуляция липогенеза, что способствует накоплению жира.

Оказывает катаболическое действие в лимфоидной и соединительной ткани, мышцах, жировой ткани, коже, костной ткани. В меньшей степени чем гидрокортизон, влияет на процессы водно-электролитного обмена: способствует выведению ионов калия и кальция, задержке в организме ионов натрия и воды. Остеопороз и синдром Иценко-Кушинга являются главными факторами, ограничивающими длительную терапию ГКС. В результате катаболического действия возможно подавление роста у детей.

В высоких дозах преднизолон может повышать возбудимость тканей мозга и способствует понижению порога судорожной готовности. Стимулирует избыточную продукцию соляной кислоты и пепсина в желудке, что приводит к развитию пептической язвы.

При системном применении терапевтическая активность преднизолона обусловлена противовоспалительным, противоаллергическим, иммунодепрессивным и антипролиферативным действием.

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

По сравнению с гидрокортизоном противовоспалительная активность преднизолона в 4 раза больше, минералокортикоидная активность в 0.6 раза меньше.

Фармакокинетика

При приеме внутрь хорошо всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме отмечается через 90 мин. В плазме большая часть преднизолона связывается с транскортином (кортизолсвязывающим глобулином). Метаболизируется преимущественно в печени.

$T_{1/2}$ составляет около 200 мин. Выводится почками в неизмененном виде - 20%.

Показания к применению:

Для приема внутрь и парентерального применения: ревматизм; ревматоидный артрит, дерматомиозит, узелковый периартериит, склеродермия, болезнь Бехтерева, бронхиальная астма, астматический статус, острые и хронические аллергические заболевания, анафилактический шок, болезнь Аддисона, острая недостаточность коры надпочечников, адреногенитальный синдром; гепатит, печеночная кома, гипогликемические состояния, липоидный нефроз; агранулоцитоз, различные формы лейкемии, лимфогранулематоз, тромбоцитопеническая пурпура, гемолитическая анемия; малая хорея; пузырчатка, экзема, зуд, эксфолиативный дерматит, псориаз, почесуха, себорейный дерматит, СКВ, эритродермия, алопеция.

Для внутрисуставного введения: хронический полиартрит, посттравматический артрит, остеоартрит крупных суставов, ревматические поражения отдельных суставов, артрозы.

Для инфильтрационного введения в ткани: эпикондилит, тендовагинит, бурсит, плечелопаточный периартрит, келоиды, ишиалгии, контрактура Дюпюитрена, ревматические и сходные с ними поражения суставов и различных тканей.

Для применения в офтальмологии: аллергический, хронический и нетипичный конъюнктивит и блефарит; воспаление роговицы при неповрежденной слизистой; острое и хроническое воспаление переднего отрезка сосудистой оболочки, склеры и эписклеры; симпатическое воспаление глазного яблока; после травм и операций при продолжительном раздражении глазных яблок.

Относится к болезням:

- Агранулоцитоз
- Аденоиды (гипертрофия глоточной миндалины)
- Аллергия
- Артрит
- Артроз
- Астма
- Блефарит
- Бронхиальная астма
- Бронхит
- Бурсит
- Воспаление
- Гепатит
- Гепатоз
- Гипогликемия
- Дерматит
- Дерматомиозит
- Зуд
- Инфильтраты
- Ишиалгия
- Кома
- Конъюнктивит
- Лейкемия
- Лейкоз
- Лимфогранулематоз
- Лимфогранулематоз
- Лимфома
- Липома
- Малая хорея
- Нефрит

- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Периартериит
- Печеночная кома
- Полиартрит
- Псориаз
- Пузырчатка
- Ревматизм
- Ревматоидный артрит
- Себорея
- Склерит
- Склеродермия
- Тендовагинит
- Травмы
- Тромбоз
- Хорея
- Шок
- Экзема
- Эпикондилит
- Эписклерит

Противопоказания:

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

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:

При приеме внутрь для замещающей терапии у взрослых начальная доза составляет 20-30 мг/сут, поддерживающая доза - 5-10 мг/сут. При необходимости начальная доза может составлять 15-100 мг/сут, поддерживающая - 5-15 мг/сут. Суточную дозу следует уменьшать постепенно. Для детей начальная доза составляет 1-2 мг/кг/сут в 4-6 приемов, поддерживающая - 300-600 мкг/кг/сут.

При в/м или в/в введении доза, кратность и продолжительность применения определяются индивидуально.

При внутрисуставном введении в крупные суставы применяют дозу 25-50 мг, для суставов средней величины - 10-25 мг, для мелких суставов - 5-10 мг. Для инфильтрационного введения в ткани в зависимости от тяжести заболевания и величины области поражения применяют дозы от 5 до 50 мг.

Местно в офтальмологии применяют 3 раза/сут, курс лечения - не более 14 дней; в дерматологии - 1-3 раза/сут.

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:

При беременности (особенно в I триместре) применяют только по жизненным показаниям. При необходимости применения в период лактации следует тщательно взвесить ожидаемую пользу лечения для матери и риск для ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с салицилатами возможно повышение вероятности возникновения кровотечений.

При одновременном применении с диуретиками возможно усугубление нарушений электролитного обмена.

При одновременном применении с гипогликемическими препаратами уменьшается скорость снижения уровня глюкозы в крови.

При одновременном применении с сердечными гликозидами усиливается риск развития гликозидной интоксикации.

При одновременном применении с рифампицином возможно ослабление терапевтического действия рифампицина.

При одновременном применении гипотензивных средств возможно снижение их эффективности.

При одновременном применении производных кумарина возможно ослабление антикоагулянтного эффекта.

При одновременном применении рифампицина, фенитоина, барбитуратов возможно ослабление действия преднизолона.

При одновременном применении гормональных контрацептивов - усиление действия преднизолона.

При одновременном применении ацетилсалициловой кислоты возможно снижение содержания салицилатов в крови.

При одновременном применении празиквантела возможно уменьшение его концентрации в крови.

Появлению гирсутизма и угрей способствует одновременное применение других ГКС, андрогенов, эстрогенов, пероральных контрацептивов и стероидных анаболиков. Риск развития катаракты повышается при применении на фоне ГКС антипсихотических средств, карбутамида и азатиоприна.

Одновременное назначение с м-холиноблокаторами (включая антигистаминные препараты, трициклические антидепрессанты), нитратами способствует развитию повышения внутриглазного давления.

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-инфицированность).

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, неэффективности (или кратковременности) действия 2 предыдущих введений (с учетом индивидуальных свойств применявшихся ГКС).

Во время лечения (особенно длительного) необходимо наблюдение окулиста, контроль АД и водно-электролитного баланса, а также картины периферической крови, глюкозы в крови; с целью уменьшения побочных эффектов можно назначить анаболические стероиды, антибиотики, а также увеличить поступление калия в организм (диета, препараты калия). Рекомендуется уточнить необходимость введения АКТГ после курса лечения преднизолоном (после проведения кожной пробы!).

При болезни Аддисона следует избегать одновременного применения с барбитуратами.

После прекращения лечения возможно возникновение синдрома отмены, надпочечниковой недостаточности, а также обострение заболевания, по поводу которого был назначен преднизолон.

При интеркуррентных инфекциях, септических состояниях и туберкулезе, необходимо одновременное проведение антибиотикотерапии.

У детей в период роста ГКС следует применять только по абсолютным показаниям и под тщательным контролем врача.

Наружно не следует применять более 14 дней. В случае применения при обыкновенных или розовых угрях возможно обострение заболевания.

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

У детей в период роста ГКС следует применять только по абсолютным показаниям и под тщательным контролем врача.

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

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