Реленза



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Занамивир

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Порошок для ингаляций дозированный белого или почти белого цвета.

	1 доза	**1 ротадиск**
занамивир	5 мг	20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат.

Ротадиск (5) - коробки пластиковые (1) в комплекте с дискхалером (1 шт.) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противовирусный препарат, высокоселективный ингибитор нейраминидазы (поверхностного фермента вируса гриппа). Вирусная нейраминидаза обеспечивает высвобождение вирусных частиц из инфицированной клетки и может ускорять проникновение вируса через слизистый барьер к поверхности эпителиальных клеток, тем самым обеспечивая инфицирование других клеток дыхательных путей. Ингибирующая активность занамивира показана как in vitro так и in vivo и включает все 9 подтипов нейраминидаз вирусов гриппа, в т.ч. циркулирующие и вирулентные для различных видов. Половина ингибирующей концентрации (IC_{50})для штаммов вируса А и В, составляет от 0.09 до 95.2 пМ.

Репликация вируса гриппа ограничена клетками поверхностного эпителия дыхательных путей. Занамивир действует во внеклеточном пространстве, уменьшая воспроизведение обоих типов вируса гриппа А и В, предотвращая выброс вирусных частиц из клеток поверхностного эпителия дыхательных путей.

Эффективность занамивира при ингаляционном применении подтверждена в контролируемых клинических исследованиях. Использование занамавира в качестве терапии острых инфекций, вызванных вирусом гриппа, приводило к уменьшению выброса вируса (по сравнению с плацебо). Развития резистентности к занамивиру не зарегистрировано.

Клиническая эффективность и безопасность

Занамивир, применяемый в дозах, используемых при лечении гриппа, у здоровых, относящихся к группе риска (как правило, находившихся в контакте с заболевшими), облегчает симптоматику и сокращает продолжительность заболевания. Комбинированный анализ результатов 3 исследований показал, что медиана времени до облегчения симптомов заболевания сокращается до 1.5 дней у пациентов в группе занамивира по сравнению с пациентами в

группе плацебо (p<0.001). Количество осложнений снижалось в группе занамивира 171/769 (22%) по сравнению с плацебо 208/711 (29%) и относительный риск составил: 0.77; (95% CI: 0.65-0.92; p=0.004). Использование антибиотиков для лечения осложнений после перенесенного гриппа также снижалось от 136/711 (19%) в группе плацебо до 110/769 (14%) в группе занамивира (относительный риск: 0.76; 95% CI: 0.60-0.95; p=0.021). Оптимальная эффективность занамивира была показана в случае начала проведения лечения в максимально короткие сроки после появления первых симптомов заболевания.

Было показано, что занамивир также эффективен в качестве средства профилактики гриппа у детей старше 5 лет и у взрослых. Процент эффективной защиты составляет 67-79% по сравнению с плацебо и 56-61% по сравнению с активным контролем.

Фармакокинетика

Всасывание

При ингаляционном применении абсолютная биодоступность препарата низкая (в среднем 2%). Системная абсорбция составляет примерно 10-20%. После однократного приема дозы 10 мг C_{max} составляет 97 нг/мл и достигается через 1.25 ч. Вследствие низкой абсорбции концентрация активного вещества в плазме крови низкая (низкая степень всасывания сохраняется при повторных ингаляциях).

Распределение

После ингаляции занамивир распределяется в тканях респираторного тракта, достигая высоких концентраций. При применении в однократной дозе 10 мг занамивир определяется в эпителиальном слое дыхательных путей, который является основным местом репликации вируса гриппа.

Концентрация занамивира через 12 ч и 24 ч после ингаляции примерно в 340 и 52 раз соответственно превышает среднее значение IC_{50} для вирусной нейраминидазы. Высокая концентрация занамивира в респираторном тракте обеспечивает быстрое ингибирование вирусной нейраминидазы.

Занамивир накапливается преимущественно в тканях ротоглотки и легких (в среднем 77.6% и 13.2% соответственно).

Метаболизм и выведение

Занамивир выводится почками в неизмененном виде и не подвергается метаболизму.

$T_{1/2}$ занамивира после ингаляции колеблется от 2.6 до 5.05 ч. Общий клиренс - от 2.5 до 10.9 л/ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов пожилого возраста при терапевтической дозе 20 мг/сут биодоступность низкая (10-20%), вследствие этого системное действие занамивира отсутствует. Изменения фармакокинетики, связанные с возрастом, маловероятны (коррекция дозы не требуется).

У детей фармакокинетика занамивира оценивалась в контролируемом исследовании у 24 пациентов в возрасте от 3 мес до 12 лет при использовании небулайзера (10 мг) и порошкового ингалятора (10 мг). Фармакокинетические параметры у детей не отличались от таковых у взрослых.

У пациентов с нарушением функции почек при применении терапевтических доз 20 мг биодоступность низкая и составляет 10-20%, следовательно, системные концентрации занамивира незначительны. Учитывая широкий диапазон безопасности препарата, возможное увеличение системных концентраций у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени остается клинически незначимым и не требует коррекции режима дозирования.

Поскольку занамивир не подвергается метаболизму, при нарушении функции печени не требуется коррекции режима дозирования.

Показания к применению:

— лечение и профилактика инфекции, вызванной вирусом гриппа типа А и В, у детей старше 5 лет и взрослых.

Относится к болезням:

- Грипп
- Инфекции

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при заболеваниях дыхательных путей, сопровождающихся бронхоспазмом (в т.ч. в анамнезе).

Способ применения и дозы:

Предназначен только для ингаляционного введения в дыхательные пути с использованием прилагаемого ингалятора Дискхалер. Другие ингаляционные препараты, например, быстродействующие бронходилататоры, следует принимать до начала ингаляции препаратом Реленза.

При *лечении гриппа А и В* **взрослым и детям старше 5 лет** рекомендуется назначать по 2 ингаляции (2×5 мг) 2 раза/сут в течение 5 дней. Суточная доза - 20 мг.

Пациентам пожилого возраста и пациентам с нарушениями функции почек и печени коррекции дозы не требуется.

Для достижения оптимального эффекта лечение должно быть начато как можно раньше.

С *целью профилактики гриппа А и В* **взрослым и детям старше 5 лет** рекомендуется назначать по 2 ингаляции (2×5 мг) 1 раз/сут в течение 10 дней. Суточная доза - 10 мг. Курс профилактики может быть продлен до 1 мес, если риск возникновения заболевания сохраняется более 10 дней.

Пациентам пожилого возраста и пациентам с нарушениями функции почек и печени коррекция дозы не требуется.

Правила применения Дискхалера

Устройство Дискхалер используется для ингаляций ротадиска (форма выпуска Релензы). Дискхалер состоит из следующих частей:

— корпус с крышкой и пластиковой иглой для прокалывания ячейки ротадиска;

— чехол для мундштука;

— выдвижной лоток с мундштуком и вращающимся колесом, на которое помещается Ротадиск.

Ротадиск состоит из 4 блистеров, каждый из которых содержит определенную дозу препарата.

Ротадиск может храниться в устройстве для ингаляций Дискхалер, тем не менее, блистер следует прокалывать непосредственно перед ингаляцией препарата. Несоблюдение этой рекомендации может нарушить работу Дискхалера и, соответственно, снизить эффективность препарата.

Важно: не следует протыкать ротадиск до того, как он будет помещен в Дискхалер.

Загрузка ротадиска в Дискхалер

1. Снять чехол с мундштука, убедиться, что мундштук чистый внутри и снаружи.

2. Осторожно вытянуть выдвижной лоток до выхода пластмассовых зажимов, взявшись за углы лотка. Лоток следует выдвинуть до упора, чтобы были видны насечки на боковой стороне зажимов.

3. Вытянуть лоток полностью, сжавши большим и указательным пальцем насечки на боковой стороне зажимов.

4. Поместить ротадиск на колесо ячейками вниз и вставить лоток обратно в Дискхалер.

Проведение ингаляции

1. Поднять крышку Дискхалера вверх до упора, чтобы проколоть верхнюю и нижнюю фольгу Ротадиска. Закрыть крышку.

Важно: не следует поднимать крышку до того, как выдвижной лоток будет полностью установлен.

2. После полного выдоха поместить мундштук между зубами, плотно обхватить мундштук губами, не закрывая отверстий для воздуха по обе стороны мундштука. Сделать медленный глубокий вдох (обязательно через рот, а не через нос). Вынуть мундштук изо рта. Задержать дыхание насколько возможно. Медленно выдохнуть. Нельзя делать выдох в ингалятор.

3. Осторожно однократно выдвинуть выдвижной лоток до упора, не нажимая на зажимы, и задвинуть. При этом ротадиск повернется на одну ячейку и готов для следующей ингаляции.

Важно: прокалывать ячейку следует только непосредственно перед ингаляцией.

Для проведения повторных ингаляций повторить п.1 и п.2.

Замена пустого ротадиска

Каждый ротадиск содержит 4 ячейки. После четырех ингаляций пустой ротадиск следует заменить на новый (п.2-4).

Важно: дети должны использовать ингаляционное устройство под контролем взрослых.

Побочное действие:

В контролируемых клинических исследованиях частота возникновения нежелательных явлений сходна в группе занамивира и группе плацебо. Спонтанные сообщения содержали информацию о нежелательных реакциях на применение занамивира и классифицировались следующим образом: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, <1/10) иногда (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000), включая отдельные случаи.

Аллергические реакции: очень редко - аллергические реакции, включая отек лица и гортани.

Со стороны дыхательной системы: очень редко - бронхоспазм, затруднение дыхания.

Дерматологические реакции: очень редко - сыпь, крапивница, тяжелые кожные реакции, включая полиморфную эритему, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Передозировка:

Случайная передозировка маловероятна вследствие дозированного введения, способа применения и низкой биодоступности препарата.

При ингаляционном применении 64 мг/сут (более чем в 3 раза превышающей рекомендуемую суточную дозу) не зарегистрировано побочных эффектов. Также они не зарегистрированы и при парентеральном применении препарата в дозе 1.2 г/сут в течение 5 дней.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Эффективность и безопасность применения занамивира при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) не изучалась.

В *экспериментальных исследованиях* на животных было показано, что занамивир проникает через плацентарный барьер и выделяется с грудным молоком, тем не менее, не отмечено тератогенного эффекта или снижения фертильности или клинических проявлений каких-либо нарушений в пре- и постнатальном периодах. Информации о проникновении через плацентарный барьер или в грудное молоко у человека нет.

Тем не менее, занамивир не следует применять при беременности и в период грудного вскармливания, особенно в I триместре, за исключением случаев, когда ожидаемая польза применения для матери превышает возможный риск для плода.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Данные о лекарственном взаимодействии препарата Реленза не предоставлены.

Особые указания и меры предосторожности:

Зарегистрированы очень редкие отдельные сообщения о развитии бронхоспазма и/или ухудшении функции дыхания после применения занамавира, в т.ч. без предшествующих заболеваний в анамнезе. В случае развития одного из вышеперечисленных явлений следует прекратить прием занамивира и обратиться к врачу.

Пациенты с заболеваниями дыхательных путей должны иметь в качестве средства скорой помощи короткодействующие бронходилататоры при лечении занамивиром.

Инфекция, вызванная вирусом гриппа, может быть, ассоциирована с различными неврологическими и поведенческими расстройствами. В сообщениях, полученных в постмаркетинговом периоде (преимущественно зарегистрированные у детей в Японии), отмечались судорожные припадки, делирий, галлюцинации и девиантное

поведение у пациентов, инфицированных вирусом гриппа и принимающих ингибиторы нейраминидазы, включая занамивир. Эти явления наблюдались преимущественно на ранних стадиях заболевания, часто имели внезапное начало и быстрое наступление исхода. Причинно-следственная связь между приемом занамивира и вышеуказанными нежелательными явлениями не была доказана. При возникновении каких-либо психоневрологических симптомов необходимо оценить сооотношение риск/польза дальнейшего лечения занамивиром для каждого конкретного пациента.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Не влияет.

При нарушениях функции почек

Пациентам с нарушениями функции почек коррекции дозы не требуется.

При нарушениях функции печени

Пациентам печени коррекции дозы не требуется.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

Применение в детском возрасте

Препарат назначают детям старше 5 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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