Салтиказон-натив



Код АТХ:

- R03AK06

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Салметерол
- Флутиказон

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Порошок для ингаляций дозированный, 50 мкг + 100 мкг, 50 мкг + 250 мкг, 50 мкг + 500 мкг. По 10 капс. в контурной ячейковой упаковке из пленки полимерной и фольги алюминиевой печатной или фольги алюминиевой многослойной и фольги алюминиевой печатной.

По 3 или 6 контурных ячейковых упаковок вместе с устройством для ингаляций или без него помещают в картонную пачку.

Состав:

Порошок для ингаляций дозированный	1 капс.
активные вещества:	
салметерола ксинафоат	72,5/72,5/72,5 мкг
(в пересчете на салметерол — 50/50/50 мкг)	
флутиказона пропионат	100/250/500 мкг
вспомогательные вещества: натрия бензоат — 2/2/2 мг; лактозы моногидрат — до 12/12/12 мг	
капсулы желатиновые	
корпус капсулы: индиготин —	

-/0,3/-%; железа оксид желтый — -/1,7143/-%; азорубин — -/-/0,0016%; бриллиантовый черный — -/-/0,0958%; патентованный синий — -/-/0,1643%; хинолиновый желтый — -/-/1,1496%; титана диоксид — 2/2/1,3333%; желатин — до 100/до 100/до 100%	
крышечка капсулы: азорубин — -/-/0,0016%; бриллиантовый черный — -/-/0,0958%; патентованный синий — -/-0,1642%; хинолиновый желтый — -/-/1,1496%; титана диоксид — 2/1/1,3333%; желатин — до 100/до 100/до 100%	

Описание:

Дозировка 50 мкг+100 мкг: твердые желатиновые капсулы № 3, корпус — белого цвета, крышечка — белого цвета.

Дозировка 50 мкг+250 мкг: твердые желатиновые капсулы № 3, корпус — белого цвета, крышечка — зеленого цвета.

Дозировка 50 мкг+500 мкг: твердые желатиновые капсулы № 3, корпус — зеленого цвета, крышечка — зеленого цвета.

С*одержимое капсул* — порошок белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — бронходилатирующее, глюкокортикоидное, бета-адреномиметическое.

Фармакодинамика

Салтиказон®-натив — комбинированный препарат, содержащий салметерол и флутиказона пропионат, которые обладают разными механизмами действия. Салметерол предотвращает возникновение бронхоспазма, флутиказона пропионат улучшает легочную функцию и предотвращает обострение. Препарат Салтиказон®-натив может быть альтернативой для пациентов, которые одновременно получают агонист β_2-адренорецепторов и ингаляционный ГКС из разных ингаляторов. Салметерол — это селективный длительно действующий (до 12 ч) агонист β_2-адренорецепторов, имеющий длинную боковую цепь, которая связывается с наружным доменом рецептора.

Фармакологические свойства салметерола обеспечивают защиту от индуцируемой гистамином бронхоконстрикции и более длительную бронходилатацию (продолжительностью не менее 12 ч), чем агонисты β_2-адренорецепторов короткого действия. Начало бронхолитического эффекта — в течение 10–20 мин.

Салметерол является сильным и длительно действующим ингибитором высвобождения из легочной ткани человека медиаторов тучных клеток, таких как гистамин, ЛТ и $ПГ_{D2}$. Салметерол угнетает раннюю и позднюю фазы ответа на ингаляционные аллергены; эффект длится более 30 ч после введения одной дозы, когда бронходилатирующее действие уже отсутствует.

Однократное введение салметерола ослабляет гиперреактивность бронхиального дерева. Это свидетельствует о том, что салметерол помимо бронхолитического эффекта обладает дополнительным действием, клиническая значимость которого окончательно не установлена.

Флутиказона пропионат — синтетический ГКС для местного применения, улучшает легочную функцию и предотвращает обострения.

Флутиказона пропионат ингибирует приток тучных клеток, эозинофилов, лимфоцитов, макрофагов, нейтрофилов, снижает продукцию и высвобождение медиаторов воспаления и других биологически активных веществ (в т.ч. гистамина, ПГ, ЛТ и цитокинов), вовлеченных в формирование аллерген-специфической сенсибилизации. В результате снижается проницаемость капилляров, исчезает экссудация, уменьшается секреция слизи слизистыми железами, восстанавливается проходимость бронхиального дерева.

При ингаляционном введении в рекомендуемых дозах флутиказона пропионат проявляет выраженное

противовоспалительное и противоаллергическое действие в легких, что приводит к уменьшению клинических симптомов и снижению частоты обострений заболеваний, сопровождающихся обструкцией дыхательных путей. Восстанавливает реакцию больного на бронходилататоры, позволяя уменьшить частоту их применения.

При длительном применении ингаляционного флутиказона пропионата в максимально рекомендуемых дозах суточная секреция гормонов коры надпочечников остается в пределах нормы. После перевода пациентов, получающих другие ингаляционные ГКС, на прием флутиказона пропионата суточная секреция гормонов коры надпочечников постепенно нормализуется, несмотря на предшествующее и текущее периодическое использование пероральных кортикостероидов. Это указывает на восстановление функции надпочечников на фоне ингаляционного применения флутиказона пропионата. При длительном применении флутиказона пропионата резервная функция коры надпочечников также остается в пределах нормы, о чем свидетельствует нормальное увеличение выработки кортизола в ответ на соответствующую стимуляцию (необходимо учитывать, что остаточное снижение адреналового резерва, вызванного предшествующей терапией, может сохраняться в течение длительного времени).

Фармакокинетика

Салметерол

Действует местно в легочных тканях, поэтому его содержание в плазме крови не коррелирует с терапевтическими эффектами. Данные о его фармакокинетике весьма ограничены, т.к. при ингаляции в терапевтических дозах его C_{max} в плазме крайне низка (около 200 пг/мл и ниже). После регулярных ингаляций салметеролом в крови удается обнаружить гидроксинафтоевую кислоту, C_{ss} которой составляют около 100 нг/мл. Эти концентрации в 1000 раз ниже C_{ss}, наблюдавшихся в исследованиях токсичности. Результаты исследования in vitro показали, что салметерол экстенсивно метаболизируется под действием изофермента CYP3A4 системы цитохрома P450 до α-гидроксисалметерола путем алифатического окисления.

Флутиказон

Абсолютная биодоступность ингаляционного флутиказона пропионата у здоровых людей варьирует в зависимости от используемого ингалятора, при введении комбинации салметерола и флутиказона пропионата с помощью дозированного аэрозоля для ингаляций она составляет 5.3%. У пациентов с бронхиальной астмой и ХОБЛ наблюдаются более низкие концентрации флутиказона пропионата в плазме крови. Системная абсорбция происходит преимущественно через легкие. Вначале она более быстрая, но затем ее скорость замедляется. Часть ингаляционной дозы может быть проглочена, но эта часть вносит минимальный вклад в системную абсорбцию вследствие низкой растворимости флутиказона пропионата в воде и ввиду его пресистемного метаболизма; биодоступность из ЖКТ составляет менее 1%. По мере увеличения ингаляционной дозы наблюдается линейное увеличение концентрации флутиказона пропионата в плазме крови. Флутиказон имеет большой V_d в равновесном состоянии (около 300 л) и обладает сравнительно высокой степенью связывания с белками плазмы (91%). Быстро элиминируется из крови, главным образом в результате метаболизма под действием изофермента CYP3A4 системы цитохрома P450 до неактивного карбоксильного метаболита. Распределение флутиказона характеризуется быстрым клиренсом из плазмы (1150 мл/мин) и конечным $T_{1/2}$, равным примерно 8 ч. Почечный клиренс неизмененного флутиказона пропионата ничтожно мал (<0.2%), в виде метаболита с мочой выводится менее 5% дозы.

Показания к применению:

Для регулярного лечения бронхиальной астмы, если показана комбинированная терапия бета$_2$-адреномиметиком длительного действия и ингаляционным ГКС.

Для поддерживающей терапии у пациентов при ХОБЛ со значением ОФВ1<60% нормы до ингаляции бронходилататора и повторными обострениями в анамнезе, у которых выраженные симптомы заболевания сохраняются, несмотря на регулярную терапию бронходилататорами.

Относится к болезням:

- Бронхит

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к компонентам препарата; детский возраст до 4 лет.

С осторожностью: пациенты с острым или латентным туберкулезом легких; тиреотоксикоз; грибковые, вирусные или бактериальные инфекции органов дыхания; сердечно-сосудистые заболевания, суправентрикулярная тахикардия и экстрасистолия, желудочковая экстрасистолия, фибрилляция предсердий; гипокалиемия; глаукома, катаракта, остеопороз; сахарный диабет.

Способ применения и дозы:

Применяется только в виде ингаляций.

Доза и схема применения устанавливаются индивидуально, в зависимости от показаний, возраста пациента, применяемой лекарственной формы и используемого ингалятора.

Побочное действие:

Инфекционные и паразитарные заболевания: часто - кандидоз ротовой полости и глотки, пневмония (у пациентов с ХОБЛ); редко - кандидоз пищевода.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности: нечасто - кожные реакции гиперчувствительности, одышка; редко - анафилактические реакции.

Со стороны эндокринной системы: нечасто - катаракта; редко - глаукома, синдром Кушинга, кушингоидные симптомы, угнетение функции надпочечников, задержка роста у детей и подростков, снижение минеральной плотности костной ткани.

Со стороны обмена веществ и питания: нечасто - гипергликемия; очень редко - гипокалиемия.

Нарушения психики: нечасто - тревожность, нарушения сна; редко - изменения в поведении, в т.ч. гиперактивность и раздражительность (особенно у детей).

Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль; нечасто - тремор.

Со стороны сердца: нечасто - учащенное сердцебиение, тахикардия, фибрилляция предсердий; редко - аритмия, включая желудочковую экстрасистолию, наджелудочковую тахикардию и экстрасистолию.

Со стороны дыхательной системы: часто - охриплость голоса и/или дисфония; нечасто - раздражение глотки; редко - парадоксальный бронхоспазм.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - кровоподтеки.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - мышечные спазмы, артралгия.

Передозировка:

Симптомы

Салметерол. К объективным и субъективным симптомам передозировки салметерола относятся: тремор, головная боль, тахикардия, повышение сАД и гипокалиемия.

Лечение: антидотами являются кардиоселективные β-адреноблокаторы. В тех случаях, когда бывает необходимо отменить препарат Салтиказон®-натив вследствие передозировки входящего в его состав салметерола, пациенту следует назначить соответствующий замещающий адреномиметик.

Флутиказона пропионат. Ингаляция доз флутиказона пропионата превышающих рекомендуемые может вызвать временное угнетение гипоталамо-гипофизарно-надпочечниковой системы. Обычно это не требует принятия каких-то экстренных мер, поскольку в большинстве случаев нормальная функция надпочечников восстанавливается в течение нескольких дней.

Салтиказон®-натив. При длительной ингаляции чрезмерно больших доз препарата Салтиказон®-натив может возникнуть значимое угнетение надпочечников.

Пациенты должны знать, что не следует применять препарат Салтиказон®-натив в дозах превышающих рекомендуемые.

Важное значение имеет регулярная оценка эффективности терапии и снижение дозы препарата Салтиказон®-натив до минимально эффективной, т.е. до такой, которая обеспечивает эффективный контроль симптомов болезни. При хронической передозировке рекомендуется проводить контроль резервной функции коры надпочечников.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение при беременности и в период грудного вскармливания допустимо только в случае, если потенциальная польза для матери превышает возможный риск для плода или грудного ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Диагнозы

- Астматический статус
- Бронхит
- Кашель
- Муковисцидоз

Особые указания и меры предосторожности:

Данная комбинация не предназначена для облегчения острых симптомов, поскольку в таких случаях следует применять быстро- и короткодействующий ингаляционный бронходилататор (например, сальбутамол).

Более частое применение бронходилататоров короткого действия для облегчения симптомов свидетельствует об ухудшении контроля заболевания, и в таких ситуациях пациент должен обращаться к врачу.

Внезапное и усиливающееся ухудшение контроля бронхоспастического синдрома представляет потенциальную угрозу жизни, и в таких ситуациях пациент тоже должен обращаться к врачу.

Пациентам с астмой нельзя резко прекращать лечение данной комбинацией, дозу препарата следует снижать постепенно под контролем врача. У пациентов с ХОБЛ отмена препарата может сопровождаться симптомами декомпенсации и требует наблюдения врача.

Любой ингаляционный ГКС может вызывать системные эффекты, особенно при длительном использовании в высоких дозах; однако вероятность возникновения таких симптомов намного ниже, чем при лечении пероральными ГКС. Возможные системные реакции включают синдром Кушинга, кушингоидные черты, угнетение функции надпочечников, задержку роста у детей и подростков, снижение минеральной плотности костной ткани, катаракту и глаукому. Поэтому при лечении бронхиальной астмы, важно снижать дозу до самой низкой дозы, обеспечивающей эффективный контроль над заболеванием.

В экстренных и плановых ситуациях с вероятностью стресса следует всегда учитывать возможность угнетения функции коры надпочечников и необходимость применения ГКС.

При проведении реанимационных мероприятий или хирургических вмешательств требуется определение степени надпочечниковой недостаточности.

Рекомендуется регулярно измерять рост детей, которые получают длительную терапию ингаляционными ГКС.

Ввиду возможности угнетения надпочечников, пациентов, переведенных с пероральных ГКС на ингаляционную терапию флутиказона пропионатом, следует лечить с особой осторожностью и регулярно контролировать у них функцию коры надпочечников.

После начала лечения ингаляционным флутиказоном системные ГКС следует отменять постепенно, и такие пациенты должны иметь при себе специальную карточку пациента, содержащую указание о возможной потребности в дополнительном введении ГКС в стрессовых ситуациях.

У больных с обострением бронхиальной астмы, гипоксией необходимо контролировать концентрацию калия в плазме.

Имеются очень редкие сообщения о повышении уровня глюкозы в крови, это следует учитывать при необходимости применения данной комбинации у больных сахарным диабетом.

Источник: http://drugs.thead.ru/Saltikazon-nativ