Соматулин Аутожель



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ланреотид

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Гель для п/к введения пролонгированного действия от беловатого до желтоватого цвета.

	1 шприц
ланреотида ацетат	149.4 мг
в пересчете на ланреотид*	125.5 мг
вводимая доза ланреотида**	120 мг
общая масса - 510 мг/шприц масса, вводимая при инъекции*** - 488 мг/шприц	

Вспомогательные вещества: вода д/и - 357.8 мг/шприц, уксусная кислота ледяная**** - до pH 6.1±0.3.

510 мг - шприцы одноразовые полипропиленовые (1) в комплекте с иглой - пакеты трехслойные (1) - пачки картонные.

* среднее содержание ланреотида основания в ланреотида ацетате 82-84%, концентрация ланреотида основания в перенасыщенном растворе 24.6% (м/м).
** количество ланреотида, поступающего в центральный кровоток при инъекции.
*** потеря массы в шприце составляет 22 мг.
**** уксусная кислота ледяная может добавляться или нет, в зависимости от уровня содержания безводного ацетата в активной субстанции.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Синтетический аналог природного соматостатина, синтетический пептид.

Подобно природному соматостатину, ланреотид подавляет ряд эндокринных, экзокринных и паракринных механизмов. Выявлена выраженная тропность ланреотида к соматостатиновым рецепторам человека (ССР)-2, 3 и 5, и низкая тропность к ССР-1 и 4. Как полагают, активация ССР-2 и 5 является основным механизмом, лежащим в основе подавления секреции гормона роста (ГР).

Ланреотид, подобно соматостатину, оказывает общее экзокринное антисекреторное действие. Он подавляет базальную секрецию ингибирующих пептидов желудка и полипептидов поджелудочной железы, но не оказывает действие на секрецию пищеварительных ферментов или желудочную секрецию. Ланреотид существенно подавляет индуцируемое пищей усиление кровотока в верхней мезентериальной артерии и портальной вене. Ланреотид

существенно уменьшает стимулируемую простагландином Е1 секрецию воды, натрия, калия и хлоридов в тощей кишке.

Ланреотид уменьшает уровень пролактина у пациентов с акромегалией, получающих лечение в течение длительного времени.

Фармакокинетика

В отличие от показателей при в/в введении, профили фармакокинетики ланреотида в лекарственной форме пролонгированного действия, вводимого в/м или глубоко п/к, показали продолжительность действия препарата в течение 28 дней.

Способ введения препарата (п/к или в/м) не оказывает какого-либо влияния на фармакокинетические параметры ланреотида. Уровень концентрации препарата в плазме показал дозозависимую линейность с небольшими отклонениями, связанными с индивидуальными особенностями участников исследований.

Всасывание

После однократного глубокого п/к введения препарата Соматулин Аутожель 120 мг здоровым добровольцам C_{max} в сыворотке крови составляла 6.79 нг/мл и достигалась через 7 ч, с последующим медленным снижением (в среднем $T_{1/2}$ составил 30.1 сут). Через 4 недели средняя концентрация препарата в сыворотке составила 1.69 нг/мл. Абсолютная биодоступность составила 78.4%.

После однократного глубокого п/к введения препарата Соматулин Аутожель 120 мг пациентам с акромегалией значения C_{max} составляла 3.1 нг/мл и достигалась через 23.52 ч, с последующим медленным снижением. Через 4 недели средняя концентрация препарата в сыворотке составила 1.4 нг/мл.

В среднем после 4 инъекций, вводимых каждые 4 недели, достигалась C_{ss} ланреотида в плазме. При этом среднее значение C_{ss}^{max} составляло 7.7 нг/мл при дозе 120 мг. Среднее значение C_{min} составило 3.8 нг/мл.

Распределение

Фармакокинетические параметры ланреотида после в/в введения здоровым добровольцам выявили ограниченное внесосудистое распределение с V_d в равновесном состоянии 13 л.

Выведение

После в/в введения здоровым добровольцам общий клиренс - 20 л/ч, $T_{1/2}$ - 2.5 ч, среднее время определения препарата в плазме – 0.68 ч.

После инъекций препарата Соматулин Аутожель 120 мг здоровым добровольцам $T_{1/2}$ составил примерно 28 дней.

Показания к применению:

Акромегалия (с целью снижения уровня ГР и инсулиноподобного фактора роста-1 /ИФР-1/ и, по возможности, их нормализации):

— длительная терапия пациентов, у которых уровень ГР и/или инсулиноподобного фактора роста-1 (ИФР-1) остается повышенным после оперативного лечения и/или лучевой терапии;

— длительная терапия пациентов, которым показано проведение медикаментозной терапии (целью терапии акромегалии является снижение ГР и ИФР-1 и, по возможности, нормализация этих показателей).

Терапия симптомов карциноидных опухолей.

Относится к болезням:

- Инсулинома
- Инсульт
- Опухоли

Противопоказания:

— осложненный, нелеченный холедохолитиаз;

— беременность;

— лактация;

— детский возраст (в связи с недостаточностью клинических данных);

— повышенная чувствительность к ланреотиду или к родственным пептидам.

Способ применения и дозы:

Акромегалия

Рекомендуемая начальная доза составляет 120 мг каждые 28 дней.

Пациентам, у которых на фоне терапии аналогами соматостатина достигнут эффективный контроль над заболеванием, может быть назначен Соматулин Аутожель в дозе 120 мг с увеличенным интервалом - каждые 42-56 дней. У этих пациентов необходимо регулярно и в долгосрочной перспективе мониторировать клинические симптомы и уровень ГР и ИФР-1.

Всем пациентам показан регулярный контроль клинических симптомов, уровня ГР и ИФР-1.

Карциноидные опухоли

Рекомендуемая начальная доза составляет 120 мг каждые 28 дней. В дальнейшем дозу следует подбирать в зависимости от достигнутого уменьшения симптоматики.

Пациентам, у которых на фоне терапии аналогами соматостатина достигнут эффективный контроль над заболеванием, может быть назначен Соматулин Аутожель в дозе 120 мг с увеличенным интервалом - каждые 42-56 дней.

Правила введения препарата

Гель для п/к введения пролонгированного действия поставляется в предварительно заполненном шприце, снабженном защитным устройством, которое автоматически закрывает иглу сразу после проведения инъекции, тем самым помогает предотвратить случайный укол иглой после использования.

Препарат следует ввести глубоко п/к немедленно после вскрытия упаковки.

1 шприц с препаратом предназначен только для однократного введения.

Препарат вводится медицинским персоналом в верхний латеральный квадрант ягодицы.

В случае если пациент получает стабильную дозу препарата Соматулин Аутожель, инъекции могут проводить в домашних условиях сами пациенты или его близкие после предварительного соответствующего тренинга у врача. При самостоятельном проведении инъекции пациентом препарат следует вводить в верхнюю часть бедра.

При введении препарата следует соблюдать следующие указания.

1. Достать Соматулин Аутожель из холодильника за 30 мин до применения.

2. Убедиться в наличии чистого места для подготовительных действий и вымыть руки.

3. Перед вскрытием проверить целостность пакета, в который помещен шприц с препаратом. Также, необходимо убедиться, что у препарата не истек срок годности. Дата окончания срока годности присутствует на этикетке пакета. Не использовать препарат в случае нарушения целостности пакета или по истечении срока годности.

4. Вскрыть пакет и извлечь из него шприц с защитным устройством.

5. Выбрать место для предполагаемой инъекции. Продезинфицировать место предполагаемой инъекции (верхнюю часть бедра или верхний латеральный квадрант ягодицы), избегая растирания кожи. Инъекция делается каждый раз попеременно, то в левую, то в правую ягодицу или бедро.

6. Повернуть и потянуть защитное устройство хода поршня, затем удалить его.

7. Снять колпачок с иглы.

8. Введите иглу в верхнюю часть бедра или верхний латеральный квадрант ягодицы без захвата кожной складки, но удерживая кожу большим и указательным пальцами.

Игла должна быть введена быстро, на всю длину, перпендикулярно поверхности кожи (глубокая подкожная инъекция).

9. Медленно ввести весь препарат, оказывая постоянное равномерное давление на поршень, оставляя при этом иглу в неподвижном состоянии (обычно для полного введения препарат требуется около 20 сек). В то момент, когда поршень полностью пройдет все тело шприца и упрется в противоположный конец, слышится щелчок.

Замечание: следует продолжать удерживать поршень в нажатом состоянии во избежание срабатывания защитного устройства.

10. Удерживая поршень, вынуть иглу из места инъекции.

11. После этого, отпустить поршень, игла автоматически втянется в трубку защитного устройства и заблокируется в ней.

12. Аккуратно приложить к месту инъекции сухой ватный диск или стерильную салфетку, чтобы избежать кровотечения. Не растирать и не массировать место введения препарата после инъекции.

13. Утилизировать использованный шприц в соответствии с инструкциями.

Побочное действие:

Выявленные в процессе клинических исследований побочные реакции на фоне применения препарата Соматулин Аутожель аналогичны тем, которые наблюдаются при применении других лекарственных форм ланреотида пролонгированного действия, и, в основном, являются нарушениями со стороны пищеварительной системы.

В клинических исследованиях препарата Соматулин Аутожель при лечении больных с акромегалией, у 80% пациентов наблюдалось, по крайней мере, 1 нежелательное явление. Более чем 50% этих нежелательных явлений были отнесены к нарушениям со стороны пищеварительной системы. Эти побочные эффекты обычно слабо выражены и преходящи.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто (> 10%) - диарея, абдоминальная боль, тошнота, холелитиаз или сладж-синдром в желчном пузыре; часто (> 5%, но < 10%) - запор, метеоризм, анорексия; редко (>1%, но < 5%) - повышение концентрации билирубина; очень редко (< 1%) - тенезмы, рвота, острый панкреатит, стеаторея.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто (> 5%, но < 10%) - синусовая брадикардия.

Со стороны обмена веществ: часто (> 5%, но < 10%) - гипогликемия; очень редко (< 1%) - ухудшение течения сахарного диабета, нарушение толерантности к глюкозе, гипергликемия.

Дерматологические реакции: очень редко (< 1%) - выпадение волос, зуд, повышенное потоотделение, кожные реакции (неспецифические).

Местные реакции: очень редко (< 1%) - боль в месте введения, припухлость кожи. Через 30 мин после глубокой п/к инъекции препарата Соматулин Аутожель в области введения могут наблюдаться боль, покраснение, зуд и уплотнение соответственно у 8%, 5%, 5% и 19% пациентов. После 3-й инъекции частота этих симптомов снижается и наблюдается у 6%, 2%, 3% и 9% пациентов. Во всех случаях симптомы были слабо выраженными.

Прочие: часто (> 5%, но < 10%) - головокружение, аллергические кожные реакции; редко (>1%, но < 5%) - слабость, утомляемость; очень редко (< 1%) - чувство жара, боли в ногах, недомогание, головная боль, снижение либидо, сонливость.

Передозировка:

Симптомы: в клинических исследованиях ланреотид применяли в дозах, превышающих 15 мг/сут, при этом в процессе лечения серьезные побочные явления не выявлены. Описание передозировки ланреотида в лекарственной форме пролонгированного действия у людей ограничено одним случаем, когда, как сообщалось, пациенту вводили ланреотид в/м в дозе 30 мг в лекарственной форме пролонгированного высвобождения ежедневно в течение 2 месяцев (вместо 1 инъекции каждые 7 или 14 дней). Через 1 неделю после окончания терапии у 52-летнего мужчины с акромегалией, сахарным диабетом и артериальной гипертензией развился инфаркт миокарда с летальным исходом.

Лечение: в случае передозировки показано проведение симптоматической терапии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований безопасности применения препарата при беременности не проводилось.

В *экспериментальных исследованиях* по изучению влияния на репродуктивность у крыс и кроликов препарата в дозах, в 33 раза превышающих дозы, применяемые у человека, не выявлен риск для плода. Поскольку исследования по изучению репродуктивности у животных не всегда предсказывают влияние на репродуктивность у человека, данный препарат противопоказан при беременности.

Противопоказано применение препарата в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении ланреотида и циклоспорина возможно уменьшение концентрации циклоспорина в плазме крови, поэтому необходимо контролировать его концентрацию в крови.

Взаимодействие с лекарственными средствами, которые характеризуются высоким связыванием с белками плазмы, маловероятно, ввиду слабого связывания ланреотида с белками плазмы (в среднем 78%).

Особые указания и меры предосторожности:

Фармакологические исследования на животных и людях показали, что ланреотид, подобно соматостатину и его аналогам, может вызвать преходящее ингибирование секреции инсулина и глюкагона. Следовательно, у пациентов с сахарным диабетом, получающих лечение препаратом Соматулин Аутожель, могут наблюдаться незначительные кратковременные изменения уровня глюкозы в крови. Для определения необходимости коррекции противодиабетической терапии, необходимо контролировать уровень глюкозы в крови.

В процессе лечения пациентов с акромегалией возможно незначительное снижение функции щитовидной железы, однако клинический гипотиреоз наблюдается редко (<1%). В связи с этим показан контроль функции щитовидной железы.

Ланреотид может вызвать образование камней в желчном пузыре, поэтому проведение УЗИ желчного пузыря показано как в начале лечения, так и в его процессе. Холелитиаз протекает обычно бессимптомно. При появлении симптомов желчнокаменной болезни требуется лечение.

У пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек наблюдается уменьшение примерно в 2 раза общего клиренса ланреотида в плазме с обусловленным этим увеличением $T_{1/2}$ и AUC. При нарушении функции печени наблюдается увеличение объема распределения и среднего времени определения ланреотида в плазме, но нет изменений общего клиренса или AUC. У пожилых пациентов выявлено увеличение периода полувыведения и среднего времени определения ланреотида в плазме по сравнению с молодыми здоровыми лицами. Благодаря большой терапевтической широте ланреотида, в этих случаях нет необходимости изменять его дозу.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Маловероятно, что во время лечения препаратом Соматулин Аутожель ухудшается способность управлять автотранспортом и работать с механизмами.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре от 2° до 8°C (в холодильнике); не замораживать.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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