

Состав и форма выпуска

Таблетки цвета слоновой кости, круглые, с перекрестными баллами для перорального применения.

Действующее вещество - дефлазакорт.

Другие ингредиенты: лактоза, микрокристаллическая целлюлоза, кукурузный крахмал и стеарат магния.

Фармакологическое действие

Дефлазакорт является глюкокортикоидом. Его противовоспалительные и иммуносупрессивные эффекты используются при лечении различных заболеваний и сопоставимы с другими противовоспалительными стероидами. Клинические исследования показали, что среднее отношение активности дефлазакорта к преднизолону составляет 0,69-0,89.

Фармакокинетика

Абсорбция: перорально вводимый дефлазакорт хорошо всасывается.

Распределение: Активный метаболит D 21-ОН достигает пиковых концентраций в плазме через 1,5-2 часа. Он на 40% связан с белками и не имеет сродства к кортикостероидсвязывающему глобулину (транскортину).

Биотрансформация: перорально вводимый дефлазакорт немедленно превращается плазменными эстеразами в фармакологически активный метаболит (D 21-ОН). Метаболизм D 21-ОН является обширным. Метаболитом D 21-ОН является дефлазакорт 6-бета-ОН.

Устранение: его период полувыведения из плазмы составляет от 1,1 до 1,9 часа.

Ликвидация происходит главным образом через почки; 70% введенной дозы выводится с мочой. Оставшиеся 30% выводятся с калом. Метаболизм D 21-ОН обширен; только 18% экскреции с мочой представляет собой D 21-ОН. Метаболит D 21-ОН, дефлазакорт 6-бета-ОН, составляет одну треть от мочеиспускания.

Показания к применению

Широкий спектр состояний может иногда нуждаться в лечении глюкокортикоидами.

Показания включают в себя:

- Анафилаксия, астма, тяжелые реакции гиперчувствительности.
- Ревматоидный артрит, ювенильный хронический артрит, ревматическая полимиалгия.
- Системная красная волчанка, дерматомиозит, смешанная болезнь соединительной ткани (кроме системного склероза), узловой полиартериит, саркоидоз.
- Пемфигус, буллезный пемфигоид, пиодермия гангренозная.
- Минимальное изменение нефротического синдрома, острый интерстициальный нефрит.
- Ревматический кардит.
- Язвенный колит, болезнь Крона.
- Увеит, неврит зрительного нерва.
- Аутоиммунная гемолитическая анемия, идиопатическая тромбоцитопеническая пурпура.
- Острый и лимфатический лейкоз, злокачественная лимфома, множественная миелома.
- Иммунная супрессия при трансплантации.

Способ применения и дозы

Дозировка должна подбираться индивидуально в зависимости от диагноза, тяжести заболевания, реакции и переносимости пациента. Следует использовать самую низкую дозу, которая даст приемлемый ответ.

Взрослые

При острых расстройствах может потребоваться дефлазакорт до 120 мг / день. Поддерживающие дозы в большинстве случаев находятся в диапазоне от 3 до 18 мг / сут. Следующие схемы предназначены только для ознакомления.

Ревматоидный артрит: поддерживающая доза обычно находится в диапазоне от 3 до 18 мг / день. Наименьшая эффективная доза должна использоваться и увеличиваться при необходимости.

Бронхиальная астма: при лечении острого приступа могут потребоваться высокие дозы 48-72 мг / сут в зависимости от тяжести и постепенно снижаться после того, как приступ контролируется. Для поддержания при хронической астме дозы следует титровать до минимальной дозы, которая контролирует симптомы.

Другие условия: доза дефлазакорта зависит от клинической потребности, титруемой до самой низкой эффективной дозы для поддержания. Начальные дозы могут быть оценены на основе отношения 5 мг преднизона или преднизолона к 6 мг дефлазакорта.

Печеночная недостаточность

У пациентов с печеночной недостаточностью уровень дефлазакорта в крови может быть

повышен. Поэтому дозу дефлазакорта следует тщательно контролировать и доводить до минимальной эффективной дозы.

Почечная недостаточность

У пациентов с почечной недостаточностью не требуется никаких особых мер предосторожности, кроме тех, которые обычно применяются у пациентов, получающих терапию глюкокортикоидами.

Престарелые

У пожилых пациентов не требуется никаких особых мер предосторожности, кроме тех, которые обычно применяются у пациентов, получающих терапию глюкокортикоидами. Общие побочные эффекты системных кортикостероидов могут быть связаны с более серьезными последствиями в пожилом возрасте.

Детская популяция

В клинических испытаниях было ограничено воздействие детей на дефлазакорт.

У детей показания к глюкокортикоидам такие же, как и у взрослых, но важно использовать самую низкую эффективную дозировку. Администрирование в течение дня может быть целесообразным.

Дозы дефлазакорта обычно лежат в диапазоне 0.25 - 1,5 мг / кг / сут. Следующие диапазоны обеспечивают общее руководство:

Ювенильный хронический артрит: обычная поддерживающая доза составляет от 0,25 до 1,0 мг / кг / сутки.

Нефротический синдром: начальная доза обычно составляет 1,5 мг / кг / день с последующим титрованием в зависимости от клинической необходимости.

Бронхиальная астма. Исходя из соотношения потенции, начальная доза должна составлять от 0,25 до 1,0 мг / кг дефлазакорта в разные дни.

Противопоказания

- Системная инфекция, если не применяется специфическая противoinфекционная терапия.
- Повышенная чувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ.
- Пациенты, получающие живую вирусную иммунизацию.

Побочные эффекты

Наиболее распространенным побочным эффектом является увеличение массы тела, однако проявляется это в меньшей степени, чем у пациентов, принимающих Преднизон. Есть риск развития катаракты и эффекта подавления роста, однако последнее считается положительным для пациентов с DM. При нерегулярной схеме вероятность проявления

побочных эффектов ниже, но все же необходим постоянный врачебный контроль.

Особые предупреждения и меры предосторожности при использовании

Пациенты с редкими наследственными проблемами непереносимости галактозы, дефицита лаппы Лаппа или мальабсорбции глюкозы-галактозы не должны принимать это лекарство.

Нежелательные эффекты могут быть сведены к минимуму путем использования самой низкой эффективной дозы в течение минимального периода и путем введения суточной потребности в виде одной утренней дозы или, когда это возможно, в виде одной утренней дозы в чередующиеся дни. Частое обследование пациента необходимо для правильного подбора дозы против активности болезни.

Подавление надпочечников

Атрофия коры надпочечников развивается при длительной терапии и может сохраняться годами после прекращения лечения. Поэтому отмена кортикостероидов после длительной терапии всегда должна быть постепенной, чтобы избежать острой надпочечниковой недостаточности, которая может привести к летальному исходу, и уменьшаться в течение недель или месяцев в зависимости от дозы и продолжительности лечения. Во время длительной терапии любое интеркуррентное заболевание, травма или хирургическое вмешательство потребуют временного увеличения дозировки; Если кортикостероиды были прекращены после длительной терапии, их может потребоваться временно повторно.

Пациенты должны иметь карты «Лечение стероидами», в которых даны четкие указания о мерах предосторожности, которые необходимо предпринять для минимизации риска, и в которых указаны данные о назначении лекарства, препарате, дозировке и продолжительности лечения.

Противовоспалительное / иммуносупрессивное действие и инфекция

Подавление воспалительного ответа и иммунной функции повышает восприимчивость к инфекциям и их тяжесть. Клиническая картина часто может быть атипичной, а серьезные инфекции, такие как септицемия и туберкулез, могут быть замаскированы и могут достигать поздней стадии, прежде чем их распознают.

Ветряная оспа вызывает особую озабоченность, поскольку это обычно незначительное заболевание может привести к летальному исходу у пациентов с ослабленным иммунитетом. Пациентам (или родителям детей) без определенной истории ветряной оспы следует рекомендовать избегать тесного личного контакта с ветряной оспой или опоясывающим герпесом, и, если они подвергаются воздействию, они должны обратиться за неотложной медицинской помощью. Пассивная иммунизация иммуноглобулином против ветряной оспы (VZIG) необходима облученным неиммунным пациентам, которые получают системные кортикостероиды или которые использовали их в течение предыдущих 3 месяцев; это должно быть дано в течение 10 дней после контакта с ветряной оспой. Если диагноз ветряной оспы подтвердится, болезнь требует специальной помощи и срочного лечения. Кортикостероиды не должны быть остановлены, и доза, возможно, должна быть

увеличена. Пациентам следует рекомендовать проявлять особую осторожность, чтобы избежать контакта с корью и немедленно обратиться к врачу, если происходит воздействие. Может потребоваться профилактика с помощью внутримышечного нормального иммуноглобулина.

Живые вакцины не следует назначать лицам с нарушенной реакцией. Антительный ответ на другие вакцины может быть уменьшен.

Нарушение зрения

Зрительные нарушения могут сообщаться при системном и местном применении кортикостероидов. Если у пациента появляются такие симптомы, как помутнение зрения или другие нарушения зрения, пациент должен быть направлен к офтальмологу для оценки возможных причин, которые могут включать катаракту, глаукому или редкие заболевания, такие как центральная серозная хориоретинопатия (CSCR), которые были сообщаются после использования системных и актуальных кортикостероидов.

Длительное использование глюкокортикоидов может привести к развитию задних субкапсулярных катаракт, глаукоме с возможным повреждением зрительных нервов и может способствовать развитию вторичных глазных инфекций, вызванных грибами или вирусами.

Использование при активном туберкулезе должно быть ограничено теми случаями молниеносного и диссеминированного туберкулеза, при которых дефлазакорт используется для лечения с соответствующей противотуберкулезной схемой. Если глюкокортикоиды показаны пациентам с латентным туберкулезом или туберкулиновой реактивностью, необходимо тщательное наблюдение, так как может возникнуть реактивация заболевания. При длительной терапии глюкокортикоидами эти пациенты должны получать химиопрофилактику.

Тендонит и разрыв сухожилия являются известным классовым эффектом глюкокортикоидов. Риск таких реакций может быть увеличен при одновременном назначении хинолонов.

Кризис феохромоцитомы, который может быть смертельным, сообщается после введения системных кортикостероидов. Кортикостероиды следует назначать пациентам с подозреваемой или выявленной феохромоцитомой после соответствующей оценки риска / пользы.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие формы взаимодействия

Следует соблюдать те же меры предосторожности, что и для других глюкокортикоидов. Дефлазакорт метаболизируется в печени. Рекомендуется увеличить поддерживающую дозу дефлазакорта, если совместно вводятся препараты, которые являются индукторами ферментов печени, например, рифампицин, рифабутин, карбамазепин, фенобарбитон, фенитоин, примидон и аминоглутетимид. Для лекарств, которые ингибируют ферменты печени, например, Кетоназол может быть возможно уменьшить поддерживающую дозу

дефлазакорта.

У пациентов, принимающих эстрогены, требования к кортикостероидам могут быть снижены.

Желательные эффекты гипогликемических агентов (включая инсулин), антигипертензивных средств и диуретиков антагонизируются кортикостероидами, а гипокалиемические эффекты ацетазоламида, петлевых диуретиков, тиазидных диуретиков, бета 2 -агонистов, ксантинов и карбеноксолона усиливаются.

Эффективность антикоагулянтов кумарина может быть повышена при одновременной терапии кортикостероидами, и для предотвращения спонтанного кровотечения необходим тщательный мониторинг времени МНО или протромбина.

У пациентов, получающих системные кортикостероиды, использование недеполяризующих миорелаксантов может привести к длительному расслаблению и острой миопатии. Факторы риска для этого включают длительное лечение кортикостероидами в высоких дозах и длительный паралич мышц. Это взаимодействие более вероятно после длительной вентиляции (например, в настройках МСЭ).

Почечный клиренс салицилатов увеличивается с помощью кортикостероидов, и отмена стероидов может привести к интоксикации салицилатом.

Поскольку глюкокортикоиды могут подавлять нормальные реакции организма на воздействие микроорганизмов, важно обеспечить эффективность любой противомикробной терапии, поэтому рекомендуется внимательно следить за пациентами. Одновременное использование глюкокортикоидов и оральных контрацептивов следует тщательно контролировать, так как уровень глюкокортикоидов в плазме может быть увеличен. Этот эффект может быть связан с изменением метаболизма или связывания с сывороточными белками. Антациды могут снижать биодоступность; оставить как минимум 2 часа между приемом дефлазакорта и антацидов.

Ожидается, что совместное лечение ингибиторами СYP3A, включая кобицистат-содержащие продукты, увеличит риск системных побочных эффектов. Эту комбинацию следует избегать, если только выгода не перевешивает повышенный риск системных побочных эффектов кортикостероидов, и в этом случае пациенты должны контролироваться на наличие побочных эффектов системных кортикостероидов.

Беременность и кормление грудью

Способность кортикостероидов проникать через плаценту варьируется между отдельными препаратами, однако Дефлазакорт действительно проникает через плаценту.

Нет никаких доказательств того, что кортикостероиды приводят к увеличению частоты врожденных патологий, таких как волчья пасть / губа у человека. Однако при назначении в течение длительных периодов или многократно во время беременности кортикостероиды могут увеличивать риск задержки внутриутробного развития. Теоретически, гипoadрeнализм может возникать у новорожденных после внутриутробного воздействия кортикостероидов, но обычно проходит самопроизвольно после рождения и редко имеет

клиническое значение. Как и все лекарства, кортикостероиды следует назначать только тогда, когда польза для матери и ребенка перевешивает риски. Однако, когда кортикостероиды необходимы, пациенты с нормальной беременностью могут лечиться так, как если бы они находились в невесомости.

Грудное вскармливание

Кортикостероиды выделяются с грудным молоком, хотя данные по дефлазакорту отсутствуют. Дозы дефлазакорта до 50 мг в день вряд ли будут вызывать системные эффекты у ребенка. Младенцы матерей, принимающих более высокие дозы, чем это, могут иметь степень подавления надпочечников, но польза от грудного вскармливания может перевесить любой теоретический риск.

Влияние на способность управлять автомобилем и использовать машины

Влияние кортикостероидов на способность управлять автомобилем или использовать оборудование систематически не оценивалось. Головокружение является возможным нежелательным эффектом после лечения дефлазакортом. При поражении пациенты не должны водить машину или работать с ней.

Условия хранения

При комнатной температуре, в недоступном месте для детей.

Категория отпуска

По рецепту.