

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

Кеналог 40 (Kenalog 40)

Склад:

діюча речовина: триамцинолон ацетонід;

1 мл суспензії для інекцій містить триамцинолону ацетоніду 40 мг;

допоміжні речовини: натрію карбоксиметилцелюлоза, натрію хлорид, спирт бензиловий, полісорбат 80, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Суспензія для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Кортикостероїди для системного застосування. Глюкокортикоїди.
Код АТС Н02А В08.

Клінічні характеристики.

Показання.

Триамцинолону ацетонід рекомендується для лікування:

- *алергічних станів*, включаючи сезонні та постійні алергічні риніти, астму, атопічний та контактний дерматит, реакції на лікарські препарати, сироваткову хворобу та гострий неінфекційний набряк гортані. При анафілактичних реакціях кортикостероїди не є корисними для лікування гострого явища, однак вони корисні для попередження настання останньої фази алергічної реакції;
- *ревматичних порушень*: кортикостероїди слід застосовувати для пацієнтів з важким ревматоїдним артритом, які чекають на корисні ефекти протиревматичних препаратів пролонгованої дії. Вони призначені для короткострокового лікування гострої подагри, гострого неспецифічного анкілозивного спондиліту, бурситу, епікондиліту, посттравматичного остеоартриту, псоріатичного артрити та синовіту при остеоартриті;
- *дерматологічних хвороб*: кортикостероїди рекомендовані при герпетиформах бульозного дерматиту, ексфолювативному дерматиті, важкій поліморфній еритемі, важкому псоріазі, важкому себорейному дерматиті, екземі, атопічному дерматиті, дискоїдному вовчаку, контактному дерматиті, гніздовій алопеції, пемфігусі та при різних гострих і хронічних дерматозах;
- *хвороб очей*: кортикостероїди рекомендовані при важких гострих та хронічних алергічних та запальних станах, включаючи алергічні кон'юнктивіти, алергічні крайні виразки рогівки, запалення переднього сегменту, хоріоретиніт, дифузний задній увеїт та хороїдит, оперізувальний герпес ока, ірит та іридоцикліт, кератит, неврит ока та симпатичну офтальмію;
- *ендокринних хвороб*: кортикостероїди рекомендовані для лікування первинної та вторинної адренкортикальної недостатності, уродженої гіперплазії, гіперкальціємії, що асоціюється зі злоякісною пухлиною, при хворобі Де Кервіна та хворобі Аддісона;
- *захворювань дихальних шляхів*: кортикостероїди застосовувати для лікування аспіраційного пневмоніту, бериліозу, синдрому Лефлера;
- *інших хвороб*: туберкульозний менінгіт, поліморфний склероз (кортикостероїди слід застосовувати для лікування гострого погіршення поліморфного склерозу; вони зменшують тривалість загострення хвороби, але вони не зупиняють прогресування захворювання).

Протипоказання.

Підвищена чутливість до активної речовини або до будь-якої допоміжної речовини.

Системні інфекції, крім випадків застосування специфічної антибактеріальної терапії.

Хронічний первинний геморагічний діатез, зумовлений недостатністю тромбоцитарної ланки

гемостазу, з підшкірними крововиливами та крововиливами зі слизових оболонок у природні порожнини (хвороба Вергольфа).

Внутрішньовенне, інтратекальне та епідуральне або інтраокулярне введення.

Кортикостероїд-індукована проксимальна міопатія в анамнезі.

Спосіб застосування та дози.

Слід зауважити, що вимоги щодо дозування триамцинолону є різними, і його дозу слід підбирати індивідуально залежності від хвороби та реакції пацієнта у відповідь. Найменші можливі дози кортикостероїдів слід застосовувати для контролю станів, що лікуються, і якщо можливе зниження дози, то воно повинно бути поступовим.

Дозування слід визначити відповідно до розмірів суглоба та ступеня тяжкості симптомів і реакції пацієнта у відповідь.

Терапевтичні результати слід спостерігати через 2-3 тижні. Однак навіть більше шести тижнів терапії може знадобитися для того, як почнуть спостерігатися певні позитивні результати.

Кеналог не можна вводити внутрішньовенно!

Внутрішньом'язове введення

Кеналог можна вводити внутрішньом'язово у дозах від 40 до 80 мг.

Рекомендована початкова доза для дорослих та дітей віком від 12 років становить 60 мг.

При необхідності одразу можна ввести дозу 100-120 мг.

Рекомендована початкова доза для дітей віком 6-12 років становить 0,03-0,2 мг/кг у м'яз з інтервалами 1-7 днів.

Внутрішньом'язове введення препарату Кеналог часто може замінювати початкову пероральну терапію.

Дозу слід вводити глибоко у сідничний м'яз.

Як правило, можна очікувати, що однократна парентеральна доза буде достатньою для 4-7-денного та до 3-4-тижневого контролю хвороби. Однократна доза 40-60 мг може викликати ремісію симптомів протягом сезону у пацієнтів з алергічним ринітом або астмою, спричиненою пилком.

Цей спосіб введення може надати корисні ефекти, наприклад, при астмі, але він може асоціюватися з побічними ефектами типу лихоманки, що є типовим для хронічного застосування кортикостероїдів.

Внутрішньосуглобове введення

На даний час триамцинолону ацетонід рідко використовується для симптоматичного лікування ревматоїдного артриту; його можна вводити внутрішньосуглобово для послаблення болю та запалення при ревматоїдному артриті, подагричному артриті (подагрі), псоріатичному артриті та остеоартриті. Пацієнтів слід попередити не перевантажувати суглоби після досягнення симптоматичного покращення. Внутрішньосуглобові ін'єкції, що повторюються протягом довшого періоду часу, можуть спричинити важку деструкцію суглобів та некроз кісток.

Звичайні внутрішньосуглобові дози триамцинолону ацетоніду у дорослих становлять 5-10 мг для менших суглобів та 20-60 мг для більших суглобів. Однак дози 6-10 мг на ін'єкцію вдало застосовували для менших суглобів та 40 мг на ін'єкцію для більших суглобів. При ін'єкціях у декілька суглобів робиться введення до 80 мг триамцинолону ацетоніду.

Рекомендована початкова доза для дітей віком 12-18 років становить 2,5-40 мг. Зважаючи на клінічну реакцію у відповідь, наступні дози можна збільшувати.

Триамцинолону ацетонід можна вводити місцево для полегшення бурситу та тендосиновіту. Слід бути обережним при ін'єкції у простір між сухожильною піхвою та сухожиллям, а не в саме сухожилля, через можливість його розриву. Доза залежить від розміру суглобу або синовіального простору та ступеня запалення.

Введення у місце ураження

Введення у ділянку ураження ін'єкцій триамцинолону ацетоніду, як правило, має діапазон від 5 до 10 мг, розподілені на кількості, що відповідають ураженій площі.

Рекомендована початкова доза для дітей віком 12-18 років становить 2,5-40 мг. Зважаючи на клінічну реакцію у відповідь, наступні дози можна збільшувати.

Як правило, великі площі вимагають кілька ін'єкцій та менших доз на місце ін'єкції. Зазвичай 2-3 ін'єкції через кожні 2-3 тижні адекватно відповідають цій вимозі. Введення в уражену ділянку підходить для лікування великих уражень, наприклад, псоріазу та гніздової алопеції.

Діти

Триамцинолон ацетонід у вигляді внутрішньом'язової ін'єкції не рекомендується для застосування дітям, віком до 6 років; а також у вигляді внутрішньосуглобової ін'єкції або введення у ділянку ураження для дітей віком до 12 років не рекомендується, якщо на те не має чітких показань. Під час лікування слід ретельно спостерігати за ростом та розвитком дитини (див. розділи «Протипоказання» та «Особливості застосування»).

Порушення функції нирок

Не потрібно жодного коригування дози.

Порушення функції печінки

При важкому порушенні функції печінки лікування слід розпочати з половини дози, оскільки у таких пацієнтів ефект кортикостероїдів може бути посилений.

Ін'єкції триамцинолону ацетоніду можна розводити або змішувати з певними місцевими анестетиками (див. детальну інформацію у розділі «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Побічні реакції.

Побічні ефекти, що можуть мати місце під час застосування препарату Кеналог, наведені відповідно до класифікації по органах та системах органів.

За дослідженнями:

підвищений рівень загального вмісту холестерину, підвищений рівень ліпопротеїнів низької щільності та тригліцеридів, зміни показників ЕКГ внаслідок дефіциту калію, гіпокаліємічний алкалоз, підвищене виведення кальцію.

З боку серцево-судинної системи:

погіршення серцевої функції, затримка рідини, серцева аритмія, гіпертензія, некротичний васкуліт/лімфангіт, тромбофлебіт, облітеруючий ендартеріт.

З боку кров'яної та лімфатичної систем:

гранулоцитоз, лімфопенія, моноцитопенія, лейкоцитоз.

З боку нервової системи:

головний біль, доброякісна внутрішньочерепна гіпертензія (псевдопухлина головного мозку), вертиго, втрата свідомості, неврит або парестезія.

З боку органів зору:

задня підкапсулярна катаракта, глаукома, ушкодження зорового нерва з набряком зорового нерва (пов'язано із псевдопухлиною головного мозку), підвищення інтраокулярного тиску, екзофтальм, стоншення рогівки або склери, загострення вірусних або грибкових хвороб ока.

Респіраторні, торакальні та медіастинальні порушення:

захриплість голосу, подразнення та сухість у горлі (після застосування пероральних кортикостероїдних інгаляторів), активізація туберкульозу легенів.

З боку шлунково-кишкового тракту:

сухість у ротовій порожнині, виразка дванадцятипалої кишки (включаючи шлунково-кишкову кровотечу), перфорація, диспепсія, панкреатит, здуття живота, виразковий езофагіт.

З боку шкіри та підшкірних тканин:

вугрові висипи, ураження, синці, екхімози, почервоніння обличчя, атрофія, надмірне оволосіння, погане загоєння ран, збільшення потовиділення, стрії, телеангієктазія та потоншення шкіри, дерматит, петехії та екхімози, зміни, характерні для системного червоного вовчака, відсутність

реакції на шкірні проби, зміни в місці введення.

З боку скелетно-м'язового апарату та сполучної тканини:

міопатія, остеонекроз, остеопороз (найбільша втрата кісткової тканини спостерігається у перші 6 місяців лікування), м'язова слабкість, втомлюваність, втрата м'язової маси, компресійні переломи хребта, асептичний некроз стегнової і плечової голівок, патологічні переломи трубчатих кісток та спонтанні переломи, розриви сухожиль.

З боку ендокринних залоз:

затримка натрію в організмі, що призводить до гіпокаліємії, пригнічення функції надниркових залоз, синдром Кушинга, уповільнення росту дітей, погіршення стану у пацієнтів, хворих на цукровий діабет, гіпоглікемія, порушення менструального циклу та аменорея, підвищення маси тіла, від'ємний азотистий та кальцієвий баланси, підвищений апетит.

З боку метаболізму та травлення:

порфірія.

Інфекції та інвазії:

ротоглотковий кандидоз, септичний некроз (особливо у пацієнтів з системним червоним вовчаком або ревматоїдним артритом).

Загальні порушення та порушення умов введення:

безсудинний некроз, локальне знебарвлення шкіри, атрофія шкіри, ураження сухожилля при місцевому застосуванні.

З боку імунної системи:

анафілактоїдні реакції, анафілаксія, включаючи анафілактичні реакції та анафілактичний шок, ангіоневротичний набряк (набряк Квінке), висипи, свербіж та кропив'янка, особливо при наявності у хворого медикаментозної алергії в анамнезі.

З боку репродуктивної функції та молочних залоз:

порушення менструального циклу та вазомоторні симптоми.

Психічні порушення:

ейфорія, психічна залежність, депресія, безсоння, судоми, ускладнення наявних психічних розладів та епілепсії, психіатричні реакції (включаючи афективні розлади, такі як дратівливість, ейфоричний, депресивний та лабільний настрій і суїцидальні думки), психічні реакції (включаючи манію, марення, галюцинації, ускладнення шизофренії), порушення поведінки, дратівливість, страх, порушення сну, когнітивна дисфункція, включаючи амнезію та сплутаність свідомості.

Синдром відміни (абстинентний синдром):

при відміні можуть спостерігатися гарячка, міалгія, артралгія, риніт, кон'юнктивіт, больові ділянки шкіри зі свербіжем, втрата маси тіла. Дуже різке зниження дози при тривалому лікуванні може призвести до гострої недостатності надниркових залоз, гіпотензії та летального наслідку.

Внутрішньосуглобове введення:

всмоктування триамцинолону після ін'єкції внутрішньосуглобовим способом введення є належним. Однак під час застосування пацієнт повинен перебувати під ретельним наглядом лікаря. Побічні реакції після внутрішньосуглобового введення виникають рідко. У деяких випадках спостерігалася транзиторна гіперемія та запаморочення. Можуть спостерігатися місцеві симптоми, такі як печіння у місці ін'єкції, транзиторний біль, почервоніння, стерильний абсцес, гіпер- або гіпопигментація, артропатія Шарко та періодичне підвищення дискомфорту у суглобах. Локальна жирова атрофія може спостерігатися, якщо ін'єкція не була зроблена у суглобову щілину, але вона є тимчасовою та зникає через проміжок часу від кількох тижнів до місяця.

Внутрішньом'язове введення:

при внутрішньом'язовому введенні відзначався різкий біль. Також спостерігалися стерильний абсцес, шкірна та підшкірна атрофія, гіперпигментація, гіпопигментація та артропатія Шарко. При появі важких побічних ефектів лікування слід припинити.

Передозування.

Існують поодинокі повідомлення про летальний наслідок через гостре передозування.

Як правило, лише після кількох тижнів застосування дуже високих доз може виникати більшість небажаних ефектів, насамперед синдром Кушинга, а також неспокій, хвилювання, депресії, шлунково-кишкова коліка або кровотеча, екхімози, артеріальна гіпертензія, гіперглікемія.

Специфічного антидоту немає. Застосовувати підтримуюче та симптоматичне лікування.

Гемодіаліз не є ефективним методом прискороного виведення триамцинолону з організму.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вірогідність кортикостероїдів проникати крізь плацентарний бар'єр різниться між різними препаратами та їх формами.

Застосування кортикостероїдів вагітним тваринам може спричинити у них аномалії розвитку плода включаючи вовчу пащу; затримку внутрішньоутробного розвитку та впливу на ріст та розвиток мозку. Тривале лікування або повторне призначення у період вагітності кортикостероїдів може підвищувати ризик затримки внутрішньоутробного розвитку. Теоретично можливе виникнення гіпоадrenalізму при впливі кортикостероїдів на плід у пренатальному або неонатальному періоді. Як і інші препарати, кортикостероїди слід призначати, тільки якщо користь для матері та дитини перевищує імовірний ризик.

Діти.

Триамцинолону ацетонід у вигляді внутрішньом'язової ін'єкції не рекомендується для дітей віком до 6 років. У вигляді внутрішньо суглобової ін'єкції або введення у ділянку ураження для дітей віком до 12 років не рекомендується, якщо на те немає чітких показань. Під час лікування слід ретельно спостерігати за ростом та розвитком дитини.

Особливості застосування.

Кеналог не можна вводити внутрішньовенно.

Оскільки ускладнення лікування глюкокортикоїдами (також триамцинолоном) залежать від розміру дози та тривалості лікування, то у кожному окремому випадку слід провести оцінку ризик/користь щодо дози та тривалості лікування, та визначити щоденна чи короткочасна терапія має бути застосована.

Відповідні та всебічні дослідження, що демонстрували б безпеку Кеналогу при ін'єкціях у носову раковину, субкон'юнктивальних, субтенозових, ретробульбарних та інтраокулярних (інтравітреальних) ін'єкціях – не проводились. Були повідомлення про ендодальміт, запалення ока, підвищення внутрішньоочного тиску та зорові розлади (у тому числі втрата зору) при застосуванні у вигляді інтраокулярних (інтравітреальних) ін'єкцій. Були повідомлення про поодинокі випадки сліпоти після ін'єкцій суспензії кортикостероїдів у носову раковину та при внутрішньоосередковій ін'єкції у голову пацієнта.

Були отримані повідомлення про поодинокі випадки серйозних анафілактичних реакцій та анафілактичного шоку, включаючи летальний наслідок, незалежно від способу застосування.

Протягом тривалої терапії введення вільних протеїнів є важливим для перешкоджання схильності до поступової втрати маси тіла, яка іноді асоціюється з негативним азотним балансом та атрофією скелетних м'язів.

Пацієнти або особи, що доглядають за ними, повинні бути попереджені про можливість виникнення тяжких психічних розладів у наслідок прийому стероїдів для системного застосування. Типові симптоми з'являються через кілька днів або тижнів з початку лікування. Ризик може підвищуватися разом з підвищенням дози або системної дії, незважаючи на те, що рівень дозування не дозволяє прогнозувати початок, тип, тяжкість або тривалість реакції. Більшість реакцій зникають після зниження дози або припинення прийому препарату, маючи на увазі, що все ж таки може бути необхідним специфічне лікування. Пацієнти або особи, що доглядають за ними, повинні звертатися за медичною допомогою, якщо проявляються психічні симптоми які їх турбують, особливо якщо виникають депресивні настрої або суїцидальні думки. Пацієнти або особи, що доглядають за ними, повинні бути готові до можливих психічних розладів, які можуть виникати одразу після або протягом зниження дози та/або припинення прийому системних стероїдів, при тому, що повідомлення про такі побічні реакції були вкрай рідкими.

Особливої уваги потребує рішення про застосування системних стероїдів у пацієнтів із тяжкими афективними порушеннями у них самих або у їх найближчих родичів. Це включає депресивні або манакально-депресивні захворювання або попередні стероїдні психози.

Препарат слід застосовувати з особливою обережністю: при свіжому кишковому анастомозі, дивертикуліті, тромбофлебіті, тяжкому афективному розладі в анамнезі (особливо при попередньому стероїдному психозі), екзантематозних захворюваннях, хронічному нефриті або нирковій недостатності, метастатичній карциномі, остеопорозі (постклімактеричні жінки є частково групою ризику); пацієнтам з пептичною виразкою у стадії загострення (або пептичною виразкою у анамнезі). При міастенії gravis. При латентній або неактивній формі туберкульозу; наявності місцевої або системної вірусної інфекції, системної грибової інфекції або активній інфекції не контрольованій антибіотиками. При гострих психозах, гострому гломерулонефриті. Артеріальній гіпертензії; застійній серцевій недостатності; глаукомі (або глаукомі у сімейному

анамнезі), попередній стероїдній міопатії або епілепсії. Печінковій недостатності. Ефекти кортикостероїдів можуть бути більш вираженими у пацієнтів з гіпотиреозом або цирозом та менш вираженими у пацієнтів з гіпертиреозом. Пацієнтам з гіпопротромбінемією аспірин разом з кортикостероїдами треба застосовувати з обережністю. Усі кортикостероїди підвищують виведення кальцію. Пацієнти на кортикостероїдній терапії, які зазнали сильного стресу, повинні приймати швидкодіючу кортикостероїдну підтримку, а дозу слід збільшити до, під час та після стресової ситуації. Пригнічення надниркових залоз може тривати кілька місяців після припинення лікування; тому протягом періодів стресу може знадобитися замісна терапія. Кортикостероїди можуть маскувати ознаки інфекції та зменшити резистентність до інфекції. Терапія кортикостероїдами може підвищити ризик туберкульозу у пацієнтів з латентним туберкульозом чи з позитивною пробєю Манту. Застосування кортикостероїдів при активному туберкульозі слід обмежити до надгострої чи дисемінованої хвороби, при якій кортикостероїд застосовується разом з відповідним протитуберкульозним режимом лікування. Кортикостероїди можуть збільшити ризик появи серйозної чи летальної інфекції у осіб, які мають вірусну інфекцію, таку як вітряна віспа чи кір. Пацієнтам, які приймають кортикостероїдну терапію, не слід проходити вакцинацію. Кортикостероїди слід з обережністю застосовувати пацієнтам з простим герпесом очей через можливість перфорації рогівки. Кортикостероїди можуть спричинити психічні розлади з діапазоном від ейфорії, безсоння, перепадів настрою, зміни особистості до важкої депресії та вираженого прояву психозу. Кортикостероїди також можуть підсилити існуючу емоційну нестабільність чи тенденції до психозу. Кортикостероїди слід з обережністю приймати пацієнтам з неспецифічним виразковим колітом, дивертикулітом, свіжим анастомозом, активними або латентними пептичними виразками, нирковою недостатністю, гіпертонією, остеопорозом та міастенією *gravis*. Підвищується ризик появи вітряної віспи у пацієнтів на кортикостероїдній терапії, які раніше не хворіли на це вірусне захворювання. Таким пацієнтам слід уникати контакту з інфекційними пацієнтами. Якщо вони мали контакт з ними, то рекомендується проведення пасивної імунізації. Слід ретельно спостерігати за ростом та розвитком дитини, яка знаходиться на довготривалій кортикостероїдній терапії. Кортикостероїди можуть мати сильний вплив на пацієнтів з цирозом печінки чи гіпотиреозом. Внутрішньосуглобове призначення кортикостероїдів може спричинити системні побічні ефекти додатково до місцевих побічних ефектів. Слід уникати внутрішньосуглобового введення кортикостероїдів у раніше запалені або нестабільні суглоби. При застосуванні внутрішньосуглобової ін'єкції слід перевірити синовіальну рідину на предмет виключення септичного процесу. Значне підвищення болювого відчуття, що супроводжується локальною припухлістю, подальшим обмеженням моторики суглоба, гарячкою та загальним нездужанням, вказують на наявність септичного артрити. При виникненні цього ускладнення та підтвердженні сепсису слід розпочати відповідну терапію антибіотиками. Спричинена прийомом препарату вторинна адреналокортикальна недостатність може бути мінімізована завдяки поступовому зниженню дози. Цей тип недостатності може тривати місяцями після припинення терапії. Такі параметри лабораторних аналізів можуть збільшитися під час лікування кортикостероїдами: кількість лейкоцитів (більш ніж 20000/мм³) без ознак запалення чи новоутворення, глюкоза в крові, холестерин, тригліцериди та ліпопротеїди низької щільності. Триамцинолон може збільшити рівні глюкози в крові, що може призвести до появи глюкозурії чи цукрового діабету. Зниження у сечі рівнів 17-кетостероїду та 17-гідроксистероїду може виникнути вторинно після пригнічення надниркових залоз під час терапії триамцинолоном.

Особлива інформація про деякі допоміжні речовини препарату Кеналог

1 мл препарату Кеналог (1 ампула) містить 9,9 мг спирту бензилового. Його не слід вводити передчасно народженим або новонародженим немовлятам. Він може спричинити токсичні та анафілактоїдні реакції у немовлят та дітей віком до 3 років.

Цей лікарський препарат містить менше 1 ммоль (23 мг) натрію на дозу, що не має клінічного

значення при застосуванні.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Лікування препаратом Кеналог 40 незначно або помірно впливає на здатність пацієнта керувати автомобілем та іншими механічними засобами.

У перший або другий тиждень лікування можуть виникати такі небажані реакції з боку центральної нервової системи: седативний ефект, депресія, головний біль, безсоння, зміни особистості, манія, галюцинації та психози. При виникненні таких симптомів слід утриматись від керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами, доки вони не зникнуть.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При одночасному застосуванні разом з амфотерицином Б та калій-незберігаючими засобами пацієнт повинен бути під наглядом стосовно можливого розвитку гіпокаліємії.

Антихолінестеразні засоби чинять антагоністичний вплив по відношенню до кортикостероїдів.

Кортикостероїди проявляють антагонізм по відношенню до антигіпертензивних засобів та діуретиків. Гіпокаліємічний ефект діуретиків, у тому числі ацетазоламиду, є більш вираженим.

Протитуберкульозні засоби: концентрація ізоніазиду у сироватці крові може підвищуватися.

Циклоспорин: проводять ретельне відстеження ознак підвищення токсичності циклоспорину при одночасному його застосуванні з кортикостероїдами.

Естрогени, включаючи оральні контрацептиви: період напіввиведення кортикостероїдів та концентрація можуть підвищуватися, а кліренс – знижуватися.

Індуктори печінкових ферментів (у тому числі барбітурати, фенітоїн, карбамазепін, рифампіцин, примідон, аміноглутетимід): можуть підвищувати метаболічний кліренс Кеналогу. пацієнт повинен перебувати під ретельним наглядом щодо можливого зниження ефектів стероїдів з відповідним коригуванням дозування.

Гормон росту людини: ефект прискорення росту може гальмуватися.

Кетоконазол: може бути зниження кліренсу кортикостероїдів, та як наслідок посилення їх ефектів.

Тиреоїдні препарати: метаболічний кліренс адренкортикоїдів знижується у пацієнтів, хворих на гіпотиреоз та підвищується у хворих на гіпертиреоз. Зміна тиреоїдного статусу пацієнта може потребувати коригування дозувань адренкортикоїдів.

Комбінація кортикостероїду з нестероїдними протизапальними засобами підвищує ризик появи пептичних виразок та шлунково-кишкової кровотечі.

Лікарські засоби, що містять ацетилсаліцилову кислоту, слід з обережністю приймати разом з кортикостероїдами при гіпотромбінемії.

Концентрації саліцилатів у сироватці крові у стабільному стані зменшуються при внутрішньосуглобовій ін'єкції кортикостероїдів, включаючи триамцинолон.

Повідомлялося, що супутній прийом кортикостероїдів та міорелаксантів протистоїть нервово-м'язовій блокаді.

Клінічні дослідження показали, що при супутньому прийомі кортикостероїди посилюють або послаблюють дію пероральних антикоагулянтів.

Було продемонстровано, що фенітоїн збільшує метаболізм кортикостероїдів у печінці та знижує ефективність триамцинолону.

Супутня протигрипозна вакцинація та імунодепресивна терапія (кортикостероїдами) асоціювалася з погіршенням реакції імунітету на вакцину.

Кортикостероїдна терапія має тенденцію до збільшення глюкози в крові у пацієнтів з цукровим діабетом, тому можуть бути необхідними більші дози інсуліну.

Супутній прийом фенобарбіталу та кортикостероїду може призвести до зниження рівнів у плазмі крові та терапевтичних ефектів кортикостероїду.

Ризик появи гіпокаліємії може підвищитись, якщо триамцинолон вводити супутньо з симпатоміметиками та теофіліном, який знижує рівні калію у плазмі, та з діуретиками, що виводять калій; гіпокаліємія також може підсилити ефекти серцевих глікозидів.

Кортикостероїдні препарати для введення в уражену ділянку можна розводити водою для ін'єкцій або 0,9 % розчином натрію хлориду для ін'єкцій.

Через 7 днів невикористану розведену суспензію слід утилізувати.

Перед введенням в уражену ділянку кортикостероїди можна змішувати з місцевими анестетиками. Приготовані препарати слід застосувати негайно; невикористані порції слід утилізувати. Придатні анестетики: 1 % або 2 % розчин лідокаїну гідрохлориду або 1 % розчин прокаїну гідрохлориду.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Триамцинолону ацетонід – похідний триамцинолону, призначений для широкого застосування. Хоча триамцинолон сам по собі виявляється майже в два рази потужнішим, ніж преднізон при вивченні моделей запалення у тварин, триамцинолону ацетонід майже у 8 разів ефективніший, ніж преднізон.

Основні ефекти триамцинолону у людини пов'язані із глюкокортикоїдною дією та пригніченням запальної реакції. Активність глюкокортикоїдів призводить до посилення глюконеогенезу та зменшення утилізації глюкози у тканинах. Катаболізм протеїну прискорюється, а синтез із харчового білка зменшується, хоча загальний вплив на азотистий баланс залежить від інших факторів, включаючи дієту, дозу та тривалість лікування. При застосуванні доз 12-24 мг на добу може спричинити негативний азотистий баланс. Жири метаболізуються, і жирові відкладення на плечах, обличчі та животі збільшуються. Триамцинолон має незначну мінералокортикоїдну активність. Під час лікування кортикостероїдами кількість еритроцитів та нейтрофілів збільшується; кількість еозинофілів та базофілів зменшується. Також зменшується маса лімфоїдної тканини.

Кортикостероїди запобігають або пригнічують перші ознаки запального процесу, тобто почервоніння, болючість, локальне збільшення температури тіла, пітливість, а також пізніші ускладнення, включаючи проліферацію фібробластів або відкладення колагену.

Фармакокінетика.

Абсорбція та розподіл

При застосуванні 120 мг триамцинолону ацетоніду внутрішньом'язово максимальна концентрація препарату у плазмі крові становить 44-54 мкг/100 мл через 8-10 годин; цей рівень знижується до 8,9 мкг/100 мл через 72 годин після введення.

Через три дні після внутрішньосуглобової ін'єкції всмоктується від 58 % до 67 % триамцинолону ацетоніду. Порівняння площі під кривою залежності «концентрація у плазмі – час» (AUC) при внутрішньосуглобовій та внутрішньом'язовій ін'єкціях вказує на повне всмоктування препарату при обох способах введення.

Метаболізм

Як і преднізон, триамцинолон, імовірно, метаболізується у печінці. Менш ніж 15 % препарату виводиться у незмінному вигляді з сечею. Після абсорбції через шкіру кортикостероїди для місцевого застосування поведуть себе так само, як і системні кортикостероїди, а саме – метаболізм проходить головним чином у печінці.

Були виявлені три метаболіти триамцинолону, і картина метаболізму для усіх трьох способів застосування препарату аналогічна. Метаболіти триамцинолону включають 6-бета-гідрокситриамцинолону ацетонід, 21-карбоксі-6-бета-гідрокситриамцинолону ацетонід та 21-карбокситриамцинолону ацетонід.

Виведення

Під час фармакокінетичних клінічних досліджень не виявлена достатня системна резорбція місцевих кортикостероїдів, внаслідок якої значна кількість препарату була б присутня у грудному молоці. Кортикостероїди, що застосовуються систематично, проникають у грудне молоко у кількості, яка навряд чи матиме негативний вплив на дитину.

Після 40 мг внутрішньом'язової дози триамцинолону ацетоніду виведена радіоактивність у сечі досягла 12,5 % введеної дози. Після 32 мг пероральної дози триамцинолону препарат був присутній у сечі упродовж чотирьох днів в одного пацієнта, та упродовж п'яти днів – в іншого. Після одноразової внутрішньом'язової дози 80 мг триамцинолону ацетоніду препарат був присутній у сечі упродовж 7 днів у двох пацієнтів та 11 днів – у одного пацієнта.

Місцеві кортикостероїди та їхні неактивні метаболіти проникають у жовч у невеликій кількості після системної резорбції.

Період напіввиведення перорального триамцинолону з плазми крові становить від 2 до більш ніж 5 годин.

Згідно з результатами, фармакокінетика залежить від дози. Група прийому 5мг/кг мала середній період напіввиведення 85 хвилин; група прийому 10 мг/кг – 88 хвилин. Загальний кліренс організму становив 61,6 л/год для групи прийому 5 мг/кг та 48,2 л/год для групи прийому 10 мг/кг; різниця була статистично значимою. Фармакокінетика триамцинолону та його ефіру фосфату

досліджувалась після внутрішньовенної ін'єкції 5 мг/кг та 10 мг/кг. Одна група приймала 80 мг триамцинолону ацетоніду.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: суспензія білого кольору, практично без видимих механічних включень та грудочок, з легким запахом спирту бензилового.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі від 8 до 25 °С. Не заморожувати. Зберігати у вертикальному положенні. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 1 мл суспензії для ін'єкцій в ампулі; по 5 ампул у блістері в картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

КРКА, д.д., Ново место, Словенія/
KRKA, d.d., Novo mesto, Slovenia.

Місцезнаходження.

Шмар'ешка cesta 6, 8501 Ново место, Словенія/
Smarjeska cesta 6, 8501 Novo mesto, Slovenia.