Инструкция по применению
Сертикан Таблетки 0,25 мг 60 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Швейцария
Производитель: Новартис Фарма
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Эверолимус
Количество в упаковке: 60
Дозировка действующего вещества: 0,25 мг
Срок годности: 36.0



Описание

Таблетки диспергируемые от белого до желтоватого цвета, круглые, плоские, со скошенными краями; допускается мраморность; на одной стороне нанесена гравировка "JO", на другой - "NVR".

Действующее вещество

Эверолимус

Состав

Состав на одну таблетку Активные вещества: Аскорбиновая кислота в пересчете на 100 % вещество 0,05 г Рутин (Рутозид) в пересчете на 100 % вещество 0,05 г Вспомогательные вещества: Сахар-рафинад (сахароза) 0,16643 г Целлюлоза микрокристаллическая 0,0390 г Кросповидон 0,0165 г Тальк 0,0049 г Кальция стеарат 0,00317 г

Форма выпуска

Таблетки

Показания

профилактика отторжения трансплантата почки и сердца у взрослых реципиентов с низким и средним иммунологическим риском, получающих базовую иммуносупрессивную терапию циклоспорином в форме микроэмульсии и глюкокортикостероидами.

Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь. Рекомендуемая начальная доза препарата для взрослых пациентов с почечными и сердечными трансплантатами составляет по 0.75 мг 2 раза /сут. Препарат следует начать применять как можно скорее после трансплантации. Суточную дозу Сертикана всегда разделяют на 2 приема; препарат принимают или всегда вместе с пищей, или всегда без нее. Сертикан принимают в одно и то же время с циклоспорином в форме микроэмульсии. Предпочтительно проводить коррекцию режима дозирования Сертикана, основываясь на значениях С0 эверолимуса, определяемых более чем через 4-5 дней после предыдущего изменения дозы. Если пациент не переносит снижение дозы циклоспорина, то следует пересмотреть последующее использование Сертикана. Рекомендации по режиму дозирования циклоспорина при комбинированной терапии с сертиканом у пациентов после трансплантации сердца. Для пациентов после трансплантации сердца в поддерживающей фазе следует снижать дозу циклоспорина с целью улучшения функции почек. При прогрессировании нарушения функции почек или в том случае, если расчетное значение клиренса креатинина составляет <60 мл/мин, необходима коррекция режима терапии на основании данных ,полученных в ходе клинических исследований. Таблетки следует принимать целиком, не дробить перед использованием; запивать стаканом воды. Пациентам, которые не могут глотать таблетки, назначают Сертикан в форме таблеток диспергируемых, из которых готовят дисперсию (мелкие твердые частицы в воде). При приеме диспергируемых таблеток можно использовать пероральный шприц. Для этого следует поместить диспергируемые таблетки в шприц. Максимальное количество Сертикана, из которого можно приготовить дисперсию с объемом воды 10 мл (шприц 10 мл), составляет 1.25 мг. Далее следует добавить воды до отметки 5 мл, подождать 90 сек, при этом слегка встряхивая шприц. После образования дисперсии вводят содержимое шприца прямо в рот. Затем следует ополоснутье шприц, набрав 5 мл воды, и ввести одержимое в рот. После этого следует выпить 10-100 мл воды. При приеме диспергируемых таблеток можно использовать пластмассовую чашку. Для этого следует поместить диспергируемые таблетки Сертикана в пластмассовую чашку, в которой находится приблизительно 25 мл воды. Максимальное количество Сертикана, из которого можно приготовить дисперсию с объемом воды 25 мл, составляет 1.5 мг. Далее следует оставить чашку примерно на 2 мин, чтобы образовалась дисперсия; перед употреблением взболтать содержимое чашки, чтобы позволить таблеткам раствориться. Затем следует сразу ополоснуть чашку, добавив 25 мл воды, и полностью выпить содержимое.

Противопоказания

повышенная чувствительность к эверолимусу, сиролимусу или другим компонентам препарата.

Передозировка

В экспериментальных исследованиях было показано, что эверолимус обладает низким потенциалом острой токсичности. После приема внутрь препарата в дозе 2000 мг/кг однократно не наблюдалось летальных исходов или тяжелой токсичности у мышей и крыс (контроль по диапазону значений). Сообщения о случаях передозировки у человека очень ограничены. Имеется единственный факт случайного проглатывания 1.5 мг эверолимуса ребенком в возрасте 2 лет, при этом нежелательных явлений не наблюдалось. При однократном приеме внутрь в дозах до 25 мг у пациентов после трансплантации отмечалась приемлемая переносимость препарата. Во всех случаях передозировки следует начать проведение общих поддерживающих мероприятий.

Взаимодействие с другими препаратами

Эверолимус метаболизируется, главным образом, в печени и в некоторой степени в кишечной стенке при участии изофермента CYP3A4. Также эверолимус является субстратом для белка-переносчика Р-гликопротеина. Следовательно, на абсорбцию и последующую элиминацию системно абсорбировавшегося эверолимуса могут оказывать влияние препараты, взаимодействующие с CYP3A4 и/или Р-гликопротеином. Сочетанное применение Сертикана с сильными ингибиторами или индукторами CYP3A4 не рекомендуется. Ингибиторы Р-гликопротеина могут снизить высвобождение эверолимуса из кишечных клеток и повысить концентрацию эверолимуса в сыворотке. In vitro эверолимус являлся конкурентным ингибитором CYP3A4 и CYP2D6, потенциально увеличивающим концентрации в плазме препаратов, выводящихся при участии этих ферментов. Поэтому следует соблюдать осторожность при одновременном применении Сертикана с субстратами CYP3A4 и CYP2D6, имеющими узкий терапевтический индекс. Все исследования взаимодействия in vivo проводились без одновременного применения циклоспорина. Биодоступность эверолимуса значительно увеличивалась при одновременном применении циклоспорина (ингибитор CYP3A4/Р-гликопротеина). В исследовании однократной дозы у здоровых добровольцев циклоспорин в виде микроэмульсии (Сандиммун Неорал) увеличивал AUC эверолимуса на 168% (от 46% до 365%) и Cmax - на 82% (от 25% до 158%) по сравнению с применением только одного эверолимуса. При изменении дозы циклоспорина может потребоваться коррекция режима дозирования эверолимуса. Клиническая значимость влияния Сертикана на фармакокинетику

циклоспорина минимальна у пациентов с пересадкой почки и сердца, получающих циклоспорин в форме микроэмульсии. У здоровых добровольцев, получавших предшествующую терапию многократными дозами рифампицина (индуктор CYP3A4), при последующем применении Сертикана в однократной дозе наблюдалось почти 3-кратное повышение клиренса эверолимуса и уменьшение Cmax на 58% и AUC - на 63%. Комбинированное применение Сертикана с рифампицином не рекомендуется. Прием однократной дозы Сертикана с аторвастатином (субстрат CYP3A4) или правастатином (субстрат Р-гликопротеина) здоровыми добровольцами клинически значимо не влиял на фармакокинетику аторвастатина, правастатина и эверолимуса, так же как и на общую биореактивность ГМГ-КоА-редуктазы в плазме. Однако эти результаты не могут быть экстраполированы на другие ингибиторы ГМГ-КоА-редуктазы. Пациентов, получающих ингибиторы ГМГ-Ко А-редуктазы, следует мониторировать на предмет развития рабдомиолиза и других нежелательных явлений в соответствии с инструкциями по применению вышеуказанных средств. Умеренные ингибиторы CYP3A4 и Р-гликопротеина могут повышать концентрацию эверолимуса в крови (например, противогрибковые средства: флуконазол; антибиотики группы макролидов /эритромицин/; блокаторы кальциевых каналов /верапамил, никардипин, дилтиазем/; ингибиторы протеазы /нелфинавир, индинавир, ампренавир/). Индукторы CYP3A4 могут повышать метаболизм эверолимуса и уменьшать концентрации эверолимуса в крови (например, зверобой продырявленный, противосудорожные средства /карбамазепин, фенобарбитал, фенитоин/; препараты для лечения ВИЧ /эфавиренз, невирапин/).

Особые указания

Сертикан не следует применять у пациентов с редкими наследственными нарушениями, связанными с непереносимостью галактозы, тяжелой лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией. Эверолимус не изучался у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью. Рекомендуется тщательно мониторировать концентрацию эверолимуса в плазме крови у пациентов с нарушениями функции печени. Всем пациентам рекомендуется регулярный контроль функции почек. При повышении концентрации креатинина в сыворотке следует рассмотреть вопрос о коррекции режима иммуносупрессивной терапии, в частности об уменьшении дозы циклоспорина. Следует соблюдать осторожность при одновременном применении других лекарственных средств, оказывающих отрицательное влияние на функцию почек. Лечение Сертиканом должны начинать и проводить только врачи, имеющие опыт проведения иммуносупрессивной терапии после трансплантации органов, и у которых имеется возможность мониторинга концентрации эверолимуса в цельной крови. В клинических исследованиях Сертикан

применяли одновременно с циклоспорином в форме микроэмульсии, базиликсимабом и глюкокортикостероидами. Применение Сертикана в комбинации с другими иммуносупрессивными средствами недостаточно изучено. Применение Сертикана у пациентов с высоким иммунологическим риском недостаточно изучено. Не рекомендуется совместное применение Сертикана с сильными ингибиторами CYP3A4 (например, кетоконазол, итраконазол, вориконазол, кларитромицин, телитромицин, ритонавир) и индукторами (например, рифампицин, рифабутин), за исключением тех случаев, когда ожидаемая польза такой терапии превышает потенциальный риск. Рекомендуется контролировать концентрации эверолимуса в цельной крови при одновременном применении с индукторами или ингибиторами CYP3A4 и после их отмены. У пациентов, получающих терапию иммуносупрессивными средствами, включая Сертикан, повышается риск развития лимфом и других злокачественных заболеваний, особенно кожи. Абсолютный риск связан скорее с длительностью и интенсивностью иммуносупрессии, чем с использованием конкретного препарата. Следует регулярно контролировать состояние пациентов для выявления кожных новообразований, рекомендовать сведение к минимуму воздействие ультрафиолетового излучения, солнечного света и использовать соответствующие солнцезащитные средства. Гипериммуносупрессия, в т.ч. и при использовании схем терапии на основе Сертикана предрасполагает к развитию инфекций, особенно вызываемых оппортунистическими патогенами. Имеются сообщения о развитии фатальных инфекций и сепсиса при применении Сертикана. В клинических исследованиях Сертикана проводили профилактику развития пневмонии, вызванной Pneumocystis carinii, на протяжении 12 мес после трансплантации. Профилактику развития цитомегаловирусной инфекции рекомендовали в течение 3 мес после трансплантации, особенно у пациентов с повышенным риском развития этой инфекции. Совместное применение Сертикана с циклоспорином в форме микроэмульсии у пациентов после трансплантации связывали с повышением содержания в сыворотке холестирина и триглицеридов, что может потребовать соответствующего лечения. Пациентов, получающих Сертикан, следует мониторировать с целью выявления гиперлипидемии и при необходимости проводить лечение гиполипидемическими средствами и назначать соответствующую корригирующую диету. Необходимо оценить соотношение риск/польза для пациентов, у которых выявлена гиперлипидемия до начала терапии иммуносупрессивными средствами, включая Сертикан. Также следует оценить соотношение риск/польза продолжения терапии Сертиканом у пациентов с тяжелой рефрактерной гиперлипидемией. Пациентов, получающих ингибиторы ГМГ-КоА-редуктазы и/или фибраты, следует наблюдать на предмет развития нежелательных явлений, вызванных вышеуказанными лекарственными средствами. Использование в педиатрии. Данных по применению Сертикана у детей и подростков недостаточно для

того, чтобы рекомендовать использование препарата у данной категории пациентов. Однако имеются ограниченные данные о применении Сертикана в педиатрии при трансплантации почки. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами. Исследования влияния Сертикана на способность к вождению автотранспорта и вождению механизмами не проводились.

Условия хранения

В сухом месте