

ЗАФИРЛУКАСТ

1. Зафирлукаст.
2. Аколлат.
3. Средства, влияющие на органы дыхания (Противоастматические средства).
4. Оказывает противовоспалительное, противоастматическое (предупреждающее бронхоспазм) действие.
5. Уровень убедительности доказательств В. Имеющиеся клинические исследования показали, что дополнительное комплексное лечение зафирлукаста позволяет снизить дозы ингаляционных глюкокортикостероидов у больных умеренной и тяжелой бронхиальной астмой, а также улучшает контроль бронхиальной астмы у больных, плохо отвечающих на терапию низкими или высокими дозами ингаляционных глюкокортикостероидов. Однако в качестве дополнительного компонента терапии эти средства менее эффективны, чем ингаляционные β_2 -агонисты длительного действия.

6. Цена за 1 таблетку (20 мг) – 23,01 руб.[3].

Два исследования с использованием анализа «затраты-эффективность» продемонстрировали, что терапия зафирлукастом (аколлат) уменьшает общую стоимость лечения за счет предупреждения госпитализаций, полустационарного лечения и временной нетрудоспособности. В зарубежном рандомизированном многоцентровом клинико-экономическом исследовании с двойным слепым контролем использование аколлата позволило значительно сократить прямые и косвенные расходы

7. Конкурентно блокирует лейкотриеновые рецепторы и предупреждает сокращение гладкой мускулатуры бронхов под влиянием соответствующих лейкотриенов – LTC₄, LTD₄, LTE₄, предотвращает повышение проницаемости сосудов, отек слизистой и приток эозинофилов к легким; снижает подъем содержания базофилов, лимфоцитов и гистамина, уменьшает стимулирующую продукцию супероксидов альвеолярными макрофагами; уменьшает клеточный и не клеточный компоненты воспаления в воздушных путях, вызываемого антигенной провокацией. Ослабляет гиперреактивность бронхов и бронхоспазм после провокации ингаляционными аллергенами; при длительном приеме снижает чувствительность к метахолину, улучшает вентиляционную функцию легких: уменьшает обструкцию; предотвращает бронхоспазм, вызываемый ингалируемым лейкотриеном D₄, диоксидом серы, физической нагрузкой, холодным воздухом. Ослабляет ранние и поздние фазы воспалительных реакций, вызываемых различными антигенами: растениями, перхотью животных, амброзией и смешанными антигенами. Уменьшает число дневных и ночных приступов бронхиальной астмы, улучшает функцию легких, уменьшает потребность в приеме β_2 -адреностимуляторов и уменьшает частоту обострений. После приема внутрь всасывается быстро, но недостаточно полно, прием пищи, богатой жиром или белком, снижает биодоступность на 40%. T_{сmax} - 3 ч. Величина равновесной концентрации в плазме пропорциональна дозе и прогнозируема по фармакокинетике разовой дозы. Связь с белками (альбуминами) - 99%. Кумуляция - низкая.

Экстенсивно метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов. T_{1/2} - 10 ч. Выводится почками на 10%, через кишечник - 85-89%; частично с грудным молоком, в виде метаболитов.

8. Бронхиальная астма (легкой и средней степени тяжести) - профилактика приступов и поддерживающая терапия (в т.ч. при неэффективности β_2 -адреностимуляторов).

9. Гиперчувствительность, грудное вскармливание, детский возраст до 5 лет.

10. Слабый и нестойкий бронхорасширяющий эффект, уменьшение выраженности симптомов, улучшение функции внешнего дыхания и снижение числа обострений бронхиальной астмы.

11. Внутрь, за 1 ч до еды или 2 ч после еды, взрослые и дети старше 12 лет - по 20 мг 2 раза в сутки. Средняя поддерживающая доза - так же 20 мг/сут в 2 приема; максимальная суточная доза – 80 мг (по 40 мг в 2 приема). Увеличение дозы может дать дополнительный эффект. Дети от 5 до 11 лет (включительно) - 10 мг 2 раза в сутки.

DDD=40 мг (перорально).

12. Нет информации о случаях передозировки.

13. Нельзя применять для купирования бронхоспазма.

14. У пожилых пациентов лечение начинают с 20 мг 2 раза в сутки и корректируют дозу в зависимости от клинического ответа. У пациентов с циррозом печени стабильного течения алкогольной этиологии начинают с 20 мг 2 раза в сутки и корректируют дозу в зависимости от клинического ответа. Применение препарата не изучалось у пациентов с нарушением функции печени другого генеза или при длительном приеме у больных с циррозом. У пациентов с нарушением функции почек коррекция режима дозирования не требуется. Применение препарата во время беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода и ребенка. Зафирлукаст экскретируется с грудным молоком, поэтому не должен назначаться кормящим матерям.

15. Нарушение функции желудочно-кишечного тракта или печени (тошнота, рвота, боль в правом подреберье, повышенная утомляемость, вялость, апатия, гепатомегалия, зуд кожи, желтуха), повышение активности "печеночных" трансаминаз, лекарственный гепатит, очень редко – печеночная недостаточность, гипербилирубинемия; миалгия, артралгия, отек нижних конечностей; аллергические реакции (крапивница, ангионевротический отек); головная боль, кожная сыпь (в т.ч. везикулярная), повышение частоты развития респираторных вирусных инфекций у пожилых пациентов, образование гематом при ушибах, редко - кровотечения, очень редко – агранулоцитоз; сухость во рту, тошнота, гастрит; редко – нарушения функции печени; головная боль, повышенная утомляемость, сонливость, у детей - (редко) – головная боль, нервозность, седативное действие.

16. Концентрацию зафирлукаста в плазме повышает (в 1,5 раза) ацетилсалициловая кислота, снижают - эритромицин (на 40%) и теофиллин (примерно на 30%). Сочетание с варфарином пролонгирует протромбиновое время на 35% (рекомендуется контроль протромбинового времени и международного нормализованного отношения). Препарат может применяться одновременно с другими видами медикаментозной терапии, применяемой для лечения бронхиальной астмы.

17. Не применяется.

18. Пациент информируется о необходимости соблюдения режима приема препарата, предупреждается о возможности возникновения побочных эффектов. Препарат не используется для купирования бронхоспазма.

19. Пациент должен дать согласие на лечение возможных осложнений.

20. Таблетки, покрытые оболочкой 20 мг.

Фирмы: AstraZeneca UK Ltd, Великобритания.

21. Список Б.