

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Алендронат – ВЕРТЕКС, 10 мг, таблетки.

Алендронат – ВЕРТЕКС, 70 мг, таблетки.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: алендроновая кислота.

Алендронат – ВЕРТЕКС, 10 мг, таблетки

Каждая таблетка содержит 10,00 мг алендроновой кислоты (в виде алендроната натрия тригидрата – 13,05 мг).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. раздел 4.4).

Алендронат – ВЕРТЕКС, 70 мг, таблетки

Каждая таблетка содержит 70,00 мг алендроновой кислоты (в виде алендроната натрия тригидрата – 91,35 мг).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки.

Алендронат – ВЕРТЕКС, 10 мг, таблетки

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с фаской. Допускается незначительная мраморность.

Алендронат – ВЕРТЕКС, 70 мг, таблетки

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с фаской и риской. Допускается незначительная мраморность.

Линия разлома (риска) не предназначена для разламывания таблетки.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Препарат Алендронат – ВЕРТЕКС показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет для лечения:

- остеопороза у женщин в постменопаузе с целью предупреждения развития переломов, в том числе переломов бедра и компрессионных переломов позвоночника;
- остеопороза у мужчин с целью предотвращения возникновения переломов.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Рекомендуемая доза – 1 таблетка 10 мг один раз в сутки или 1 таблетка 70 мг один раз в неделю.

Оптимальная длительность применения препарата не установлена.

Необходимость продолжения терапии бисфосфонатами должна оцениваться на регулярной основе, особенно после 5 и более лет применения.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Для пациентов пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

Пациенты с нарушением функции почек

Для пациентов с почечной недостаточностью легкой и средней степени тяжести (клиренс креатинина (КК) от 35 до 60 мл/мин) коррекции дозы не требуется.

Препарат Алендронат – ВЕРТЕКС не рекомендуется назначать пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК <35 мл/мин) в связи с отсутствием опыта применения у данных пациентов.

Дети

Безопасность и эффективность препарата Алендронат – ВЕРТЕКС у детей в возрасте от 0 до 18 лет на данный момент не установлены.

Алендронат – ВЕРТЕКС противопоказан у детей в возрасте от 0 до 18 лет (см. раздел 4.3).

Способ применения

Внутрь.

Таблетки не разжевывать и запивать водой не менее чем за 30 минут до первого приема пищи, напитков или лекарственных препаратов. Другие напитки (включая минеральную воду), пища и некоторые лекарственные средства могут уменьшать всасывание препарата Алендронат – ВЕРТЕКС.

Для облегчения поступления таблетки в желудок и уменьшения риска возникновения раздражения пищевода препарат Алендронат – ВЕРТЕКС следует принимать, выполняя следующие правила:

- принимать утром сразу после подъема с постели, запивая полным стаканом воды (не менее 200 мл);
- не разжевывать таблетки и не рассасывать их во рту из-за возможного образования язв в ротовой полости и глотке;
- не следует ложиться до первого приема пищи, который следует производить как минимум через 30 минут после приема препарата Алендронат – ВЕРТЕКС;
- не принимать препарат перед сном или перед подъемом с постели.

Пациентам следует дополнительно принимать препараты кальция и витамина D, если поступление этих веществ с пищей недостаточно.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к алендроновой кислоте или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- заболевания пищевода и другие факторы, замедляющие его опорожнение (стриктуры или ахалазия);
- неспособность сидеть или стоять прямо в течение 30 минут;
- гипокальциемия;
- тяжелые нарушения минерального обмена;
- хроническая почечная недостаточность ($КК < 35$ мл/мин);
- дефицит витамина D;
- тяжелый гипопаратиреоз;
- беременность и период грудного вскармливания (см. раздел 4.6).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Препарат Алендронат – ВЕРТЕКС применяется с осторожностью:

- у пациентов с заболеваниями желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) в фазе обострения (дисфагия, заболевания пищевода, эзофагит, гастрит, дуоденит, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки);
- у пациентов с серьезными заболеваниями ЖКТ, перенесенными в предшествующие 12 месяцев, например, пептическая язва, желудочно-кишечное кровотечение,

хирургическое вмешательство на верхних отделах ЖКТ, за исключением пилоропластики;

- у пациентов с предрасположенностью к гипокальциемии (гипотериоз, мальабсорбция кальция).

Нежелательные реакции со стороны верхних отделов ЖКТ

Алендронат – ВЕРТЕКС может вызывать местное раздражение слизистой оболочки верхних отделов ЖКТ. При лечении алендроновой кислотой известны случаи нежелательных реакций со стороны пищевода (эзофагит, язва или эрозия пищевода), иногда протекавших в тяжелой форме и требовавших стационарного лечения, и в редких случаях осложнявшихся формированием стриктуры. Необходимо уделять особое внимание любым признакам или симптомам, указывающим на возможные нарушения со стороны пищевода, а пациенты должны быть предупреждены о необходимости прекращения приема препарата и обращения к врачу при появлении симптомов раздражения пищевода, таких как дисфагия, боль при глотании или боль за грудиной, появление или усиление изжоги (см. раздел 4.8.). Необходимо проинформировать пациента о возможном риске повреждения слизистой оболочки пищевода при несоблюдении инструкции по применению. Риск возникновения тяжелых нежелательных явлений со стороны пищевода выше у тех пациентов, которые нарушают рекомендации по приему препарата и/или продолжают принимать его при появлении симптомов раздражения пищевода. Особенно важно дать пациенту рекомендации по приему препарата, чтобы он понимал, что риск развития поражения пищевода возрастает в случае невыполнения данных рекомендаций.

Препарат следует назначать с особой осторожностью пациентам с обострениями заболеваний верхних отделов ЖКТ, такими как дисфагия, заболевания пищевода, гастрит, дуоденит, язва, а также при активном желудочно-кишечном кровотечении, хирургическом вмешательстве на верхних отделах ЖКТ, за исключением пилоропластики, из-за возможного раздражающего действия препарата на слизистую оболочку верхних отделов ЖКТ и ухудшения течения основного заболевания. Для пациентов с диагностированным пищеводом Барретта вопрос о назначении алендроновой кислоты должен решаться индивидуально на основании оценки отношения ожидаемой пользы к возможному риску. Хотя в расширенных клинических исследованиях алендроновой кислоты повышения риска возникновения нежелательных явлений со стороны ЖКТ не отмечалось, в пострегистрационных отчетах сообщалось о редких случаях развития язвы желудка и двенадцатиперстной кишки, иногда тяжелой и осложненной (см. раздел 4.8.).

Остеонекроз челюсти

У людей с онкологическим заболеванием, при лечении которых проводилось внутривенное введение бисфосфонатов, отмечались случаи остеонекроза челюсти, обусловленного главным образом предшествующей экстракцией зуба и/или локальной инфекцией (включая остеомиелит). Многие из пациентов также получали химиотерапию и глюкокортикостероиды. Также известны случаи остеонекроза челюсти у пациентов с остеопорозом, принимавших бисфосфонаты перорально.

При оценке индивидуального риска развития некроза челюсти следует учитывать следующие факторы риска:

- активность бисфосфоната (наивысшая у золендроновой кислоты), путь введения и общая доза;
- онкологические заболевания, химиотерапия, радиотерапия, прием глюкокортикостероидов, курение;
- болезни зубов в анамнезе, плохая гигиена полости рта, пародонтоз, инвазивные стоматологические процедуры и плохо подобранные протезы.

Перед началом терапии пероральными бисфосфонатами пациентам с неудовлетворительным стоматологическим статусом рекомендуется стоматологический осмотр и превентивные лечебные мероприятия. Во время курса бисфосфонатов таким пациентам рекомендуется по возможности избегать инвазивных стоматологических процедур. Если у пациента развился остеонекроз челюсти во время терапии бисфосфонатами, хирургическое стоматологическое лечение может ухудшить его состояние. Неизвестно, уменьшает ли прекращение приема бисфосфонатов риск остеонекроза челюсти у пациентов, которым требуются стоматологические процедуры. В каждом случае решение должен принимать лечащий врач на основании оценки отношения ожидаемой пользы к возможному риску для конкретного пациента. Во время терапии бисфосфонатами следует разъяснить пациентам важность правильной гигиены полости рта, профилактических осмотров, а также предупредить их о необходимости сообщения о любых симптомах со стороны полости рта, например, подвижности зубов, боли или появлении припухлости.

Скелетно-мышечная боль

Известно о случаях появления болей в костях, суставах и/или мышцах во время курса бисфосфонатов. Во время пострегистрационного применения в редких случаях данные симптомы были выраженными и/или приводили к инвалидности (см. раздел 4.8.). Время появления симптомов варьировало от одного дня до нескольких месяцев после начала лечения. У большинства пациентов симптомы разрешались после прекращения лечения.

У некоторых из них симптомы появлялись снова при возобновлении приема того же препарата или другого бисфосфоната.

Известно о случаях появления болей в костях, суставах и/или мышцах во время курса бисфосфонатов. Во время пострегистрационного применения в редких случаях данные симптомы были выраженными и/или приводили к инвалидности (см. раздел 4.8.). Время появления симптомов варьировало от одного дня до нескольких месяцев после начала лечения. У большинства пациентов симптомы разрешались после прекращения лечения. У некоторых из них симптомы появлялись снова при возобновлении приема того же препарата или другого бисфосфоната.

Метаболизм костной ткани и минеральный обмен

При наличии гипокальциемии концентрацию кальция в крови необходимо нормализовать до начала лечения препаратом. Другие нарушения минерального обмена (например, дефицит витамина D и гипопаратиреоз) также должны быть эффективно пролечены до начала терапии алендроновой кислотой. У пациентов с данными нарушениями во время терапии препаратом Алендронат – ВЕРТЕКС необходимо контролировать концентрацию кальция в сыворотке крови и симптомы гипокальциемии.

Поскольку алендроновая кислота увеличивает содержание минеральных веществ в костях, может наблюдаться снижение концентрации кальция и фосфатов в сыворотке крови, особенно у пациентов, принимающих глюкокортикостероиды, у которых всасывание кальция может быть снижено. Обычно такое снижение небольшое и бессимптомное. Тем не менее, известны редкие случаи симптоматической гипокальциемии, которая иногда достигала тяжелой степени и развивалась у пациентов с соответствующей предрасположенностью (гипопаратиреоидизм, дефицит витамина D и мальабсорбция кальция) (см. раздел 4.8.).

Атипичные переломы бедра

Сообщалось о возникновении патологических (то есть при воздействии незначительной силы или самопроизвольных) подвертельных переломов или переломов проксимальных отделов диафиза бедренной кости при лечении бисфосфонатами, главным образом у пациентов, получающих длительную терапию по поводу остеопороза. Некоторые из переломов относились к категории стрессовых (также известны под названием нагрузочный перелом, маршевый перелом, перелом Дойчлендера), возникающих в отсутствие травмы. Переломы часто бывают двусторонними, поэтому у пациентов с переломом бедра, принимающих бисфосфонаты, следует обследовать второе (контралатеральное) бедро. Известно, что данные переломы плохо срастаются. Некоторые пациенты за недели или месяцы до возникновения полного перелома испытывали

продромальные боли в пораженной области, часто связанные с характерной рентгенологической картиной стрессового перелома.

Количество сообщений было очень небольшим, кроме того, стрессовые переломы со сходными клиническими особенностями возникают и у пациентов, не принимающих бисфосфонаты. Пациентов со стрессовыми переломами необходимо обследовать с оценкой известных причин и факторов риска (дефицит витамина D, нарушения всасывания, применение глюкокортикостероидов, стрессовый перелом в анамнезе, артрит или перелом нижних конечностей, чрезмерные или увеличенные нагрузки, сахарный диабет, хронический алкоголизм) и предоставить им надлежащую ортопедическую помощь. При подозрении на атипичный перелом бедра следует рассмотреть возможность прекращения терапии бисфосфонатами до проведения индивидуальной оценки отношения ожидаемой пользы к возможному риску. Во время терапии бисфосфонатами следует рекомендовать пациентам сообщать о любых болях в бедре или в паховой области. Всех пациентов, поступивших с такими жалобами, необходимо осматривать на предмет неполного перелома бедренной кости.

Кожные реакции

Во время пострегистрационного применения поступали редкие сообщения о тяжелых кожных реакциях, включая синдром Стивенса-Джонсона и синдром Лайелла (токсический эпидермальный некролиз).

Остеонекроз наружного слухового канала

Сообщалось о случаях остеонекроза наружного слухового канала на фоне приема алендроновой кислоты, главным образом при длительной терапии. Возможные факторы риска развития остеонекроза наружного слухового канала включают применение стероидов, химиотерапию, травмы.

Следует принимать во внимание и другие причины остеопороза, помимо дефицита эстрогенов и возраста.

Пропуск приема препарата

Пациентов следует предупредить, что при случайном пропуске приема препарата 1 раз в неделю им следует принять одну таблетку утром ближайшего дня после того, как они вспомнят. Не следует принимать две таблетки в один день, но в последующем необходимо вернуться к приему препарата 1 раз в неделю в тот день недели, который был выбран в начале лечения.

Вспомогательные вещества

Данный лекарственный препарат содержит лактозы моногидрат. Пациентам с редкими наследственными заболеваниями непереносимости галактозы, дефицитом лактазы или

глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать данный лекарственный препарат.

4.5. Взаимодействия с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Исследования взаимодействия не проводились.

Препараты кальция, антациды, пища, напитки, в том числе минеральные воды влияют на всасываемость алендроновой кислоты; лекарственные средства можно принимать внутрь не ранее чем через 30 минут после приема препарата.

В клинических исследованиях у пациентов, принимавших препараты эстрогена (интравагинально, трансдермально или внутрь) одновременно с алендроновой кислотой, не было выявлено клинически значимого взаимодействия.

В клинических исследованиях алендроновой кислоты у мужчин, женщин в постменопаузе и пациентов, принимающих глюкокортикостероиды, не было выявлено клинически значимого лекарственного взаимодействия в отношении влияния на связывание с белками, почечной экскреции и метаболизма.

Частота нежелательных явлений со стороны верхнего отдела ЖКТ увеличивается при сочетании алендроновой кислоты в дозе более 10 мг/сутки с препаратами, содержащими ацетилсалициловую кислоту. Однако данный эффект не наблюдался при приеме алендроновой кислоты в дозе 70 мг 1 раз в неделю.

Препарат может быть назначен пациентам, принимающим нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП). В трехлетнем контролируемом клиническом исследовании (количество пациентов 2027), во время которого большинство пациентов принимало в качестве сопутствующей терапии НПВП, количество нежелательных явлений, относящихся к верхним отделам ЖКТ, было сходным у пациентов, получавших алендроновую кислоту в дозе 5 и 10 мг в сутки, и у пациентов, получавших плацебо. Однако применение НПВП ассоциировано с раздражением слизистой оболочки ЖКТ, поэтому применение НПВП одновременно с алендроновой кислотой должно быть осторожным.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Препарат Алендронат – ВЕРТЕКС противопоказан во время беременности.

Нет данных о применении алендроновой кислоты у беременных женщин.

Исследования на животных не указывают на наличие непосредственных негативных эффектов во время беременности, развития эмбриона и плода или постнатального развития. Алендроновая кислота, вводившаяся крысам во время беременности, вызывала дистоцию, обусловленную гипокальциемией.

Бисфосфонаты встраиваются в костный матрикс, из которого они постепенно высвобождаются в течение нескольких лет. Количество бисфосфоната, инкорпорированного в костную ткань женщины и высвобождаемого из нее в системный кровоток, прямо связаны с дозами и длительностью лечения. Существует теоретический риск влияния на плод (в особенности на костную ткань), если беременность наступает после прохождения курса терапии бисфосфонатами.

Нет данных о прямом эмбриотоксическом или тератогенном действии. Влияние таких факторов риска на плод, как время между прекращением терапии бисфосфонатами и наступлением беременности, пути введения (внутривенное, пероральное), не изучалось.

Лактация

Препарат Алендронат – ВЕРТЕКС противопоказан в период грудного вскармливания.

Данных о проникновении в грудное молоко нет.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Исследований по влиянию алендроновой кислоты на способность управлять транспортными средствами и работу с точными механизмами не проводилось. Однако, учитывая возможность развития нежелательных реакций (головокружение и других), следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами, точными механизмами и воздерживаться от выполнения указанных видов деятельности в случае развития нежелательных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

В однолетнем исследовании у женщин с остеопорозом в период постменопаузы общие профили безопасности алендроновой кислоты 70 мг 1 раз в неделю (n=519) и алендроновой кислоты 10 мг/сутки (n=370) были в целом схожи. В двух трёхлетних исследованиях с практически идентичным дизайном у женщин в период постменопаузы (алендроновая кислота 10 мг: n=196; плацебо: n=397) профили безопасности алендроновой кислоты 10 мг/сутки и плацебо были в целом схожи.

Нежелательные реакции, описанные в данных исследованиях как возможно, вероятно или определенно связанные с приемом алендроновой кислоты, представлены в таблице 1. Нежелательные реакции наблюдались у ≥ 1 % пациентов в каждой группе приема в однолетнем исследовании. У ≥ 1 % пациентов, принимавших алендроновую кислоту 10 мг/сутки, нежелательные реакции наблюдались с большей частотой, чем в группе плацебо в трехлетнем исследовании.

Таблица 1. Нежелательные реакции, описанные в клинических исследованиях алендроновой кислоты

	Однолетнее исследование		Трехлетние исследования	
	Алендронат 70 мг (1 раз в неделю, n=519) %	Алендронат 10 мг (1 раз в день, n=370) %	Алендронат 10 мг (1 раз в день, n=196) %	Плацебо (n=397) %
<i>Нарушения со стороны нервной системы</i>				
Головная боль	0,4	0,3	2,6	1,5
<i>Желудочно-кишечные нарушения</i>				
Боль в животе	3,7	3,0	6,6	4,8
Диспепсия	2,7	2,2	3,6	3,5
Кислая отрыжка	1,9	2,4	2,0	4,3
Тошнота	1,9	2,4	3,6	4,0
Вздутие живота	1,0	1,4	1,0	0,8
Запор	0,8	1,6	3,1	1,8
Диарея	0,6	0,5	3,1	1,8
Дисфагия	0,4	0,5	1,0	0,0
Метеоризм	0,4	1,6	2,6	0,5
Гастрит	0,2	1,1	0,5	1,3
Язва желудка	0,0	1,1	0,0	0,0
Язва пищевода	0,0	0,0	1,5	0,0
<i>Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани</i>				
Костно-мышечная боль (в костях, мышцах или суставах)	2,9	3,2	4,1	2,5
Мышечный спазм	0,2	1,1	0,0	1,0

Классификация частоты развития нежелательных реакций согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ):

очень часто $\geq 1/10$;

часто $\geq 1/100$, но $< 1/10$;

нечасто $\geq 1/1000$, но $< 1/100$;

редко $\geq 1/10000$, но $< 1/1000$;

очень редко $< 1/10000$;

частота неизвестна – на основании имеющихся данных оценить невозможно.

Нарушения со стороны иммунной системы:

редко – реакции гиперчувствительности, включая гиперемию кожных покровов, крапивницу, ангионевротический отек (отек Квинке);

Нарушения со стороны нервной системы:

часто – головная боль, головокружение²;

нечасто – нарушения вкусовых ощущений²;

частота неизвестна – раздражительность.

Нарушения со стороны органа зрения:

нечасто – воспаление органов зрения (уевит, склерит, эписклерит).

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта:

часто – системное головокружение².

Желудочно-кишечные нарушения:

часто – боль в животе, диспепсия, запор, диарея, язва пищевода³, дисфагия³, вздутие живота, кислая отрыжка, метеоризм;

нечасто – тошнота, рвота, гастрит, эзофагит³, эрозия пищевода, язва желудка, в том числе язвенная болезнь желудка, осложненная кровотечением (мелена);

редко – стриктура пищевода³, изъязвление пищевода³, нарушения верхних отделов ЖКТ (перфорация пищевода¹, язва ротоглотки¹, изъязвление слизистой оболочки полости рта, кровотечение¹).

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

часто – зуд², алопеция²;

нечасто – кожная сыпь, эритема;

редко – кожная сыпь с фотосенсибилизацией, тяжелые кожные реакции, включая синдром Стивенса-Джонсона и синдром Лайелла (токсический эпидермальный некролиз)⁴.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани:

очень часто – миалгия, боли в костях, боли в суставах (иногда сильно выраженные)^{1,2};

часто – припухлость суставов²;

редко – локальный остеонекроз челюсти, ассоциированный главным образом с предшествующей экстракцией зуба и/или локальной инфекцией (включая остеомиелит), часто с медленным выздоровлением^{1,4}, тяжелые мышечные судороги, атипичные подвертельные и дифизарные переломы бедренной кости (нежелательная реакция препаратов класса бисфосфонатов)⁵;

частота неизвестна – холестеатома наружного слухового канала (очаговый остеонекроз), низкоэнергетические переломы костей, кроме бедренной.

Общие нарушения и реакции в месте введения:

часто – астения², периферические отеки²;

нечасто – преходящие симптомы как реакция острой фазы (миалгия, недомогание, реже – лихорадка), обычно в связи с началом лечения².

Лабораторные и инструментальные данные:

редко – симптоматическая гипокальциемия и гипофосфатемия (часто на фоне факторов предрасположенности)¹ (см. раздел 4.4);

очень редко – бессимптомная транзиторная гипофосфатемия.

¹ см. раздел 4.4

² в клинических исследованиях частота была сопоставимой для группы препарата и группы плацебо

³ см. разделы 4.2 и 4.4

⁴ данная нежелательная реакция была установлена в ходе пострегистрационного наблюдения

⁵ установлено при пострегистрационном применении

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств-членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1.

Телефон: +7 (800) 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:
www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. Передозировка

Симптомы

Боли в животе, диспептические расстройства, дисфагия, изжога, эзофагит, гастрит; могут развиваться гипокальциемия и гипофосфатемия.

Лечение

Специфического лечения нет. Рекомендуется прием молока, антацидов. Во избежание раздражения пищевода нельзя вызывать рвоту, пациенту следует придать вертикальное положение («стоя» или «сидя»).

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: Алендроновая кислота.

ФТГ: средства для лечения заболеваний костей; средства, влияющие на структуру и минерализацию костей; бисфосфонаты.

Код АТХ: M05BA04

Алендроновая кислота – негормональный специфический ингибитор остеокластической костной резорбции (из группы аминокислотобисфосфонатов – синтетических аналогов пирофосфата, связывающего гидроксиапатит, находящийся в кости), подавляет активность остеокластов. Стимулирует остеогенез, восстанавливает положительный баланс между резорбцией и восстановлением кости, прогрессивно увеличивает минеральную плотность костей (регулирует фосфорно-кальциевый обмен), способствует формированию костной ткани с нормальной гистологической структурой.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Биодоступность алендроновой кислоты при пероральном приеме в дозе 5 – 70 мг натощак утром за 2 часа до стандартного завтрака составляет 0,64 % у женщин и 0,6 % у мужчин; при приеме натощак за 0,5 – 1 часа до стандартного завтрака биодоступность снижается до 0,46 % и 0,39 % соответственно. Биодоступность алендроновой кислоты значительно снижается, если принимать препарат менее чем за 30 минут до приема пищи или жидкости, биодоступность минимальна при приеме вместе с пищей или в течение двух часов после еды.

Распределение

Средний объем распределения в состоянии равновесной концентрации (за исключением костей) у человека составляет не менее 28 л. Концентрация алендроновой кислоты в плазме крови после перорального приема в терапевтической дозе слишком мала для аналитического обнаружения (< 5 нг/мл). Связывание с белками плазмы крови составляет приблизительно 78 %.

Биотрансформация

Нет данных, подтверждающих, что алендроновая кислота подвергается метаболизму в организме человека или животных.

Элиминация

Выводится в неизменном виде. Процесс выведения характеризуется быстрым снижением концентрации алендроновой кислоты в плазме крови и крайне медленным высвобождением из костей. При внутривенном введении через 6 часов концентрация в плазме снижается более чем на 95 %. Абсорбированная, но не встроившаяся в костную ткань алендроновая кислота быстро выводится почками. После однократного внутривенного введения 10 мг алендроновой кислоты почечный клиренс составляет 71 мл/мин, системный – 200 мл/мин. После введения однократной внутривенной дозы [^{14}C] алендроновой кислоты приблизительно 50 % радиоактивности выводилось с мочой в течение 72 часов и незначительно или практически не выводилось с калом.

Конечный период полувыведения превышает 10 лет, что отражает высвобождение алендроновой кислоты из костной ткани.

Алендроновая кислота не выводится через кислотные и основные транспортные системы почек у крыс; таким образом можно ожидать, что она не нарушает выведение других лекарственных препаратов через эти системы у человека.

Пол

Биодоступность алендроновой кислоты существенно не отличается у мужчин и женщин.

Раса

Фармакокинетические различия по расовому признаку не были изучены.

Почечная недостаточность

У здоровых добровольцев алендроновая кислота, не накапливающаяся в костной ткани, быстро выводится с мочой. Контролируемых фармакокинетических исследований по применению алендроновой кислоты при почечной недостаточности нет, но у пациентов с выраженным нарушением функции почек выведение алендроновой кислоты будет снижено. Поэтому можно ожидать несколько большее накопление алендроновой кислоты в костной ткани у пациентов с нарушением функции почек.

При КК от 35 до 60 мл/мин коррекции дозы не требуется.

Применять алендроновую кислоту у пациентов с КК менее 35 мл/мин не рекомендуется в связи с отсутствием опыта применения.

Печеночная недостаточность

У пациентов с нарушением функции печени нет необходимости корректировать дозу алендроновой кислоты, поскольку она не метаболизируется и не выводится с желчью.

Лица пожилого возраста

Биодоступность и выведение алендроновой кислоты сходны у пожилых и молодых пациентов.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Алендронат – ВЕРТЕКС, 10 мг, таблетки

Лактозы моногидрат

Крахмал картофельный

Повидон К-17 (поливинлпирролидон низкомолекулярный)

Кремния диоксид коллоидный

Кальция стеарат

Алендронат – ВЕРТЕКС, 70 мг, таблетки

Лактозы моногидрат

Крахмал картофельный

Повидон К-17 (поливинлпирролидон низкомолекулярный)

Кремния диоксид коллоидный

Кальция стеарат

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

Таблетки 10 мг и 70 мг

Таблетки 10 мг

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой. По 1 или 3 контурные ячейковые упаковки вместе с листком-вкладышем в пачке из картона.

Таблетки 70 мг

По 4 или 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой. По 1, 2 или 3 контурные ячейковые упаковки по 4 таблетки или 1 контурная ячейковая упаковка по 10 таблеток вместе с листком-вкладышем в пачке из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Россия, АО «ВЕРТЕКС»

Адрес: 197350, г. Санкт-Петербург, Дорога в Каменку, д. 62, лит. А

Тел.: 8 (800) 2000 305

Адрес электронной почты: vertex@vertex.spb.ru

7.1 Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия, АО «ВЕРТЕКС»

197350, г. Санкт-Петербург, Дорога в Каменку, д. 62, лит. А

Тел.: 8 (800) 2000 305

Адрес электронной почты: pharmacovigilance@vertex.spb.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Алендронат – ВЕРТЕКС доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет» <http://ees.eaeunion.org/>.