

Алендроновая кислота

Латинское название: Alendronic acid

Действующее вещество: алендроновая кислота

Код АТХ: M05BA04

Производитель: ВЕРТЕКС АО (Россия)

Условие отпуска из аптеки: по рецепту

Условия хранения: вдали от света и детей

Срок годности: 2 года

Введение

Алендроновая кислота (синоним: алендронат) – бисфосфонатное лекарственное средство, используемое при остеопорозе и других заболеваниях костной системы. Алендронат уменьшает резорбцию кости путем ингибирования остеокластов и способствует увеличению костной массы.

Алендронат натрия обычно принимают в виде недельных таблеток, которые вводят один раз в неделю утром после пробуждения. Наиболее распространенные потенциальные нежелательные эффекты – желудочно-кишечный дискомфорт, мигрень, боль в мышцах и суставах.

Состав и форма выпуска

Алендроновая кислота продается в виде недельных (по 70 мг) и ежедневных таблеток (10 мг). На фармацевтическом рынке также доступна комбинация с витамином D3, которая одобрена в России с 1996 года.

Поскольку прямых сравнительных исследований нет, эти затраты невозможно сравнить с расходами других методов лечения остеопороза. Тем не менее, замена эстрогенами и прогестинами или лечение витамином D намного дешевле.

Фармакологические свойства

Подобно этидронату или памидронату, алендронат – синтетический аналог пирофосфата. Бисфосфанаты имеют высокое сродство к кристаллам гидроксиапатита и более биологически стабильны, чем пирофосфат, который легко разлагается фосфатазами. По сравнению с другими бисфосфонатами алендронат обладает большей фармакологической активностью. Эксперименты на животных показали, что алендроновая кислота ингибирует индуцированную остеокластами резорбцию кости. Точный механизм действия до конца не изучен.

В оптимальных условиях – за два часа до завтрака – около 0,7% дозы попадает в системный кровоток после перорального введения. Если человек принимает препарат за 0,5-1 часа до приема пищи, биодоступность снижается на 40%. Снижение доступности на 60% наблюдается при одновременном употреблении препарата с кофе или апельсиновым соком. После абсорбции алендронат изначально распределяется в мягкие ткани и через короткое время переносится в скелет.

Оставшееся количество (около 50%) вещества выводится почками в течение трех дней. Уровни алендроната в плазме снижаются на 95% в течение 6 часов. По экспертным оценкам, костный алендронат имеет терминальный период полураспада более 10 лет.

На основе экспериментов на животных можно предположить, что почечная недостаточность может привести к нежелательному накоплению алендроната в кости. Снижение функции печени не должно влиять на фармакокинетику лекарства.

Показания к применению

Данные 881 женщин были проанализированы на предмет возникновения переломов позвонков. 355 женщин получали только плацебо и 500 мг кальция в день. 526 женщин получали 5 или 10 мг алендроната ежедневно с одной дозой кальция в течение трех лет. Предпосылкой для включения в исследование была плотность костной ткани (измеренная с помощью двухэнергетической рентгеновской абсорбциометрии), которая была по меньшей мере на 2,5 стандартных отклонения ниже средней плотности костной ткани женщин в пременопаузе.

Исследования через три года показали, что у пациентов имелась на 6-9% более высокая плотность костной ткани в позвоночнике, бедренной кости и вертеле по сравнению с группой плацебо. Доза 5 мг была менее эффективной. У женщин, получавших алендронат, было значительно меньше новых переломов позвонков (3,2%), чем у тех, кто принимал плацебо (6,2%).

Другие показания к применению:

- Остеопороз у мужчин
- Гиперкальциемия при злокачественных новообразованиях.

Инструкция по применению

Согласно инструкции по применению, рекомендуемая доза алендроновой кислоты для терапии постменопаузального остеопороза составляет 10 мг в день. Производитель рекомендует пациентам с остеопорозом употреблять достаточное количество кальция.

Что касается абсорбции и потенциальных проблем с пищеводом, во время применения следует нужно следующие рекомендации:

- Таблетки алендроната следует принимать рано утром после пробуждения с полным стаканом дистиллированной воды
- Таблетку нельзя жевать или растворять во рту
- Женщина должна после этого как можно скорее позавтракать и до тех пор не ложиться в постель
- Препарат нельзя принимать перед сном.

Противопоказания, побочные эффекты, передозировка, лекарственное взаимодействие

Алендронат противопоказан женщинам с острым желудочно-кишечным воспалением, стриктурами пищевода, клинически выраженной остеопорозом, гипокальциемией и выраженной почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 30 мл/мин). Беременным и кормящим женщинам не следует принимать алендронат.

В упомянутых исследованиях алендронат иногда вызывал желудочно-кишечные симптомы: дискомфорт в области живота наблюдался почти у 3%, запоры, диарея, метеоризм, мышечная боль и головная боль у 3% -4% пациентов. Редкие, но более распространенные, чем плацебо, побочные эффекты – диспепсия, язва пищевода, дисфагия и рвота.

В медицине известно не менее 36 случаев тяжелого эзофагита, вызванных приемом препарата, которые потребовали госпитализации пациента. Экзантема и покраснение встречаются редко. При алендронате могут снижаться уровни кальция и фосфата в плазме.

Препарат нельзя принимать одновременно с другими лекарствами (но не с пищей), поскольку биодоступность может в значительной мере снижаться. Запрещено комбинировать медикамент с кальцием, железом, магнием и алюминием. Одновременное лечение активными аналогами витамина D – кальцитриол – или фторидами, не рекомендуется. Неблагоприятные взаимодействия алендроновой кислоты с трициклическими антидепрессантами были выявлены в клиническом исследовании 2014 года.