

**ДЕФОРТ-3**  
**Инструкция**  
**по медицинскому применению лекарственного средства**

Торговое название: **Дефорт-3.**

МНН: **Холекальциферол.**

Химическое название:

Холекальциферол: 24,25-Дигидроксивитамин D3 (24,25(OH)<sub>2</sub>D<sub>3</sub>).

**Лекарственная форма:** Раствор для инъекций и для перорального приема.

Состав: **1 мл раствора содержит:**

Активные вещества:

Холекальциферол..... USP 300 000 ME / мл;

Вспомогательные вещества:

Диглицериды, кардамоновое масло.

**Фармако-терапевтическая группа:** Регулирующее кальций-фосфорный обмен. Витамин D и его производные. Холекальциферол. Витамин и витаминоподобные средства.

**Код АТХ:** A11CC05.

**Фармакологические свойства:**

*Фармакодинамика:*

Препарат, регулирующий обмен кальция и фосфора. Усиливает всасывание кальция в кишечнике и реабсорбцию фосфора в почечных канальцах. Способствует формированию костного скелета и зубов у детей, сохранению структуры костей.

Витамин D3 необходим для нормального функционирования паращитовидных желез, также участвует в функционировании иммунной системы, влияя на продукцию лимфокинов.

Участвует в процессе синтеза АТФ.

В качестве гормона действует на клетки кишечника, почек и мышц. В клетках слизистой оболочки кишечника витамин D стимулирует синтез белка-носителя, необходимого для транспорта Ca. Действие паратгормона, проявляющееся усилением абсорбции кальция, осуществляется полностью через его стимулирующее влияние на продукцию 1,25-(O)<sub>2</sub>-D<sub>3</sub> почками. Всасывание фосфора также стимулируется витамином D. Усиление процессов минерализации тканей при лечении витамином D, по видимому, является следствием повышения содержания Ca и фосфора в плазме. Кальцитриол способен повышать реабсорбцию Ca, но в умеренной степени, так как 99% Ca реабсорбируется и в отсутствие витамина D. В мышечной ткани при дефиците витамина D снижается захват Ca саркоплазматическим ретикуломом, что проявляется мышечной слабостью. Процесс образования гормона регулируется потребностью организма в Ca и фосфоре и опосредуется паратгормоном и содержанием фосфора в крови.

*Фармакокинетика:*

В крови большая его часть находится в связанном состоянии с гамма-глобулинами и альбуминами. Витамин D депонируется главным образом в жировой ткани. Основные процессы биотрансформации витамина D происходят в коже, печени и почках. В коже под действием ультрафиолетового облучения образуется витамин D<sub>3</sub> из предшественников. В печени витамин D подвергается гидроксигированию и затем превращается в 25-оксихолекальциферол (25-OH-D<sub>3</sub>). Последний в почках с участием паратгормона переходит в самый активный метаболит витамина D - кальцитриол, или 1,25-дигидрооксихолекальциферол (1,25(OH)<sub>2</sub>-D<sub>3</sub>), который рассматривается как сильнодействующий почечный гормон стероидной структуры. 1,25-(OH)<sub>2</sub>-D<sub>3</sub> выполняет важную роль в регуляции метаболизма Ca, P и двухвалентных микроэлементов (Cd, Ni, Zn, Hg, Be, Sr). Период полувыведения витамина D из организма составляет около 19 дней. Он выводится путем экскреции с желчью, первоначально в кишечник (15-30% от введенной дозы в течение суток), где подвергается энтерогепатической циркуляции (повторное всасывание). Оставшаяся часть выводится с содержимым кишечника. Скорость исчезновения исходного витамина из плазмы крови составляет 19-25 часов, но при накоплении в тканях время его пребывания в организме может составить до 6 месяцев.

**Токсикология:**

Симптомы хронической интоксикации витамином D (при приеме в течение нескольких недель или месяцев для взрослых в дозах 20-60 тыс. ME/сутки, детей - 2-4 тыс. ME/сутки): кальциноз мягких тканей, почек, легких, кровеносных сосудов, артериальная гипертензия, почечная и хроническая сердечная недостаточность (эти эффекты наиболее часто возникают при присоединении к гиперкальциемии гиперфосфатемии), нарушение роста у детей (длительный прием в дозе 1,8 тыс. ME/сутки).

**Показания к применению:**

- Гипо- и авитаминоз витамина D (профилактика и лечение);
- Рахит, спазмофилия;
- Остеопороз у женщин в постменопаузном периоде (в составе комплексной терапии), остеопения;
- Диабет второго типа;
- Гипертония и нарушение в работе CCC;
- Рассеянный склероз и болезнь Паркинсона;
- Депрессия и частые головные боли;
- Рак молочной железы и яичников у женщин;
- Нефрогенная остеопатия;
- Неполноценное и несбалансированное питание (в т.ч. парентеральное, вегетарианская диета);
- Алкоголизм;
- Печеночная недостаточность, цирроз;
- Беременность (особенно при никотиновой и лекарственной зависимости, многоплодная беременность), период лактации;
- Синдром мальабсорбции;
- Гипокальциемия, гипофосфатемия (в т.ч. семейная);
- При недостаточной инсоляции;
- Прием барбитуратов, колестирамина, колестипола, минеральных масел, противосудорожных препаратов (в т.ч. фенитоина и примидона);
- Гипопаратиреоз: послеоперационный, идиопатический;
- Тетания (послеоперационная и идиопатическая), псевдогипопаратиреоз.

**Противопоказания:**

- при наличии реакций гиперчувствительности к веществу;

- гипervитаминоз витамина D3;
- пациентам с гиперкальциемией, гиперкальциемией, кальциевым нефроуролитиазом;
- в большой дозировке у лежачих больных;
- при гиперфосфатемии, почечной остеодистрофии;
- пациентам с саркоидозом;
- при активной форме туберкулеза легких.

**С осторожностью:**

С осторожностью следует назначать препарат при атеросклерозе, сердечной недостаточности, почечной недостаточности, туберкулезе легких (активная форма), гиперфосфатемии, фосфатном нефроуролитиазе, органических поражениях сердца, острых и хронических заболеваниях печени и почек, заболеваниях ЖКТ (в т.ч. язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки), во время беременности и в период лактации, при гипотиреозе.

**Применение при нарушениях функции печени:**

С осторожностью следует назначать препарат при острых и хронических заболеваниях печени.

**Применение при нарушениях функции почек:**

С осторожностью следует назначать препарат при почечной недостаточности, фосфатном нефроуролитиазе, острых и хронических заболеваниях почек.

**Побочные действия:**

*Со стороны электролитного обмена:* гиперфосфатемия, гиперкальциемия, гиперкальциурия.

*Со стороны пищеварительной системы:* анорексия, запор.

*Со стороны мочевыделительной системы:* полиурия, почечная недостаточность.

*Со стороны ЦНС:* головная боль.

*Со стороны костно-мышечной системы:* миалгия, артралгия.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* повышение АД, аритмии.

*Прочие:* аллергические реакции.

**Способ применения и дозировка:**

Препарат применяют как внутримышечно (в/м) так и перорально.

Внутримышечно препарат вводится в клинических/больничных условиях под наблюдением квалифицированного медицинского работника для подтверждения безопасности внутримышечной терапии холекальциферола.

*Дети и подростки (2-18 лет):*

Профилактика: 1 ампула (300 000 МЕ витамина D3) 1 раз в год.

Лечение: 1 ампула (300 000 МЕ витамина D3) каждые 3 месяца.

*Взрослые и пожилые:*

Профилактика: 1 ампула (300 000 МЕ витамина D3) 1 раз в год. У пациентов с высоким риском дефицита может потребоваться увеличить дозу до 1 ампулы (300 000 МЕ витамина D3) каждые 6 месяцев.

Лечение: 1 ампула (300 000 МЕ витамина D3) каждые 6 недель. Для обеспечения эффективности лечения необходимо обеспечить адекватное потребление кальция.

**Передозировка:**

*Симптомы гипervитаминоза D:* ранние (обусловленные гиперкальциемией) - запор или диарея, сухость слизистой оболочки полости рта, головная боль, поллакиурия, никтурия, полиурия, анорексия, металлический привкус во рту, тошнота, рвота, необычайная усталость, общая слабость, гиперкальциемия, гиперкальциурия; поздние - боль в костях, помутнение мочи (появление в моче гиалиновых цилиндров, протеинурии, лейкоцитурии), повышение АД, кожный зуд, фоточувствительность глаз, гиперемия конъюнктивы, аритмия, сонливость, миалгия, тошнота рвота, панкреатит, гастралгия, похудание, редко - психоз (изменение психики и настроения).

Симптомы хронической передозировки витамина D (при приеме в течение нескольких недель или месяцев для взрослых в дозах 20-60 тыс. МЕ/сут, для детей - 2-4 тыс. МЕ/сут): кальциноз мягких тканей, почек, легких, кровеносных сосудов, артериальная гипертензия, почечная и хроническая сердечная недостаточность (эти эффекты наиболее часто возникают при присоединении к гиперкальциемии, гиперфосфатемии), нарушение роста у детей (длительный прием).

*Лечение:* отмена препарата, диета с низким содержанием кальция, потребление больших количеств жидкости, назначение ГКС, а-токоферола, аскорбиновой кислоты, ретинола, тиамин, в тяжелых случаях - в/в введение больших количеств 0,9% раствора натрия хлорида, фуросемида, электролитов, проведение гемодиализа. Специфического антидота не существует. Для исключения передозировки в ряде случаев рекомендуется определение концентрации кальция в крови.

**Лекарственное взаимодействие:**

При одновременном приеме витамина D3 с тиазидными диуретиками увеличивается риск развития гиперкальциемии.

При одновременном применении с фенитоином (увеличение скорости биотрансформации), колестирамином, ЕКС, кальцитонином, производными этидроновой и памидроновой кислот, пликсамидом, галлия нитратом снижается эффективность препарата, содержащего витамин D3.

Ретинол при одновременном применении с витамином D3 снижает токсичность последнего.

Барбитураты при одновременном применении с витамином D3 увеличивают скорость биотрансформации холекальциферола.

Витамин D3 при одновременном применении повышает токсичность сердечных гликозидов.

Длительная терапия препаратом, на фоне одновременного применения антицидов, содержащих алюминий и магний, увеличивает их концентрацию в крови и риск возникновения интоксикации (особенно при наличии хронической почечной недостаточности).

Колестирамин, колестипол и минеральные масла снижают абсорбцию холекальциферола в ЖКТ, что требует повышения его дозы при одновременном применении с вышеперечисленными лекарственными средствами.

Холекальциферол увеличивает абсорбцию фосфорсодержащих препаратов и риск возникновения гиперфосфатемии.

При одновременном применении препарата с натрия фторидом интервал между приемами должен составлять не менее 2 ч, с пероральными формами тетрациклинов - не менее 3 ч. Одновременное применение с другими аналогами витамина D3 повышает риск развития гипervитаминоза.

**Беременность и кормление грудью:**

Гиперкальциемия во время беременности может вызвать дефекты физического и умственного развития плода.

Витамин D3 и его метаболиты проникают в грудное молоко.

При беременности и в период лактации суточная доза холекальциферола не должна превышать 600 МЕ.

Особые указания:

При профилактическом применении необходимо избегать передозировки, особенно у детей (не следует назначать более 10-15 мг в год).

При применении доз свыше 1000 МЕ/сут, а также при непрерывном приеме препарата в течение нескольких месяцев рекомендуется периодическое определение концентрации кальция и фосфора в сыворотке крови для исключения хронического гипervитаминоза D3 и гиперфосфатемии.

Для того, чтобы предотвратить развитие гиперфосфатемии у пациентов с поражением костей почечного генеза, препарат можно назначать вместе с фосфат связывающими средствами.

Форма выпуска и упаковка:

Раствор для инъекций и для приема внутрь по 1 мл в прозрачной стеклянной ампуле.

По 1 ампуле вместе с инструкцией по применению помещены в картонную пачку.

Условия хранения:

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

Хранить в местах недоступных для детей.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек:

По рецепту врача

**Произведено для:**

**MAXX-PHARMA LTD**

**Лондон, Великобритания**

The logo consists of the word "MAXX" in a bold, white, serif typeface. The letters are evenly spaced and centered within a light gray, horizontally-oriented rounded rectangle. The overall design is clean and professional.