Альценорм



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ривастигмин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный ингибитор ацетилхолинэстеразы головного мозга. Инактивация фермента обусловлена временным образованием комплекса с ковалентной связью.

Замедление распада ацетилхолина, который выделяется функционально интактными холинергическими нейронами, приводит к облегчению холинергической нейротрансмиссии.

В экспериментальных исследованиях показано, что ривастигмин селективно увеличивает содержание ацетилхолина в коре головного мозга и гиппокампе.

Ривастигмин оказывает положительное влияние на присущие болезни Альцгеймера дефициты когнитивных процессов, опосредуемых холинергическими воздействиями. Кроме того, имеются указания на то, что ингибирование холинэстеразы может замедлить образование фрагментов белкового бета-предшественника амилоида (beta-amiloid-precurcor protein, APP), участвующего в амилоидогенезе, и, следовательно, формирование амилоидных бляшек, являющихся одним из главных патологических признаков болезни Альцгеймера.

Улучшает показатели когнитивной функции, общей физической активности и активности в повседневной жизни, а также снижает выраженность проявлений заболевания.

Фармакокинетика

Ривастигмин связывается с белками плазмы в слабой степени (около 40%), легко проникает через ГЭБ.

Метаболизм ривастигмина происходит главным образом путем гидролиза холинэстеразой с образованием декарбамилированного метаболита, который in vitro продемонстрировал минимальную способность ингибировать ацетилхолинэстеразу (<10%). В соответствии с данными, полученными in vitro и в экспериментальных исследованиях, основные изоферменты цитохрома P450 в минимальной степени вовлечены в метаболизм ривастигмина. Общий плазменный клиренс ривастигмина составляет около 130 л/ч после в/в введения в дозе 0.2 мг и снижается до 70 л/ч после в/в введения 2.7 мг, который согласуется с нелинейным, обратно пропорциональным характером фармакокинетики ривастигмина вследствие его элиминации по мере насыщения.

У пациентов с легко и умеренно выраженными печеночными нарушениями после приепма ривастигмина внутрь отмечалось увеличение C_{max} примерно на 60% и AUC более чем в 2 раза по сравнению со здоровыми лицами.

У пациентов с болезнью Альцгеймера и умеренно выраженными нарушениями функции почек после приема

ривастигмина внутрь отмечалось увеличение C_{max} и AUC более чем в 2 раза по сравнению со здоровыми лицами; однако у пациентов с болезнью Альцгеймера и тяжелыми нарушениями функции почек изменений C_{max} и AUC не наблюдалось.

Показания к применению:

Слабая и умеренная деменция альцгеймеровского типа (в случае предполагаемой или установленной болезни Альцгеймера).

Относится к болезням:

- Деменция

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к ривастигмину, другим производным карбамата.

Способ применения и дозы:

Начальная доза - 1-1.5 мг 2 раза/сут. При хорошей переносимости разовая доза может быть увеличена до 3 мг, затем до 4.5 и до 6 мг; частота приема - 2 раза/сут; интервал между каждым увеличением дозы должен составлять не менее 2 недель. С целью достижения наилучшего терапевтического эффекта дозу ривастигмина следует сохранять на максимальном хорошо переносимом уровне.

Побочное действие со стороны ЖКТ или снижение массы тела, наблюдающиеся во время лечения, можно уменьшить, пропустив один или нескольких приемов. Если побочное действие сохраняется, то суточную дозу следует понизить до предыдущего, хорошо переносимого уровня.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: повышенная утомляемость, астения, головокружение, головная боль, возбуждение, бессонница, нарушения ориентации, депрессия, сонливость.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, боли в животе, потеря аппетита.

Прочие: случайная травма, инфекции верхних дыхательных путей, инфекции мочевыводящих путей, повышенное потоотделение, чувство недомогания, снижение массы тела и тремор.

Тошнота, рвота, потеря аппетита и снижение массы тела чаще отмечались у женщин.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения ривастигмина при беременности у человека в настоящее время не установлена. Применение возможно только в случаях, когда ожидаемая польза лечения для матери превышает потенциальный риск для плода.

Неизвестно, выделяется ли ривастигмин с грудным молоком у человека, поэтому при необходимости применения в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Ривастигмин метаболизируется преимущественно путем гидролиза при участии эстераз. Метаболизм при участии основных изоферментов системы цитохрома P450 происходит в минимальной степени. Следовательно, фармакокинетическое взаимодействие с другими лекарственными средствами, метаболизирующимися с участием данных ферментов, маловероятно.

При одновременном применении с антихолинергическими препаратами возможно изменение активности антихолинергических препаратов.

При одновременном применении возможно усиление действия деполяризующих миорелкасантов во время наркоза.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с СССУ или тяжелыми аритмиями, повышенном риске эрозивно-язвенных поражений ЖКТ, заболеваниях органов дыхания (в т.ч. в анамнезе), при обструкции мочевыводящих путей, судорогах. Опыт применения ривастигмина у пациентов с бронхиальной астмой в фазе обострения отсутствует.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

С осторожностью применять у пациентов, деятельность которых требует концентрации внимания и высокой скорости психомоторных реакций.

Источник: http://drugs.thead.ru/Alcenorm