Азилект



Код АТХ:

- N04BD02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Разагилин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого или почти белого цвета, круглые, плоскоцилиндрические, с фаской, с гравировкой "GIL 1" на одной стороне таблетки.

	1 таб.
разагилина мезилат	1.56 мг,
что соответствует содержанию разагилина	1 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный - 20 мг, крахмал кукурузный прежелатинизированный - 20 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.2 мг, маннитол - 159.24 мг, стеариновая кислота - 4 мг, тальк - 4 мг.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты
- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противопаркинсоническое средство, ингибитор МАО. Азилект - селективный необратимый ингибитор МАО типа В, фермента, на 80% определяющего активность МАО в головном мозге и метаболизм допамина. Разагилин в 30-80 раз активнее в отношении МАО типа В, по сравнению с МАО типа А.

В результате ингибирующего действия препарата на МАО типа В в ЦНС повышается уровень допамина, снижается образование токсичных свободных радикалов, избыточное образование которых наблюдается при болезни Паркинсона. Разагилин обладает также нейропротекторным действием.

В отличие от неселективных ингибиторов МАО, препарат в терапевтических дозах не блокирует метаболизм поступающих с пищей биогенных аминов (например, тирамина), в связи с чем не вызывает тирамин-обусловленного гипертензивного синдрома ("сырный" эффект).

Фармакокинетика

Всасывание

Разагилин быстро всасывается после приема внутрь, C_{max} в плазме крови достигается через 0.5 ч. Абсолютная биодоступность препарата после однократного введения составляет около 36%. Пища не влияет на время достижения C_{max} разагилина в крови, однако при потреблении жирной пищи C_{max} и AUC снижаются на 60% и 20% соответственно.

Фармакокинетика препарата имеет линейный характер в диапазоне доз 0.5-2 мг.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови колеблется от 60% до 70%.

Метаболизм

Разагилин почти полностью метаболизируется в печени. Биотрансформация осуществляется путем N-деалкилирования и/или гидроксилирования с образованием основного биологически малоактивного метаболита — 1-аминоиндана, а также двух других метаболитов — 3-гидрокси-N-пропаргил-1-аминоиндана и 3-гидрокси-1-аминоиндана. Метаболизм препарата осуществляется при участии изофермента CYP1A2.

Выведение

Разагилин выводится преимущественно почками (более 60%) и в меньшей степени через кишечник (более 20%). Менее 1% введенной дозы препарата выделяется в неизменном виде. $T_{1/2}$ составляет 0.6-2 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Параметры фармакокинетики разагилина практически не меняются у пациентов с почечной недостаточностью легкой и средней степени.

При печеночной недостаточности легкой степени может наблюдаться повышение значений параметров AUC и C_{max} на 80% и 38%, а у пациентов с умеренными нарушениями функции печени эти параметры достигают более 500% и 80% соответственно.

Показания к применению:

— лечение болезни Паркинсона (в виде монотерапии или комбинированной терапии с препаратами леводопы).

Противопоказания:

— умеренная или тяжелая печеночная недостаточность (класс В и С по шкале Чайлд-Пью);

— феохромоцитома;

— сопутствующая терапия петидином или другими ингибиторами МАО (перерыв между отменой разагилина и началом терапии этими препаратами должен быть не менее 14 дней);

— совместная терапия с симпатомиметиками (в т.ч. с препаратами, в которых они содержатся), другими деконгестантами, декстрометорфаном, а также с лекарственными препаратами их содержащими;

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— беременность;

— период лактации (риск угнетения продукции молока на фоне торможения образования пролактина);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* назначают препарат при легкой печеночной недостаточности, совместно с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина, трициклическими и тетрациклическими антидепрессантами, активными ингибиторами изофермента CYP1A2.

Способ применения и дозы:

Назначают по 1 мг 1 раз/сут как в виде монотерапии, так и на фоне применения леводопы, длительно.

Таблетки принимают внутрь независимо от приема пищи.

Побочное действие:

Перечисленные побочные эффекты встречались с частотой >1/100, а также редко - 1/100-1/1000.

При монотерапии разагилином

Со стороны нервной системы: головные боли, депрессия, головокружение, анорексия, судороги, галлюцинации; редко - нарушение мозгового кровообращения.

Со стороны пищеварительной системы: снижение аппетита, диспептические явления.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, артрит, боль в области шеи.

Дерматологические реакции: везикулобуллезная сыпь, контактный дерматит; редко - карцинома кожи.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: стенокардия; редко - инфаркт миокарда.

Прочие: гриппоподобный синдром, лихорадка, лейкопения, ринит, общая слабость, конъюнктивит, острые нарушения мочевыводящей системы, аллергические реакции.

При применении вместе с леводопой

Со стороны нервной системы: дискинезия, мышечная дистония, анорексия, необычные сновидения, атаксия, галлюцинации; редко - нарушение мозгового кровообращения, растерянность.

Со стороны пищеварительной системы: запор, рвота, боль в животе, сухость во рту.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, боль в области шеи, тендосиновит.

Дерматологические реакции: сыпь; редко - меланома кожи.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: постуральная гипотензия; редко - стенокардия.

Прочие: случайные падения, снижение массы тела, аллергические реакции.

Имеются два сообщения о развитии рабдомиолиза и нарушении секреции АДГ. Оба случая зафиксированы при проведении пострегистрационных исследований без плацебо контроля, развились на фоне падения и последующей длительной иммобилизации. Взаимосвязь между этими осложнениями и приемом разагилина определить невозможно.

Передозировка:

Симптомы передозировки препарата Азилект сходны с таковыми при передозировке неселективными ингибиторами МАО (в т.ч. артериальная гипертензия, постуральная гипотензия).

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля, симптоматическая терапия. Специфического антидота нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

В связи с тем, что механизм действия разагилина связан с ингибированием МАО, его нельзя назначать одновременно с другими ингибиторами этого фермента из-за риска развития гипертонического криза.

При одновременном применении разагилина с ингибиторами обратного захвата серотонина (в т.ч. флуоксетин, флувоксамин), трициклическими и тетрациклическими антидепрессантами, ингибиторами МАО возможно развитие серотонинового синдрома, проявляющегося в спутанности сознания, гипоманиакальном состоянии, двигательном беспокойстве, ознобе, треморе, диарее. Пациентам, получающим разагилин, не рекомендуется назначать такие препараты. При необходимости комбинированной терапии требуется осторожность.

Не рекомендуется также совместное применение разагилина с симпатомиметическими лекарственными средствами, включающими эфедрин, псевдоэфедрин, содержащимися в препаратах для лечения ринитов или простуды (деконгестантах). Кроме того, не рекомендуется назначение разагилина с анальгезирующим/противокашлевым препаратом декстрометорфаном и содержащими его комбинированными средствами.

В связи с тем, что изофермент CYP1A2 участвует в метаболизме разагилина, активные ингибиторы этого фермента (например, ципрофлоксацин) могут повышать концентрацию препарата в плазме крови, поэтому при таких комбинациях требуется осторожность.

У пациентов с болезнью Паркинсона применение препаратов леводопы не оказывает влияния на клиренс разагилина.

Особые указания и меры предосторожности:

Применение Азилекта в рекомендуемой терапевтической дозе не вызывает тираминового синдрома ("сырный" эффект), что позволяет пациентам без ограничений использовать в пище продукты, содержащие значимые количества тирамина (сыры, шоколад).

Имеются данные о том, что болезнь Паркинсона, а не применение какого-либо лекарственного средства, в т.ч. препарата Азилект, является фактором риска для развития рака кожи, в частности меланомы. Необходимо предупреждать пациента о необходимости обращаться к врачу при появлении каких-либо патологических изменений кожных покровов.

Необходимо иметь в виду, что такие симптомы, как галлюцинации и растерянность, которые появляются на фоне лечения препаратом Азилект, могут быть рассмотрены и как проявление болезни Паркинсона, и как побочные реакции препарата Азилект.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Изучение влияния разагилина на вождение автомобиля и управление другими механизмами не проводилось. Однако, учитывая возможность появления значимых побочных эффектов со стороны ЦНС, в период лечения препаратом Азилект необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Параметры фармакокинетики разагилина практически не меняются у пациентов с почечной недостаточностью легкой и средней степени.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при умеренной или тяжелой печеночной недостаточности (класс B и C по шкале Чайлд-Пью).

Применение в детском возрасте

Противопоказано: детский и подростковый возраст до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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