Леводопа+Бенсеразид

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Капсулы твердые №00 корпус и крышечка непрозрачные, белого или почти белого цвета; содержимое капсулы - порошок или уплотненная порошковая масса от почти белого или белого с желтоватым оттенком цвета до белого с красновато-коричневатым или коричневатым оттенком цвета.

	1 капс.
леводопа	200 мг
бенсеразида гидрохлорид	57 мг
что соответствует содержанию бенсеразида	50 мг

Вспомогательные вещества: натрия лаурилсульфат - 1 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 64 мг, кальция гидрофосфат - 150 мг, кремния диоксид коллоидный - 15 мг, кросповидон - 10 мг, магния стеарат - 3 мг.

Состав корпуса капсулы: титана диоксид - 2%, желатин - до 100%.
Состав крышечки капсулы: титана диоксид - 2%, желатин - до 100%.

20 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
30 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
50 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
60 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
80 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
90 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
100 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
120 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
150 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
200 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (4) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (5) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (8) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (9) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (10) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (12) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (15) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (16) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (18) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (20) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Леводопа/бенсеразид - комбинированное противопаркинсоническое лекарственное средство, содержащее предшественник дофамина и ингибитор переферической декарбоксилазы ароматических L-аминокислот. При паркинсонизме нейромедиатор дофамин образуется в базальных ядрах в недостаточных количествах. Заместительная терапия проводится путем применения леводопы - непосредственного метаболического предшественника допамина. Большая часть леводопы превращается в дофамин в периферических тканях (кишечник, печень, почки, сердце, желудок), который не участвует в реализации противопаркинсонического эффекта, поскольку периферический дофамин плохо проникает через ГЭБ, а также ответственен за большинство ее нежелательных реакций. Блокирование экстрацеребрального декарбоксилирования леводопы является весьма желательным. Это достигается одновременным введением леводопы и бенсеразида - ингибитора периферической декарбоксилазы ароматических L-аминокислот, который снижает образование допамина в периферических тканях, что косвенным образом приводит к повышению количества леводопы, поступающей в ЦНС - с одной стороны, и к уменьшению проявлений нежелательных реакций леводопы - с другой. Комбинация этих веществ в соотношении 4:1 обладает такой же эффективностью, как и леводопа в высоких дозах.

Фармакокинетика

Всасывание происходит в основном в верхних отделах тонкой кишки. Время достижения C_{max} леводопы в плазме составляет 1 ч. C_{max} в плазме и степень всасывания возрастают пропорционально дозе.

Прием пищи уменьшает скорость и степень всасывания.

Леводопа проходит через ГЭБ посредством насыщаемой транспортной системы и не связывается с белками плазмы.

Бенсеразид в терапевтических дозах не проникает через ГЭБ, накапливается, главным образом, в почках, легких, тонкой кишке и печени.

$T_{1/2}$ основного метаболита из плазмы составляет 15-17 ч, и у пациентов, принимающих терапевтические дозы препарата, происходит его накопление.

$T_{1/2}$ леводопы составляет 1.5 ч. Клиренс леводопы из плазмы составляет примерно 430 мл/мин.

Бенсеразид почти полностью элиминируется путем метаболизма. Метаболиты выводятся, главным образом, с мочой и, в меньшей степени, с калом.

Показания к применению:

Болезнь Паркинсона, синдром паркинсонизма (за исключением вызванного антипсихотическими средствами).

Синдром "беспокойных ног", в т.ч. идиопатический и у больных с хронической почечной недостаточностью, получающих диализ.

Относится к болезням:

- Паркинсонизм

Противопоказания:

Тяжелые нарушения деятельности сердечно-сосудистой, эндокринной системы, печени, почек (за исключением пациентов с синдромом "беспокойных ног", получающих диализ), психические заболевания с психотическим компонентом, закрытоугольная глаукома, одновременный прием неселективных ингибиторов МАО или комбинации ингибиторов МАО типа А и МАО типа В, беременность, период лактации, женщины детородного возраста, не использующие надежные методы контрацепции, возраст до 25 лет; повышенная чувствительность к леводопе и/или бенсеразиду.

Способ применения и дозы:

Дозу устанавливают индивидуально, в зависимости от показаний, клинической ситуации, применяемой лекарственной формы.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: анорексия, тошнота, рвота, диарея, потеря или изменение вкусовых ощущений, сухость слизистой оболочки полости рта.

Со стороны кожных покровов: зуд, сыпь.

Со стороны мочевыделительной системы: возможно незначительное изменение цвета мочи (как правило, приобретает красный оттенок и темнеет при отстаивании.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмия, ортостатическая гипотензия (ослабевает после уменьшения дозы), повышение АД.

Со стороны системы кроветворения: гемолитическая анемия, транзиторная лейкопения, тромбоцитопения, сокращение тромбопластинового времени.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, на более поздних стадиях лечения - самопроизвольные движения (хорея, атетоз), эпизоды "застывания", ослабление эффекта к концу действия дозы, феномен "включения-выключения", выраженная сонливость, эпизоды внезапной сонливости, усиление симптомов синдрома "беспокойных ног", ажитация, тревога, бессонница, галлюцинации, бред, временная дезориентация, депрессия.

Со стороны дыхательной системы: ринит, бронхит.

Со стороны лабораторных показателей: транзиторное повышение активности "печеночных" трансаминаз и ЩФ, повышение азота мочевины крови. Возможно изменение цвета или окрашивание биологических жидкостей или тканей, в частности, слюны, языка, зубов или слизистой оболочки полости рта.

Прочие: фебрильная инфекция.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Диагнозы

- Бессонница
- Болезнь Альцгеймера
- Боли в спине
- Вертебро-базилярная недостаточность

Особые указания и меры предосторожности:

Недопустимо внезапное прекращение приема леводопы; резкая отмена может приводить к развитию ЗНС.

Пациентам с открытоугольной глаукомой на фоне лечения следует регулярно контролировать внутриглазное давление.

В период лечения необходим контроль функции печени и почек, формулы периферической крови.

У пациентов с инфарктом миокарда, ИБС или аритмией в анамнезе необходимо регулярно оценивать функцию сердца (в частности, с помощью ЭКГ).

Препарат не должен применяться у пациентов со злокачественной меланомой (в т.ч. в случае предполагаемого диагноза, наличия недиагностированных образований кожи или при злокачественной меланоме в анамнезе).

У больных сахарным диабетом необходим частый контроль концентрации глюкозы в плазме крови и при необходимости коррекция дозы гипогликемических ЛС.

Лечение проводят вплоть до проведения хирургического вмешательства, требующего общей анестезии (за исключением применения галотана).

Лечение комбинацией леводопа+бенсеразид может повлиять на результаты лабораторного определения катехоламинов, креатинина, мочевой кислоты и глюкозы; возможна ложноположительная проба Кумбса.

У некоторых пациентов, принимающих агонисты допаминовых рецепторов, отмечены случаи патологического влечения к азартным играм, усиление либидо и гиперсексуальности.

У некоторых пациентов с болезнью Паркинсона отмечено появление поведенческих и когнитивных расстройств в результате неконтролируемого применения возрастающих доз препарата.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами.

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций; при возникновении эпизодов сонливости следует отказаться от вождения транспортных средств.

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