Лейковорин-Тева (раствор)



Код АТХ:

- V03AF03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Кальция фолинат

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Раствор для в/в и в/м введения прозрачный, желтоватого цвета.

	1 мл
кальция фолината пентагидрат	12.71 мг,
что соответствует содержанию кальция фолината	10.8 мг
в пересчете на фолиниевую кислоту	10 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, натрия гидроксид 1% или хлористоводородная кислота 1М, вода д/и.

5 мл - флаконы (1) - пачки картонные.
10 мл - флаконы (1) - пачки картонные.
20 мл - флаконы (1) - пачки картонные.
30 мл - флаконы (1) - пачки картонные.
50 мл - флаконы (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики
- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кальция фолинат является восстановленной формой фолиевой кислоты и используется в качестве антидота лекарственных средств, которые действуют как антагонисты фолиевой кислоты.

Антагонисты фолиевой кислоты, такие как метотрексат, ингибируют дигидрофолатредуктазу и, тем самым, препятствуют образованию из фолиевой кислоты тетрагидрофолата, который является кофактором переноса одноуглеродных остатков в биосинтезе нуклеиновых кислот. В результате происходит блокирование синтеза нуклеиновых кислот и клеточного деления. Кальция фолинат в отличие фолиевой кислоты не требует

восстановления дигидрофолатредуктазой для превращения в тетрагидрофолат, что позволяет при его применении восстановить нарушенный процесс биосинтеза ДНК, РНК и белков. Защитное действие кальция фолината проявляется только в отношении здоровых клеток. За счет указанных свойств кальция фолинат предотвращает токсическое действие метотрексата на клетки костного мозга и желудочно-кишечного тракта, но не влияет существенно на уже развившийся нефротоксический эффект метотрексата.

Препарат способствует восполнению дефицита в организме фолиевой кислоты.

Кальция фолинат также может усиливать противоопухолевое действие фторурацила. При взаимодействии этих двух препаратов образуется стабильный комплекс компонентов, содержащий тимидилат синтетазу, ингибирующий и подавляющий синтез ДНК.

Начало действия препарата при в/м введении - через 10-20 минут, при в/в введении - менее чем через 5 минут. Продолжительность действия - около 3-6 ч независимо от способа введения.

Фармакокинетика

C_{max} восстановленного фолата в сыворотке крови при в/м введении достигается в среднем через 40 минут, при в/в – через 10 минут и при приеме внутрь через 1 ч 40 минут. Проникает через гематоэнцефалический барьер в умеренных количествах; в большей степени накапливается в печени. Метаболизируется в печени и слизистой оболочке кишечника преимущественно в активный метаболит 5-метилтетрагидрофолат. Период полувыведения – 6.2 ч независимо от способа введения.

Выводится почками 80-90%, кишечником – 5-8%.

Показания к применению:

— интоксикация антагонистами фолиевой кислоты (метотрексатом, триметопримом и пириметамином);

— профилактика токсического действия метотрексата, применяемого в высоких дозах;

— колоректальный рак (в составе комбинированной терапии с фторурацилом);

— мегалобластная анемия, вызванная дефицитом фолиевой кислоты (в т.ч.на фоне синдрома мальабсорбции, недостаточности питания, беременности, спру, в раннем детском возрасте при врожденной недостаточности дигидрофолатредуктазы).

Относится к болезням:

- Интоксикация
- Рак

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к кальция фолинату или любому другому компоненту, входящему в состав препарата;

— мегалобластная анемия, обусловленная дефицитом цианокобаламина (витамина B_{12});

— беременность и период кормления грудью.

С осторожностью: при алкоголизме, эпилепсии, хронической почечной недостаточности (ХПН), детский возраст до 2 лет (безопасность и эффективность не установлена).

Способ применения и дозы:

Раствор вводится в/м или в/в.

При выборе доз и режима введения препарата в каждом индивидуальном случае следует обращаться к специальной литературе.

Обычно при назначении препарата в сочетании с высокими дозами метотрексата (12-15 мг/м$^{2)}$ введение начинают через 24 ч после окончания лечения метотрексатом в дозе: 10 мг/м^2 каждые 6 ч в течение 72 ч или до достижения концентрации метотрексата в плазме крови менее 5x10^{-8} М.

У больных с кислой реакцией мочи, экссудативными выпотами, нарушением функции почек, непроходимостью

кишечника может потребоваться более высокая доза кальция фолината и/или большая продолжительность лечения, так как выведение метотрексата у этой группы пациентов может быть замедленно. Применение Лейковорина-Тева в этих случаях рекомендуется основывать на обязательном определении концентрации метотрексата в плазме крови.

Для профилактики развития ХПН проводят гидратацию (3 л/сут) и вводят натрия гидрокарбонат для поддержания pH мочи на уровне 7 или выше.

При случайной передозировке метотрексата Лейковорин-Тева вводится в дозе равной или превышающей дозу введенного метотрексата не позднее чем, через 1 ч после инъекции метотрексата, далее препарат вводится каждые 3 ч по 10 мг/м^2 до исчезновения признаков токсичности.

При сочетании с фторурацилом Лейковорин-Тева вводится:

— в дозе 200 мг/м^2 в/в медленно (не менее 3 минут) или в/в капельно с последующим в/в введением фторурацила в дозе 370 мг/м^2 или

— в дозе 20 мг/м^2 в/в с последующим в/в введением фторурацила в дозе 425 мг/м^2.

Препараты вводятся ежедневно в течение 5 дней с интервалом 4-5 недель для повторных курсов.

При лечении мегалобластной анемии, вызванной дефицитом фолиевой кислоты Лейковорин-Тева назначают по 1 мг/сут в/м или в/в.

Приготовление препарата для инъекций

Препарат Лейковорина-Тева разводят в р-ре Рингера; р-ре Рингера с лактатом; 10% р-ре декстрозы в воде; 5% р-ре декстрозы в воде; 0.9% р-ре натрия хлорида до концентрации от 0.06 мг/мл до 1 мг/мл. Полученный раствор сохраняет стабильность в течение 24 ч. Оставшийся после инъекции раствор не использовать.

Побочное действие:

Перечисленные ниже нежелательные явления, отмеченные при применении препарата Лейковорин-Тева, распределены по частоте возникновения в соответствии со следующей градацией: очень часто(≥1/10), часто (от ≥1/100 до <1/10), нечасто (от ≥1/1000 до <1/100), редко (от ≥1/10000 до <1/1000), крайне редко (<1/10000).

Со стороны иммунной системы: очень редко – аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница, зуд, анафилактический шок.

Со стороны нервной системы: редко – бессонница, ажитация, депрессия, возбуждение, повышение частоты эпилептических припадков.

Со стороны органов пищеварения: редко – диспепсические явления (при применении высоких доз кальция фолината).

Прочие: нечасто – лихорадка.

Передозировка:

Кальция фолинат мало токсичен. Даже при применении высоких доз признаков передозировки не наблюдается.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Запрещено принимать при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Кальция фолинат при одновременном применении снижает эффективность антагонистов фолиевой кислоты.

Уменьшает противосудорожную активность фенобарбитала, фенитоина и примидона. Его применение может привести к усилению как терапевтического, так и токсического действия фторурацила, в связи с чем при совместном применении дозы фторурацила должны быть снижены.

Особые указания и меры предосторожности:

Применение кальция фолината при пернициозной и других мегалобластных анемиях, обусловленных дефицитом цианокобаламина (витамина B_{12}), может привести к гематологической ремиссии с одновременным прогрессированием неврологических расстройств.

Может повышать частоту эпилептических припадков у предрасположенных к ним детей вследствие снижения эффекта противоэпилептических препаратов – производных гидантоина и примидона (гексамидина).

С осторожностью применяют кальция фолинат при кислой реакции мочи, асците, обезвоживании, экссудативном плеврите, нарушении функции почек.

Перед началом и в процессе терапии следует контролировать функцию почек, pH мочи.

При случайной передозировке метотрексата прием кальция фолината следует начать как можно быстрее.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применять при хронической почечной недостаточности (ХПН), при нарушении функции почек.

Применение в детском возрасте

С осторожностью: детский возраст до 2 лет (безопасность и эффективность не установлена).

Условия хранения:

Список Б.

Препарат следует хранить при температуре от 2 до 8°С, в защищенном от света месте.

Хранить в недоступном для детей месте.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Leykovorin-Teva_rastvor