

Лейковорин Лахема



Код АТХ:

- [V03AF03](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Кальция фолинат](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[PLC VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Лиофилизат для приготовления раствора для в/в и в/м введения в виде аморфной или спрессованной массы светло-желтого цвета.

	1 фл.
кальция фолината пентагидрат	12.7 мг,
что соответствует содержанию фолиниевой кислоты	10 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, натрия гидроксид.

Флаконы (1) - пачки картонные.

Флаконы (10) - пачки картонные.

Лиофилизат для приготовления раствора для в/в и в/м введения в виде аморфной или спрессованной массы светло-желтого цвета.

	1 фл.
кальция фолината пентагидрат	31.8 мг,
что соответствует содержанию фолиниевой кислоты	25 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, натрия гидроксид.

Флаконы (1) - пачки картонные.

Флаконы (10) - пачки картонные.

Раствор для в/в введения прозрачный, от светло-желтого до желтого цвета.

	1 мл	1 фл.
кальция фолината пентагидрат	10.8 мг	486 мг,
что соответствует содержанию фолиниевой кислоты	10 мг	450 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, динатрия эдетат, натрия гидроксид, азот, вода д/и.

45 мл - флаконы бесцветного стекла (1) - пачки картонные.

45 мл - флаконы бесцветного стекла (5) - пачки картонные.

Раствор для в/в введения прозрачный, от светло-желтого до желтого цвета.

	1 мл	1 фл.
--	-------------	--------------

Лейковорин Лахема

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

кальция фолината пентагидрат	10.8 мг	864 мг,
что соответствует содержанию фолиниевой кислоты	10 мг	800 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, динатрия эдетат, натрия гидроксид, азот, вода д/и.

80 мл - флаконы бесцветного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Метаболики](#)
- [Метаболики](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Лейковорин Лахема - производное тетрафолиевой кислоты, является восстановленной формой фолиевой кислоты и используется в качестве антидота лекарственных средств, которые действуют как антагонисты фолиевой кислоты. Это соединение известно также как фолиниевая кислота.

Антагонисты фолиевой кислоты, такие как метотрексат, ингибируют дигидрофолатредуктазу и, тем самым, препятствуют образованию из фолиевой кислоты тетрагидрофолата, который служит важным кофактором переноса одноуглеродных остатков в биосинтезе нуклеиновых кислот. В результате происходит блокирование синтеза нуклеиновых кислот и клеточного деления. Кальция фолинат в отличие от 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. Предотвращает токсическое действие метотрексата на клетки костного мозга и ЖКТ, но не влияет существенно на уже оказанный нефротоксический эффект метотрексата.

Способствует восполнению дефицита фолиевой кислоты в организме.

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

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

Фармакокинетика

C_{max} при в/м введении 15 мг препарата достигается через 1.72 ч и составляет 241 нг/мл. При в/в введении 25 мг C_{max} (1259 нг/мл) достигается уже через 10 мин.

Проникает через ГЭБ в умеренных количествах; в большей степени накапливается в печени. Метаболизируется в печени и слизистой оболочке кишечника преимущественно в активный метаболит 5-метилтетрагидрофолат. C_{max} восстановленного фолата в сыворотке крови достигается при в/м введении препарата в среднем через 40 мин. $T_{1/2}$ - 6.2 ч независимо от способа введения.

Выводится, в основном, почками - 80-90%, с каловыми массами - 5-8%.

Показания к применению:

- интоксикация антагонистами фолиевой кислоты (метотрексатом, триметопримом, пириметамином);
- профилактика токсического действия метотрексата при применении его в повышенных и высоких дозах;
- колоректальный рак (в составе комплексной терапии с фторурацилом);
- мегалобластная анемия на фоне дефицита 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:

- мегалобластная анемия, обусловленная дефицитом цианокобаламина (витамина В12);
- повышенная чувствительность к кальция фолинату или любому другому веществу, входящему в состав препарата.

С *осторожностью* - алкоголизм, эпилепсия, хроническая почечная недостаточность, детский возраст до 2-х лет (безопасность и эффективность для детей не установлены).

Способ применения и дозы:

Вводится в/м или в/в.

В связи с тем, что используются разные схемы применения Лейковорина Лахема, при выборе конкретной дозы врач должен руководствоваться специальной медицинской литературой.

Все ниже указанные дозы рассчитаны в соответствии с пересчетом на фолиниевую кислоту.

Обычно при назначении препарата в сочетании с высокими дозами метотрексата (12-15 г/м²) введение начинают через 24 ч после окончания лечения метотрексатом в дозе 10 мг/м² каждые 6 ч в течение 72 ч или до достижения концентрации метотрексата в плазме крови менее 5 x 10⁻⁸М.

У *больных с кислой реакцией мочи, экссудативными выпотами, нарушением функции почек, непроходимостью кишечника* может потребоваться более высокая доза Лейковорина Лахема и/или большая продолжительность лечения, т.к введение метотрексата у этой группы пациентов может быть замедленно. Применение Лейковорина Лахема 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 рН мочи на уровне 7 или выше.

При случайной передозировке метотрексата Лейковорин Лахема 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/м² до исчезновения признаков токсичности.

При сочетании с фторурацилом Лейковорин Лахема вводится в дозе 200 мг/м² в/в медленно (не менее 3 мин) или в/в капельно с последующим в/в введением фторурацила в дозе 370 мг/м² или в дозе 20 мг/м² в/в с последующим в/в введением фторурацила в дозе 425 мг/ м².

Препараты вводят ежедневно в течение 5 дней с интервалом 4-5 недель между повторными курсами.

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

Для приготовления раствора для инъекций во флакон с лиофилизатом для приготовления раствора для в/в и в/м введения добавить 1 мл воды для инъекций.

Перед в/в введением препарата в виде инфузии раствор для в/в и в/м введения разводят 5% раствором декстрозы или 0.9% раствором натрия хлорида для инъекций.

Инфузионный раствор следует использовать сразу после его приготовления. В том случае, если раствор не был введен сразу, его хранят в асептических условиях при температуре 2°-8°С не более 24 ч.

Побочное действие:

Аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница, зуд, анафилактический шок, возможна лихорадка.

При применении высоких доз возможны диспептические нарушения.

Редко - нарушение сна, возбуждение.

Передозировка:

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

Применение при беременности и кормлении грудью:

Исследования кальция фолината на репродуктивную функцию у животных и людей не проводились. Неизвестно, оказывает ли кальций фолинат вредное воздействие на плод при назначении препарата беременным и может ли он влиять на репродуктивную функцию. Неизвестно, проникает ли кальций фолинат в молоко матери.

Применение препарата при беременности и в период лактации возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Снижает эффективность антагонистов фолиевой кислоты.

Уменьшает противосудорожную активность фенобарбитала, фенитоина и примидона.

Может привести к усилению как терапевтического, так и токсического действия фторурацила, в связи с чем, при совместном применении дозы фторурацила должны быть снижены.

Не следует применять препарат одновременно с инфузионными растворами, содержащими гидрокарбонат, в связи с химической нестабильностью кальция фолината.

Непосредственное смешивание в одном шприце дроперидола и кальция фолината может привести к выпадению осадка.

Особые указания и меры предосторожности:

Применение кальция фолината при пернициозной и других мегалобластных анемиях, обусловленных дефицитом цианокобаламина, 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).

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* - хроническая почечная недостаточность.

Условия хранения:

Лиофилизат следует хранить при температуре не выше 25°C в защищенном от света месте. Приготовленный раствор хранится в течение 12 ч.

Раствор для в/в введения следует хранить при температуре 2°-8°C в защищенном от света месте. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности лиофилизата - 2 года, раствора для в/в введения - 3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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