Наком



Код АТХ:

- N04BA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Карбидопа
- Леводопа

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки голубого цвета с белыми вкраплениями и отдельными вкраплениями темно-голубого цвета, овальные, двояковыпуклые, с насечкой на одной стороне.

	1 таб.
леводопа	250 мг
карбидопа	25 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, крахмал прежелатинизированный, крахмал кукурузный, краситель голубой (индиготин Е132), магния стеарат.

10 шт. - блистеры (10) - коробки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противопаркинсонический препарат. Леводопа уменьшает симптомы болезни Паркинсона за счет повышения содержания допамина в головном мозге. Карбидопа, которая не проникает через ГЭБ, препятствует экстрацеребральному декарбоксилированию леводопы, увеличивая тем самым ее количество, попадающее в головной мозг и преобразующееся в допамин.

Наком оказывает более выраженный терапевтический эффект по сравнению с леводопой, обеспечивает длительное поддержание терапевтической концентрации леводопы в плазме при дозах, которые примерно на 80% ниже тех, которые требуются в случае применения одной леводопы.

Действие препарата проявляется в течение первых суток с начала приема, иногда - после приема первой дозы. Максимальный эффект достигается в течение 7 дней.

Фармакокинетика

Карбидопа

Всасывание

После приема внутрь карбидопы в разовой дозе у пациентов с болезнью Паркинсона T_{max} составляет от 1.5 ч до 5 ч.

Метаболизм и выведение

Метаболизируется в печени.

Среди метаболитов, экскретируемых с мочой, основными являются альфа-метил-3-метокси-4-гидроксифенилпропионовая кислота, а также альфа-метил-3.4-дигидроксифенилпропионовая кислота, которые составляют около 14% и 10% экскретируемых метаболитов соответственно. В меньших количествах обнаруживаются два других метаболита. Один из них идентифицирован как 3.4-дигидроксифенил-ацетон, другой - предварительно как N-метил-карбидопа. Содержание каждого из этих веществ составляет не более 5% от общего количества метаболитов. В моче также обнаруживается неизмененная карбидопа. Конъюгаты не выявлены.

Выведение

Экскреция с мочой неизмененного препарата в основном завершается в течение 7 ч и составляет 35%.

Леводопа

Всасывание

Леводопа быстро всасывается из ЖКТ и активно метаболизируется. Несмотря на то, что образуется более 30 различных метаболитов, в основном леводопа преобразуется в допамин, эпинефрин, норэпинефрин.

После приема внутрь леводопы в разовой дозе у пациентов с болезнью Паркинсона T_{max} составляет 1.5-2 ч и удерживается на терапевтическом уровне в течение 4-6 ч.

Выведение

Метаболиты быстро экскретируются с мочой - в течение 2 ч выводится около 1/3 дозы.

$T_{1/2}$ леводопы составляет около 50 мин.

При приеме комбинации карбидопы и леводопы $T_{1/2}$ леводопы увеличивается приблизительно до 1.5 ч.

Влияние карбидопы на метаболизм леводопы

Карбидопа повышает концентрацию леводопы в плазме крови. При предшествующем приеме карбидопы концентрация леводопы в плазме крови повышается примерно в 5 раз, а время поддержания терапевтической концентрации в плазме увеличивается от 4 до 8 ч. При одновременном приеме карбидопы и леводопы были получены сходные результаты.

У пациентов с болезнью Паркинсона, которые предварительно принимали карбидопу, при приеме леводопы в однократной дозе $T_{1/2}$ леводопы возрастал от 3 до 15 ч. Концентрация леводопы повышается за счет карбидопы, по крайней мере, в 3 раза. Концентрация допамина и гомованильной кислоты в плазме крови и в моче снижается при предварительном приеме карбидопы.

Показания к применению:

— лечение болезни Паркинсона и синдрома паркинсонизма.

Относится к болезням:

- Паркинсонизм

Противопоказания:

— закрытоугольная глаукома;

— меланома установленная или подозреваемая;

— кожные заболевания неизвестной этиологии;

— одновременный прием с неселективными ингибиторами МАО (прием ингибиторов МАО следует прекратить за 2 недели до начала приема леводопы);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при тяжелых заболеваниях сердечно-сосудистой системы, в т.ч. при инфаркте миокарда с нарушениями сердечного ритма (в анамнезе), сердечной недостаточности, тяжелых заболеваниях дыхательной системы, включая бронхиальную астму, судорожных припадках (в анамнезе), включая эпилептические, эрозивно-язвенных поражениях ЖКТ (из-за возможности возникновения кровотечения из верхних отделов ЖКТ), декомпенсированных заболеваниях эндокринной системы, включая сахарный диабет, почечной недостаточности тяжелой степени, тяжелой печеночной недостаточности, открытоугольной глаукоме.

Способ применения и дозы:

Оптимальную суточную дозу определяют путем тщательного индивидуального подбора. Форма таблетки позволяет делить ее на две части с минимальным усилием.

В процессе лечения может потребоваться коррекция как индивидуально подобранной дозы, так и частоты приема препарата. Как показали исследования, периферическая допа-декарбоксилаза насыщается карбидопой при приеме последней в дозе около 70-100 мг/сут. У пациентов, получающих карбидопу в меньшей дозе, возможны тошнота и рвота.

В случае назначения Накома прием стандартных препаратов для лечения паркинсонизма, за исключением тех, которые содержат одну леводопу, может быть продолжен, при этом их дозы следует подбирать заново.

Начальную дозу подбирают в соответствии с показаниями и реакцией пациента на лечение. Начальная доза препарата Наком составляет 1/2 таб. 1-2 раза/сут. Однако такая доза может не обеспечить оптимального количества карбидопы, которое потребуется пациенту. Поэтому, в случае необходимости, добавляют 1/2 таб. Накома каждый день или через день до достижения оптимального эффекта. Терапевтический эффект наблюдается в первый же день, а иногда - после приема первой дозы. Полный эффект препарата достигается в течение 7 дней.

При переходе с препаратов леводопы прием последних следует прекратить, по крайней мере, за 12 ч до начала лечения препаратом Наком (за 24 ч - в случае применения препаратов леводопы пролонгированного действия). Суточная доза препарата Наком должна обеспечивать примерно 20% предшествующей суточной дозы леводопы.

Для пациентов, принимавших более 1.5 г леводопы, начальная доза Накома составляет 1 таб. 3-4 раза/сут.

При поддерживающей терапии в случае необходимости дозу Накома можно повышать на 1/2-1 таб. каждый день или через день до достижения максимальной дозы - 8 таб./сут. Опыт приема карбидопы в дозе более 200 мг/сут ограничен.

Максимальная рекомендуемая доза препарата Наком составляет 8 таб./сут (200 мг карбидопы и 2 г леводопы). Это примерно 3 мг карбидопы и 30 мг леводопы на 1 кг массы тела (при массе тела пациента 70 кг).

Побочное действие:

Наиболее часто **-** дискинезии, включая непроизвольные движения (в т.ч. хорееподобные, дистонические), а также тошнота.

Ранними признаками, на основании которых может быть принято решение об отмене препарата являются мышечные подергивания и блефароспазм.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: ЗНС, эпизоды брадикинезии ("on-off"-синдром), головокружение, сонливость, парестезия, эпизоды психотических состояний, включая иллюзии, галлюцинации и параноидное мышление, депрессия с развитием суицидальных намерений или без таковых, деменция, расстройства сна, возбуждение, спутанность сознания, повышение либидо.

В редких случаях - судороги, однако причинная связь с приемом препарата Наком не установлена.

Со стороны пищеварительной системы: возможны анорексия, рвота, кровотечение из ЖКТ, обострение язвенной болезни двенадцатиперстной кишки, диарея, потемнение слюны.

Со стороны организма в целом: возможны обмороки, боль в груди.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмии и/или сердцебиение, ортостатические эффекты (в т.ч. эпизоды повышения или снижения АД), флебит.

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, анемия (в т.ч. гемолитическая), тромбоцитопения, агранулоцитоз.

Со стороны дыхательной системы: возможно диспноэ.

Дерматологические реакции: возможны алопеция, сыпь, потемнение секрета потовых желез.

Со стороны мочеполовой системы: потемнение мочи.

Аллергические реакции: ангионевротический отек, крапивница, кожный зуд, болезнь Шенлейн-Геноха.

Другие побочные эффекты, которые могут наблюдаться в результате приема леводопы:

Со стороны пищеварительной системы: диспепсия, сухость во рту, чувство горечи во рту, сиалорея, дисфагия, бруксизм, приступы икоты, боли и чувство дискомфорта в животе, запор, метеоризм, ощущение жжения языка.

Со стороны обмена веществ: снижение или повышение массы тела, отеки.

Со стороны ЦНС: слабость, обмороки, утомляемость, головная боль, астения, снижение мыслительной активности, дезориентация, атаксия, оцепенение, усиление тремора рук, мышечные судороги, тризм, активация скрытого синдрома Бернара-Горнера, бессонница, чувство тревоги, эйфория, психомоторное возбуждение, неустойчивость походки.

Со стороны органов чувств: диплопия, нечеткость зрения, расширение зрачков, окулогирные кризы.

Со стороны мочеполовой системы: задержка мочеиспускания, недержание мочи, приапизм.

Прочие: охриплость голоса, недомогание, "приливы" крови к коже лица, шеи и грудной клетки, диспноэ, злокачественная меланома.

Со стороны лабораторных показателей: повышение активности ЩФ, АСТ, АЛТ, ЛДГ, увеличение содержания билирубина, азота мочевины в плазме, повышение содержания сывороточного креатинина, гиперурикемия, положительная проба Кумбса, снижение гемоглобина и гематокрита, гипергликемия, лейкоцитоз, бактериурия, эритроцитурия.

Препараты, содержащие карбидопу и леводопу, могут вызвать ложноположительную реакцию на кетоновые тела в моче, если для определения кетонурии используются тест-полоски. Эта реакция не изменится после кипячения проб мочи. Ложноотрицательные результаты могут быть получены при использовании глюкозооксидазного метода определения глюкозурии.

Передозировка:

Симптомы: усиление побочных эффектов.

Лечение: следует обеспечить тщательное наблюдение и ЭКГ-мониторинг с целью выявления возможной аритмии, при необходимости следует проводить адекватную антиаритмическую терапию. Необходимо учитывать возможность того, что наряду с препаратом Наком пациент принимал и другие лекарственные препараты.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Влияние Накома на течение беременности у женщин неизвестно. В *экспериментальных исследованиях* выявлено, что комбинация леводопы и карбидопы вызывает висцеральные и скелетные изменения у животных. Поэтому применение препарата возможно только в случае, когда ожидаемая польза терапии для матери превосходит потенциальный риск для плода.

Неизвестно, выделяются ли с грудным молоком леводопа и карбидопа. Имеется одно сообщение об экскреции леводопы с грудным молоком у кормящей матери с болезнью Паркинсона. Поэтому из-за возможного серьезного вредного воздействия препарата на новорожденного и с учетом важности проведения терапии для матери, при необходимости применения препарата в период лактации следует решить вопрос либо о прекращении грудного вскармливания, либо отмене препарата Наком.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При применении Накома у пациентов, получающих антигипертензивную терапию, наблюдалась симптоматическая ортостатическая гипотензия (в начале лечения препаратом Наком в таких случаях может потребоваться коррекция дозы антигипертензивного препарата).

При одновременно применении леводопы с ингибиторами МАО (за исключением ингибиторов МАО типа В) возможны нарушения кровообращения (прием ингибиторов МАО следует прекратить за 2 недели до начала приема леводопы). Это связано с накоплением под влиянием леводопы допамина и норэпинефрина, инактивация которых заторможена ингибиторами МАО. В результате этого высока вероятность развития возбуждения, повышения АД, тахикардии, покраснения лица и головокружения.

Имеются отдельные сообщения о побочных реакциях, включающих повышение АД и дискинезию в случае сочетанного применения трициклических антидепрессантов и Накома.

Биодоступность карбидопы и/или леводопы снижается при одновременном применении железа сульфата или железа глюконата.

При одновременном применении леводопы с бета-адреностимуляторами, дитилином и средствами для ингаляционной анестезии возможно повышение риска развития нарушений сердечного ритма.

Антагонисты допаминовых D_2-рецепторов (например, фенотиазины, бутирофеноны и рисперидон), а также изониазид могут уменьшать терапевтический эффект леводопы.

Имеются сообщения о блокировании положительного терапевтического воздействия леводопы при болезни Паркинсона в результате приема фенитоина и папаверина. За пациентами, принимающими эти лекарства одновременно с препаратом Наком, требуется тщательное наблюдение для своевременного выявления уменьшения терапевтического действия.

Препараты лития повышают риск развития дискинезий и галлюцинаций.

При одновременном применении метилдопа усиливает побочное действие Накома.

Одновременное применение тубокурарина повышает риск возникновения артериальной гипотензии.

Абсорбция леводопы может быть нарушена у некоторых пациентов, находящихся на высокобелковой диете, поскольку леводопа конкурирует с некоторыми аминокислотами.

Карбидопа препятствует действию пиридоксина гидрохлорида (витамин B_6), который ускоряет биотрансформацию леводопы в допамин в периферических тканях.

Особые указания и меры предосторожности:

Как и в случаях применения леводопы, при назначении Накома пациентам, перенесшим инфаркт миокарда и имеющим предсердную, узловую или желудочковую аритмии, необходимо тщательное предварительное обследование. У таких пациентов необходимо контролировать сердечную деятельность, особенно при назначении первой дозы и в период подбора дозы.

Пациентам с открытоугольной глаукомой Наком следует назначать с осторожностью и при условии постоянного контроля внутриглазного давления во время лечения.

Поскольку как терапевтические, так и побочные эффекты чаще возникают при применении комбинации карбидопы и леводопы, чем одной леводопы, в период подбора дозы за пациентами необходимо тщательное наблюдение. В частности, Наком чаще, чем леводопа, вызывает непроизвольные движения. Появление непроизвольных движений может потребовать снижения дозы. Ранним признаком избыточной дозы у некоторых пациентов может служить блефароспазм.

Если терапевтическая реакция на препарат леводопы непостоянна, а проявления и симптомы болезни Паркинсона не контролируются в течение всего дня, то переход на Наком обычно позволяет уменьшить колебания в реакции на препарат.

Благодаря уменьшению определенных отрицательных эффектов, вызываемых препаратом леводопы, Наком обеспечивает у пациентов адекватное уменьшение симптомов болезни Паркинсона.

Наком также показан пациентам с паркинсонизмом, принимающим витаминные препараты, содержащие пиридоксина гидрохлорид (витамин B_6).

Наком не рекомендуется для устранения экстрапирамидных расстройств, вызванных лекарственными препаратами.

Наком может назначаться пациентам, уже получающим препараты, содержащие только леводопу, однако прием леводопы должен быть прекращен, по крайней мере за 12 ч до начала лечения препаратом Наком. Наком должен назначаться в дозах, которые обеспечивают примерно 20% от прежней дозы леводопы.

У пациентов, принимавших ранее леводопу, может наблюдаться дискинезия, т.к. карбидопа позволяет большему количеству леводопы достичь головного мозга, и, таким образом, образуется большее количество допамина. Появление дискинезии может потребовать снижения дозы.

Как и леводопа, Наком может вызвать непроизвольные движения или психические расстройства. Предполагается, что эти реакции обусловлены увеличением содержания допамина в головном мозге. Эти явления могут потребовать снижения дозы. Все пациенты, принимающие Наком, должны находиться под наблюдением в связи с возможностью развития депрессивного состояния с суицидальными тенденциями. Пациентам, у которых наблюдались психозы, требуется осторожный подход при подборе терапии.

Следует с осторожностью назначать Наком и психотропные препараты.

При внезапной отмене противопаркинсонических препаратов был описан симптомокомплекс, напоминающий злокачественный нейролептический синдром, включающий мышечную ригидность, повышение температуры тела, психические нарушения и возрастание концентрации сывороточной КФК. Поэтому необходимо тщательное обследование пациентов в период резкого снижения дозы Накома или его отмены, особенно если пациент получает нейролептики. Как и в случае с леводопой, во время длительного лечения Накомом рекомендуется периодический контроль функций печени, кроветворной, сердечно-сосудистой систем и почек.

Если требуется общая анестезия, то препарат Наком можно принимать до тех пор пока пациенту разрешено пероральное введение жидкости и лекарств.

Если лечение временно прервано, то прием Накома может быть возобновлен в обычной дозе, как только пациент будет в состоянии принимать препарат внутрь.

Использование в педиатрии

Безопасность применения препарата **у детей младшего и среднего возраста** не установлена.

Не рекомендуется назначать Наком **детям и подросткам в возрасте до 18 лет**.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует применять у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью.

Применение в детском возрасте

Безопасность применения препарата у детей младшего и среднего возраста не установлена.

Не рекомендуется назначать Наком **детям и подросткам в возрасте до 18 лет**.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Nakom