

Прамирпексол



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Прамирпексол

Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противопаркинсоническое средство, агонист допаминовых рецепторов. Полагают, что механизм действия связан со способностью прамирпексола стимулировать допаминовые рецепторы в полосатом теле. Это подтверждается влиянием на уровень импульсации в нейронах полосатого тела за счет активации допаминовых рецепторов в полосатом теле и черном веществе.

Нельзя исключить, что прамирпексол ингибирует секрецию пролактина у человека.

Фармакокинетика

После приема внутрь прамирпексол быстро абсорбируется из ЖКТ, C_{max} в плазме достигается примерно через 2 ч. Абсолютная биодоступность прамирпексола превышает 90%. Пища не влияет на степень абсорбции прамирпексола, хотя время достижения C_{max} в плазме увеличивается примерно на 1 ч при приеме препарата во время еды.

C_{ss} достигается через 2 дня от начала приема прамирпексола.

Широко распределяется в организме, V_d составляет около 500 л (коэффициент вариации - 20%). Связывание с белками плазмы - около 15%. Прамирпексол накапливается в эритроцитах, что подтверждается соотношением концентрации в эритроцитах к концентрации в плазме, равным 2.

$T_{1/2}$ составляет 8 ч у молодых здоровых добровольцев и около 12 ч у пожилых добровольцев.

Прамирпексол выводится преимущественно почками; в моче определяется 90% введенной дозы практически полностью в неизмененном виде. Внепочечные пути выведения могут играть некоторую роль в элиминации прамирпексола, хотя в плазме и моче не было обнаружено его метаболитов. Почечный клиренс прамирпексола составляет примерно 400 мл/мин (коэффициент вариации - 25%), что примерно в 3 раза выше, чем скорость клубочковой фильтрации. Прамирпексол, таким образом, секретируется почечными канальцами, возможно через систему транспорта органических катионов.

Клиренс прамирпексола примерно на 30% ниже у женщин, чем у мужчин, но это различие в значительной степени может быть обусловлено различием в массе тела. Отсутствует различие в значениях $T_{1/2}$ у мужчин и женщин.

С возрастом клиренс прамирпексола снижается, при этом у пожилых лиц (в возрасте 65 лет и старше) $T_{1/2}$ увеличивается примерно на 40% (с 8.5 ч до 12 ч), а общий клиренс прамирпексола снижается на 30% по сравнению с молодыми, здоровыми добровольцами (в возрасте менее 40 лет).

У пациентов с болезнью Паркинсона клиренс прамипексола может снижаться до 30% по сравнению со здоровыми пожилыми испытуемыми. Причиной этого различия, по-видимому, является снижение функции почек у больных с болезнью Паркинсона.

Фармакокинетика прамипексола у пациентов с недостаточностью функции печени не изучена. Поскольку примерно 90% выделяемой дозы выводится с мочой в неизменном виде, можно ожидать, что нарушение функции печени не оказывает существенного влияния на выведение прамипексола.

При тяжелых нарушениях функции почек (КК около 20 мл/мин) клиренс прамипексола снижается примерно на 75%, при умеренных нарушениях функции почек (КК примерно 40 мл/мин) - на 60%, по сравнению со здоровыми испытуемыми. У таких больных рекомендуется применять препарат в более низкой начальной и поддерживающей дозах. Клиренс прамипексола крайне низок у больных, находящихся на гемодиализе, поскольку при диализе выводятся незначительные количества прамипексола.

Фармакокинетика прамипексола у детей не изучена.

Показания к применению:

Лечение болезни Паркинсона (в виде монотерапии и в комбинации с леводопой).

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к прамипексолу.

Способ применения и дозы:

Для взрослых при приеме внутрь начальная доза составляет 375 мкг/сут в 3 приема. Дозу следует повышать каждые 5-7 дней до достижения максимального терапевтического эффекта, который наблюдается при приеме 1.5-4.5 мг/сут.

У пациентов с нарушениями функции почек начальная доза составляет 125 мкг/сут, частота приема 1-3 раза/сут в зависимости от значений КК.

Максимальные дозы: разовая доза - 1.5 мг; суточная доза при КК более 60 мл/мин - 4.5 мг в 3 приема, при КК 35-59 мл/мин - 3 мг в 2 приема, при КК 15-34 мл/мин - 1.5 мг в 1 прием.

Прекращать лечение рекомендуется в течение 1 недели.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: сонливость, дискинезии, галлюцинации; в отдельных случаях - бессонница. При быстром снижении дозы прамипексола, а также при резкой отмене возможно развитие ЗНС.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, запор.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: в отдельных случаях в начале лечения - артериальная гипотензия (особенно при постепенном увеличении дозы в течение слишком короткого времени).

Прочие: в отдельных случаях - периферические отеки.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых исследований безопасности применения прамипексола при беременности не проводилось. Считается, что применение возможно в случаях, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Неизвестно, выделяется ли прамипексол с грудным молоком. При необходимости применения в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с лекарственными средствами, которые выводятся катионной транспортной системой почек, возможно повышение концентрации прамипексола в плазме крови.

При одновременном применении с леводопой возможно развитие дискинезии; с циметидином - уменьшение клиренса прамипексола и увеличение его концентрации в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с нарушениями функции почек. У пациентов с КК менее 15 мл/мин опыт применения прамипексола недостаточен.

Безопасность и эффективность применения прамипексола у детей не установлена.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения следует воздерживаться от управления автомобилем и других потенциально опасных видов деятельности.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применяют у пациентов с нарушениями функции почек. У пациентов с КК менее 15 мл/мин опыт применения прамипексола недостаточен.

Применение в детском возрасте

Безопасность и эффективность применения прамипексола у детей не установлена.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Pramipeksol>