Синдопа



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Леводопа
- Карбидопа

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 светло-розового цвета с вкраплениями, плоскоцилиндрические, с фаской и двумя пересекающимися рисками с одной стороны и гравировкой "Syndopa" - с другой.

	1 таб.
леводопа	250 мг
карбидопа	25 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, лактоза, краситель Понсо 4R lake, повидон К30, бутилгидроксианизол, тальк очищенный, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный, натрия крахмала гликолат, крахмал кукурузный высушенный.

10 шт. - стрипы из алюминиевой фольги (5) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Структура леводопы представляет собой аминокислоту, образующуюся из L-тирозина. Дофамин образуется непосредственно из леводопы при участии цитоплазматического фермента - декарбоксилазы ароматических L-аминокислот. Конечным результатом влияния дофамина является угнетение нейрональной активности в полосатом теле головного мозга. Леводопа быстро декарбоксилируется в периферических тканях под влиянием зависимой от пиридоксина декарбоксилазы ароматических аминокислот, превращаясь в дофамин, который, однако, через гематоэнцефалический барьер не проникает.

Карбидопа ингибирует процесс декарбоксилирования леводопы в переферических тканях, при этом не проникает через гематоэнцефалический барьер и не влияет на превращение леводопы в дофамин в ЦНС. Таким образом, комбинация карбидопы и леводопы позволяет увеличивать количество леводопы, поступающее в головной мозг. При совместном приеме внутрь карбидопа удваивает биодоступность леводопы. Введение карбидопы никогда не приводит к полному угнетению дофадекарбоксилазы.

Фармакокинетика

Леводопа

Всасывание

Леводопа всасывается путем активного транспорта из желудочно-кишечного тракта, ее прохождение через гематоэнцефалический барьер также осуществляется за счет активных механизмов. Барьером на пути всасывания леводопы является наличие дофадекарбоксилазы в стенке кишечника. Из желудка леводопа абсорбируется в ограниченном количестве. Скорость опорожнения желудка играет ключевую роль во всасывании препарата. Факторы, замедляющие опорожнение желудка (пища, м-холиноблокнруюшне средства), задерживают пассаж препарата в двенадцатиперстную кишку и замедляют его всасывание. C_{max} препарата в крови отмечается через 1-2 ч после введения.

Распределение

Объем распределения леводопы составляет 0,9-1,6 л/кг. При сохранении активности дофадекарбоксилазы общий клиренс леводопы в плазме крови составляет 0,5 л/кг/ч. Леводопа проникает через гематоэнцефалический барьер путем облегченной диффузии. Эндотелий капилляров головного мозга также содержит дофадекарбоксилазу как второй потенциальный барьер на пути поступления леводопы в головной мозг, однако, в этих капиллярах декарбоксилируется незначительная часть введенной дозы леводопы.

Метаболизм

Примерно 70-75% вводимой внутрь леводопы метаболизируется в стенке кишечника (эффект «первого прохождения»). Печень в метаболизме первого прохождения участия практически не принимает. С увеличением дозы леводопы, количество препарата, подвергающегося декарбоксилированию в кишечнике, уменьшается. Леводопа не связывается с белками плазмы крови. Декарбоксилирование леводопы допа-декарбоксилазой является основным путем образования дофамина из леводопы. Большое количество этого фермента находится в кишечнике, печени и почках. Метоксилирование леводопы под влиянием катехол-О-метилтрансферазы с образованием 3-О-метилдофы является вторым путем метаболизма леводопы. При длительном лечении этот метаболит может накапливаться. Трансаминирование является дополнительным путем метаболизма леводопы. Конечным продуктом этого пути является ванилпируват, ванилацетат и 2,4,5-тригидроксифенилуксусная кислота. Все пути метаболизма, за исключением трансаминирования, являются необратимыми.

Выделение

В комбинации с карбидопой, $T_{1/2}$ леводопы увеличивается до 3 ч. До 69% леводопы может обнаруживаться в моче у человека в виде дофамина и его метаболитов - винилинминдальной кислоты, норадреналина, гомованилиновой кислоты, дигидрофенилуксусной кислоты.

Карбидопа

В рекомендуемых дозах карбидопа не проникает через гематоэнцефалический барьер. C_{max} в плазме крови достигается через 2-4 ч. Примерно 50% карбидопы выводится с мочой и калом. 35% карбидопы, выводящейся почками, выводится в неизменном виде.

Показания к применению:

— болезнь Паркинсона и синдром паркинсонизма известной этиологии (вследствие энцефалита, цереброваскулярных нарушений, интоксикации токсическими веществами, в том числе оксидом углерода или марганцем).

Относится к болезням:

- Интоксикация
- Паркинсонизм
- Энцефалит

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к препарату;

— закрытоугольная форма глаукомы;

— тяжелый психоз или невроз;

— беременность и лактация;

— меланома или подозрение на нее;

— кожные заболевания неизвестной этиологии;

— болезнь Хантингтона;

— эссенциальный тремор;

— вторичный паркинсонизм, вызываемый применением антипсихотических средств (нейролептиков);

— детский и подростковый возраст до 18 лет.

С осторожностью: препарат принимают с осторожностью при эррозивно-язвенных поражениях желудка и/или двенадцатиперстной кишки, эпилептических припадках в анамнезе, инфаркте миокарда с нарушениями ритма сердца в анамнезе, сердечной недостаточности, сахарном диабете, бронхиальной астме, заболеваниях эндокринной системы, психических нарушениях, а также при тяжелых нарушениях функции печени и почек.

Способ применения и дозы:

Внутрь, с небольшим количеством пищи или после еды, запивая водой и не разжевывая. Поскольку существует конкуренция между ароматическими аминокислотами и леводопой при всасывании, во время использования препарата следует избегать потребления большого количества белков. Средняя дневная доза карбидопы, необходимая для подавления периферического превращения леводопы, составляет 70-100 мг. Превышение 200 мг карбидопы не влечет за собой дальнейшего усиления терапевтического эффекта. Суточная доза леводопы не должна превышать 2000 мг.

Начальная доза - по 1/2 таблетки 2 раза в день, при необходимости можно увеличивать на 1/2таблетки в день. Как правило, в начале заместительной терапии дневная доза не должна превышать 3-х таблеток в день (по 1-й таблетке 3 раза в день). Применение в этой дозировке рекомендуют в начале лечения тяжелых случаев паркинсонизма. Суточная доза препарата в виде исключения может быть увеличена при монотерапии, но не должна превышать 8 таблеток (по 1-й таблетке 8 раз в день). Применение в количестве более, чем 6 таблеток в день, должно проводиться с большой осторожностью.

Тидомет форте при замене леводопы

Прием леводопы прекращают за 12 ч до начала лечения Синдопой, а в случае приема пролонгированных форм левокарбидопы за 24 ч. Дозировка Синдопы в этом случае должна составлять не более 20% от прежней дозы леводопы. Поддерживающая доза составляет 3-6 таблеток в сутки для большинства пациентов.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: дискинезия, в том числе хореоатетоз, очаговая дистония, при длительном применении синдром «включения-выключения», головокружение, атаксия, судороги, анорексия, седация, сонливость, кошмарные сновидения, нервное напряжение, повышенная возбудимость, беспокойство, бессонница, психотические реакции, галлюцинации, депрессия, параноидные состояния, гипомания, повышенное либидо, эйфория, деменция.

Желудочно-кишечный тракт: тошнота, рвота, запор, боли в эпигастрии, дисфагия, ульцерогенное действие у предрасположенных пациентов.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия, коллапс, сердечные аритмии, тахикардия.

Со стороны системы кроветворения: умеренная лейкопения, тромбоцитопения, гемолитическая анемия.

Лабораторные показатели: изменение уровня глутаматоксалаттрансаминазы, глутаматпируватоксалазы, щелочной фосфатазы, лактатдегидрогеназы, азота мочевины, билирубина, йода, связанного с белком, положительная прямая реакция Кумбса.

Прочие: блефароспазм, мидриаз, диплопия, незначительное увеличение массы тела при длительном применении.

Побочные эффекты, как правило, зависят от принимаемой дозы, а также от индивидуальной чувствительности больного. Побочные эффекты могут быть устранены временным снижением дозы без перерыва в лечении. Если побочные эффекты не регрессируют, то лечение прекращают постепенно.

Передозировка:

Симптомы: сначала повышение, а затем снижение артериального давления, синусовая тахикардия, спутанность сознания, возбуждение, бессонница, беспокойство. Может также развиваться ортостатическая гипотензия. Симптомы анорексии и бессонницы могут сохраняться в течение нескольких дней.

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля. При необходимости проведение симптоматического лечения в условиях стационара. Специфического антидота не существует.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

— одновременное назначение с гипотензивными средствами требует специального внимания в связи с опасностью постуральной гипотензии;

— при совместном применении с трициклическими антидепрессантами может возникнуть артериальная гипертензия и дискинезия, так же уменьшается биодоступность леводопы;

— комбинированное применение фенотиазинов, бутирофенонов и Синдопы уменьшает эффект последней;

— Синдопа не должна назначаться вместе с неселективными ингибиторами моноаминооксидазы, так как может развиться гипертонический криз. Лечение ингибиторами моноаминооксидазы должно быть прекращено, по крайней мере, за 14 дней до начала назначения препарата. Исключение составляет селегилин (избирательный ингибитор моноаминооксидазы -В), который может использоваться как адъювант при лечении леводопой;

— может усиливать действие симпатомиметиков, в связи с чем рекомендуется снизить их дозу. При одновременном применении леводопы с β-адреностимуляторами, средствами для ингаляционной анестезии - возможно увеличение риска развития нарушений сердечного ритма;

— при применение амантадина с леводопой отмечается потенцирующий эффект;

— метилдофа и леводопа могут потенцировать побочные эффекты друг друга;

— пиридоксин является кофактором дофадекарбоксилазы - фермента, ответственного за периферическое декарбоксилирование леводопы и образование дофамина. При его назначении больным, получающим леводопу (без ингибиторов дофадекарбоксилазы), отмечается усиление периферического метаболизма леводопы и меньшее ее количество проникает через гематоэнцефалический барьер. Таким образом, пиридоксин уменьшает терапевтический эффект леводопы, если дополнительно не назначаются ингибиторы периферической дофадекарбоксилазы;

— при дополнительном назначении ингибиторов дофадекарбокснлазы суточную дозу леводопы можно уменьшить на 70-80% при сохранении того же клинического результата;

— совместное применение с диазепамом, фенитоином, клофелином, производными тиоксантена, папаверином, резерпином, м-холиноблокаторами - возможно уменьшение противопаркинсонического действия.

Особые указания и меры предосторожности:

Не следует применять в случаях вторичного паркинсонизма (синдрома Паркинсона), вызванного применением антипсихотических средств (нейролептиков).

Прекращать лечение следует постепенно, так как при внезапном прекращении приема препарата возможно развитие симптомокомплекса, напоминающего злокачественный нейролептический синдром (мышечная ригидность, повышение температуры тела, повышение содержания КФК в сыворотке крови). Необходим контроль за пациентами, которым потребовалось внезапно снизить дозу препарата или прервать его прием. Всасывание леводопы у пожилых больных выше, чем у молодых. Эти данные подтверждают сведения о снижении активности дофадекарбоксилазы в тканях с возрастом, а также при длительном назначении леводопы.

При эррозивно-язвенных поражениях желудка и/или двенадцатиперстной кишки, эпилептических припадках в анамнезе, инфаркте миокарда с нарушениями ритма в анамнезе, сердечной недостаточности, сахарном диабете, бронхиальной астме, заболеваниях эндокринной системы, психических нарушениях, а также при тяжелых нарушениях функции печени или почек принимать препарат следует с осторожностью. В таких случаях больные должны находиться под пристальным наблюдением.

При продолжительном лечении необходимо осуществлять периодический контроль функции печени, почек, системы кроветворения и сердечно-сосудистой системы, также необходим контроль психического статуса пациента.

При обшей анестезии при проведении хирургических операций Синдопу назначают не снижая дозы, если больной в состоянии принимать препараты и жидкость внутрь. При использовании галотана и циклопропана назначение препарата прекращают, как минимум, за 8 часов до операции. Лечение продолжают после операции в той же дозе.

Больным глаукомой на фоне приема препарата следует регулярно контролировать внутриглазное давление.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Необходимо воздержаться от управления транспортом, а также видов деятельности, требующих быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применяют при тяжелых нарушениях функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применяют при тяжелых нарушениях функции печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

.

Условия хранения:

Хранить в сухом, недоступном для детей и защищенном от света месте при температуре не выше 30° С.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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