Состав

действующие вещества: леводопа, карбидопа;

1 таблетка содержит леводопы 250 мг и карбидопы 25 мг в форме моногидрата;

вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат, индиго (Е 132).

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: голубого цвета, неоднородно окрашенные, овальные, двояковыпуклые с насечкой с одной стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Противопаркинсонические препараты. Допаминергические средства. Леводопа с ингибитором декарбоксилазы. Код АТХ N04B A02.

Фармакодинамика

Наком® - комбинированный противопаркинсонический средство, содержащее метаболический предшественник допамина - леводопу и ингибитор периферической допа-декарбоксилазы - карбидопу.

Симптомы болезни Паркинсона связаны, вероятно, с недостаточным количеством допамина. В норме допамин выполняет функцию нейромедиатора и производится в определенных клетках мозга, контролирующих мышечную активность. Двигательные расстройства считают следствием допаминовой недостаточности.

Противопаркинсоническую действие леводопы обусловлено ее превращением в допамин путем декарбоксилирования непосредственно в ЦНС, устраняет дефицит допамина в нервных клетках.

Карбидопа, не проникает через гематоэнцефалический барьер, препятствует экстрацеребральному декарбоксилированию леводопы, благодаря чему поступление леводопы в мозг и превращения ее в допамин в ЦНС увеличивается, что способствует уменьшению симптомов болезни Паркинсона у многих пациентов.

Фармакокинетика

Леводопа быстро абсорбируется из желудочно-кишечного тракта и метаболизируется. В основном она превращается в допамин, адреналин и норадреналин и, в конечном итоге - в гидроксифенилоцтовую, гомованилиновую и ванилилмигдалевую кислоты. В плазме и спинномозговой жидкости оказывается 3-О-метилдопа. Период полувыведения леводопы из плазмы составляет примерно 50 минут. При комбинированном применении карбидопы и леводопы период полувыведения леводопы повышается до 1,5 часа. Все метаболиты карбидопы и леводопы выводятся с мочой.

Показания

Болезнь и синдром Паркинсона.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ препарата.
- Одновременное применение неселективных ингибиторов МАО (МАО) (применение данных препаратов следует прекратить не менее чем за две недели до назначения лечения Наком®). Препарат можно применять только с селективными ингибиторами МАО-В в рекомендованных дозах (например с селегилином HCl).
- Глаукома.
- Подозрительные недиагностированные образования на коже (дерматозы) или меланома в анамнезе.
- Тяжелые психозы.
- Тяжелая печеночная и почечная недостаточность.
- Тяжелая сердечная недостаточность. Тяжелая сердечная аритмия.
- Острый инсульт.
- Состояния, при которых противопоказаны адренергические средства (например, феохромоцитома, гипертиреоз, синдром Кушинга).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Необходимо с осторожностью назначать препарат одновременно с нижеприведенными лекарственными средствами:

Антигипертензивные средства. У пациентов, которые вместе с препаратом Наком® применяют антигипертензивные средства, может возникать

симптоматическая ортостатическая гипотензия. Может потребоваться корректировка дозы антигипертензивного средства.

Антихолинергические средства. Могут действовать синергично вместе с леводопой для снижения тремора, однако они могут усилить неконтролируемые движения. В больших дозах они также могут снизить положительный эффект леводопы путем замедления ее абсорбции.

Антидепрессанты. Были отдельные сообщения о возникновении негативных реакций, включая артериальную гипертензию и дискинезию, вызванные одновременным применением трициклических антидепрессантов и препарата Наком® (для пациентов, принимающих ингибиторы МАО). Наком® можно применять под наблюдением только с селективными ингибиторами МАО-В в рекомендованных дозах (например с селегилином HCl).

Железо. Зафиксировано снижение биодоступности действующих веществ препарата Наком® при применении его вместе с сульфатом железа или глюконатом железа.

Анестетики. Одновременное применение анестетиков может вызвать аритмию.

Другие лекарственные средства. Антагонисты рецепторов допамина D2 (например, фенотиазины, бутирофенонов и рисперидон) и изониазид могут снижать терапевтический эффект леводопы.

Положительный эффект препарата Наком® при болезни Паркинсона может быть обратимым при применении фенитоина и папаверина. Поэтому пациенты, которые применяют эти препараты в комбинации с леводопой / карбидопой, должны находиться под тщательным наблюдением из-за возможности потери терапевтического эффекта.

Не рекомендуется применение леводопы / карбидопы с лекарственными средствами, блокирующими накопления допамина (например, с Тетрабеназин) или с другими лекарственными средствами, которые могут подавлять уровне моноамина.

Совместная терапия с селегилином может привести к тяжелой ортостатической гипотензии, не характерных для препарата Наком®.

Поскольку леводопа конкурирует с некоторыми аминокислотами, у пациентов, находящихся на высокобелковой диете, может нарушаться всасывание леводопы.

При одновременном применении с антацидами влияние на биодоступность леводопы не изучали.

Возможно одновременное применение Наком® и средств, содержащих витамин B6 (пиридоксина гидрохлорид).

Особенности применения

Препарат не следует применять для лечения экстрапирамидных реакций, возникших в результате применения лекарственных средств.

Пациентам, которые предварительно применяли леводопу, в качестве монотерапии, можно применять Наком®. Однако прием леводопы следует прекратить по крайней мере за 12 часов до начала терапии препаратом Наком®. Суточная доза препарата должна обеспечить примерно 20% предыдущей ежедневной дозы леводопы (см раздел «Способ применения и дозы»).

Меланома. Эпидемиологические исследования показали, что при наличии болезни Паркинсона пациенты имеют более высокий (примерно в 2-6 раз) риск развития меланомы. Однако неизвестно, связан повышенный риск развития меланомы с болезнью Паркинсона, или с другими факторами, например такими как прием лекарств, предусмотренных для лечения болезни Паркинсона. Поэтому при применении препарата Наком® рекомендуется постоянный контроль за кожей пациента. В идеале, периодические обследования кожи должны проводить квалифицированные специалисты (например, дерматологи).

Дизрегулюючий допаминовый синдром (ДДС) - это аддиктивный расстройство, виникаюе вследствие чрезмерного применения лекарственного средства и наблюдается у некоторых пациентов, которые принимали карбидопу / леводопу. Перед началом лечения пациенты и их опекуны должны быть предупреждены о потенциальном риске развития ДДС (см. Также раздел «Побочные реакции»).

Нарушение импульсного управления.

Следует тщательно наблюдать за пациентами для возникновения нарушений импульсного управления. Пациентов и их окружения следует предупредить о возможных изменениях в поведении, которые свидетельствуют о нарушении импульсного управления, такие как патологическая азартность, повышение либидо, гиперсексуальность, импульсивное желание совершить покупку, переедание, импульсивное еды, при применении допаминовых агонистов и / или допаминергического лечения , включая препарат Наком®. В этом случае лечение следует скорректировать.

Дискинезия может наблюдаться у пациентов, предварительно лечились только леводопой, потому что карбидопа позволяет леводопе больше достичь мозга, поэтому, может быть создано больше допамина. В случае появления дискинезии

может потребоваться снижение дозы.

Наком®, как и другие препараты леводопы, может вызвать непроизвольные движения и психические расстройства. Такие реакции обусловлены, вероятно, повышением концентрации допамина в мозге после назначения леводопы. Может потребоваться снижение дозы.

Надо внимательно наблюдать за пациентами, чтобы вовремя выявить у них развитие депрессии с сопроводительными суицидальными намерениями. Пациенты с психозом (в том числе в анамнезе) требуют особого внимания. Также особого внимания требуют пациенты, попутно принимают психоактивные препараты.

Препарат следует назначать с осторожностью пациентам с тяжелыми заболеваниями сердечно-сосудистой системы и легких, бронхиальной астмой, заболеваниями почек, печени и эндокринной системы, с язвенной болезнью (из-за риска возникновения кровотечения верхних отделов кишечного тракта) или судорогами в анамнезе. С осторожностью назначают Наком® также пациентам, которые недавно перенесли инфаркт миокарда, при наличии предсердной, узловой или желудочковой аритмии. Необходимо наблюдать за состоянием сердечно-сосудистой системы таких пациентов, особенно при применении начальной дозы препарата.

Пациентам с хронической открытоугольной глаукомой следует назначать с осторожностью при условии постоянного контроля внутриглазного давления и тщательного наблюдения за его изменениями во время лечения.

При внезапной отмене препарата наблюдался комплекс симптомов, подобных злокачественного нейролептического синдрома с проявлениями ригидности мышц, гипертермии, изменениями в психике и повышением уровня КФК в сыворотке крови. Необходимо тщательное наблюдение за состоянием пациентов, которым снижают дозу препарата или проводят его отличие, особенно если пациент одновременно применяет нейролептики.

Леводопа может вызвать сонливость и внезапные эпизоды засыпания. Случаи возникновения внезапных эпизодов сонливости во время дневной активности - редкие. Однако пациентов необходимо проинформировать о возможном возникновении таких симптомов, а при их появлении следует рассмотреть возможность снижения дозы или отмены препарата.

Во время длительного лечения необходимо периодически контролировать функциональное состояние печени, почек, сердечно-сосудистой системы и кроветворной системы.

Если необходимо провести операцию под наркозом, препарат накануне отменяют. Применение препарата восстанавливают после операции, как только пациент сможет его принимать.

Препараты карбидопы с леводопой могут вызвать ложноположительную реакцию на кетоновые тела в моче, если для определения кетонурии используют индикаторную ленту. Эта реакция не меняется после кипячения проб мочи.

Ложноотрицательные результаты могут быть получены при использовании глюкозооксидазного метода тестирования глюкозурии.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Учитывая, что при применении препарата могут возникать побочные реакции (головокружение, галлюцинации, неконтролируемые движения, сонливость, случаи внезапного сна, расстройства зрения), на время приема препарата следует воздержаться от управления транспортными средствами и выполнения других работ, требующих концентрации внимания.

Применение в период беременности или кормления грудью

Влияние на ход беременности неизвестен, однако и леводопа, и ее комбинации с карбидопой вызвали пороки развития внутренних органов и скелета плода в эксперименте на животных. Поэтому не следует применять препарат в период беременности.

В случае необходимости применения препарата кормящим грудью, на период лечения необходимо прекратить кормление грудью.

Способ применения и дозы

Режим дозирования устанавливают индивидуально, в зависимости от тяжести заболевания, сопутствующей патологии и терапевтического эффекта для взрослых пациентов, ранее получавших лечение препаратом. При необходимости таблетки можно делить пополам по распределительной риске. Для достижения оптимального эффекта лучше принимать препарат ежедневно, не делая перерыва в применении.

Пациенты, которые ранее не получали леводопу. Для пациентов, которые начинают прием препарата Наком®, начальная доза составляет ½ таблетки один или два раза в сутки после еды. Но при этом может не обеспечиваться необходимое количество карбидопы для многих пациентов, поэтому, для

достижения оптимального эффекта от лечения, дозу можно повышать постепенным добавлением по ½ таблетки каждый день или через день. Терапевтический эффект проявляется в течение 1 дня, иногда - после приема одной дозы. Оптимальный эффект обычно достигается в течение 7 дней по сравнению с неделями или месяцами при применении только леводопы.

Пациенты, принимающие леводопу. Прием леводопы следует прекратить по крайней мере за 12 часов (24 часа для препаратов леводопы медленного высвобождения) до начала терапии препаратом Наком®. Суточная доза препарата должна обеспечить примерно 20% предыдущей ежедневной дозы леводопы.

Начальная доза. Для пациентов, которые получают меньше 1500 мг леводопы в сутки, начальная суточная доза должна составлять 75-100 мг карбидопы и 300-400 мг леводопы в 3-4 приема (применяют препарат с соотношением карбидопы / леводопы 1: 4, то есть с дозировкой 25 мг / 100 мг).

Для пациентов, которые получают более 1500 мг леводопы в сутки, начальная доза Наком® должна составлять 1 таблетку 3-4 раза в сутки.

Поддерживающая доза. При применении препарата Наком® необходимо учитывать индивидуальные особенности пациентов, дозировку можно постепенно менять в зависимости от терапевтического эффекта.

В случае, когда необходимо большее количество леводопы, дозу можно увеличивать по ½ или по 1 таблетке каждого следующего дня до максимальной суточной дозы - 200 мг карбидопы и 2 г леводопы (8 таблеток в 3-4 приема) для пациентов с массой тела 70 кг .

Когда перевода пациента из леводопы на препарат Наком® сочетается с другими ингибиторами декарбоксилазы, их применение следует прекратить по крайней мере за 12 часов до начала применения препарата Наком®.

Комбинация препарата с ингибиторами МАО-В способна повысить эффективность препарата Наком® в контролируемых случаях акинезии и / или дискинезии.

Для пациентов, принимающих одновременно с препаратом Наком® другие противопаркинсонические препараты, может возникнуть необходимость корректировки дозы этих средств.

Пациенты пожилого возраста. Препарат применяют пожилым пациентам.

Дети

Безопасность и эффективность применения препарата у детей не установлены, поэтому его не рекомендуют назначать пациентам в возрасте до 18 лет.

Передозировка

Симптомы: нарушение сердечного ритма, непроизвольные движения, блефароспазм.

Лечение: симптоматическое. Пиридоксин (витамин В6) не эффективен для предотвращения действия препарата.

Необходим ЭКГ мониторинг и тщательное наблюдение за пациентом за возможного развития аритмии. Следует учитывать также, что вместе с препаратом Наком® пациент может применять другие лекарственные средства. Опыт применения диализа отсутствует.

Побочные реакции

Побочные эффекты, возникающие при лечении препаратом Наком®, вызванные центральной нейрофармакологической активностью допамина. Эти реакции обычно исчезают при снижении дозы. Частыми проявлениями являются дискинезия, в том числе хорееподибни, дистонические и другие непроизвольные движения и тошнота. Первыми признаками, свидетельствующими о необходимости снижения дозы, является подергивание мышц и блефароспазм.

Другими серьезными побочными эффектами являются ментальные изменения, включая параноидальное мышление и психозы, депрессии с суицидальными тенденциями или без них, деменцией. Зафиксированы случаи патологического азарта, повышение либидо и гиперсексуальности среди пациентов, особенно при применении больших доз эти проявления исчезают при снижении дозы или прекращении терапии.

Другие побочные эффекты, о которых сообщали в связи с применением леводопы или ее комбинации с карбидопой, систематизированы по системам органов.

Со стороны нервной системы: дискинезия, включая хорея, дистония, брадикинезия, брадикинетические эпизоды (феномен «включения-выключения»), (может через несколько месяцев и даже лет после начала лечения леводопой и, вероятно, связан с прогрессированием заболевания (в таких случаях может потребоваться коррекция доз и интервалов между ними)), атаксия, астения, дезориентация, онемение, блефароспазм, тризм, головокружение / вертиго, сонливость, в том числе очень редко - чрезмерная дневная сонливость и внезапные эпизоды засыпания, парестезии, синкопе,

деменция, тремор рук, экстрапирамидные и двигательные расстройства, нарушение координации движения, утомляемость, головная боль, активация латентного синдрома Горнера, обморок, угнетение дыхания, падение, нарушение походки, раздражительность. Очень редко - судороги.

Со стороны психики: нарушение сна, психотические эпизоды, включая бред, кошмары, галлюцинации, и параноидальное мышление, снижена способность к мышлению, депрессия с развитием суицидальных намерений или без них, спутанность сознания, бессонница, тревожность, изменение психического статуса, включая манию, нарушение импульсного управления, такие как патологическая азартность, повышение либидо, гиперсексуальность, возможные симптомы расстройства контроля над побуждениями и компульсивное поведение (переедание, ониомания (импульсивное желание совершить покупку), наблюдалось у пациентов, получавших агонисты допамина, в том числе карбидопу / леводопу, особенно в высоких дозах. Эти нежелательные эффекты были преимущественно оборотными после уменьшения дозы или прекращения лечения. Страх, эйфория, дизрегулюючий допаминовый синдром.

Доброкачественные, злокачественные и другие новообразования (в том числе кисты и полипы): доброкачественные, злокачественные и недиагностированные новообразования, включая кисты и полипы, злокачественная меланома.

Со стороны крови: лейкопения, гемолитическая и негемолитическая анемия, тромбоцитопения, агранулоцитоз.

Со стороны иммунной системы: ангионевротический отек.

Расстройства метаболизма: анорексия, увеличение или потеря массы тела, отеки.

Со стороны органа зрения: диплопия, мидриаз, окуломоторный кризисов (тонические спазмы внешних мышц яблоки глаза), помутнение зрения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нарушение сердечного ритма / сердцебиение, ортостатические эффекты, в том числе артериальная гипотензия, артериальная гипертензия, боль в груди, флебит, склонность к потере сознания, обмороки, гиперемия, приливы крови к лицу.

Со стороны органов дыхания: одышка, хрипота, аномальное дыхание, одышка.

Со стороны пищеварительного тракта: тошнота, рвота, диарея, запор, боль в животе, темная слюна, диспепсия, сухость и горький привкус во рту, гиперсаливация, дисфагия, бруксизм, приступы икоты, желудочно-кишечное кровотечение, метеоризм, чувство жжения языка, развитие язвы

двенадцатиперстной кишки.

Со стороны кожи и подкожных тканей: реакции повышенной чувствительности, включая ангионевротический отек, крапивница, пурит, болезнь Шенлейна-Геноха, выпадение волос, сыпь, окраска пота в темный цвет, зуд, повышенная потливость, активация злокачественной меланомы.

Со стороны костно-мышечной системы: судороги, спазм мышц.

Со стороны мочевыделительной системы: задержка мочеиспускания, недержание мочи, окрашивание мочи в темный цвет, приапизм.

Другие: оедема, общая слабость и недомогание, чувство раздражения, злокачественный нейролептический синдром.

Лабораторные показатели: повышение показателей функции печени, таких как щелочная фосфатаза, аланинаминотрансфераза (АЛТ), аспартатаминотрансфераза (АСТ), лактатдегидрогеназа, билирубин, азот мочевины крови, креатинин, мочевая кислота, положительный тест Кумбса.

Редко отмечали снижение гемоглобина и гематокрита, повышение уровня глюкозы в сыворотке, лейкоцитоз, бактериурия, гематурия.

Описание некоторых побочных реакций.

ДДС - это аддиктивные расстройства, возникающие у некоторых пациентов, которые принимали карбидопу / леводопу. У пациентов вследствие злоупотребления препаратом наблюдалась компульсивное поведение, в некоторых случаях могла вызвать острую дискинезию.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С в сухом, защищенном от света месте.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, по 10 (10х10) блистеров в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Лек Фармацевтическая компания д. д.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Веровшкова 57, Любляна 1526, Словения.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.