

Фампира (Фампридин)

—

Фамруга

Лекарство прописывают пациентам с рассеянным склерозом для коррекции нарушений ходьбы. На начальном этапе средство назначают не более, чем на 4 недели. Необходимость дальнейшего применения оценивают в индивидуальном порядке.

Международное название:

Фампридин (Fampridine)

Клинико-фармакологическая группа: противосклеротические средства — ингибиторы протеинкиназ.

Основные физико-химические характеристики: каждая таблетка с пролонгированным высвобождением содержит 10 мг Фампридин (Fampridine)

Действие лекарства

Фармакодинамика

Механизм действия активного компонента лекарственного средства обусловлен блокирующим влиянием на калиевые каналы, расположенные на мембране клетки. Таким образом восстанавливается нормальный режим формирования электрических потенциалов клетки.

Демиелинизированные в результате развития рассеянного склероза нервные волокна постепенно теряют способность к адекватной передаче импульсов к тканям — мишеням. Фампридин тормозит патологический процесс, способствуя сохранению моторной и двигательной функции. Но в соответствии с рецензиями специалистов, препарат обладает симптоматическим действием, не оказывая влияния на патогенез

рассеянного склероза.

Фармакокинетика

Абсорбция. После приема таблетки, активный ингредиент достаточно быстро и практически в полном объеме всасывается из полости пищеварительного тракта. Биодоступность не оценивалась, предполагаемый показатель — 96%.

Распределение. Фампиридин связывается с белками плазмы на 97–99%. Объем распределения в среднем составляет 2,6 л/кг.

Биотрансформация. Активный компонент медикаментозного средства метаболизируется с образованием 3-гидрокси-4-аминопиридина и в дальнейшем конъюгируется до сульфатного соединения. В экспериментах *in vivo* терапевтическая активность метаболитов не выявлена. Биохимические превращения фампиридина осуществляются в печени с участием энзимов CYP2E1.

Элиминация. Фампиридин и образующиеся в результате биотрансформации соединения выводятся практически в полном объеме в течение суток. Около 96% препарата обнаруживается в моче, и только 0,5% — в фекальных массах. Порядка 90,3% медикаментозного средства выводится в неизменном виде, 4,3% — в форме 3-гидрокси-4-аминопиридина и 2,6% — в форме 3-гидрокси-4-аминопиридина сульфата. Период полувыведения составляет от 5,2 до 6,5 часов, время полураспада сульфатсодержащего метаболита — до 7,6 часов.

Фармакокинетические параметры у отдельных категорий пациентов

Педиатрия. Безопасность использования Фампиры у больных младше 18 лет не установлена.

Пожилые пациенты. В клинических испытаниях участвовало недостаточно людей старше 65 лет, чтобы оценить параметры фармакокинетики. Однако действующее вещество препарата преимущественно выделяется почками, а с возрастом их функция постепенно падает. Поэтому пожилым пациентам средство назначают с осторожностью.

Поражения почек. В клинических исследованиях принимали участие больные с сопутствующими патологиями мочевыделительной системы. Установлено,

что период полувыведения напрямую коррелирует с параметрами клиренса креатинина.

Поражения печени. В экспериментах не участвовали пациенты с патологиями печени. Но с учетом особенностей фармакокинетики, специалисты предполагают, что подобное состояние практически не влияет на эффективность медикамента и риск развития побочных реакций.

Половая и расовая принадлежность не воздействует на фармакокинетические показатели лекарства.

Показания к применению

Лекарство прописывают пациентам с рассеянным склерозом для коррекции нарушений ходьбы. На начальном этапе средство назначают не более, чем на 4 недели. Необходимость дальнейшего применения оценивают в индивидуальном порядке.

Противопоказания

Прием Фампиры противопоказан при:

- реакциях непереносимости, (из-за риска анафилаксии и ангионевротического отека);
- беременности и в период лактации;
- поражениях почек любой степени тяжести;
- эпилепсии и судорожных припадках другой этиологии.

Использование медикамента также ограничено у пациентов, не достигших 18-летнего возраста.

Особенности применения и дозировки

Рекомендованная суточная доза составляет 20 мг, что соответствует двум таблеткам, которые следует принимать натощак (за 40 минут до еды), строго с интервалом в 12 часов. Прием большего количества Фампиры терапевтически нецелесообразен, но существенно повышает вероятность развития осложнений.

Таблетки следует глотать целиком, не разжевывая и не разделяя на части.

Это связано с тем, что действующее вещество будет выделяться слишком быстро. Соответственно, повышается риск нарушения фармакокинетики и развития побочных реакций (в частности, возникновения судорог).

Если доза пропущена, следующую принимают в надлежащее время. Одновременный прием двух и более таблеток противопоказан.

Возможные нежелательные реакции

Риск побочных эффектов оценивали в ходе клинических исследований, в который участвовало 1000 человек, принимающих препарат на протяжении 12 недель, 819 больных, находящихся на лечении в течение полугода, 628 пациентов, состояние которых отслеживали год, и 526 человек, наблюдавшихся на протяжении 2 лет и более. Подавляющее большинство нежелательных реакций были связаны с неврологическими расстройствами и повышением частоты инфекций мочевыделительного тракта.

На фоне приема лекарства существует вероятность следующих осложнений (в скобках указана частота возникновения плацебо/активный медикамент):

- мочеполовые инфекции (8,4/12%);
- расстройства сна (3,8/8,8%);
- головокружение (4,2/7,3%);
- головная боль (3,8/7%);
- тошнота (2,5/7%);
- астенический синдром (3,8/6,8%);
- боль в области спины (2,1/5%);
- нарушения равновесия и координации (1,3/4,8%);
- парестезии (2,5/4%);
- назофарингиты (1,7/3,5%);
- запор (2,1/3,3%);
- боли в горле (0,8/2%);
- диспепсические явления (0,8/2%);
- рвота (0,4/1,8%);
- беспричинное беспокойство (0,4/1,5%);
- гриппоподобное состояние (0/1,5%);
- вирусные инфекции (0,4/1,5%);
- эпидермальный зуд (0,4/1,5%);

- тремор (0/1%);
- диспноэ (0/1%);
- снижение количества лейкоцитов (0/1%);
- повышение уровня триглицеридов (0/1%).

Менее чем у 1% пациентов, принимавших участие в клинических исследованиях, отмечали:

- анемию;
- нарушения формулы крови;
- ощущение сердцебиения, тахикардию, изменения проводимости сердечной мышцы;
- шум и боль в ушах;
- нарушения функционирования щитовидной железы;
- расстройства зрительной функции;
- повышенную сухость слизистой ротовой полости, зубную боль;
- дискомфорт в области груди;
- приливы жара и потливости;
- манифестация сезонной аллергии;
- бронхиты, циститы, микозы половых органов, отиты;
- дизурические расстройства;
- бурситы;
- снижение аппетита.

Также возможны ухудшение лабораторной картины работы печени, почек.

Взаимодействие

Пациента предупреждают о необходимости сообщать лечащему врачу обо всех принимаемых медикаментах. С особой осторожностью назначают комбинации, требующие сочетания с препаратами, экскретируемыми почками. Допускается одновременный прием с Баклофеном и интерферонами.

Не рекомендуют принимать Фампиру с лекарственными средствами, метаболизм которых происходит с участием ферментов CYP1A2, CYP2A6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP2D6, CYP1E1. При необходимости подобной комбинации (по жизненным показаниям) нужен строгий контроль дозировок и состояния пациента.

Совместимость с алкоголем

В инструкции по применению не приведена информация относительно возможности и безопасности приема спиртных напитков на время лечения.

Особые указания и меры предосторожности

Основные рекомендации и предупреждения врачей касаются следующих аспектов:

- Разовая дозировка препарата не должна превышать 10 мг, суточная — 20 мг.
- Перерыв между применением таблеток должен строго составлять 12 часов (одну пьют утром, вторую — вечером).
- Прием медикамента должен контролироваться врачом, имеющим опыт в применении подобных препаратов и лечения пациентов с рассеянным склерозом.
- Превышение концентрации действующего вещества Фампиры в крови в результате несоблюдения правил приема или дозирования, нарушения функции почек может вызвать судороги.

Реакции гиперчувствительности. У некоторых пациентов отмечали анафилаксию и ангионевротический отек, иногда подобные осложнения возникали уже после приема первой таблетки. Кроме того, симптомами аллергии могут быть гипотензия, тахикардия, припухание языка, диспноэ, крапивница. Пациента предупреждают о возможности развития такого синдрома и необходимости как можно быстрее связаться с врачом.

Сопутствующие поражения почек. Действующее вещество Фампиры преимущественно выделяется почками, поэтому при нарушении их функции необходима коррекция дозы. Но, так как таблетки выпускаются только с количеством активного компонента в 10 мг, а делить их на части запрещено из-за возможных изменений фармакокинетики, применение медикамента пациентам с поражениями почек противопоказано.

Риск развития судорожного синдрома. Вероятность возникновения судорог носит дозозависимый характер. Кроме того, прием лекарственного средства пациентами с подобными нарушениями в анамнезе противопоказан. Перед началом лечения больного информируют о риске таких осложнений. С

осторожностью медикамент назначают людям с предрасположенностью к развитию судорожного синдрома. Даже единичный эпизод судорог служит показанием к прекращению терапии.

Сопутствующие заболевания сердечно-сосудистой системы. Пациентам с такими патологиями Фампиру назначают с осторожностью, хотя достоверных данных о возможном риске или, наоборот, безопасности применения препарата на фоне подобных болезней, нет. Больные с сердечно-сосудистыми нарушениями не принимали участие в клинических испытаниях.

Влияние на работу иммунной системы. В ходе экспериментов установлено, что у 2,1% больных, принимающих Фампиру, снижался уровень лейкоцитов, на плацебо эта цифра составляла 1,9%. Несмотря на незначительную разницу, специалисты предполагают, что на фоне лечения возможно снижение резистентности к вирусным, бактериальным и микотическим инфекциям.

Неврологическая симптоматика. На начальных этапах терапии возможно сильное головокружение. Поэтому некоторым пациентам необходима посторонняя помощь, также следует воздержаться от работы и других занятий, требующих концентрации внимания.

Поражения мочеполовых органов. Во время клинических исследований инфекции структур половой и мочевыделительной системы регистрировали у 12% пациентов (против 8% на плацебо). Механизм развития подобных осложнений не до конца выяснен.

Применение при беременности и лактации. В экспериментах с участием животных отметили возможность негативного влияния Фампиры на развитие плода. Поэтому прием медикамента в период беременности не рекомендован. Неизвестно, выделяется ли лекарственное вещество с грудным молоком. На период лечения лактацию прекращают.

Обязательные лабораторные исследования. Во время терапии необходим строгий контроль функции почек. Регулярно выполняют клинический анализ крови.

Передозировка

Превышение количества медикамента может вызвать серьезные осложнения со стороны центральной нервной системы. Поэтому пациента немедленно госпитализируют и назначают поддерживающее лечение с обязательным применением противосудорожных препаратов.

Условия хранения препарата Стиварга

При температуре не выше -25°C . Хранить в оригинальной упаковке. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности препарата Стиварга

2 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.