Нивалин: инструкция по применению

Латинское название: Nivalin

Действующее вещество: галантамин

Код АТХ: N06DA04

Производитель: Софарма АО (Болгария)

Условие отпуска из аптеки: по рецепту

Условия хранения: вдали от света и детей

Срок годности: 24 месяца

Введение в тему

«Нивалин» – лекарственный препарат растительного происхождения из группы ингибиторов холинэстеразы. За счет ингибирования фермента ацетилхолинэстеразы в головном мозге препарат увеличивает концентрацию ацетилхолина и к уменьшает симптомы болезни Альцгеймера. Таблетки принимают один раз в день с небольшим количеством воды и пищи. Наиболее распространенными побочными эффектами являются тошнота и рвота.

Состав и форма выпуска

Действующее вещества:

- Галантамин.

Вспомогательные вещества:

- Молочный сахар
- Крахмал
- Магний
- Кальций
- Тальк.

«Нивалин» выпускается в виде таблеток для перорального введения по 5 мг активного вещества.

Фармакологические свойства

Галантамин представляет собой третичный алкалоид со структурой, подобной кодеину, относящийся к фармакологическому классу ингибиторов холиэстеразы. Активное вещество первоначально извлекли из лука семейства Amaryllidaceae. Это селективный, конкурентный и обратимый ингибитор холинэстеразы. Ранее это вещество использовалось в отдельных странах, например, для лечения миастении.

Считается, что центрально действующие ингибиторы холинэстеразы при деменции Альцгеймера способствуют холинергической нейротрансмиссии путем замедления деградации молекул ацетилхолина, высвобождаемых все еще неповрежденными холинергическими нейронами. Галантамин также влияет на холинергическую передачу другими способами: он связывается с холинергическими рецепторами никотинового типа, что приводит к усилению действия физиологических агонистов.

Галантамин быстро абсорбируется после приема внутрь; максимальные уровни в плазме достигаются через 1-2 часа. Биологическая доступность составляет чуть меньше 90%, период полувыведения плазмы примерно 10 часов. Галантамин метаболизируется примерно до 75% печеночными цитохромами; CYP2D6 и CYP3A4 являются наиболее важными. Однако, согласно

имеющимся на сегодняшний день данным, галантамин не оказывает соответствующего ингибирующего или индуцирующего действия на эти цитохромы. Хотя отдельные метаболиты активны in vitro, этот эффект должен быть неактуальным in vivo. Препарат и его метаболиты на 90% устраняются с мочой. Легкое или умеренное нарушение функции печени или почек и снижение активности CYP2D6 (медленные метаболизаторы) приводят к умеренному увеличению уровней в плазме, что представляется клинически бессмысленным.

Показания к применению

По сравнению с плацебо, галантамин обеспечивает среднее статистически значимое улучшение когнитивной функции и повседневной деятельности в течение 6-месячного периода. Хотя это не было напрямую сопоставлено ни с донепезилом, ни с ривастигмином, считается, что он обладает такой же эффективностью при болезни Альцгеймера, как эти два других ингибитора холинэстеразы.

Даже в отношении спектра и степени нежелательных эффектов никакие заметные различия между тремя препаратами не могут быть идентифицированы до сих пор. Практическая польза от ингибиторов холинэстеразы относительно скромна и длится немногим более 6 месяцев (несколько исследований, которые продолжались дольше, не были двойными слепыми).

Пациенты с болезнью Альцгеймера практически не реагируют или плохо переносят ингибиторы холинэстеразы. Следует также отметить, что преимущество было продемонстрировано только для пациентов с умеренными или тяжелыми когнитивными нарушениями. Однако, ввиду ограниченных терапевтических возможностей, введение ингибитора холинэстеразы может быть предпринято в отдельных случаях.

Инструкция по применению

Согласно инструкции по применению, «Нивалин» следует назначать дважды в день (утром и вечером). Производитель рекомендует начинать лечение 2 раза по 4 мг в день и увеличивать его до 2 раз 8 мг ежедневно после 1 недели.

Ежедневные дозы выше 16 мг приносят мало пользы и вызывают более серьезные неблагоприятные последствия. У пациентов с умеренной печеночной недостаточностью рекомендуется начинать с уменьшенной дозы (4 мг/сут) и не превышать ее до 16 мг/сут. Такая же предосторожность применяется к пациентам, принимающим ингибиторы CYP2D6 или CYP3A4.

Противопоказания, побочные эффекты, передозировка, лекарственное взаимодействие

Галантамин не должен использоваться при повышенной чувствительности к препарату, тяжелой печеночной или почечной дисфункции, ирите и тяжелых заболеваниях щитовидной железы (тиреотоксикоз). Не рекомендован препарат пациентам с желудочно-кишечными окклюзиями, стенозами или судорогами.

Галантамин не следует использовать пациентам с повышенным мышечным напряжением (миотония), болезнью Паркинсона и астмой. После операции или введения мышечных релаксантов (суксаметония или декаметония) препарат категорически запрещен.

Только после тщательной оценки риска и пользы врачом галантамин следует принимать пациентам с замедленным сердечным ритмом, чрезмерно низким кровяным давлением, сердечной недостаточностью, недавним инфарктом. То же самое относится к желудочно-кишечным язвам, эпилепсии, тетании и воспалению кишечника.

Тщательное медицинское наблюдение требуется пациентам, которые проходили операцию на кишечнике. Если у пациентов наблюдаются сильные судороги в области ЖКТ, необходимо

отказаться от применения препарата, поскольку он может усугублять состояние пациентов. Самолечение медикаментом категорически запрещено, поскольку может приводить к непредсказуемым последствиям. Вопреки распространенным заблуждениям, препарат не оказывает ноотропное действие у здоровых людей.

У пациентов с сердечной аритмией или сопутствующим использованием дигоксина или бета-блокаторов врач должен назначать меньшую дозировку галантамина. Галантамин не следует использовать во время беременности и лактации, поскольку исследования на животных показали, что препарат переходит через плацентарный барьер, а также попадает в грудное молоко.

Галантамин был оценен во многих исследованиях, которые пришли к тому, что Объединенный федеральный комитет (G-BA) по безопасности лекарств пересмотрел пользу вещества. Комитет пришел к выводу, что, хотя галантамин у пациентов болезнью Альцгеймера может положительно влиять на когнитивные способности и запоминание, его не следует использовать из-за побочных эффектов.

Как и другие ингибиторы холинэстеразы, галантамин вызывает преимущественно желудочно-кишечные побочные реакции холинергической природы. Тошнота, рвота и потеря аппетита гораздо чаще встречаются, чем при использовании плацебо, и при более высоких дозах. Таким образом, около 40% пациентов, получавших суточную дозу 32 мг, жалуются на тошноту. Другие побочные эффекты, влияющие на 10% пациентов, включают потерю веса, диарею, головокружение, головную боль или боль в животе. Наблюдается также тремор. Побочные эффекты возникают особенно во время увеличения дозы.

До сих пор никакие соответствующие взаимодействия не подтверждались клинически. В принципе, однако, можно ожидать, что галантамин противодействует эффекту антихолинергических веществ, а также может увеличить брадикардический эффект бета-блокаторов или дигоксина. Препараты, которые оказывают сильное ингибирующее действие на CYP2D6 или CYP3A4, могут вызывать увеличение уровней галантамина и соответствующее усиление холинергических побочных эффектов.