Леркамен 20



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Лерканидипин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Леркамен 10

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой от бледно-желтого до светло-желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне; на изломе - светло-желтого цвета.

	1 таб.
лерканидипина гидрохлорид	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 30 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 39 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 15.5 мг, повидон К30 - 4.5 мг, магния стеарат - 1 мг.

Состав оболочки: опадрай OY-SR-6497 - 3 мг (гипромеллоза - 1.913 мг, макрогол 6000 - 0.3 мг, тальк - 0.15 мг, титана диоксид - 0.6 мг, краситель железа оксид желтый - 0.037 мг).

7 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Леркамен 20

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой красновато-розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне; на изломе - светло-желтого цвета.

	1 таб.
лерканидипина гидрохлорид	20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 60 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 78 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 31 мг, повидон К30 - 9 мг, магния стеарат - 2 мг.

Состав оболочки: опадрай 02F25077 - 6 мг (гипромеллоза - 3.825 мг, тальк - 0.3 мг, титана диоксид - 1.2 мг, макрогол 6000 - 0.6 мг, железа оксид (III) - 0.075 мг).

7 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (7) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный блокатор медленных кальциевых каналов с преимущественным влиянием на сосуды, производное дигидропиридина. Ингибирует трансмембранный ток ионов кальция в клетки гладкой мускулатуры сосудов. Механизм антигипертензивного действия лерканидипина обусловлен прямым релаксирующим действием на гладкомышечные клетки сосудов, в результате чего снижается ОПСС.

Несмотря на относительно короткий период полувыведения из плазмы крови, лерканидипин оказывает пролонгированное антигипертензивное действие вследствие высокого коэффициента мембранного распределения. Благодаря высокой сосудистой селективности не оказывает отрицательного инотропного действия. Острая артериальная гипотензия с рефлекторной тахикардией возникает редко благодаря постепенному развитию вазодилатации при приеме лерканидипина.

Лерканидипин представляет собой рацемическую смесь (+)R- и (-)S-энантиомеров. Антигипертензивный эффект лерканидипина, прежде всего, обусловлен S-энантиомером.

Длительность терапевтического действия - 24 ч.

Фармакокинетика

Всасывание

Лерканидипин полностью всасывается после приема внутрь. C_{max} в плазме крови достигается через 1.5-3 часа и составляет 3.3±2.09 нг/мл и 7.66±5.90 нг/мл после приема 10 и 20 мг лерканидипина, соответственно.

(+)R- и (-)S-энантиомеры лерканидипина демонстрируют сходный фармакокинетический профиль: имеют одинаковое время достижения C_{max}, одинаковый $T_{1/2}$; значения C_{max} и AUC в 1.2 раза выше для (-)S-энантиомера. Взаимопревращения энантиомеров в опытах in vivo не наблюдали.

Вследствие эффекта "первого прохождения" через печень абсолютная биодоступность лерканидипина при приеме внутрь после еды составляет приблизительно 10%, при приеме натощак значение биодоступности уменьшается на 1/3. При приеме лерканидипина не позднее 2 ч после приема жирной пищи его биодоступность увеличивается в 4 раза, поэтому препарат Леркамен не следует принимать после еды. При пероральном применении лерканидипина его концентрация в плазме крови не является прямо пропорциональной к принятой дозе (нелинейная кинетика). Насыщение пресистемного метаболизма, происходит постепенно. Таким образом, биодоступность увеличивается с повышением дозы.

Распределение

Распределение из плазмы крови в ткани и органы происходит быстро и обширно. Связывание с белками плазмы крови превышает 98%.

Метаболизм и выведение

Лерканидипин метаболизируется с участием изофермента CYP3A4 с образованием неактивных метаболитов.

Около 50% принятой дозы выводится почками (около 50% выводится кишечником). Элиминация происходит в основном путем биотрансформации. Средний $T_{1/2}$ составляет 8-10 ч.

Кумуляции лерканидипина при повторном приеме внутрь не наблюдается.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Было показано, что фармакокинетика лерканидипина у пациентов пожилого возраста, пациентов с почечной недостаточностью (КК более 30 мл/мин) и у пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести схожа с фармакокинетикой, которая наблюдается в общей популяции пациентов.

У пациентов с почечной недостаточностью (КК менее 30 мл/мин) и у пациентов, находящихся на гемодиализе, концентрации лерканидипина в плазме крови были более высокими (приблизительно 70%).

У пациентов с тяжелой почечной и/или печеночной недостаточностью из-за снижения концентрации белка в плазме крови, свободная фракция лерканидипина может увеличиваться.

У пациентов с печеночной недостаточностью средней и тяжелой степени системная биодоступность лерканидипина, вероятно, увеличивается, поскольку лерканидипин метаболизируется главным образом в печени.

Показания к применению:

— эссенциальная гипертензия I-II степени тяжести.

Относится к болезням:

- Гипертензия

Противопоказания:

— нелеченная сердечная недостаточность;

— нестабильная стенокардия;

— обструкция сосудов, исходящих из левого желудочка сердца;

— период в течение 1 месяца после перенесенного инфаркта миокарда;

— тяжелая печеночная недостаточность;

— почечная недостаточность тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин);

— одновременное применение с ингибиторами CYP3A4 (кетоконазол, итраконазол, эритромицин, ритонавир, тролеандомицин);

— одновременное применение с циклоспорином;

— одновременный прием с соком грейпфрута;

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— применение у женщин детородного возраста, не пользующихся надежными методами контрацепции;

— детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не изучены);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность к другим производным дигидропиридинового ряда.

С *осторожностью* следует применять при почечной (КК более 30 мл/мин) и/или печеночной недостаточности легкой и средней степени тяжести, у пациентов пожилого возраста, при СССУ (без кардиостимулятора), ИБС, дисфункции левого желудочка.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, не менее чем за 15 минут до еды, предпочтительно утром, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды.

Назначают по 10 мг 1 раз/сут. В зависимости от индивидуальной переносимости препарата пациентом доза может

быть увеличена до 20 мг.

Терапевтическую дозу подбирают постепенно, т.к. максимальное антигипертензивное действие развивается приблизительно через 2 недели после начала приема препарата. Маловероятно, что эффективность препарата будет возрастать с повышением дозы более 20 мг/сут, в тоже время повышается риск возникновения побочных эффектов.

Фармакокинетический профиль и данные клинических исследований показывают, что у **пациентов пожилого возраста** коррекции дозы препарата Леркамен не требуется. Однако следует соблюдать осторожность на начальном этапе лечения препаратом Леркамен у данной группы пациентов.

При применении препарата Леркамен у пациентов с **почечной и печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести** следует соблюдать осторожность.

При **почечной недостаточности (КК более 30 мл/мин) или печеночной недостаточности легкой или средней степени тяжести**, начальная доза составляет 10 мг, затем с осторожностью увеличивают дозу до 20 мг/сут. Антигипертензивный эффект может усиливаться у пациентов с **печеночной недостаточностью легкой или средней степени тяжести** и может потребоваться коррекция (снижение) дозы.

При **почечной недостаточности (КК менее 30 мл/мин) и печеночной недостаточности тяжелой степени** тяжести применение препарата Леркамен противопоказано.

Побочное действие:

Возможные побочные эффекты приведены ниже по нисходящей частоте возникновения: часто (<1/10, ≥1/100), нечасто (<1/100, ≥1/1000), редко (<1/1000, ≥1/10000), очень редко (<1/10000), включая отдельные сообщения.

Со стороны нервной системы: нечасто - головная боль, головокружение; редко - сонливость.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - ощущение сердцебиения, тахикардия, "приливы" крови к коже лица; редко - стенокардия, боль за грудиной; очень редко - обморок, у пациентов со стенокардией возможно увеличение частоты, продолжительности и тяжести приступов.

Со стороны пищеварительной системы: редко - тошнота, диспепсия, диарея, эпигастральная боль, рвота.

Со стороны кожи и подкожных тканей: редко - кожная сыпь.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - миалгия.

Со стороны мочевыводящей системы: редко - полиурия.

Со стороны иммунной системы: очень редко **-** реакции повышенной чувствительности.

Со стороны организма в целом: нечасто - периферические отеки; редко **-** астения, повышенная утомляемость.

Имеются сообщения о следующих побочных очень редких (<1/10 000) явлениях: инфаркт миокарда, гиперплазия десен, обратимое повышение активности "печеночных" трансаминаз, выраженное снижение АД, поллакиурия (увеличение частоты мочеиспускания), боль в грудной клетке.

Передозировка:

Предположительно, в случае передозировки лерканидипина будут наблюдаться *симптомы*, сходные с таковыми при передозировке других производных дигидропиридина: периферическая вазодилатация с выраженным снижением АД и рефлекторной тахикардией.

Лечение: проведение симптоматической терапии; в случае выраженного снижения АД, потери сознания показана сердечно-сосудистая терапия, при брадикардии - в/в введение атропина.

Имеются данные о 3-х случаях передозировки при приеме лерканидипина в дозах 150 мг, 280 мг и 800 мг с целью суицида.

В случае приема 150 мг лерканидипина + алкоголь (неустановленное количество) наблюдалась сонливость.

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля.

В случае приема 280 мг лерканидипина + 5.6 мг моксонидина наблюдались следующие *симптомы:* кардиогенный шок, выраженная ишемия миокарда, почечная недостаточность легкой степени.

Лечение: сердечные гликозиды, диуретики (фуросемид), высокие дозы катехоламинов, плазмозаменители.

В случае приема 800 мг лерканидипина наблюдались тошнота и выраженное снижение АД.

Лечение: прием активированного угля и слабительного средства, в/в - допамин.

Во всех случаях передозировки все пациенты остались живы. Информация по эффективности диализа для лерканидипина отсутствует. Наиболее вероятно, что из-за высокой связи лерканидипина с белками плазмы крови, диализ может быть неэффективным.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Леркамен при беременности и в период грудного вскармливания, а также у **женщин детородного возраста** при отсутствии надежной контрацепции противопоказано.

В ходе доклинических исследований не выявлено тератогенного эффекта лерканидипина у крыс и кроликов, репродуктивная функция крыс была без изменений.

В виду отсутствия клинического опыта применения лерканидипина при беременности и в период грудного вскармливания и поскольку известно, что другие производные дигидропиридина оказывали тератогенное действие у животных, лерканидипин не рекомендуется применять при беременности и у женщин детородного возраста, не пользующихся надежными методами контрацепции.

Вследствие высокой липофильности лерканидипина, можно предполагать его проникновение в грудное молоко, поэтому препарат не рекомендуется применять в период грудного вскармливания

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Лерканидипин можно одновременно применять с бета-адреноблокаторами, диуретиками, ингибиторами АПФ.

При одновременном применении с метопрололом, биодоступность лерканидипина уменьшается на 50%. Этот эффект может встречаться и при одновременном применении с другими бета-адреноблокаторами, поэтому может потребоваться коррекция дозы лерканидипина для достижения терапевтического эффекта при данной комбинации.

Лерканидипин метаболизируется при участии изофермента CYP3A4, поэтому ингибиторы и индукторы этого изофермента, при одновременном применении, могут влиять на метаболизм и выведение лерканидипина. Не рекомендуется одновременное применение лерканидипина с ингибиторами CYP3A4 (кетоконазол, итраконазол, ритонавир, эритромицин, тролеандомицин).

Не рекомендуется одновременное применение циклоспорина и лерканидипина, т.к. наблюдается увеличение концентрации обоих веществ в плазме крови.

Следует проявлять осторожность при одновременном применении лерканидипина с другими субстратами CYP3A4 (терфенадин, астемизол, антиаритмические препараты III класса, например, амиодарон, хинидин).

При одновременном применении лерканидипина в дозе 20 мг с мидазоламом биодоступность лерканидипина у пожилых пациентов может увеличиваться приблизительно на 40%.

Лерканидипин следует назначать с осторожностью одновременно с индукторами CYP3A4, например, противосудорожные средства (фенитоин, карбамазепин) и рифампицин, поскольку возможно снижение антигипертензивного действия препарата. Необходим регулярный контроль АД.

При одновременном применении лерканидипина в дозе 20 мг у пациентов, постоянно принимающих бета-метилдигоксин, не было отмечено фармакокинетического взаимодействия, в то время как у здоровых добровольцев, которых лечили дигоксином, отмечалось увеличение значения C_{max} для дигоксина в среднем на 33% после приема 20 мг лерканидипина натощак, при этом AUC и почечный клиренс изменялись незначительно. Необходимо контролировать наличие признаков интоксикации дигоксином у пациентов, принимающих одновременно дигоксин и лерканидипин.

Одновременное применение лерканидипина с циметидином (до 800 мг) не вызывает значительных изменений концентрации лерканидипина в плазме крови. При высоких дозах циметидина могут увеличиваться биодоступность и антигипертензивное действие лерканидипина.

При одновременном применении лерканидипина (20 мг) и симвастатина (40 мг), значение AUC для симвастатина увеличивалось на 56%, а это же значение для его активного метаболита - β-гидроксикислоты - на 28%. При приеме препаратов в разное время суток (лерканидипин - утром, симвастатин - вечером) можно избежать нежелательного взаимодействия.

При одновременном применении лерканидипина в дозе 20 мг и варфарина у здоровых добровольцев изменений фармакокинетики варфарина не наблюдалось.

Одновременное применение с флуоксетином (ингибитором CYP2D6 и CYP3A4) у пациентов пожилого возраста не оказало клинически значимых изменений фармакокинетики лерканидипина.

Возможно усиление антигипертензивного действия при одновременном приеме сока грейпфрута и лерканидипина.

Этанол может потенцировать антигипертензивное действие лерканидипина.

Особые указания и меры предосторожности:

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Поскольку на фоне терапии препаратом Леркамен возможно появление головокружения, астении, усталости и в редких случаях сонливости, в период применения препарата пациентам следует с особой осторожностью управлять автотранспортом и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности, требующими высокой скорости психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять при почечной недостаточности (КК более 30 мл/мин).

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять при печеночной недостаточности легкой и средней степени тяжести.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью следует применять у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям до 18 лет

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Lerkamen_20