Лерканидипин-СЗ



Код АТХ:

- C08CA13

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Лерканидипин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг, 20 мг. По 10 или 30 табл. в контурной ячейковой упаковке. По 30 табл. в банке полимерной или во флаконе полимерном.

Каждую банку или флакон, 3, 6 контурных ячейковых упаковок по 10 табл. или 1, 2 контурные ячейковые упаковки по 30 табл. помещают в картонную пачку.

Состав:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 табл.
активное вещество:	
лерканидипина гидрохлорид	10/20 мг
вспомогательные вещества	
ядро: лактозы моногидрат (сахар молочный) — 31,5/63 мг; МКЦ — 38,5/77 мг; натрия гликолят крахмала — 15,5/31 мг; гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) — 3,5/7 мг; магния стеарат — 1/2 мг	
оболочка пленочная: Opadry II (спирт поливиниловый, частично гидролизованный — 1,2/2,4 мг, титана диоксид (E171) — 0,67998/1,3416 мг, тальк — 0,444/0,888 мг, макрогол (полиэтиленгликоль) 3350 — 0,606/1,212 мг, краситель железа оксид желтый (E172) — 0,06825/0,0858 мг, краситель железа оксид красный (E172) — 0,00096/0,0726 мг, краситель железа оксид	

черный (E172) — 0,00081/- мг)	

Описание:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг: от бежево-желтого до бежевого цвета, круглые, двояковыпуклые.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 20 мг: розовато-оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые.

На поперечном разрезе ядро таблетки светло-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — антигипертензивное.

Фармакодинамика

Лерканидипин (БКК) является рацемической смесью право- (R) и левовращающего (S) стереоизомеров, производным 1,4-дигидропиридина, способен избирательно блокировать ток ионов кальция внутрь клеток гладкой мускулатуры сосудистой стенки. Механизм гипотензивного действия обусловлен прямым релаксирующим действием на гладкомышечные клетки сосудов. Обладает пролонгированным антигипертензивным действием. Терапевтический эффект достигается через 5–7 ч после приема внутрь, и длительность его сохраняется в течение суток (24 ч). Благодаря высокой селективности к гладкомышечным клеткам сосудов отрицательное инотропное действие отсутствует. Лерканидипин является метаболически нейтральным препаратом и не оказывает существенного воздействия на содержание липопротеинов и аполипопротеинов в сыворотке крови, а также не изменяет липидный профиль у пациентов с артериальной гипертензией.

Фармакокинетика

После приема внутрь в дозе 10-20 мг полностью всасывается. C_{max} в плазме крови обнаруживается через 1.5-3 ч и составляет 3.3 нг/мл и 7.66 нг/мл соответственно. Распределение из плазмы крови в ткани и органы происходит быстро. Связывание с белками плазмы крови превышает 98%. Кумуляции при повторном приеме не наблюдается. Подвергается метаболизму. Средний $T_{1/2}$ составляет 8-10 ч.

Показания к применению:

Мягкая и умеренная эссенциальная артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия

Противопоказания:

Хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации; нестабильная стенокардия; аортальный стеноз; в течение 1 месяца после перенесенного инфаркта миокарда; выраженные нарушения функции печени; нарушение функции почек (КК менее 10 мл/мин); непереносимость лактозы; галактоземия; синдром нарушенного всасывания глюкозы/галактозы; беременность; период лактации (грудного вскармливания); женщины детородного возраста, не пользующиеся надежной контрацепцией; детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к компонентам препарата; повышенная чувствительность к другим производным дигидропиридинового ряда.

Способ применения и дозы:

Внутрь по 10 мг 1 раз/сут не менее чем за 15 минут до еды, предпочтительно утром. В зависимости от достигнутого терапевтического эффекта доза может быть увеличена до 20 мг. Терапевтическую дозу подбирают постепенно, при необходимости, увеличение дозы до 20 мг осуществляется через 2 недели после начала лечения.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко отмечались эффекты, связанные с сосудорасширяющим действием - периферические отеки, ощущение "приливов" крови к лицу, сердцебиение, тахикардия, боль в груди, снижение АД, стенокардия, инфаркт миокарда, астения, утомляемость, головная боль, головокружение.

Со стороны пищеварительной системы: очень редко - диспепсия, тошнота, рвота, боль в эпигастрии, диарея, обратимое повышение активности печеночных ферментов, гиперплазия десен.

Прочие: очень редко - полиурия, кожная сыпь, сонливость, миалгия.

Передозировка:

Симптомы: предположительно будут наблюдаться симптомы, сходные с таковыми при передозировке других производных дигидропиридина (периферическая вазодилатация с выраженным снижением АД и рефлекторной тахикардией), тошнота.

Имеются данные о 3 случаях передозировки при приеме лерканидипина в дозах 150, 280 и 800 мг. Во всех случаях передозировки пациенты остались живы.

Симптомы в случае одновременного приема 150 мг лерканидипина с этанолом (неустановленное количество): сонливость.

Симптомы в случае одновременного приема 280 мг лерканидипина с 5,6 мг моксонидина: кардиогенный шок, выраженная ишемия миокарда, почечная недостаточность легкой степени.

Симптомы в случае приема 800 мг лерканидипина: тошнота, выраженное снижение АД.

Лечение: симптоматическое. В случае выраженного снижения АД, потери сознания показана сердечно-сосудистая терапия, при брадикардии — в/в введение атропина. Информация об эффективности гемодиализа отсутствует. Учитывая высокую степень связи с белками плазмы крови, диализ может быть неэффективным.

Лечение в случае одновременного приема 150 мг лерканидипина с этанолом (неустановленное количество): промывание желудка, назначение внутрь активированного угля.

Лечение в случае одновременного приема 280 мг лерканидипина с 5,6 мг моксонидина: назначение сердечных гликозидов, диуретиков (фуросемид), высоких доз катехоламинов, плазмозаменителей.

Лечение в случае приема 800 мг лерканидипина: назначение внутрь активированного угля и слабительных средств, в/в — допамин.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) противопоказано.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с ингибиторами CYP3A4 (в т.ч. с кетоконазолом, интраконазолом, эритромицином) возможны проявления лекарственного взаимодействия (комбинации применять с осторожностью).

При применении совместно с индукторами CYP3A4 (в т.ч. с антидепрессантами, рифампицином) возможно уменьшение антигипертензивного действия лерканидипина.

Возможно усиление гипотензивного эффекта лерканидипина при употреблении сока грейпфрута.

Этанол может потенцировать действие лерканидипина.

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 пациентов пожилого возраста 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.

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

Этанол может потенцировать антигипертензивное действие лерканидипина.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять при почечной и/или печеночной недостаточности легкой и умеренной степени, у пациентов пожилого возраста, при СССУ (без кардиостимулятора), ИБС, дисфункции левого желудочка.

Источник: http://drugs.thead.ru/Lerkanidipin-SZ