Левосимендан-Натив



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Концентрат для приготовления раствора для инфузий в виде прозрачного раствора от желтого или оранжево-желтого до коричневато-оранжевого цвета.

	1 мл
левосимендан	2.5 мг

Вспомогательные вещества: повидон - 10 мг, лимонная кислота безводная - 2 мг, спирт этиловый абсолютированный - 785 мг.

5 мл - флаконы (1) - пачки картонные.
5 мл - флаконы (4) - пачки картонные.
5 мл - флаконы (10) - пачки картонные.
10 мл - флаконы (1) - пачки картонные.
10 мл - флаконы (4) - пачки картонные.
10 мл - флаконы (10) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиотоническое средство. Повышает чувствительность сократительных белков к кальцию путем связывания с тропонином С миокарда в кальциево-зависимой фазе. Левосимендан повышает силу сердечных сокращений, но не влияет на расслабление желудочков. Оказывает вазодилатирующее действие на артерии (включая коронарные) и вены. Левосимендан является селективным ингибитором ФДЭ 3 in vitro.

Благодаря наличию положительного инотропного и вазодилатирующего действия, при сердечной недостаточности повышает силу сердечных сокращений и уменьшает как преднагрузку, так и постнагрузку.

Левосимендан активирует ишемизированный миокард у пациентов после коронарной ангиопластики или тромболизиса.

Левосимендан увеличивает коронарный кровоток у пациентов, перенесших операции на сердце, и улучшает перфузию миокарда у пациентов с сердечной недостаточностью. Эти положительные эффекты достигаются без значительного повышения потребления миокардом кислорода. Левосимендан значительно снижает циркулирующий уровень эндотелина-1 при хронической сердечной недостаточности.

Вызывает дозозависимое увеличение сердечного выброса и ударного объема, а также дозозависимое снижение давления в легочно-капиллярной сети, снижение среднего АД и ОППС.

Положительное влияние на сердечный выброс и давление в легочных капиллярах сохраняется как минимум в течение 24 ч после прекращения инфузии.

Влияние на АД, как правило, продолжается 3-4 дня. При применении в терапевтических дозах образуется один фармакологически активный метаболит, который дает схожие с левосименданом гемодинамические эффекты, сохраняющиеся до 7-9 дней после прекращения 24 ч инфузии.

Фармакокинетика

В диапазоне терапевтических доз 50-200 мкг/кг/мин характеризуется линейной фармакокинетикой.

C_{max} левосимендана в плазме крови достигается примерно через 2 дня после прекращения введения препарата. V_d составляет около 0.2 л/кг.

Связывание с белками плазмы крови (преимущественно с альбумином) составляет 97-98%. Связывание с белками активного метаболита составляет 40%.

Левосимендан практически полностью метаболизируется.

Первичный метаболизм левосимендана осуществляется путем конъюгации с циклическим или N-ацетилированным цистеинилглицином и цистеиновыми конъюгатами. Около 5% введеной дозы метаболизируется в тонкой кишке путем восстановления до аминофенилпиридазинона, который после реабсорбции метаболизируется при участии N-ацетилтрансферазы до активного метаболита. Степень ацетилирования генетически детерминирована.

В исследованиях in vitro показано, что левосимендан может умеренно ингибировать CYP2D6.

Клиренс левосимендана составляет около 3 мл/мин/кг, $T_{1/2}$ около 1 ч. Выводится практически полностью в виде метаболитов: с мочой - 54%, с калом - 44%. Менее 0.05% выводится с мочой в неизмененном виде.

$T_{1/2}$ метаболитов составляет около 75-80 ч.

Выведение активного метаболита не изучено.

При легкой степени печеночной недостаточности, связанной с циррозом, выведение левосимендана несколько замедлено.

Показания к применению:

Острая декомпенсация тяжелой хронической сердечной недостаточности (для кратковременной терапии при неэффективности стандартной терапии и необходимости поддержания сократительной функции миокарда).

Относится к болезням:

- Миокардит
- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

Механическая обструкция, препятствующая заполнению желудочков или выбросу крови из желудочков; тяжелые нарушения функции почек (КК < 30 мл/мин); тяжелые нарушения функции печени; артериальная гипотензия; тахикардия; трепетание-мерцание желудочков в анамнезе; неконтролируемая гипокалиемия; детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к левосимендану.

Способ применения и дозы:

Предназначен для применения только в условиях стационара, располагающего необходимым оборудованием для мониторинга и медицинским персоналом с опытом работы с кардиотоническими лекарственными средствами.

Доза и длительность терапии устанавливаются индивидуально, в зависимости от клинической ситуации. Вводят путем в/в инфузии.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: значительное снижение АД, экстрасистолия, фибрилляция предсердий,

тахикардия, желудочковая тахикардия, трепетание предсердий, ишемия миокарда.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, головная боль.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота.

Со стороны лабораторных показателей: снижение гемоглобина, гематокрита, гипокалиемия.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Клинический опыт применения левосимендана при беременности отсутствует. Применение возможно только в случаях, когда ожидаемая польза терапии для матери превосходит потенциальный риск для плода.

В экспериментальных исследованиях отмечено токсическое действие на репродукцию.

Неизвестно, выделяется ли левосимендан с грудным молоком. Пациентка должна отказаться от грудного вскармливания на период 14 дней после инфузии.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Выведение метаболита левосимедана из организма изучено недостаточно, поэтому лекарственное взаимодействие, связанное с этим процессом предсказать трудно; считается, что существует риск более выраженного и длительного влияния на ЧСС.

При одновременном применении с изосорбида мононитратом имеется риск усиления гипотензивного эффекта.

Особые указания и меры предосторожности:

С особой осторожностью применять при острой сердечной недостаточности, обусловленной внекардиальными причинами; при тяжелой декомпенсированной сердечной недостаточности после хирургической операции; тяжелой сердечной недостаточности у пациентов, ожидающих трансплантацию.

С осторожностью следует применять у пациентов с почечной недостаточностью легкой или умеренной степени, легкой или умеренной печеночной недостаточностью, сопутствующей анемией, фибрилляцией предсердий, у пациентов с существующей ишемией миокарда, удлинением интервала QT различного генеза или при одновременном назначении лекарственных средств, удлиняющих интервал QT (только под тщательным контролем ЭКГ).

Данные о безопасности и эффективности применения левосимендана отсутствуют при следующих заболеваниях: гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, тяжелая недостаточность митрального клапана, разрыв, перфорация миокарда, гемотампонада сердца, инфаркт правого желудочка и потенциально угрожающая жизни аритмия длительностью 3 и более месяцев.

Во время лечения следует постоянно мониторировать ЭКГ, АД, ЧСС и диурез. Кроме того, необходимо следить за динамикой симптомов сердечной недостаточности, для этого рекомендуются инвазивные методы контроля гемодинамики.

Неинвазивный мониторинг рекомендуется после окончания инфузии как минимум в течение 3 дней или до стабилизации гемодинамики. У пациентов с легкой или умеренной степенью почечной или печеночной недостаточности мониторинг рекомендуется проводить как минимум в течение 5 дней.

У пациентов с нарушениями функции печени и почек может привести к повышению концентрации метаболитов, в результате возможно более интенсивное и длительное действие на ЧСС.

Перед началом применения левосимендана следует скорректировать гипокалиемию, гиповолемию. В период лечения следует контролировать содержание калия в сыворотке крови.

Если наблюдаются резкие колебания АД или ЧСС, то следует уменьшить скорость введения или отменить инфузию.

У пациентов с тяжелыми нарушениями деятельности сердца левосимендан следует применять под постоянным контролем сердечного выброса и давления наполнения.

Перед применением левосимендана следует купировать аритмию и стабилизировать клиническое состояние пациентов с постоянной формой желудочковой тахикардии, пароксизмальной тахикардией, не связанной с реперфузией или угрожающими жизни формами аритмии.

После прекращения лечения синдрома отмены не наблюдается.

Источник: http://drugs.thead.ru/Levosimendan-Nativ