Нимотоп



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Нимодипин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой в виде байеровского креста на одной стороне, "SK" - на другой.

	1 таб.
нимодипин	30 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный - 37.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 142.5 мг, повидон - 75 мг, кросповидон - 44.4 мг, магния стеарат - 0.6 мг.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза - 5.4 мг, макрогол - 1.8 мг, железа оксид желтый - 0.54 мг, титана диоксид - 1.26 мг.

10 шт. - блистеры (3) - коробки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - коробки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Блокатор кальциевых каналов. Нимодипин обладает высокоселективным спазмолитическим действием в отношении сосудов головного мозга. Нимодипин предотвращает или устраняет сужение сосудов, спровоцированное различными вазоактивными веществами (например, серотонином, простагландинами).

У пациентов с острыми нарушениями мозгового кровообращения нимодипин расширяет мозговые сосуды и способствует улучшению мозгового кровотока. Увеличение перфузии, как правило, более выражено в областях мозга,

которые получали недостаточное кровоснабжение, чем в неповрежденных тканях. Нимодипин значительно снижает частоту ишемических повреждений головного мозга и уровень смертности у пациентов с субарахноидальным кровоизлиянием.

Нимодипин, действуя на связанные с кальциевыми каналами рецепторы кровеносных сосудов головного мозга, оказывает защитное действие на нервные клетки, стабилизирует их функцию, улучшает кровоснабжение головного мозга, улучшает переносимость ишемии нервными клетками, при этом не развивается "синдром обкрадывания". Нимодипин оказывает благоприятное воздействие при расстройствах памяти и концентрации внимания у пациентов с нарушением мозговых функций. При этом улучшаются личностные, поведенческие реакции и результаты психометрических функциональных тестов.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь нимодипин практически полностью всасывается. Нимодипин и первичные метаболиты обнаруживаются в плазме крови уже через 10-15 мин после приема таблетки. После многократного приема внутрь (30 мг 3 раза/сут) C_{max} у пожилых пациентов достигалась через 0.6-1.6 ч и составляла 7.3-43.2 нг/мл. У молодых пациентов после приема однократных доз 30 мг и 60 мг C_{max} составляет 16±8 нг/мл и 31±12 нг/мл соответственно. Увеличение C_{max} и AUC имеет дозозависимый характер.

В связи с интенсивным метаболизмом при "первом прохождении" через печень (85-95%) абсолютная биодоступность нимодипина составляет 5-15%.

Распределение

Нимодипин интенсивно связывается с белками плазмы крови (97-99%), проникает через плацентарный барьер. Концентрации нимодипина и его метаболитов в грудном молоке существенно превышают концентрацию в плазме крови. После приема внутрь концентрация нимодипина в спинномозговой жидкости составляет около 0.5% от концентрации в плазме крови.

Метаболизм и выведение

Нимодипин метаболизируется в основном дегидрогенизацией дигидропиридинового кольца и окислительным расщеплением эфиров. Три основных метаболита, обнаруживающиеся в плазме крови, не обладают клинически значимой активностью.

Влияние нимодипина на активность печеночных ферментов не изучалось. Метаболиты на 50% выводятся почками и на 30% с желчью.

При приеме внутрь $T_{1/2}$ нимодипина (начальная фаза) составляет от 1.1 до 1.7 ч, окончательная фаза $T_{1/2}$ - 5-10 ч.

Показания к применению:

— профилактика и лечение ишемических неврологических расстройств, вызванных спазмом сосудов головного мозга на фоне субарахноидального кровоизлияния, вызванного разрывом аневризмы (применяется после предшествующего проведения в/в терапии раствором для инфузий);

— выраженные нарушения функций мозга у пациентов пожилого возраста (снижение памяти и концентрации внимания, эмоциональная неустойчивость).

Относится к болезням:

- Неврит
- Неврозы
- Спазмы

Противопоказания:

— тяжелые нарушения функций печени (например, цирроз печени);

— одновременное назначение с рифампицином или противоэпилептическими препаратами (фенобарбитал, фенитоин, карбамазепин);

— беременность;

— период лактации;

— возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата.

С *осторожностью* следует назначать при артериальной гипотензии (систолическое давление менее 100 мл рт.ст).

У пациентов с нестабильной стенокардией или в течение первых 4 недель после острого инфаркта миокарда необходима оценка соотношения потенциального риска (снижение перфузии коронарных артерий и ишемия миокарда) и преимуществ (улучшение перфузии головного мозга).

С *осторожностью* следует назначать препарат пожилым пациентам с сочетанной патологией с тяжелыми нарушениями функции почек (гломерулярная фильтрация менее 20 мл/мин).

Пациенты пожилого возраста с тяжелой сердечной недостаточностью, получающие препарат для лечения нарушений функции мозга, нуждаются в регулярном обследовании.

Способ применения и дозы:

Таблетки следует проглатывать целиком, запивая небольшим количеством жидкости, независимо от приема пищи. Интервалы между приемами должны составлять не менее 4 ч.

При *субарахноидальном кровоизлиянии, вызванном разрывом аневризмы,* прием таблеток следует начинать после 5-14 дней в/в терапии инфузионным раствором Нимотоп. Рекомендуемая доза - 2 таб. 6 раз/сут (60 мг нимодипина 6 раз/сут) в течение 7 дней.

При *нарушениях мозговых функций у пациентов пожилого возраста* рекомендуемая доза - 1 таб. 3 раза/сут (30 мг нимодипина 3 раза/сут).

Побочное действие:

В каждой группе нежелательные реакции представлены в порядке уменьшения их тяжести. Частота определена как очень часто (≥ 1/10), часто (от ≥ 1/100 до <1/10), нечасто (от ≥ 1/1 000 до <1/100), редко (от ≥ 1/10 000 до <1/1000), очень редко (<1/10 000).

Ниже представлены нежелательные реакции, о которых сообщалось в связи с применением препарата при ***ишемических неврологических расстройствах.***

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - тахикардия, снижение АД, вазодилатация; редко - брадикардия.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - тошнота; редко - кишечная непроходимость.

Со стороны гепатобилиарной системы: редко - транзиторное повышение уровня печеночных ферментов.

Со стороны нервной системы: нечасто - головная боль.

Со стороны системы кроветворения: нечасто - тромбоцитопения.

Со стороны иммунной системы: нечасто - аллергические реакции, сыпь.

Ниже представлены нежелательные реакции, о которых сообщалось в связи с применением препарата при ***выраженных нарушениях функции мозга у пациентов пожилого возраста.***

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - снижение АД, вазодилатация; редко - ощущение сердцебиения, тахикардия, обморок, отеки.

Со стороны пищеварительной системы: редко - запор, диарея, метеоризм.

Со стороны нервной системы: редко - головная боль, вертиго, головокружение, гиперкинезия, тремор.

Со стороны иммунной системы: редко - аллергические реакции, сыпь.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, тахикардия или брадикардия, рвота, боли в эпигастральной области, симптомы нарушения деятельности ЦНС.

Лечение: в случае передозировки прием препарата следует немедленно прекратить. Первая помощь включает промывание желудка и прием активированного угля. Проводят симптоматическую терапию. Если отмечается

значительное снижение АД, следует ввести в/в допамин или норэпинефрин. Специфические антидоты нимодипина неизвестны.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение Нимотопа при беременности всегда требует тщательной оценки соотношения факторов пользы и риска с учетом тяжести клинической картины.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Нимодипин метаболизируется с участием изофермента CYP3A4, поэтому препараты, индуцирующие или ингибирующие активность ферментов печени, могут оказывать влияние на концентрацию нимодипина в плазме.

Исходя из опыта применения других блокаторов медленных кальциевых каналов, можно ожидать, что рифампицин, являющийся индуктором активности печеночных ферментов, способен ускорять метаболизм нимодипина. При одновременном применении рифампицина и нимодипина эффективность последнего может быть снижена.

Противоэпилептические препараты, индуцирующие изофермент CYP3A4 (фенобарбитал, фенитоин и карбамазепин) значимо снижают биодоступность нимодипина, поэтому их совместное применение противопоказано.

Препараты, индуцирующие активности изофермента CYP3A4, могут повышать концентрацию нимодипина в плазме: макролиды, например, эритромицин (структурно родственный азитромицин не обладает такими свойствами), ингибиторы ВИЧ-протеазы (например, ритонавир), азоловые противогрибковые препараты (например, кетоконазол), антидепрессанты нефазодон и флуоксетин, квинопристин/дальфопристин, циметидин, вальпроевая кислота. При совместном назначении данных препаратов следует уменьшить дозы нимодипина и проводить мониторинг АД.

Длительное применение нимодипина с нортриптилином приводит к незначительному снижению концентрации нимодипина в плазме крови; концентрация нортриптилина остается неизменной.

Длительное применение нимодипина с флуоксетином приводит к повышению концентрации нимодипина в плазме крови в среднем на 50%. Концентрация флуоксетина значительно снижается, при этом содержание активного метаболита флуоксетина - норфлуоксетина не меняется.

Нимодипин может понижать АД при совместном назначении с диуретиками, бета-адреноблокаторами, ингибиторами АПФ, блокаторами АТ1-рецепторов, другими антагонистами кальция, альфа-адреноблокаторами, метилдопой, ингибиторами фосфодиэстеразы. При совместном применении нимодипина с препаратами из этих групп требуется тщательный контроль АД.

У пациентов, находящихся на долговременной терапии галоперидолом, не обнаружено лекарственного взаимодействия нимодипина с галоперидолом.

Одновременное в/в назначение зидовудина и нимодипина внутрь приводит к значительному увеличению AUC зидовудина и снижению объема его распределения и клиренса.

Препараты кальция снижают эффективность применения нимодипина.

Одновременная терапия потенциально нефротоксичными препаратами (например, аминогликозидами, цефалоспоринами, фуросемидом) может вызвать нарушение функции почек. В случае проведения подобного лечения, а также у больных с почечной недостаточностью, лечение должно проводиться под тщательным контролем. При обнаружении нарушения функций почек прием нимодипина следует прекратить.

Грейпфрутовый сок подавляет метаболизм окисления дигидропиридинов. Сочетания грейпфрутового сока и нимодипина следует избегать, т.к. это может привести к повышению концентрации нимодипина в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

Назначение нимодипина пациентам пожилого возраста с большим количеством сопутствующих заболеваний, тяжелой почечной недостаточностью (величина клубочковой фильтрации менее 20 мл/мин) и тяжелыми сердечно-сосудистыми заболеваниями должно быть особенно тщательно обосновано. Во время терапии и после ее окончания такие пациенты нуждаются в регулярном врачебном наблюдении.

У пациентов с нарушениями функции печени из-за снижения интенсивности первичного метаболизма и замедления метаболической инактивации биодоступность нимодипина может повышаться. Вследствие этого основное и побочное действие, в частности, его гипотензивный эффект, могут усиливаться. В таких случаях дозу препарата следует снизить в зависимости от степени снижения АД, а при необходимости прием нимодипина следует прекратить.

Фертильность

В отдельных случаях при проведении оплодотворения in vitro на фоне применения блокаторов медленных кальциевых каналов наблюдались обратимые химические изменения в головке сперматозоидов, что может приводить к нарушению функция спермы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Применение нимодипина может нарушать способность к управлению транспортными средствами и механизмами, в связи с возможным снижением АД и возникновения головокружения.

При нарушениях функции почек

Назначение нимодипина пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени (клубочковая фильтрация менее 20 мл/мин) и тяжелыми сердечно-сосудистыми заболеваниями должно быть тщательно обосновано. Во время терапии и после ее окончания такие пациенты нуждаются в регулярном врачебном наблюдении.

При нарушениях функции печени

Противопоказано: тяжелые нарушения функций печени (например, цирроз печени).

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью следует назначать препарат в форме таблеток пациентам пожилого возраста с сочетанной патологией с тяжелыми нарушениями функции почек (гломерулярная фильтрация менее 20 мл/мин). Пациенты пожилого возраста с тяжелой сердечной недостаточностью, получающие препарат внутрь для лечения нарушений функций головного мозга, нуждаются в регулярном обследовании.

Применение в детском возрасте

Противопоказано: возраст до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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