Нимотоп (раствор)



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:

Раствор для инфузий слегка желтоватого цвета, прозрачный.

	1 мл	**1 фл.**
нимодипин	200 мкг	10 мг

Вспомогательные вещества: этанол 96% - 10 г, макрогол 400 - 8.5 г, натрия цитрат - 0.1 г, лимонная кислота безводная - 15 мг, вода д/и - 31.225 мг.

50 мл - флаконы темного стекла (1) в комплекте с соединительной трубкой - коробки картонные.
50 мл - флаконы темного стекла (1) в комплекте с соединительной трубкой - пачки картонные (5) - пленка полиэтиленовая.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства
- Органотропные средства

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

При продолжительной инфузии со скоростью 0.03 мг/кг/ч средняя стабильная концентрация нимодипина в плазме крови составляет 17.6-26.6 нг/мл. После в/в болюсной инфузии отмечается двухфазное снижение концентрации нимодипина в плазме крови через 5-10 мин и примерно через 60 мин.

Распределение

V_d при в/в введении составляет 0.9-1.6 л/кг массы тела, общий клиренс - 0.6-1.9 л/ч/кг.

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 в/в введения 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.

Показания к применению:

— профилактика и лечение ишемических неврологических расстройств, вызванных спазмом сосудов головного мозга на фоне субарахноидального кровоизлияния вследствие разрыва аневризмы.

Относится к болезням:

- Неврит
- Неврозы
- Спазмы

Противопоказания:

— возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при выраженной брадикардии, артериальной гипотензии (систолическое давление менее 100 мл рт.ст), ишемии миокарда, выраженной сердечной недостаточности, повышении внутричерепного давления, генерализованном отеке головного мозга, печеночной и почечной недостаточности.

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).

Препарат содержит 23.7 об.% этанола, это должно быть учтено при назначении страдающим алкоголизмом с ухудшением метаболизма алкоголя, беременным и кормящим женщинам и пациентам с заболеваниями печени, эпилепсией.

Способ применения и дозы:

Рекомендуется соблюдать следующий режим дозирования:

В/в инфузия

В начале терапии в течение 2 ч вводится по 1 мг нимодипина в час (5 мл инфузионного раствора Нимотоп),

приблизительно 15 мкг/кг/ч. При хорошей переносимости (прежде всего при отсутствии заметного снижения АД), через 2 ч дозу увеличивают до 2 мг нимодипина в час (приблизительно 30 мкг/кг/ч). Начальная доза для пациентов с массой тела менее 70 кг или лабильным АД должна составлять 0.5 мг нимодипина в час.

Инфузионный раствор применяется для непрерывного в/в вливания через центральный катетер с использованием инфузионного насоса и трехканального запорного крана одновременно с одним из следующих растворов: 5% декстроза, 0.9% натрия хлорид, раствор Рингера, раствор Рингера с магнием, раствор декстрана 40 или 6% гидроксиэтилированного крахмала в соотношении примерно 1:4 (Нимотоп/другой раствор). В качестве сопутствующей инфузии также может использоваться маннитол, человеческий альбумин или кровь.

Раствор Нимотоп нельзя добавлять в инфузионный сосуд или смешивать с другими препаратами. Рекомендуется продолжать введение нимодипина в ходе анестезии, хирургических вмешательств и ангиографии.

Для соединения полиэтиленовой трубки (по которой поступает раствор Нимотоп), канала поступления сопутствующего раствора и центрального катетера необходимо использовать трехканальный запорный кран.

Профилактическое использование. В/в терапию нимодипином следует начинать не позднее, чем через 4 дня после кровоизлияния, и продолжать в течение всего периода максимального риска развития вазоспазма, то есть до 10-14 дней после субарахноидального кровоизлияния.

После окончания инфузионной терапии в течение следующих 7 дней рекомендуется пероральный прием таблетированной формы нимодипина в дозе 60 мг 6 раз/сут с интервалом 4 ч.

Терапевтическое применение. Если уже имеют место ишемические неврологические нарушения, обусловленные вазоспазмом вследствие субарахноидального кровоизлияния, инфузионную терапию следует начинать как можно раньше и проводить в течение не менее 5, но не более 14 дней.

После окончания инфузионной терапии в течение следующих 7 дней рекомендуется пероральный прием таблетированной формы нимодипина в дозе 60 мг 6 раз/сут (каждые 4 ч).

Если в ходе терапевтического или профилактического использования раствора Нимотоп производится хирургическое лечение кровоизлияния, в/в терапию нимодипином необходимо продолжать как минимум в течение 5 дней после оперативного вмешательства.

Введение в цистерны головного мозга

В ходе хирургического вмешательства свежеприготовленный раствор нимодипина (1 мл инфузионного раствора Нимотопа и 19 мл раствора Рингера), подогретый до средней температуры тела, можно вводить в цистерны головного мозга. Раствор необходимо использовать сразу после приготовления. Если у пациента появляются неблагоприятные реакции на применение препарата, следует либо снизить дозу, либо прекратить терапию нимодипином.

При тяжелых нарушениях функции печени, особенно при циррозе печени, биодоступность нимодипина может быть повышена из-за снижения интенсивности первичного метаболизма и замедления метаболической инактивации. Следствием этого может явиться усугубление основного и побочного действий препарата, в частности, его гипотензивного эффекта. В таких случаях дозу препарата следует снизить, исходя из степени снижения АД; при необходимости лечение следует прервать.

Нимодипин чувствителен к воздействию света, поэтому следует избегать прямого попадания на него солнечного света: следует использовать стеклянные шприцы и соединительные трубки черного, коричневого, желтого или красного цвета; кроме того, инфузионный насос и трубки целесообразно обернуть светонепроницаемой бумагой. При рассеянном дневном свете или искусственном освещении Нимотоп можно использовать в течение 10 ч без проведения специальных защитных мероприятий.

Нимодипин, активное вещество инфузионного раствора Нимотоп, абсорбируется поливинилхлоридом, для его парентерального введения можно использовать только системы с полиэтиленовыми трубками.

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 ≥1/1000 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.

Местные реакции: редко - реакции в месте инъекции или инфузии, тромбофлебит в месте введения.

Передозировка:

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

Лечение: в случае передозировки применение препарата следует немедленно прекратить. 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 AT_1-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.

В исследовании на обезьянах одновременное назначение зидовудина и в/в болюсное введение нимодипина приводило к снижению клиренса зидовудина.

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.

Инфузионный раствор Нимотоп содержит 23.7 об.% этанола; необходимо учитывать возможное взаимодействие

этанола с другими лекарственными препаратами.

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 сопутствующими заболеваниями, 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.

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.

При лечении следует учитывать, что раствор для в/в инфузий содержит 23.7 об.% этанола (200 мг этанола на 1 мл раствора) и 17% полиэтиленгликоля 400.

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

Из-за возможного развития головокружения применение нимодипина может нарушать способность к управлению транспортными средствами и механизмами. При применении инфузионного раствора препарата Нимотоп этот фактор обычно не имеет значения.

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:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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