Нитремед



Код АТХ:

- C08CA08

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Нитрендипин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки желтого цвета, круглые, плоские, с фасками, с риской на одной стороне и гравировкой "10" на другой.

	1 таб.
нитрендипин	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 74.8 мг, крахмал кукурузный - 39.4 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 15 мг, повидон-25 тыс. - 9 мг, магния стеарат - 0.75 мг, докузат натрия - 1.05 мг.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Таблетки желтого цвета, круглые, плоские, с фасками, с риской на одной стороне и гравировкой "20" на другой.

	1 таб.
нитрендипин	20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 68.2 мг, крахмал кукурузный - 36 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 15 мг, повидон-25 тыс. - 9 мг, магния стеарат - 0.75 мг, докузат натрия - 1.05 мг.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Нитрендипин - блокатор медленных кальциевых каналов, производное дигидропиридина. Оказывает антиангинальное, антигипертензивное действие. Уменьшает ток экстрацеллюлярного кальция (Ca^{2+}) в кардиомиоциты и гладкомышечные клетки коронарных и периферических артерий. Уменьшает количество функционирующих каналов, не оказывая воздействия на время их активации, инактивации и восстановления. Разобщает процессы возбуждения и сокращения в миокарде, опосредуемые тропомиозином и тропонином, и в гладких мышцах сосудов, опосредуемые кальмодулином. В терапевтических дозах нормализует трансмембранный ток кальция, нарушенный при ряде патологических состояний, прежде всего, при артериальной гипертензии.

Нитрендипин является не только блокатором медленных кальциевых каналов, но и агонистом кальциевых каналов с некоторым положительным инотропным действием. Отрицательный инотропный эффект маскируется рефлекторным увеличением ЧСС. При сердечной недостаточности, благодаря периферическому вазодилатирующему действию, повышает фракцию выброса левого желудочка, способствует уменьшению размеров сердца. Антигипертензивный эффект связан также с ингибированием секреции альдостерона. Не влияет на тонус вен. Расслабляет гладкую мускулатуру сосудов, вызывает расширение периферических и коронарных артерий, снижает общее периферическое сосудистое сопротивление и незначительно - сократимость миокарда. Уменьшает пред- и постнагрузку и потребность миокарда в кислороде. Усиливая коронарный кровоток, улучшает кровоснабжение ишемизированных зон миокарда без развития феномена "обкрадывания", активирует функционирование коллатералей. Не угнетает проводимость в миокарде. Усиливает почечный кровоток, оказывает умеренный натрийурез.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Абсорбция - более 90%, биодоступность - 60-70%, связывание с белками плазмы крови - 98%. T_{max} в плазме крови - 1-2 ч, C_{max} в плазме крови - 9-40 нг/мл.

Метаболизм и выведение

Метаболизируется в печени путем окисления. В метаболизме участвуют изоферменты CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7. Обладает эффектом "первого прохождения" через печень. $T_{1/2}$ - 8-12 ч.

Выводится почками и с желчью через кишечник в виде четырех полярных метаболитов (30%). Общий плазменный клиренс - 1.3 л/мин. У пожилых пациентов увеличивается $T_{1/2}$, при циррозе печени - AUC и концентрация в плазме крови.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия

Противопоказания:

— гиперчувствительность к нитрендипину и/или к любому из вспомогательных веществ препарата, к другим производным 1,4-дигидропиридина;

— тяжелая артериальная гипотензия (систолическое АД ниже 90 мм рт.ст.);

— кардиогенный шок;

— тяжелая степень стеноза аортального клапана;

— острый период инфаркта миокарда (в течение первых 4-х недель);

— нестабильная стенокардия;

— одновременный прием с рифампицином;

— редкие наследственные заболевания, такие как непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— беременность;

— период грудного вскармливания;

— возраст до 18 лет.

С осторожностью

— гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия;

— СССУ;

— выраженный стеноз устья аорты или митральный стеноз;

— хроническая сердечная недостаточность;

— инфаркт миокарда с левожелудочковой недостаточностью;

— артериальная гипотензия;

— почечная недостаточность;

— печеночная недостаточность;

— пожилой возраст.

Способ применения и дозы:

Нитремед применяют внутрь, после еды, проглатывая таблетку целиком и запивая достаточным количеством воды. Для облегчения проглатывания таблетку можно разделить на части по риске, которая нс предназначена для деления таблетки на дозы!

Не рекомендуется запивать таблетки грейпфрутовым соком (см. раздел "Особые указания")!

Нитрендипин чувствителен к свету, поэтому таблетки должны извлекаться из блистера непосредственно перед употреблением!

Лечение назначают строго индивидуально в соответствии с тяжестью заболевания и на длительный срок.

Нитремед в дозировке 10 мг назначают по 1 таб. 2 раза/сут, утром и вечером (20 мг нитрендипина/сут). В случае недостаточного снижения АД суточная доза может быть увеличена до 2 таб. по 10 мг 2 раза/сут (40 мг нитрендипина/сут).

Нитремед в дозировке 20 мг назначают по 1 таб. 1 раз/сут утром (20 мг нитрендипина/сут). В случае недостаточного снижения АД суточная доза может быть увеличена до 1 таб. по 20 мг 2 раза/сут (40 мг нитрендипина/сут).

Максимальная суточная доза составляет 40 мг нитрендипина.

Обычная начальная доза нитрендипина у пациентов с артериальной гипертензией I-II степени тяжести составляет 10 мг 1 раз/сут утром. В зависимости от терапевтического эффекта доза может быть увеличена до 20 мг 1 или 2 раза/сут. Препарат применяют в монотерапии или в комбинированной терапии в сочетании с диуретиком, ингибитором АПФ, антагонистом рецепторов ангиотензина II или бета-адреноблокатором.

Пациенты пожилого возраста и пациенты с почечной недостаточностью в специальной коррекции дозы не нуждаются. Пациентам пожилого возраста и пациентам с *I степенью артериальной гипертензии* рекомендуется начинать применение с начальной дозы - 10 мг. У пожилых пациентов и пациентов с **нарушением функции печени** метаболизм нитрендипина может быть замедлен, что может привести к нежелательному снижению АД. Поскольку терапевтический эффект препарата у таких пациентов может быть усилен и/или пролонгирован, лечение начинают с малых доз (10 мг/сут) при тщательном наблюдении за состоянием пациента. При выраженном снижении АД даже при низких дозах необходимо лечение прекратить.

Побочное действие:

Частота побочных эффектов классифицирована в соответствии с рекомендациями ВОЗ: очень часто (≥1/10); часто (≥1/100 до <1/10); нечасто (≥1/1000 до <1/100); редко (≥1/10 000 до <1/1000); очень редко (<1/10 000), частота не известна (не может быть оценена на основе имеющихся данных).

Со стороны системы кроветворения: очень редко - лейкопения, агранулоцитоз.

Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль (особенно в начале лечения, проходящая); нечасто - парестезия, головокружение, повышенная утомляемость, обмороки, нервозность.

Со стороны органа зрения: нечасто - анормальное зрение, затуманенное зрение.

Со стороны слуха и лабиринтные нарушения: нечасто - головокружение.

Со стороны сердца: часто - стенокардия и далее возможно утяжеление приступов стенокардии, ощущение сердцебиения, тахикардия; очень редко - инфаркт миокарда.

Со стороны сосудов: очень часто - периферические отеки (особенно в начале лечения. проходящие); нечасто - выраженное снижение АД; редкие - лейкоцитокластический васкулит.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: нечасто - одышка.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - тошнота, рвота, боли в животе, диарея, запор; очень редко - гиперплазия десен.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: редко - повышение активности ферментов печени, особенно трансаминаз.

Со стороны кожи и подкожных тканей: очень часто - приливы крови к коже лица (особенно в начале лечения, проходящие); нечасто - кожный зуд, крапивница, сыпь, фотосенсибилизация; очень редко - эксфолиативный дерматит, ангионевротический отек.

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - миалгия, артралгия.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: нечасто - учащенные позывы к мочеиспусканию, полиурия.

Со стороны половых органов и молочной железы: очень редко - эректильная дисфункция, гинекомастия, меноррагия.

Общие реакции: нечасто - увеличение веса, повышенное потоотделение; очень редко - лихорадка.

В случае появления побочных эффектов, не указанных в инструкции, пациент должен обратиться к врачу.

Передозировка:

Симптомы: головная боль, гиперемия кожи лица, длительное выраженное снижение АД (вплоть до развития коллапса), подавление функции синусового узла, брадикардия, тахикардия.

Лечение: промывание желудка, активированный уголь. Антидотом являются препараты кальция: показано медленное в/в введение 10% растворов кальция хлорида или кальция глюконата с последующим переключением на длительную инфузию.

При выраженном снижении АД - в/в введение допамина или добутамина. При нарушениях проводимости - атропин, изопреналин или искусственный водитель ритма. Гемодиализ не эффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Нитремед противопоказан к применению во время беременности и в период грудного вскармливания.

Беременность

В исследованиях, проведенных на лабораторных животных, было показано, что тестированные дозы нитрендипина были токсичными как для матери, так и для потомства, что проявлялось в ряде легких пороков развития у детенышей. Адекватных и строго контролируемых исследований у беременных женщин не проводилось.

Грудное вскармливание

В экспериментах на лабораторных крысах было показано, что нитрендипин выделяется в молоко лактирующих крыс. Концентрация нитрендипина в молоке соответствовала его концентрации в плазме крови. Специальных клинических

исследований с участием людей не проводилось. В связи с недостаточностью данных по проявлению эффекта нитрендипина при кормлении ребенка грудью рекомендуется прервать кормление.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении нитрендипин повышает концентрацию в плазме крови: хинидина, теофиллина и дигоксина (почти в 2 раза). При одновременном приеме нитрендипина и дигоксина проводят контроль концентрации дигоксина в плазме крови и при необходимости снижают дозу дигоксина.

Нитрендипин метаболизируется с помощью изофермента CYP3A4, который находится в печени и в слизистой оболочке кишечника. Лекарственные препараты, ингибирующие или индуцирующие этотизофермент, могут влиять на эффект "первого прохождения" через печень или плазменный клиренс нитрендипина.

Антигипертензивный эффект нитрендипина ослабляют:

- НПВП - задерживают натрий и блокируют синтез простагландина почками;

- препараты кальция;

- эстрогены - задерживают натрий;

- симпатомиметики, индукторы микросомальных ферментов печени, в т.ч. рифампицин, рифампин, фенитоин, карбамазепин и фенобарбитал - значительно снижают биодоступность нитрендипина.

Одновременное применение нитрендипина с рифампицином противопоказано.

Антигипертензивный эффект нитрендипина усиливают:

- альфа- и бета-адреноблокаторы и/или другие гипотензивные средства: уменьшая печеночный кровоток, повышают концентрацию нитрендипина в плазме крови;

- ингаляционные анестетики;

-диуретики: могут привести к увеличению экскреции натрия почками;

- миорелаксанты (панкуроний, векуроний): продолжительность и интенсивность их воздействия повышена у пациентов, принимающих нитрендипин;

- циметидин и ранитидин: хотя и в меньшей степени, вызывают увеличение плазменных концентраций нитрендипина;

- трициклические антидепрессанты, противовирусные препараты (ампренавир, атазанавир, ритонавир, индинавир, нелфинавир, саквинавир), противогрибковые препараты (кетоконазол, итраконазол, флуконазол), противоэпилептические средства (вальпроевая кислота), противомикробные препараты (хинупристин, дальфопристин), антибиотики (эритромицин, тролеандомицин, кларитромицин, рокситромицин): являясь сильными ингибиторами изоферментов цитохрома Р450, в частности изофермента CYP3A4, увеличивают биодоступность нитрендипина в результате снижения его метаболизма в печени, приводя к увеличению его концентрации в плазме крови;

Нитраты, препараты лития усиливают токсические эффекты нитрендипина (тошноту, рвоту, диарею, атаксию, тремор, шум в ушах).

Прокаинамид, хинидин и другие лекарственные препараты, вызывающие удлинение интервала QT, усиливают отрицательный инотропный эффект и могут повышать риск значительного удлинения интервала QT.

Особые указания и меры предосторожности:

Для облегчения проглатывания таблетку можно разделить на части по риске, которая не предназначена для деления таблетки на дозы!

Прием дигидропиридинов требует строгой стандартизации в отношении приема пищи и напитков. Грейпфрутовый сок снижает метаболизм нитрендипина, способствует усилению его всасываемости в ЖКТ, приводя к увеличению концентрации нитрендипина в плазме крови. Во время лечения следует воздерживаться от одновременного применения препарата с приемом алкоголя.

Несмотря на отсутствие у препаратов-блокаторов медленных кальциевых каналов синдрома "отмены", перед прекращением лечения рекомендуется постепенное уменьшение доз.

Не следует принимать двойную дозу препарата, чтобы компенсировать пропущенную дозу: при последующем приеме

необходимо следовать предписанному режиму приема препарата.

В случаях некомпенсированной сердечной недостаточности, а также при СССУ (sick-sinus синдром), при отсутствии искусственного водителя ритма требуется особое внимание к состоянию пациента и регулярный контроль сердечной деятельности.

Пациенты с нарушением функции печени, а также пожилые пациенты нуждаются в наблюдении и возможной коррекции дозы препарата: им назначают минимально возможную дозу.

Пациенты с нарушением функции почек не нуждаются в специальной коррекции дозы.

Детям и подросткам (менее 18 лет) препарат не назначают в связи с отсутствием достаточного опыта относительно последствий приема препарата в этой возрастной группе.

Препарат содержит в качестве вспомогательного вещества лактозы моногидрат. Пациентам с редким наследственным заболеванием непереносимости лактозы, дефицитом лактазы или нарушением всасывания глюкозы и галактозы препарат принимать не рекомендуется.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами

В период лечения (особенно вначале, при коррекции доз в связи с переходом на другую терапию) необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре от 15° до 25°С. Не применять по истечении срока годности.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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