Инструкция по применению
Лерникор таблетки 10 мг 28 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Оболенское ФП
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Лерканидипин
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 10 мг



Описание

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета. На поперечном разрезе ядро светло-желтого цвета.

Действующее вещество

Лерканидипин

Состав

1 таблетка содержит: действующее вещество: лерканидипина гидрохлорид 10 мг/ 20 мг, вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая 39 мг/ 78 мг, лактозы моногидрат 30 мг/ 60 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (натрия крахмала гликолят) 15,5 мг/ 31 мг, повидон К30 4,5 мг/ 9 мг, магния стеарат 1 мг/ 2 мг, вспомогательные вещества для оболочки: для дозировки 10 мг: Опадрай II 85F38107 желтый [спирт поливиниловый 1,2 мг, титана диоксид 0.6684 мг, макрогол (полиэтиленгликоль) 0,606 мг, тальк 0,444 мг, алюминиевый лак на основе красителя хинолинового желтого 0,0807 мг, железа оксид красный 0,0009 мг],

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание Лерканидипин полностью всасывается после приема внутрь. Максимальная концентрация в плазме крови (Cmax) достигается через 1,5-3 часа и составляет 3,3±2,09 нг/мл и 7,66±5,90 нг/мл после приема 10 и 20 мг лерканидипина, соответственно. (+)-R- и (-)3-энантиомеры лерканидипина демонстрируют сходный фармакокинетический профиль: имеют одинаковое время достижения максимальной концентрации (Tmax), одинаковый период полувыведения (T1/2), значения Cmax и площади под кривой «концентрация-время» (AUC) в 1,2 раза выше для (-)8-энантиомера. Взаимопревращения энантиомеров в опытах in vivo не наблюдали. При «первичном прохождении» через печень, абсолютная биодоступность лерканидипина при приеме внутрь после еды составляет приблизительно 10 %, при приеме натощак значение биодоступности уменьшается на 1/3. При приеме лерканидипина не позднее 2 часов после приема жирной пищи его биодоступность увеличивается в 4 раза, поэтому лерканидипин не следует принимать после еды. При пероральном применении лерканидипина его концентрация в плазме крови не является прямо пропорциональной к принятой дозе (нелинейная кинетика). Насыщение пресистемного метаболизма, происходит постепенно. Таким образом, биодоступность увеличивается с повышением дозы. Распределение Распределение из плазмы крови в ткани и органы происходит быстро и обширно. Связь с белками плазмы крови превышает 98 %. Метаболизм и выведение Лерканидипин метаболизируется с участием изофермента CYP3A4 с образованием неактивных метаболитов. Около 50 % принятой дозы выводится почками (около 50 % выводится кишечником). Элиминация происходит в основном путем биотрансформации. Среднее значение T1/2 составляет 8-10 ч. Длительность терапевтического действия - 24 часа. Кумуляции лерканидипина при повторном приеме внутрь не наблюдается. Фармакокинетика в особых клинических случаях Было показано, что фармакокинетика лерканидипина у пожилых пациентов, пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина (КК) более 30 мл/мин) и у пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести схожа с фармакокинетикой, которая наблюдается в общей популяции пациентов. У пациентов с тяжелой почечной и/или печеночной недостаточностью из-за снижения концентрации белка в плазме крови, свободная фракция лерканидипина может увеличиваться. У пациентов с почечной недостаточностью (КК менее 30 мл /мин) и у пациентов, находящихся на гемодиализе, концентрации лерканидипина в плазме крови были более высокими (приблизительно 70 %). У пациентов с печеночной недостаточностью средней и тяжелой степени системная биодоступность лерканидипина, вероятно, увеличивается, поскольку лерканидипин метаболизируется главным образом в печени.

Показания

Артериальная гипертензия 1-2 степени.

Способ применения и дозы

Внутрь, не менее чем за 15 минут до еды, предпочтительно утром, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды. Рекомендованная доза препарата - по 10 мг 1 раз в сутки. В зависимости от индивидуальной переносимости препарата пациентом, доза может быть увеличена до 20 мг. При необходимости увеличение суточной дозы до 20 мг осуществляется через 2 недели после начала приема препарата. Терапевтическая доза подбирается постепенно, так как максимальное антигипертензивное действие развивается приблизительно через 2 недели после начала приема препарата. Маловероятно, что эффективность препарата будет возрастать с повышением дозы более 20 мг в сутки, в тоже время повышается риск возникновения побочных эффектов. Применение у пожилых пациентов Фармакокинетический профиль и данные клинических исследований показывают, что у пожилых пациентов коррекции дозы лерканидипина не требуется. Однако следует соблюдать осторожность на начальном этапе лечения у данной группы пациентов. Применение у пациентов с нарушениями функции почек или печени При наличии почечной недостаточности (КК более 30 мл/мин) или печеночной недостаточности легкой или средней степени тяжести, начальная доза составляет 10 мг, затем с осторожностью увеличивают дозу до 20 мг в сутки. Антигипертензивный эффект может усиливаться у пациентов с печеночной недостаточностью легкой или средней степени тяжести и может потребоваться коррекция (снижение) дозы.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к лерканидипину, другим производным дигидропиридинового ряда или любому компоненту препарата. Нелеченная хроническая сердечная недостаточность. Нестабильная стенокардия. Обструкция выносящего тракта левого желудочка. Период в течение 1 месяца после перенесенного инфаркта миокарда. Тяжелая печеночная недостаточность. Тяжелая почечная недостаточность (КК менее 30 мл/мин). Одновременное применение с мощными ингибиторами CYP3A4 (кетоконазол, итраконазол, эритромицин, ритонавир, тролеандомицин). Одновременное применение с циклоспорином. Одновременный прием с соком грейпфрута. Непереносимость лактозы, дефицит лактазы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции. Беременность и период грудного вскармливания. Применение у женщин детородного возраста, не пользующихся надежными методами контрацепции. Возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не изучены).

Применение при беременности и кормлении грудью

Применение лерканидипина при беременности и в период грудного вскармливания, а также у женщин детородного возраста при отсутствии надежной контрацепции противопоказано. В ходе доклинических исследований не выявлено тератогенного эффекта лерканидипина у крыс и кроликов, репродуктивная функция крыс была без изменений. В виду отсутствия клинического опыта применения лерканидипина при беременности и в период грудного вскармливания и поскольку известно, что другие производные дигидропиридина оказывали тератогенное действие у животных, лерканидипин не рекомендуется применять при беременности и у женщин детородного возраста, не пользующихся надежными методами контрацепции. Вследствие высокой липофильности лерканидипина, можно предполагать его проникновение в грудное молоко, поэтому лерканидипин не рекомендуется применять в период грудного вскармливания.

Побочные действия

Возможные нежелательные реакции приведены ниже по нисходящей частоте возникновения: часто (1/100), нечасто (1/1000), редко (1/10000), очень редко (<1 /10000), включая отдельные сообщения. Со стороны нервной системы: нечасто - головная боль, головокружение, редко - сонливость. Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - ощущение сердцебиения, тахикардия, «приливы» крови к коже лица, редко - стенокардия, боль за грудиной, очень редко - обморок, инфаркт миокарда, выраженное снижение артериального давления (АД), у пациентов со стенокардией возможно увеличение частоты, продолжительности и тяжести приступов. Со стороны желудочно-кишечного тракта: редко - тошнота, диспепсия, диарея, эпигастральная боль, рвота, очень редко - обратимое повышение активности «печеночных» трансаминаз, гиперплазия десен. Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: очень редко - боль в грудной клетке. Со стороны кожи и подкожных тканей: редко - кожная сыпь. Со стороны опорно-двигательного аппарата: редко - миалгия. Со стороны почек и мочевыводящих путей: редко - полиурия, очень редко - поллакиурия (увеличение частоты мочеиспускания). Со стороны иммунной системы: очень редко - реакции гиперчувствительности. Общие расстройства и нарушения в месте введения: нечасто - периферические отеки, редко - астения, повышенная утомляемость.

Передозировка

Симптомы: Предположительно, в случае передозировки лерканидипина будут наблюдаться симптомы, сходные с таковыми при передозировке других производных дигидропиридина: периферическая вазодилатация с выраженным снижением АД и рефлекторной тахикардией. Лечение: Лечение симптоматическое. В случае выраженного снижения АД, потери сознания показана сердечно-сосудистая терапия, при брадикардии - внутривенное введение атропина. Имеются данные о 3-х случаях передозировки при приеме лерканидипина в дозах 150 мг, 280 мг и 800 мг с целью суицида. В случае приема 150 мг лерканидипина + алкоголь (неустановленное количество) наблюдалась сонливость. Лечение: промывание желудка, прием активированного угля. В случае приема 280 мг лерканидипина + 5,6 мг моксонидина наблюдались следующие симптомы: кардиогенный шок, выраженная ишемия миокарда, почечная недостаточность легкой степени. Лечение: сердечные гликозиды, диуретики (фуросемид), высокие дозы катехоламинов, плазмозаменители. В случае приема 800 мг лерканидипина наблюдались тошнота и выраженное снижение АД. Лечение: прием активированного угля и слабительного средства, внутривенно - допамин. Во всех случаях передозировки все пациенты остались живы. Информация по эффективности диализа для лерканидипина отсутствует. Наиболее вероятно, что из-за высокой связи лерканидипина с белками плазмы крови, диализ может быть неэффективным.

Взаимодействие с другими препаратами

Лерканидипин можно одновременно применять с бета-адреноблокаторами, диуретиками, ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (ИАПФ). 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 мощными ингибиторами CYP3A4 (кетоконазол. итраконазол, ритонавир, эритромицин, тролеандомицин). Не рекомендуется одновременное применение циклоспорина и лерканидипина, так как 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, квинидин). При

одновременном применении лерканидипина в дозе 20 мг с мидазоламом биодоступность лерканидипина у пожилых пациентов 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. Необходим регулярный контроль артериального давления. 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 Cmax для дигоксина в среднем на 33 % после приема 20 мг лерканидипина натощак, при этом AUC (площадь под кривой - «концентрация- время») 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 - бета-гидроксикислоты - на 28 %. При приеме препаратов в разное время суток (лерканидипин - утром, симвастатин - вечером) можно избежать нежелательного взаимодействия. При одновременном применении 20 мг лерканидипина и варфарина у здоровых добровольцев изменений фармакокинетики варфарина не наблюдалось. Одновременное применение с флуоксетином (ингибитором CYP2D6 и CYP3A4) у пациентов пожилого возраста не оказало клинически значимых изменений фармакокинетики лерканидипина. Возможно усиление антигипертензивного действия при одновременном приеме сока грейпфрута и лерканидипина. Этанол может потенцировать антигипертензивное действие лерканидипина.

Особые указания

Особую осторожность следует соблюдать при назначении лерканидипина пациентам с синдромом слабости синусового узла (без кардиостимулятора). Несмотря на то, что исследования с гемодинамическим контролем не выявили ухудшения желудочковой функции при приеме лерканидипина, следует соблюдать осторожность при назначении лерканидипина пациентам с дисфункцией левого желудочка. Было предположено, что прием некоторых дигидропиридинов может быть связан с риском учащения приступов стенокардии у пациентов с ишемической болезнью сердца. Поэтому у таких пациентов терапию лерканидипином необходимо проводить с особой осторожностью. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами Поскольку на фоне терапии препаратом возможно появление головокружения, астении, повышенной утомляемости и, в редких случаях сонливости, в период применения препарата пациентам следует с особой осторожностью управлять автотранспортом и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности, требующими высокой скорости психомоторных реакций.

Срок хранения после открытия

3 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.