Инструкция по применению
Лерникор таблетки 20 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: 20 мг



Описание

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой розового 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 20 мг: Опадрай II 85F34555 розовый [спирт поливиниловый 2,4 мг, титана диоксид 1,4046 мг, макрогол (полиэтиленгликоль) 1,212 мг, тальк 0.888 мг, алюминиевый лак на основе красителя очаровательного красного 0.0348 мг, алюминиевый лак на основе красителя солнечный закат желтый 0,0336 мг, алюминиевый лак на основе красителя азорубина 0,027 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.