

ЛЕРКАМЕН® (LERCAMEN)

LERCANIDIPINUM C08C A13

[Menarini Group](#)

[Menarini International](#)

СОСТАВ И ФОРМА ВЫПУСКА:

ЛЕРКАМЕН® 10

табл. п/о 10 мг, № 7, № 14

табл. п/о 10 мг, № 28

Лерканидипин 10 мг

Прочие ингредиенты: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, карбоксиметилкрахмала натриевая соль, повидон К30, магния стеарат, гипромеллоза, тальк, титана диоксид, макрогол 6000, железа оксид (III).

№ UA/0583/01/01 от 22.01.2009 до 22.01.2014

ЛЕРКАМЕН® 20

табл. п/о 20 мг, № 7, № 14

табл. п/о 20 мг, № 28

табл. п/о 20 мг, № 56

Лерканидипин 20 мг

Прочие ингредиенты: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, карбоксиметилкрахмала натриевая соль, повидон К30, магния стеарат, гипромеллоза, тальк, титана диоксид, макрогол 6000, железа оксид (III).

№ UA/0583/01/02 от 09.11.2005 до 09.11.2010

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА: Фармакодинамика. Лерканидипин — селективный блокатор кальциевых каналов, дигидропиридиновой группы, с преимущественным действием на сосуды. Механизм его гипотензивного действия обусловлен прямым релаксирующим влиянием на гладкие мышцы сосудов, за счет чего снижается ОПСС. Несмотря на короткий $T_{1/2}$ из плазмы крови, лерканидипин оказывает длительное антигипертензивное действие за счет высокого коэффициента мембранного распределения. Благодаря высокой сосудистой селективности препарата его инотропное действие не имеет клинического значения. Редко отмечают коллаптоидные реакции с рефлекторной тахикардией ввиду постепенного развития вазодилатации.

Фармакокинетика. Лерканидипин полностью всасывается после приема внутрь. C_{max} в плазме крови достигается приблизительно через 1,5–3 ч; степень связывания с белками сыворотки крови — 98%. Вследствие интенсивного метаболизма при первичном прохождении через печень абсолютная биодоступность лерканидипина, принятого после еды, составляет приблизительно 10%, при этом она снижается до 1/3 этого значения, если препарат применяют у здоровых добровольцев натощак. $T_{1/2}$ составляет 8–10 ч, а терапевтическое действие продолжается на протяжении 24 ч, вследствие высокой степени связывания с липидной мембраной. При повторном применении кумуляция не отмечена. Биодоступность лерканидипина после перорального применения значительно повышается после приема пищи (в 4раза), поэтому препарат принимают натощак. При пероральном применении лерканидипина его концентрация в плазме крови не прямо пропорциональна принятой дозе (нелинейная кинетика). После приема 10; 20 и 40 мг C_{max} в плазме крови имели соотношение 1:3:8, а AUC соответственно 1:4:18, что указывает на постепенное насыщение метаболизма при первом прохождении. Таким образом, биодоступность лерканидипина увеличивается с повышением дозы. Фармакокинетика лерканидипина у лиц пожилого возраста и у пациентов с дисфункцией почек или печени легкой и средней степени тяжести мало отличима от таковой в общей популяции. При тяжелой степени

дисфункции почек или у пациентов, находящихся на гемодиализе, концентрация препарата в плазме крови повышается (приблизительно 70%). При средней или тяжелой степени дисфункции печени системная биодоступность лерканидипина, вероятно, повышается, поскольку он метаболизируется главным образом в печени. Лерканидипин метаболизируется ферментом CYP 3A4 до неактивных метаболитов, около 50% которых выводится с мочой. Исходное вещество в моче и кале не выявляют.

ПОКАЗАНИЯ: эссенциальная АГ легкой или средней степени тяжести.

ПРИМЕНЕНИЕ: рекомендованная доза для взрослых — 10 мг 1 раз в сутки, не менее чем за 15 мин до еды. В зависимости от индивидуальной чувствительности пациента и достигнутого эффекта доза может быть повышена до 20 мг. Максимальное антигипертензивное действие развивается в течение 2 нед лечения. Леркамен можно принимать одновременно с блокаторами β -адренорецепторов, диуретиками или ингибиторами АПФ. Маловероятно, что эффективность препарата будет возрастать с повышением дозы, но в то же время возможно повышение побочных эффектов.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ: повышенная чувствительность к дигидропиридинам или другим компонентам препарата; выраженный стеноз митрального или аортального клапана; гипертрофическая кардиомиопатия с обструкцией выносящего тракта левого желудочка; декомпенсированная застойная сердечная недостаточность, нестабильная стенокардия; в течение 1 мес после инфаркта миокарда; тяжелая дисфункция печени и почек (клиренс креатинина ≤ 10 мл/мин); период беременности и кормления грудью; женщинам детородного возраста (при отсутствии надлежащей контрацепции), детям и подросткам в возрасте младше 18 лет; одновременное применение с ингибиторами CYP 3A4 (например циклоспорином) и соком грейпфрута.

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ: зарегистрированные во время клинических исследований, приведены в следующей таблице:

| Со стороны иммунной системы | Очень редко ($\leq 1/10\ 000$) | Гиперчувствительность |
|--|--|---|
| Психические нарушения | Редко (1/10 000 и $\leq 1/1000$) | Сонливость |
| Со стороны ЦНС | Иногда (1/1000 и $\leq 1/100$) | Головная боль, головокружение |
| Со стороны сердца | Редко (1/10 000 и $\leq 1/1000$) Иногда (1/1000 и $\leq 1/100$) | Стенокардия Тахикардия, усиленное сердцебиение |
| Со стороны сосудов | Иногда (1/1000 и $\leq 1/100$) Очень редко ($\leq 1/10\ 000$) | Гиперемия кожи Нарушения сознания |
| Со стороны ЖКТ | Редко (1/10 000 и $\leq 1/1000$) | Тошнота, боль в эпигастральной области, диарея, диспепсические нарушения, рвота |
| Со стороны кожи | Редко (1/10 000 и $\leq 1/1000$) | Сыпь |
| Со стороны опорно-двигательного аппарата | Редко (1/10 000 и $\leq 1/1000$) | Миалгия |
| Со стороны почек и мочевыводящих путей | Редко (1/10 000 и $\leq 1/1000$) | Полиурия |
| Общие нарушения и местные реакции | Редко (1/10 000 и $\leq 1/1000$) | Астения, повышенная утомляемость. Периферические отеки |

| | | |
|--|------------------------------------|--|
| | Иногда (1/1000 и $\leq 1/100$) | |
| | | |

В единичных случаях ($\leq 1/10\ 000$) выявляют гиперплазию десен, обратимое повышение активности печеночных трансаминаз в плазме крови (других клинически значимых отклонений показателей лабораторных исследований функции печени не выявлено). Были сообщения о повышении частоты мочеиспускания. В единичных случаях применение некоторых дигидропиридинов приводит к появлению приступов стенокардии. Очень редко может развиваться нестабильная прогрессирующая стенокардия, в отдельных случаях вплоть до развития инфаркта миокарда. Лерканидипин достоверно не влияет на уровень глюкозы и липидов в плазме крови.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ: у пациентов с синдромом слабости синусного узла Леркамен следует применять с особой осторожностью (если не имплантирован кардиостимулятор). Хотя в исследованиях гемодинамики не выявили ухудшения желудочковой функции, при ее исходной дисфункции требуется особая осторожность, как и при ИБС. Некоторые дигидропиридины могут в отдельных случаях вызывать возникновение ангиальных приступов. Лерканидипин не влияет на уровень сахара и липидов в плазме крови. Одна таблетка содержит 30 мг лактозы, поэтому препарат не рекомендуется назначать при дефиците лактазы, галактоземии и нарушении всасывания глюкозы/галактозы. *Применение у пациентов пожилого возраста.* Данные фармакокинетики и клинический опыт свидетельствуют о том, что нет необходимости корректировать суточную дозу, но необходимо соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов пожилого возраста. *Применение при нарушении функции почек или печени.* Лерканидипин можно назначать больным с почечной и печеночной дисфункцией легкой и средней тяжести, но требуется соблюдение осторожности в случае превышения у них суточной дозы до 20 мг. Антигипертензивное действие препарата может усиливаться при нарушении функций печени, поэтому может быть необходима коррекция дозы. *Применение в период беременности и кормления грудью.* Не рекомендуется ввиду отсутствия клинического опыта. *Применение у детей.* Не рекомендуется ввиду отсутствия клинического опыта. *Способность влиять на скорость реакции при управлении транспортными средствами или работе с механизмами.* Риск возникновения головокружения, сонливости и повышенной утомляемости, обусловленных приемом Леркамена, невысок, но его следует учитывать при управлении транспортными средствами или работе с механизмами.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ: следует избегать одновременного применения препарата Леркамен с ингибиторами CYP 3A4 (например с кетоконазолом, итраконазолом, ритонавиром, эритромицином или тролеандомицином). Результаты исследований свидетельствуют, что одновременное применение кетоконазола и лерканидипина приводит к значительному повышению концентрации последнего в плазме крови. Сочетанное применение лерканидипина с циклоспорином приводит к повышению концентрации обоих препаратов в плазме крови, поэтому лерканидипин и циклоспорин не следует применять одновременно. Метаболизм лерканидипина, как и других дигидропиридинов, замедляется при сочетанном приеме с соком грейпфрута, который приводит к повышению его системной биодоступности и гипотензивного действия, поэтому запивать лерканидипин грейпфрутовым соком не следует. Необходима осторожность при сочетании лерканидипина с терфенадином, астемизолом, амиодароном, квинидином. Одновременное применение мидазолама и лерканидипина в дозе 20 мг приводило к повышению абсорбции лерканидипина на 40% и снижению скорости его всасывания (3 ч вместо 1,75 ч). Леркамен можно назначать вместе с диуретиками и ингибиторами АПФ. Циметидин в суточной дозе до 800 мг не вызывает значительных изменений лерканидипина в плазме крови, но при повышении дозы необходима осторожность, поскольку может повыситься биодоступность и антигипертензивное действие лерканидипина. Одновременное применение лерканидипина с индукторами CYP 3A4, такими как противосудорожные препараты (например

фенитоин, карбамазепин), и с рифампицином может приводить к уменьшению выраженности его антигипертензивного действия, в таком случае необходимо чаще контролировать АД. Следует учитывать, что сочетанное применение Леркамена с метопрололом (или другими блокаторами β -адренорецепторов) приводит к снижению его биодоступности на 50% ввиду снижения печеночного кровотока, поэтому может потребоваться коррекция дозы препарата. При одновременном применении лерканидипина с блокаторами β -адренорецепторов возможно потенцирование отрицательного инотропного эффекта. Сочетанное назначение лерканидипина в дозе 20 мг и β -метилдигоксина не приводит к их фармакокинетическому взаимодействию. Одновременное применение дигоксина и лерканидипина в дозе 20 мг приводит к повышению концентрации дигоксина в плазме крови на 33%, поэтому необходим контроль в отношении возможного проявления интоксикации дигоксином. Не выявлено клинически значимых взаимодействий лерканидипина с флуоксетином. При одновременном применении лерканидипина в дозе 20 мг и симвастатина в дозе 40 мг, показатель AUC для лерканидипина менялся незначительно, тогда как показатель AUC для симвастатина повышался на 56%, а его активного метаболита оксикислоты — на 28%. Маловероятно, что такие изменения являются клинически значимыми. Взаимодействия можно избежать, если лерканидипин принимать утром, а симвастатин вечером. При одновременном применении лерканидипина и варфарина изменений фармакокинетики варфарина не наблюдалось. При сочетанном применении с ингибиторами MAO возможно усиление гипотензивного действия лерканидипина, с нитратами — дополнительное снижение АД и повышение ЧСС. При одновременном приеме алкоголя и антигипертензивных препаратов повышается вазодилатирующее действие последних.

ПЕРЕДОЗИРОВКА: Симптомы: сонливость, тошнота, артериальная гипотензия, кардиогенный шок, тяжелая ишемия миокарда, почечная недостаточность легкой степени, брадикардия. *Лечение:* промывание желудка, применение активированного угля и слабительных средств. При тяжелом состоянии пациента назначают высокие дозы катехоламинов или в/в введение дофамина, диуретики, парентеральное введение плазмозамещающих р-ров. При тяжелой гипотензии, брадикардии и потере сознания необходимо в/в введение атропина. С учетом пролонгированного фармакологического действия лерканидипина в случае передозировки необходим контроль за состоянием таких пациентов по меньшей мере 24 ч. Гемодиализ неэффективен из-за высокой липофильности лерканидипина.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ: при температуре не выше 30 °С.

Дата добавления: 01/02/2006

Дата изменения: 03/11/2009