نوفارتس

لوميرِ® لوميرِ إس آر أو®

مضاد للكالسيوم

التركيب

لوميرِ

يحتوي القرص المحرّر الواحد على:

- المادة الفعالة: إيسراديبين ٥، ٢مجم
- السواغ: كبريتات صوديوم لوريل، سواغ تعمل أقراص.

لوميرِ إس آر أو

تحتوي الكبسولة الواحدة المنخفضة الجرعة على:

- المادة الفعالة: إيسراديبين ٥، ٢مجم
- السواغ: سواغ تعمل كبسولة.

تحتوي الكبسولة الواحدة على:

- المادة الفعالة: إيسراديبين ٥مجم
- السواغ: سواغ تعمل كبسولة.

الخصائص/الآثار

إيسراديبين، المكون الفعال في لوميرِ، هو دايهيدروبايريدين مضاد للكالسيوم له قابلية أعلى لقنوات الكالسيوم الموجودة في العضل الأملس الشرياني عن تلك الموجودة في عضلة القلب. وبذلك فهو يوسع الشبكات الوعائية الشريانية، بصفة خاصة تلك الموجودة في القلب والمخ والعضلات الهيكلية، بدون أن يخدم وظيفة القلب. وكنتيجة لتوسيع الأوعية الطرفية، ينخفض ضغط الدم الشرياني.

تشير التجارب على الحيوانات إلى أن إيسراديبين يزاول مفعولاً انتقائياً متبعاً للغدة الجبيبة. ولكنه لا يعوق التوصيل الأذيني البطيني أو الوظيفة الانقباضية لعضلة القلب. لذلك فإن تسرع القلب المنعكس يكون معتدلاً، ولا تحدث إطالة للمسافة PQ، حتى بعد العلاج المسبق بأحد حاصرات البيتا. بالجرعات الخافضة لضغط الدم، ثبت أيضاً أن إيسراديبين له مفعول معتدل مدر للصوديوم ولكنه مفعول يعتد به.

في المرضى الذين يعانون من ارتفاع ضغط الدم، يتحقق إنخفاض مرتبط بالجرعة لضغط الدم أثناء الرقاد والجلوس والقيام خلال ٣-٤ ساعات من تناول جرعة مفردة بالفم. لوميرِ له مدة مفعول طويلة مما يضمن السيطرة على ضغط الدم لمدة ٢٤ ساعة عند تناول قرصين ٥، ٢مجم مرة واحدة يومياً أو كبسولة واحدة إس آر أو ٥مجم مرة واحدة يومياً. وينخفض ضغط الدم بشكل يعتد به بعد أسبوع واحد من العلاج، ولكن يلزم على الأقل ٤-٦ أسابيع للحصول على التأثير الأقصى. لم تُشاهد في المعتاد تغيرات في سرعة القلب مع الكبسولات إس آر أو.

كانت القدرة على تحمل إيسراديبين جيدة عند إعطائه للمرضى الذين يعانون من ارتفاع ضغط الدم أو الذبحة الصدرية المستقرة بجرعات تصل إلى ٢٠ أو ٢٢،٥مجم/يوم. أدت الجرعات المقررة بالفم من لوميرِ إلى إخماد الاستجابة التشنجية الشعبية في مرضى الربو الناتجة عن التمرين. لوميرِ ليس له أي تأثير ذي دلالة إكلينيكية على استقرار الجلوكوز وبالتالي يمكن إعطاؤه لمرضى السكر.

لم تبرز تقارير عن حالات انخفاض وقوفي لضغط الدم.

لم يُشاهد حدوث تناقص لمفعول لوميرِ الخافض لضغط الدم في الدراسات التي استمرت لمدة تصل إلى سنتين.

الخرائط الدوائية

بعد الامتصاص بنسبة ٩٠-٩٥٪ من القناة الهضمية، يتعرض إيسراديبين لأيض المرور الأول بشكل مسوح، مما يؤدي إلى توافر حيوي بنسبة ٢٠٪ تقريباً. بعد تناول جرعات مفردة بالفم ٢،٥-٥مجم يظهر الدواء في البلازما خلال ٣٠ دقيقة. ويتم بلوغ تركيزات الذروة في البلازما بعد حوالي ساعتين. في حالة الأقراص، عند إعطاء المتطوعين الأصحاء ٥مجم لوميرِ إس آر أو في حالة الصيام مرة واحدة يومياً لمدة ٧ أيام، كانت تركيزات الذروة في البلازما (Cmax) حوالي ١،٢نانوجرام/مليلتر بعد ٦-٧ ساعات من تناول الدواء (Tmax).

يؤدي تناول القرص مع الطعام إلى إبطاء زمن الوصول إلى مستوى الذروة في الدم بحوالي ساعة واحدة بدون التأثير على التوافر الحيوي. يؤدي تناول كبسولة إس آر أو مع الطعام إلى ارتفاع خفيف في تركيزات الذروة في البلازما وزيادة التوافر الحيوي بنسبة ٢٠٪ تقريباً. يؤدي عصير الجريب فروت إلى زيادة التوافر الحيوي لمركبات الدايهيدروبايريدين من خلال تثبيط تأثير الجزء الأول. يرتبط إيسراديبين ببروتينات البلازما بنسبة ٩٥٪ تقريباً ويبلغ حجم توزيعه الظاهري ٣٨٦لتر. توجد علاقة خطية بين كل من تركيز الذروة في البلازما والمساحة تحت المنحنى وبين الجرعة عقب إعطاء جرعات بالفم تصل إلى ٥مجم. تبلغ التصفية الإجمالية لإيسراديبين ٤٢لتر/ساعة والإطراح ثنائي الأطوار. ويكون العمر النصفي النهائي ٢،٢ ساعة في المرضى الأصغر سناً و ٨،٨ساعة في المرضى فوق ٦٥ سنة. يكون الإبض كاملاً، فلا يظهر في البول أي قدر من الدواء. غير المتغير يتم إخراج حوالي ٦٠-٦٥٪ من الجرعة في البول و٢٥-٣٠٪ في البراز.

لم تُظهر بيانات الدراسات أي دليل واضح على وجود علاقة بين الوظيفة الكلوية وبين الخرائط الدوائية لإيسراديبين وقد شوهد كل من زيادة ونقص التوافر الحيوي في مرضى الفشل الكلوي.

وردت تقارير عن زيادة التوافر الحيوي في المرضى المسنين والمرضى الذين لديهم ضعف بالوظيفة الكبدية. وقد وصلت القيم إلى ٢٧٪.

لخائرات الخرائط الدوائية انظر بند التأثرات.

دواعي الاستعمال/الاستخدامات الممكنة

ارتفاع ضغط الدم

الجرعة وطريقة الاستعمال

الجرعة المعتادة

الجرعة الموصى بها في المرضى الذين يعانون من ارتفاع خفيف إلى متوسط لضغط الدم هي قرص واحد ٥، ٢مجم مرتين يومياً أو كبسولة واحدة إس آر أو ٥مجم مرة واحدة يومياً.

تعليمات خاصة بالجرعة

الأقراص يتم بدء العلاج بالجرعة ٥، ٢مجم مرتين يومياً ويمكن زيادة هذه الجرعة تدريجياً على فترات كل ٤ أسابيع إلى حد أقصى ٥مجم مرتين يومياً إذا لم تتحقق المستويات الطبيعية لضغط الدم، يجب التفكير في إضافة دواء آخر خافض لضغط الدم مع نظام لوميرِ.

الكبسولات: إذا لم تكن كبسولة واحدة ٥مجم مرة واحدة يومياً فعالة بالقدر الكافي يمكن عند مدة علاج ٤ أسابيع على الأقل، يوصى بإضافة دواء آخر خافض لضغط الدم.

في المرضى المسنين وفي مرضى الفشل الكبدي أو الكلوي، يوصى باستخدام جرعة إبتدائية ١،٢٥مجم (نصف قرص) مرتين يومياً أو كبسولة واحدة إس آر أو ٢،٥مجم مرة واحدة يومياً.

يمكن أيضاً إضافة لوميرِ إلى العلاج الخافض لضغط الدم المتبع بالفعل.

عند إعطاء لوميرِ في نفس الوقت مع سيميتيدين، تُخفض جرعة لوميرِ بنسبة ٥٠٪ (انظر التأثرات).

أقراص لوميرِ وكبسولات لوميرِ إس آر أو يجب أو تُبتلع صحيحة.

القيود على الاستعمال

موانع الاستعمال

فرط الحساسية لمركبات الدايهيدروبايريدين أو أي من السواغ.

لوميرِ أقراص فقط: احتشاء عضلة القلب قبل بدء العلاج بأقل من شهر واحد، الذبحة الصدرية غير المستقرة.

الاحتياطات

يوصى بتوخي الحذر الفائق عند إعطاء مركبات الدايهيدروبايريدين للمرضى الذين يعانون من ضيق أوعي شديد.

يوصى بضبط جرعة لوميرِ بشكل فردي في المرضى الذين يعانون من ضعف بالوظيفة الكبدية أو القصور القلبي المزمن، وكذلك في المرضى المسنين.

يوصى بتوخي الحذر عند علاج المرضى الذين لديهم حالة مؤكدة أو مُشتبه فيها بشدة من متلازمة الامتلال الجيبي الذين لم يتم تزويدهم بناظمة للقلب. يوصى أيضاً بتوخي الحذر الخاص في المرضى الذين لديهم انخفاض في ضغط الدم الانقباضي.

لا توجد في الوقت الحالي خبرة بشأن استعمال لوميرِ أو لوميرِ إس آر أو في المرضى تحت ١٦ سنة.

توجد أدلة توحي بأنه لا سيما في المرضى بمرض قلبي تاجي، قد تؤدي مضادات الكالسيوم السريعة المفعول من نوع دايهيدروبايريدين إلى زيادة معدل المرض والوفاة لأسباب قلبية وعائية. قد يحدث اشتداد للذبحة الصدرية أو إنخفاض حاد لضغط الدم وتسرع القلب والذي قد يتخذ مسارات غير مواتية، أثناء العلاج بهذا المستحضر.

الحمل والإرضاع

يمر إيسراديبين عبر حاجز المشيمة ولا تقدم البيانات في الحيوانات أي دليل على أن إيسراديبين له قدرة سامة للجنين أو مأسخة. ولكن الخبرة محدودة بشأن استعمال الدواء في النساء الحوامل وبالتالي فلا يمكن تبرير استعماله أثناء الحمل إلا إذا كانت الفائدة المرجوة للأم تفوق بشكل واضح أي مخاطرة ممكنة على الطفل. عند استعمال لوميرِ عن طريق الفم أثناء الشهور الثلاثة الأخير من الحمل لم يكن ذلك مصحوباً بأي تغيرات في سرعة قلب الجنين أو في سريان الدم في الرحم والمشيمة. توحي المشاهدات السابقة للولادة في الحيوانات بأن الجرعات المرتفعة من إيسراديبين قد تؤدي إلى إطالة زمن الولادة.

أظهرت إحدى الدراسات التي تم إجراؤها على الجرذان أن كميات صغيرة من إيسراديبين تنفذ إلى اللبن. ولم يتم إجراء دراسات في الإنسان. وعلى الرغم من أن الدراسات في الحيوانات لم تكشف عن أي آثار مناوئة كنتيجة لإعطاء إيسراديبين أثناء الإرضاع، إلا أنه لم يتم إثبات أمان استعمال الدواء، على الأطفال الرُضع الذين يرضعون من الثدي لذلك يجب على الأمهات اللاتي يستعملن لوميرِ ألا يرضعن أطفالهن من الثدي.

الآثار المناوئة

الآثار المناوئة الأكثر تكراراً في التقارير هي الصداع، الإحساس بالسخونة، تميع الوجه، وذمة طرفية موضعية ذات منشأ غير قلبي، دوار، خفقان، وتسرع القلب. هذه الآثار مرتبطة بخواص إيسراديبين الموسعة للأوعية وتميل للاختفاء أو النقصان مع استمرار العلاج.

انخفاض ضغط الدم في أحوال نادرة.

الآثار المناوئة غير النوعية: وهي نادرة، تشمل التعب، والطفح، والاضطرابات الهضمية (غثيان، قيء، إسهال).

شوهد ارتفاع إنزيمات الترانساميناز في الصفل في حالات منعزلة قليلة ولكنها كانت قابلة للعكس أما أثناء العلاج أو عقب وقف الدواء.

كما هو الحال مع الأدوية الأخرى الموسعة للأوعية، قد تحدث ذبحة صدرية في حالات نادرة، ولا سيما في المرضى الذين يعانون من قبل من مرض قلبي تاجي. في المرضى الذين يعانون من قبل من ذبحة صدرية، قد يزداد تكرار وحدة وشدة النوبات عند بدء العلاج أو كنتيجة لزيادة الجرعة بسرعة مفرطة.

التأثرات

لا يؤثر تناول الأقراص مع الطعام على التوافر الحيوي للوميرِ. ولكنه قد يُبطئ كلاً من بدء الامتصاص وزمن الوصول إلى تركيز الذروة في البلازما بساعة واحدة. يؤدي تناول كبسولات لوميرِ إس آر أو مع الطعام إلى زيادة طفيفة في تركيزات الذروة في البلازما وزيادة التوافر الحيوي بنسبة ٢٠٪ تقريباً.

لا تتغير خواص الحرائك الدوائية لإيسراديبين باعطائه في نفس الوقت مع ديجوكسين، وارفارين، بروبرانولول، أو هيدروكلوروثيازيد. لا يؤثر إيسراديبين على حرائك ديجوكسين، وارفارين، أو هيدروكلوروثيازيد، ولكنه يؤدي إلى زيادة التركيز الأقصى (Cmax) والتوافر الحيوي (AUC) لبروبرانولول بنسبة ٩٨٪ و٤٧٪، على الترتيب. لا يرتبط إيسراديبين بشكل نوعي بالبروتينات. ومع ذلك فإنه يوصى بتوخي الحذر في الحالات التي يستعمل فيها في نفس الوقت أدوية مضادة للتخثر.

يؤدي الاستعمال المتزامن لسيميتيدين، وهو أحد مثبطات جهاز إنزيم سيتوكروم P450، إلى زيادة التوافر الحيوي لإيسراديبين بنسبة ٥٠٪ تقريباً (انظر الجرعة وطريقة الاستعمال). في حين أن الاستعمال المتزامن لريفامبيين، والذي يُعرف بأنه محفز قوي لجهاز إنزيم سيتوكروم P450، يخفض بشدة تركيزات إيسراديبين في البلازما. يجب تجنب استعمال إيسراديبين في نفس الوقت مع ريفامبيين أو غيره من الأدوية المحفزة للإنزيم (مثل فينوباربيتال).

قد يؤدي إيسراديبين إلى إنخفاض خفيف في زمن البروثرومبين. غير أن هذا ليس له دلالة إكلينيكية.

يثبط عصير الجريب فروت التحلل التأكسدي لمركبات الدايهيدروبايريدين. وبالتالي فإن تناوله في نفس الوقت مع إيسراديبين قد يؤدي إلى زيادة المستويات في البلازما والانخفاض المفرط لضغط الدم.

تجاوز الجرعة

الخبرة محدودة بشأن التسمم بإيسراديبين. توحي البيانات المتاحة بأنه قد يؤدي إلى انخفاض ملحوظ وممتد لضغط الدم مما يتطلب تقديم الدعم القلبي الوعائي (مثلاً بأعطاء سوائل في الوريد أو موسعات حجم البلازما)، مع مراقبة الوظيفة القلبية التنفسية وحجم الدم الساري في الدورة الدموية. قد يكون من المفيد استعمال مضيقات الأوعية. بشرط ألا يكون استخدامها محظوراً. يمكن أيضاً محاولة إعطاء الكالسيوم في الوريد.

معلومات أخرى

ملحوظة

يُحفظ لوميرِ بعيداً عن متناول أيدي الأطفال.

العمر الرفي

لا ينبغي استعمال الدواء بعد تاريخ انتهاء الصلاحية (EXP) (= المطبوع على العبوة).

الصانع

انظر العبوة

آخر مراجعة لهذه المعلومات

يوليو ١٩٩٨

تاريخ الموافقة (النص)

٢١ يناير ٢٠٠٠

(م) = علامة تجارية مسجلة

نوفارتس فارما شركة مساهمة، بازل، سويسرا

(إن هذا دواء)

- الدواء: مستحضر يوثر على صحتك واستهلاكه خلافاً للتعليمات يعرضك للخطر.
- اتبع بدقة وصفة الطبيب وطريقة الاستعمال المنصوص عليها وتعليمات الصيدلاني الذي صرفها لك.
- فالطبيب والصيدلي هما الخبيران بالدواء، وينفعه وضرره.
- لا تقطع مدة العلاج المحددة لك من تلقاء نفسك.
- لا تكرر صرف الدواء، بدون وصفة طبية.

يُحفظ الأدوية بعيداً عن متناول أيدي الأطفال

مجلس وزراء الصحة العرب
واتحاد الصيادلة العرب

35540 JS 9 A/T