نوفارتس

لوميرِ ® لوميرِ إس آر أو ®

مضاد للكالسيوم

التركيب

لومير

يحتوى القرص المعزز الواحد على:

- **المادة الفعالة:** إيسرادبين ٥.٠مجم
- السواغ: كبريتات صوديوم لوريل، سواغ تعمل أقراص.

لومير إس آر أو

تحتوى الكبسولة الواحدة المنخفضة الجرعة على:

- **المادة الفعالة:** إيسرادبين ٢.٥مجم
- السواغ: سواغ تعمل كبسولة.

تحتوى الكبسولة الواحدة على:

- **المادة الفعالة:** إيسرادبين ٥مجم
- السواغ: سواغ تعمل كبسولة.

الخصائص/الآثار

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

تشير التجارب على الحيوانات إلى أن إيسرادبين يزاول مفعولاً انتقائياً مثبطاً للعقدة الجيبية. ولكنه لا يعوق التوصيل الأذينى البطينى أو الوظيفة الانقباضية لعضلة القلب لذلك فإن تسرع القلب المنعكس يكون معتدلاً. ولا تحدث إطالة للمسافة PQ، حتى بعد العلاج المديد بأحد حاصرات البيتا. بالجرعات الخافضة لضغط الدم، ثبت أيضاً أن إيسرادبين له معدل معتدل صدر للصوديوم ولكنه مفعول يعتد به.

فى المرضى الذين يعانون من ارتفاع ضغط الدم، يتحقق انخفاض مرتبط بالجرعة لضغط الدم أثناء الرقاد والجلوس والقيام خلال ٢-٣ ساعات من تناول جرعة مفردة بالفم. لومير له مدة مفعول طويلة مما يضمن السيطرة على ضغط الدم لمدة ٢٤ ساعة بعد تناول قرص من ٢.٥مجم 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 ٢-٣ أسابيع للحصول على التأثير الأقصى. لم تُشاهد فى المعتاد تغيرات فى سرعة القلب مع الكبسولات إس آر أو.

كانت القدرة على تحمل إيسرادبين جيدة عند إعطائه للمرضى الذين يعانون من ارتفاع ضغط الدم أو الذبحة الصدرية المستقرة بجرعات تصل إلى ٢٠ أو ٢٢.٥مجم/يوم. أدت الجرعات المفردة بالفم من لومير إلى إخماد الاستجابة التشنجية الشُعيبة فى مرضى الربو الناتجة من التمرين. لومير ليس له أى تأثير ذى دلالة إكلينيكية على استقرار الجلوكوز وبالتالى يمكن إعطاؤه لمرضى السكر.

لم ترد تقارير عن حالات انخفاض وقوفى لضغط الدم.

لم يُشاهد حدوث تناقص لمفعول لومير الخافض لضغط الدم فى الدراسات التى استمرت لمدة تصل إلى سنتين.

الخرائط الدوائية

بعد الامتصاص بنسبة ٩٠-٩٥٪ من القناة الهضمية، يتعرض إيسرادبين لأيض المرور الأول بشكل موسع، مما يؤدى إلى توافر حيوى بنسبة ٢٠٪ تقريباً. بعد تناول جرعات مفردة بالفم ٥-١٠مجم، يظهر الدواء فى البلازما خلال ٢٠ دقيقة؛ ويتم بلوغ تركيزات الذروة فى البلازما بعد حوالى ساعتين. فى حالة الأقراص، عند إعطاء المتطوعين الأصحاء ٢٠مجم لومير إس آر أو فى حالة الصيام مرة واحدة يومياً لمدة ٧ أيام، كانت تركيزات الذروة فى البلازما (Cmax) حوالى ١.٢نانوجرام/مليلتر بعد ٦-٧ ساعات من تناول الدواء (Tmax).

يؤدى تناول القرص مع الطعام إلى إبطاء زمن الوصول إلى مستوى الذروة فى الدم بحوالى ساعة واحدة بدون التأثير على التوافر الحيوى. يؤدى تناول كبسولة إس آر أو مع الطعام إلى ارتفاع خفيف فى تركيزات الذروة فى البلازما وزيادة التوافر الحيوى بنسبة ٢٠٪ تقريباً. يؤدى عصير الجريب فروت إلى زيادة التوافر الحيوى لمركبات الدايهيدروبايريدين من خلال تثبيط تأثير المرور الأول. يرتبط إيسرادبين ببروتينات البلازما بنسبة ٩٦٪ تقريباً ويبلغ حجم توزيعه الظاهرى ٢٨٣لتر. توجد علاقة خطية بين كل من تركيز الذروة فى البلازما والمساحة تحت المنحنى وبين الجرعة عقب إعطاء جرعات بالفم تصل إلى ٢٠مجم.

تبلغ النصفية الإجمالية لإيسرادبين ٣لتر/ساعة والأطراح ثنائى الأطوار؛ ويكون العمر النصفى النهائى ٢.٢ ساعة فى المرضى الأصغر سناً و٤.٥ساعة فى المرضى فوق ٦٥ سنة. يكون الأيض كاملاً، فلا يظهر فى البول أى قدر من الدواء غير المتغير. يتم إخراج حوالى ٦٠-٦٥٪ من الجرعة فى البول و٢٥-٣٠٪ فى البراز.

لم تُظهر بيانات الدراسات أى دليل واضح على وجود علاقة بين الوظيفة الكلوية وبين الخرائط الدوائية لإيسرادبين. وقد شوهد كل من زيادة ونقص التوافر الحيوى فى مرضى الفشل الكلوى.

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

لمنتاثرات الخرائط الدوائية انظر بند التأثيرات.

دواعى الاستعمال/الاستخدامات الممكنة

ارتفاع ضغط الدم.

الجرعة وطريقة الاستعمال

الجرعة المعتادة

الجرعة الموصى بها فى المرضى الذين يعانون من ارتفاع خفيف إلى متوسط لضغط الدم هى قرص واحد ٢.٥مجم مرتين يومياً أو كبسولة واحدة إس آر أو ٥مجم مرة واحدة يومياً.

تعليمات خاصة بالجرعة

الأقراص يتم بدء العلاج بالجرعة ٢.٥مجم مرتين يومياً ويمكن زيادة هذه الجرعة تدريجياً على فترات كل ٢ أسابيع إلى حد أقصى ٥مجم مرتين يومياً إذا لم تتحقق المستويات الطبيعية لضغط الدم. يجب التفكير فى إضافة دواء آخر خافض لضغط الدم من نظام لومير.

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

فى المرضى المسنين وفى مرضى الفشل الكبدى أو الكلوى، يوصى باستخدام جرعة إبتدائية ٢.٥مجم (نصف قرص) مرتين يومياً أو كبسولة واحدة إس آر أو ٥مجم مرة واحدة يومياً.

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

عند إعطاء لومير فى نفس الوقت مع سيميتيدين، تُخفض جرعة لومير بنسبة ٥٠٪ (انظر التأثيرات).

أقراص لومير وكبسولات لومير إس آر أو يجب أو تُبلع صحيحة.

القيود على الاستعمال

موانع الاستعمال

فرط الحساسية لمركبات الدايهيدروبايريدين أو أى من السواغ.

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

الاحتياطات

يوصى بتوخى الحذر الفائق عند إعطاء مركبات الدايهيدروبايريدين للمرضى الذين يعانون من ضيق أوردى شديد.

يوصى بضبط جرعة لومير بشكل فردى فى المرضى الذين يعانون من ضعف بالوظيفة الكبدية أو القصور القلبى المزمن، وكذلك فى المرضى المسنين.

يوصى بتوخى الحذر عند علاج المرضى الذين لديهم حالة مؤكدة أو مُشتبه فيها بشدة من متلازمة الاعتلال الجيبى الذين لم يتم تزويدهم بناظمة للقلب. يوصى أيضاً بتوخى الحذر الخاص فى المرضى الذين لديهم انخفاض فى ضغط الدم الانقباضى.

لا توجد فى الوقت الحالى خبرة بشأن استعمال لومير أو لومير إس آر أو فى المرضى تحت ١٦ سنة.

توجد أدلة توحى بأنه لا سيما فى المرضى بمرض قلبى ناجى، قد تؤدى مضادات الكالسيوم السريعة المفعول من نوع دايهيدروبايريدين إلى زيادة معدل المرض والوفاة لأسباب قلبية وعائية. قد يحدث اشتداد للذبحة الصدرية أو انخفاض حاد لضغط الدم وتسرع القلب والذى قد يتخذ مسارات غير مواتية، أثناء العلاج بهذا المستحضر.

الحمل والإرضاع

يمر إيسرادبين عبر حاجز المشيمة. ولا تقدم البيانات فى الحيوانات أى دليل على أن إيسرادبين له قدرة سامة للجنين أو مانعة. ولكن الخبرة محدودة بشأن استعمال الدواء فى النساء الحوامل وبالتالى فلا يمكن تبرير استعماله أثناء الحمل إلا إذا كانت الفائدة المرجوة تلام تفوق بشكل واضح أى مخاطرة ممكنة على الطفل. عند استعمال لومير عن طريق الفم أثناء الشهور الثلاثة الأخير من الحمل لم يكن ذلك مصحوباً بأى تغيرات فى سرعة قلب الجنين أو فى سريان الدم فى الرحم والمشيمة. توحى المشاهدات السابقة للولادة فى الحيوانات بأن الجرعات المرتفعة من إيسرادبين قد تؤدى إلى إطالة زمن الولادة.

أظهرت إحدى الدراسات التى تم إجراؤها على الجرذان أن كميات صغيرة من إيسرادبين تنفذ إلى اللبن. ولم يتم إجراء دراسات فى الإنسان. وعلى الرغم من أن الدراسات فى الحيوانات لم تكشف عن أى آثار مناوئة كنتيجة لإعطاء إيسرادبين أثناء الإرضاع، إلا أنه لم يتم إثبات أمان استعمال الدواء على الأطفال الرُضع الذين يرضعون من الثدى لذلك يجب على الأمهات اللاتى يستعملن لومير ألا يُرضعن أطفالهن من الثدى.

الآثار المناوئة

الآثار المناوئة الأكثر ذكراً فى التقارير هى الصداع، الإحساس بالسخونة، تميع الوجه، وذمة طرفية موضعية ذات منشأ غير قلبى، دوار، خفقان، وتسرع القلب. هذه الآثار مرتبطة بخواص إيسرادبين الموسعة للأوعية وتميل للاختفاء أو النقصان مع استمرار العلاج.

انخفاض ضغط الدم فى أحوال نادرة.

الآثار المناوئة غير النوعية: وهى نادرة: تشمل الشعب، والطفح، والاضطرابات الهضمية (غثيان، قىء، إسهال).

شوهد ارتفاع إنزيمات الترانسأميناز فى المصل فى حالات منعزلة قليلة ولكنها كانت قابلة للعكس إما أثناء العلاج أو عقب وقف الدواء.

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

التأثرات

لا يؤثر تناول الأقراص مع الطعام على التوافر الحيوى للومير، ولكنه قد يبطئ كلاً من بدء الامتصاص وزمن الوصول إلى تركيز الذروة فى البلازما بساعة واحدة. يؤدى تناول كبسولات لومير إس آر أو مع الطعام إلى زيادة خفيفة فى تركيزات الذروة فى البلازما وزيادة التوافر الحيوى بنسبة ٢٠٪ تقريباً.

لا تتغير خواص الخرائط الدوائية لإيسرادبين بإعطائه فى نفس الوقت مع بيجوكسين، وارفارين، بروبرانولول، أو هيدروكلوروثيازيد. لا يؤثر إيسرادبين على خرائط بيجوكسين، وارفارين، أو هيدروكلوروثيازيد، ولكنه يؤدى إلى زيادة التركيز الأقصى (Cmax) والتوافر الحيوى (AUC) لبروبرانولول بنسبة ٥٨٪ و٢٧٪، على الترتيب. لا يرتبط إيسرادبين بشكل نوعى بالبروتينات. ومع ذلك فإنه يوصى بتوخى الحذر فى الحالات التى يُستعمل فيها فى نفس الوقت أدوية مضادة للتخثر.

يؤدى الاستعمال المتزامن لسيميتيدين، وهو أحد مثبطات جهاز إنزيم سيتوكروم P450، إلى زيادة التوافر الحيوى لإيسرادبين بنسبة ٥٠٪ تقريباً (انظر الجرعة وطريقة الاستعمال)، فى حين أن الاستعمال المتزامن لريفامبيسين، والذى يُعرف بأنه محفز قوى لجهاز إنزيم سيتوكروم P450، يخفض بشدة تركيزات إيسرادبين فى البلازما. يجب تجنب استعمال إيسرادبين فى نفس الوقت مع ريفامبيسين أو غيره من الأدوية المحفزة للإنزيم (مثل فينوباربيتال).

قد يؤدى إيسرادبين إلى إنخفاض خفيف فى زمن البروثرومبين؛ غير أن هذا ليس له دلالة إكلينيكية.

يثبط عصير الجريب فروت التمثيل الناكسدى لمركبات الدايهيدروبايريدين. وبالتالى فإن تناوله فى نفس الوقت مع إيسرادبين قد يؤدى إلى زيادة المستويات فى البلازما وانخفاض المفرط لضغط الدم.

تجاوز الجرعة

الخبرة محدودة بشأن التسمم بإيسرادبين. توحى البيانات المتاحة بأنه قد يؤدى إلى انخفاض ملحوظ ومعتد لضغط الدم مما يتطلب تقديم الدعم القلبى الوعائى (مثلاً بإعطاء سوائل فى الوريد أو موسعات حجم البلازما)، مع مراقبة الوظيفة القلبية التنفسية وحجم الدم السارى فى الدورة الدموية. قد يكون من المفيد استعمال مضيقات الأوعية. يشرط ألا يكون استخدامها محظوراً. يمكن أيضاً محاولة إعطاء الكالسيوم داخل الوريد.

معلومات أخرى

ملحوظة

يُحفظ لومير بعيداً عن متناول أيدى الأطفال.

العمر الرفى

لا ينبغى 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 يؤثر على صحتك واستهلاكه خلافاً للتعليمات يعرضك للخطر.
- اتبع بدقة وصفة الطبيب وطريقة الاستعمال المنصوص عليها وتعليمات الصيدلانى الذى صرفها لك.
- فالطبيب والصيدلى 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 أيدى الأطفال

مجلس وزراء الصحة العرب
واتحاد الصيادلة العرب

35540 JS 9A/T