Амиодарон Белупо



Код АТХ:

- C01BD01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Амиодарон

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, круглые, плоские, с линией разлома на одной стороне.

	1 таб.
амиодарона гидрохлорид	200 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, лактозы моногидрат, повидон K90, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный (безводный), крахмал кукурузный прежелатинизированный.

15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антиаритмический препарат III класса (ингибитор реполяризации). Обладает также антиангинальным, коронародилатирующим, альфа- и бета-адреноблокирующим, тиреотропным и гипотензивным действием.

Антиаритмическое действие обусловлено влиянием на электрофизиологические процессы миокарда; удлиняет потенциал действия кардиомиоцитов; увеличивает эффективный рефрактерный период предсердий, желудочков, AV-узла, пучка Гиса и волокон Пуркинье, добавочных путей проведения возбуждения. Блокируя быстрые натриевые каналы, оказывает эффекты, характерные для антиаритмиков I класса. Тормозит медленную (диастолическую) деполяризацию мембраны клеток синусового узла, вызывая брадикардию и снижение AV-проводимости. Антиангинальный эффект обусловлен коронарорасширяющим и антиадренергическим действием, уменьшением потребности миокарда в кислороде. Оказывает тормозящее влияние на α- и β-адренорецепторы сердечно-сосудистой системы (без полной их блокады). Уменьшает чувствительность к гиперстимуляции симпатической нервной системы, сопротивление коронарных сосудов; увеличивает коронарный кровоток; урежает ЧСС; повышает энергетические

резервы миокарда (за счет увеличения содержания креатинсульфата, аденозина и гликогена). По своей структуре подобен тиреоидным гормонам. Содержание йода составляет около 37% его молекулярного веса. Влияет на обмен тиреоидных гормонов, ингибирует превращение T_3 в T_4 (блокада тироксин-5-дейоддиназы) и блокирует захват этих гормонов кардиоцитами и гепатоцитами, что приводит к ослаблению стимулирующего влияния тиреоидных гормонов на миокард (дефицит T_3 может привести к его гиперпродукции и тиреотоксикозу). Начало действия (даже при использовании нагрузочных доз) - от 2-3 дней до 2-3 мес, длительность действия варьирует от нескольких недель до месяцев (определяется в плазме крови на протяжении 9 мес. после прекращения его приема).

Фармакокинетика

Абсорбция медленная и вариабельная - 30-50%, биодоступность - 30-50%. C_{max} отмечается через 4-7 ч. Диапазон терапевтической плазменной концентрации - 1-2.5 мг/л (но при определении дозы необходимо иметь в виду и клиническую картину). V_d - 60 л, что свидетельствует об интенсивном распределении в ткани. Обладает высокой жирорастворимостью, в высоких концентрациях находится в жировой ткани и органах с хорошим кровоснабжением (концентрация в жировой ткани, печени, почках, миокарде выше, чем в плазме - соответственно, в 300, 200, 50 и 34 раза). Особенности фармакокинетики амиодарона обусловливают необходимость применения препарата в высоких нагрузочных дозах.

Проникает через ГЭБ и плаценту (10-50%), секретируется с грудным молоком (25% дозы, полученной матерью). Связь с белками плазмы крови - 95% (62% - с альбумином, 33,5% - с бета-липопротеинами).

Метаболизируется в печени. Основной метаболит - дезэтиламиодарон фармакологически активен и может усиливать антиаритмический эффект основного соединения. Возможно также путем дейодирования (при дозе 300 мг выделяется примерно 9 мг элементарного йода). При продолжительном лечении концентрации йода могут достигать 60-80% концентраций амиодарона.

Учитывая способность к кумуляции и связанную с этим большую вариабельность фармакокинетических параметров, данные по периоду полувыведения ($T_{1/2}$) противоречивы. Выведение амиодарона после перорального приема осуществляется в 2 фазы: начальный период - 4-21 ч, во второй фазе $T_{1/2}$ - 25-110 дней. После продолжительного перорального приема средний $T_{1/2}$ - 40 дней (это имеет важное значение при выборе дозы, т.к., возможно, необходим, по крайней мере, 1 месяц для стабилизации новой плазменной концентрации, в то время как полное выведение может продлиться более 4 месяцев). Выводится с желчью (85-95%), почками выводится менее 1% принятой внутрь дозы (поэтому при нарушенной функции почек нет необходимости в изменении дозировки). Амиодарон и его метаболиты не подвергаются диализу.

Показания к применению:

— лечение и предупреждение нарушений ритма сердца, связанных с синдромом Вольфа-Паркинсона-Уайта (WPW), пароксизмами мерцания и трепетания предсердий; предсердной и желудочковой экстрасистолией; парасистолией, желудочковыми аритмиями у больных с миокардитом Шагаса;

— предупреждение повторной фибрилляции желудочков и предсердий;

— лечение желудочковой тахикардии;

— лечение наджелудочковой тахикардии с целью восстановления синусового ритма при мерцании и трепетании предсердий в период реабилитации после инфаркта миокарда, если в анамнезе есть указания на ранее отмечавшиеся эпизоды аритмии.

Относится к болезням:

- Аритмия
- Желудочковая тахикардия
- Желудочковая экстрасистолия
- Миокардит
- Пароксизм
- Синусит
- Тахикардия
- Фиброз
- Экстрасистолия

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к йоду, к амиодарону или к другим компонентам препарата;

— синусовая брадикардия и синоатриальная блокада;

— синдром слабости синусового узла (при отсутствии кардиостимулятора);

— AV-блокада II-III степени;

— кардиогенный шок, коллапс, выраженная артериальная гипотензия;

— нарушение функции щитовидной железы (гипо- и гипертиреоз);

— беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— одновременный прием с препаратами, которые могут вызывать полиморфную желудочковую тахиаритмию типа пируэт (torsade de pointes);

— гипокалиемия;

— выраженная сердечная недостаточность;

— интерстициальные болезни легких;

— одновременный прием ингибиторов МАО;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

С осторожностью: печеночная недостаточность, бронхиальная астма; пожилой возраст (высокий риск развития выраженной брадикардии), хроническая сердечная недостаточность.

Способ применения и дозы:

Таблетки принимают внутрь целиком во время или после приема пищи, запивая достаточным количеством жидкости.

Режим дозирования устанавливается индивидуально и корректируется врачом.

Насыщающая доза составляет 600 мг/сут (3 таб), разделенная на 2-3 приема.

Курс лечения 8-15 дней. При необходимости дозу препарата Амиодарон Белупо можно повысить до 800-1200 мг/сут (4-6 таб.) на короткий период и под контролем ЭКГ. После достижения признаков насыщения переходят к поддерживающе терапии.

Поддерживающая доза. При поддерживающем лечении применяется наименьшая эффективная доза в зависимости от индивидуальной реакции пациента и обычно составляет от 200-400 мг/сут (1-2 таб) в 1-2 приема. В случаях, когда это возможно, через каждые 5 дней приема препарата делают двухдневный перерыв.

Средняя терапевтическая разовая доза - 200 мг.

Средняя терапевтическая суточная доза - 400 мг.

Максимальная разовая доза - 400 мг.

Максимальная суточная доза - 1200 мг.

Побочное действие:

Со стороны органов чувств: увеит, отложение липофусцина в эпителии роговицы (часто субъективные жалобы при этом отсутствуют, но если отложения значительные и частично заполняют зрачок, возможны жалобы на появление цветных ореолов или нечеткость контуров), в редких случаях - микроотслойка сетчатки.

Со стороны кожных покровов: васкулит, фотосенсибилизация (гиперемия кожи), свинцово-синяя или голубоватая пигментация кожи (при длительном применении), после прекращения лечения медленно исчезает в течение 10-14 дней, алопеция.

Со стороны эндокринной системы: повышение уровня T_4 при нормальном или незначительно выраженном снижении Тз (при отсутствии клинических признаков дисфункции щитовидной железы лечение прекращать не следует). При длительном применении возможно развитие в редких случаях - гипотиреоза, значительно реже - гипертиреоза (необходимо отменить препарат).

Со стороны дыхательной системы: при длительном применении - кашель, одышка, альвеолярная и/или интерстициальная пневмония, фиброз легких, плеврит, бронхоспазм (особенно у больных с тяжелой дыхательной недостаточностью или бронхиальной астмой).

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, общая слабость, головокружение, депрессия, ощущение усталости, парестезии, слуховые галлюцинации, при длительном применении - периферическая нейропатия, миопатия (симптомы обратимы после отмены препарата), тремор, нарушение памяти, сна, экстрапирамидные расстройства; неврит зрительного нерва.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, нарушение вкуса, запор, метеоризм, при длительном применении - токсический гепатит, холестаз, цирроз.

Аллергические реакции: кожная сыпь, в том числе эксфолиативный дерматит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: синусовая брадикардия (рефрактерная к холинолитикам); синоатриальная блокада, AV-блокада, при длительном применении - прогрессирование симптомов сердечной недостаточности, тахикардия типа пируэт, утяжеление течения существующей аритмии или ее возникновение.

Со стороны лабораторных показателей: редко - повышение активности печеночных трансаминаз, при длительном применении - тромбоцитопения, гемолитическая и апластическая анемия.

Прочие: редко - эпидидимит, снижение либидо, васкулит.

Передозировка:

В случае появления токсичности в виде аритмогенного эффекта препарат отменяют.

Симптомы: снижение АД, синусовая брадикардия, аритмии, AV-блокада, нарушения функции печени.

Лечение: промывание желудка и прием активированного угля, в случае если препарат принят недавно. В остальных случаях проводят симптоматическую терапию. Специфического антидота нет, гемодиализ не эффективен, амиодарон и его метаболиты не удаляются при диализе. При развитии брадикардии возможно назначение атропина, бета$_1$-адреностимуляторов, в тяжелых случаях - кардиостимуляция.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан к применению во II и III триместрах беременности, поскольку в этот период щитовидная железа новорожденного начинает аккумулировать йод, и применение амиодарона в этот период может спровоцировать развитие гипотиреоза из-за увеличения концентрации йода.

Амиодарон выделяется с грудным молоком в значительном количестве, поэтому препарат противопоказан к применению в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Амиодарон взаимодействует с большим числом лекарственных средств. Из-за большого периода полувыведения, возможность появления взаимодействий существует не только с одновременно применяемыми лекарственными средствами, но и с лекарственными средствами, которые будут применяться после прекращения терапии амиодароном.

Противопоказанные комбинации:

- с антиаритмическими средствами, ингибиторами МАО, пентамидином для парентерального введения, поскольку увеличивается риск развития желудочковой тахикардии типа "пируэт" (torsade de pointes);

Нерекомендуемые комбинации:

- с бета-адреноблокаторами, некоторыми блокаторами медленных кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), т.к., могут развиться нарушения автоматизма (брадикардия) и проводимости;

- со слабительными средствами, которые могут вызвать гипокалиемию, т.к., увеличивается риск развития желудочковой тахикардии типа "пируэт" (torsade de pointes);

Комбинации, при которых следует проявить осторожность:

- с препаратами, вызывающими гипокалиемию (диуретики, системные ГКС, тетракозактид, пентамидин, амфотерицин В (в/в), т.к. возможно развитие желудочковой тахикардии типа "пируэт" (torsade de pointes);

- антикоагулянтами для приема внутрь, т.к. увеличивается риск развития кровотечений (необходимо контролировать уровень протромбина и корректировать дозу антикоагулянтов);

- с сердечными гликозидами, т.к. могут наблюдаться нарушения автоматизма (проявляются брадикардией) и нарушения предсердно-желудочковой проводимости. Кроме того, возможно увеличение концентрации дигоксина в плазме крови за счет снижения его клиренса (необходимо контролировать концентрацию дигоксина в плазме крови, ЭКГ-контроль);

- с фенитоином, циклоспорином: возможно увеличение их концентрации в плазме крови (следует контролировать концентрацию фенитоина или циклоспорина в плазме крови);

- колестирамин уменьшает всасывание, период полувыведения и концентрацию амиодарона;

- циметидин замедляет метаболизм амиодарона, что может вызвать увеличение концентрации амиодарона в плазме крови;

- средства для ингаляционной анестезии, оксигенотерапия повышают риск развития брадикардии (резистентной к атропину), артериальной гипотензии, нарушения проводимости, снижения МОК;

- амиодарон может подавлять поглощение натрия йодида (I-131, I-123) и натрия пертехнетата (99mTc) щитовидной железой;

- совместное применение с литием повышает риск гипотиреоза;

- амиодарон повышает токсичность метотрексата;

- рифампицин снижает уровень амиодарона в сыворотке крови (ускорение метаболизма в печени);

- амиодарон замедляет метаболизм будесонида, что в результате может привести к появлению синдрома Кушинга;

- ингибиторы ВИЧ-протеаз (ампренавир, индинавир, нелфинавир, ритонавир) - повышают концентрацию амиодарона в сыворотке крови, риск развития аритмий;

- симвастатин (усиление риска побочных эффектов, зависящих от дозы) типа рабдомиолиза. Доза симвастатина не должна превышать 20 мг/сут. Если при такой дозе не удается достигнуть терапевтического эффекта, следует перейти на другой статин, не вступающий во взаимодействия такого типа;

- антиаритмические средства IA класса, трициклические антидепрессанты, фенотиазины, астемизол, терфенадин, соталол - риск развития аритмогенного действия (удлинение интервала QT, полиморфная желудочковая тахикардия, предрасположенность к синусовой брадикардии, блокаде синусового узла или AV-блокаде);

- лекарственные средства, вызывающие фотосенсибилизацию, оказывают аддитивное фотосенсибилизирующее действие;

- грейпфрутовый сок повышает AUC и C_{max} амиодарона на 50% и 84% соответственно;

- фентанил - риск развития брадикардии, снижения АД и сердечного выброса;

- лидокаин для локальной местной анестезии и амиодарон внутрь - риск развития синусовой брадикардии;

- дизопирамид, фторхинолоны, макролидные антибиотики, азолы - риск удлинения интервала QT;

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом лечения, а также через каждые 3 мес. необходимо проводить ЭКГ контроль, при этом необходимо учитывать, что у пожилых пациентов отмечается более выраженная брадикардия, также необходимо провести рентгенологическое исследование легких, оценить функцию щитовидной железы (содержание гормонов), печени (ферментов).

Частота и тяжесть побочных эффектов зависят от дозы препарата, поэтому следует применять минимально эффективные поддерживающие дозы. При применении препарата Амиодарон Белупо возможны изменения на ЭКГ: удлинение интервала QT с возможным появлением зубца U. При появлении AV-блокады II и III степени, синоатриальной блокады, а также блокады ножек пучка Гиса лечение препаратом Амиодарон Белупо следует немедленно прекратить.

Прогрессирующая одышка и непродуктивный кашель могут быть признаками поражения легких. Рекомендуется проводить рентгенологическое исследование грудной клетки и легочные функциональные пробы (каждые 6 мес. и в случае развития клинических признаков заболевания легких).

Перед началом терапии необходимо определить содержание электролитов плазмы крови.

В период лечения препаратом Амиодарон Белупо регулярно проводят контроль активности ферментов печени. В период лечения периодически проводят анализ ЭКГ (ширина комплекса QRS и длительность интервала QT), трансаминаз (при повышении в 3 раза или удвоении в случае исходно повышенной их активности дозу уменьшают

вплоть до полного прекращения терапии).

В процессе лечения следует проводить офтальмологическое обследование (выявление значительных отложений на роговице и нарушение зрения требуют отмены амиодарона). При отмене возможны рецидивы нарушений ритма.

Применение при беременности и в период лактации возможно только при угрожающих жизни нарушениях ритма при неэффективности другой антиаритмической терапии (вызывает дисфункцию щитовидной железы плода).

После отмены фармакодинамический эффект сохраняется в течение 10-30 дней.

Препарат содержит йод, поэтому может оказывать влияния на результаты тестов накопления радиоактивного йода в щитовидной железе. Поэтому перед началом лечения, во время его проведения и на протяжении нескольких месяцев после окончания лечения необходимо проводить исследования функции щитовидной железы.

Перед проведением хирургических вмешательств, а также оксигенотерапии необходимо предупредить врача о применении препарата Амиодарон Белупо, поскольку отмечались редкие случаи развития острого респираторного дистресс-синдрома у взрослых в послеоперационном периоде.

Во избежание развития фотосенсибилизации пациентам следует избегать пребывания на солнце или использовать эффективные меры защиты.

Следует соблюдать осторожность при применении препарата во время проведения общей анестезии: возможен риск развития брадикардии, выраженного снижения АД, нарушения проводимости и уменьшения ударного объема сердца.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами.

В период лечения препаратом Амиодарон Белупо следует воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции печени

Следует соблюдать осторожность при применении препарата у больных с печеночной недостаточностью.

Применение в пожилом возрасте

Следует соблюдать осторожность при применении препарата у больных пожилого возраста (высокий риск развития выраженной брадикардии).

Применение в детском возрасте

Эффективность и безопасность применения препарата для пациентов в возрасте до 18 лет не установлены.

Условия хранения:

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

Не применять по истечении сорока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Amiodaron_Belupo