Амлодифарм



Код АТХ:

- C08CA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Амлодипин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки	**1 таб.**
амлодипин (в форме безилата)	5 мг

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Производное дигидропиридина - блокатор «медленных» кальциевых каналов (БМКК) II поколения, оказывает антиангинальное и антигипертензивное действие. Связываясь с дигидропиридиновыми рецепторами, блокирует кальциевые каналы, снижает трансмембранный переход ионов кальция в клетку (в большей степени в гладкомышечные клетки сосудов, чем в кардиомиоциты).

Антиангинальное действие обусловлено расширением коронарных и периферических артерий и артериол. При стенокардии уменьшает выраженность ишемии миокарда; расширяя периферические артериолы, снижает общее периферическое сосудистое сопротивление, уменьшает преднагрузку на сердце, снижает потребность миокарда в кислороде. Расширяя коронарные артерии и артериолы в неизмененных и в ишемизированных зонах миокарда, увеличивает поступление кислорода в миокард (особенно при вазоспастической стенокардии); предотвращает развитие спазма коронарных артерий (в т.ч. вызванного курением). У пациентов со стабильной стенокардией разовая суточная доза увеличивает толерантность к физической нагрузке, увеличивает время до наступления приступа стенокардии и "ишемической" депрессии сегмента ST, снижает частоту приступов стенокардии и потребления нитроглицерина и других нитратов.

Оказывает длительное дозозависимое антигипертензивное действие. Антигиперензивное действие обусловлено прямым вазодилатирующим влиянием на гладкие мышцы сосудов. При артериальной гипертензии разовая доза обеспечивает клинически значимое снижение АД на протяжении 24 ч (в положении больного "лежа" и "стоя"). Ортостатическая гипотензия при назначении амлодипина встречается достаточно редко. Не вызывает снижения фракции выброса левого желудочка. Уменьшает степень гипертрофии миокарда левого желудочка. Не оказывает влияния на сократимость и проводимость миокарда, не вызывает рефлекторного увеличения частоты сердечных сокращений (ЧСС), тормозит агрегацию тромбоцитов, увеличивает скорость клубочковой фильтрации, обладает слабым натрийуретическим действием.

У пациентов с ИБС (включая коронарный атеросклероз с поражением одного сосуда и до стеноза 3-х и более артерий и атеросклероза сонных артерий), перенесших инфаркт миокарда, чрескожную транслюминальную ангиопластику коронарных артерий (ТЛАП) или со стенокардией, применение амлодипина предупреждает развитие утолщения интимы-медии сонных артерий, снижает летальность от инфаркта миокарда, инсульта, ТЛАП, аортокоронарного шунтирования, приводит к снижению числа госпитализаций по поводу нестабильной стенокардии и прогрессирования хронической сердечной недостаточности, снижает частоту вмешательств, направленных на восстановление коронарного кровотока. Амлодипин не повышает риск смерти или развития осложнений, приводящих к смертельным исходам у больных с хронической сердечной недостаточностью (ХСН) (III-IVфункциональный класс по классификации NYHA) на фоне терапии дигоксином, диуретиками и ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (АПФ). У больных с ХСН (III-IVфункциональный класс по классификации NYHA) неишемической этиологии при применении амлодипина существует вероятность возникновения отека легких. При диабетической нефропатии не увеличивает выраженность микроальбуминурии. Не оказывает какого-либо неблагоприятного влияния на обмен веществ и концентрацию липидов плазмы крови и может применяться при терапии пациентов с бронхиальной астмой, сахарным диабетом и подагрой. Значимое снижение АД наблюдается через 6-10 ч, длительность эффекта - 24 ч.

Фармакокинетика

После приема внутрь амлодипин медленно абсорбируется из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). Средняя абсолютная биодоступность составляет 64%, C_{max} в сыворотке крови наблюдается через 6-9 ч. Равновесные концентрации достигаются после 7-8 дней терапии. Прием пищи не влияет на абсорбцию амлодипина.

Средний V_d составляет 21 л/кг массы тела, что указывает на то, что большая часть препарата находится в тканях, а меньшая - в крови. Большая часть препарата, находящегося в крови (95%), связывается с белками плазмы крови. Амлодипин подвергается медленному, но активному метаболизму (90%) в печени при отсутствии значимого эффекта "первого прохождения". Метаболиты не обладают существенной фармакологической активностью.

После однократного приема $T_{1/2}$ варьирует от 31 до 48 ч, при повторном применении $T_{1/2}$ составляет приблизительно 45 ч. Около 60% принятой внутрь дозы выводиться почками преимущественно в виде метаболитов, 10% в неизменном виде, а 20-25% через кишечник с желчью. Общий клиренс амлодипина составляет 0.116 мл/с/кг (7 мл/мин/кг, 0.42 л/ч/кг).

У пожилых пациентов (старше 65 лет) выведение амлодипина замедлено ($T_{1/2}$ 65 ч) по сравнению с молодыми пациентами, однако, эта разница не имеет клинического значения. Удлинение $T_{1/2}$ у пациентов с печеночной недостаточностью предполагается, что при длительном назначении кумуляция препарата в организме будет выше ($T_{1/2}$ до 60 ч). У пациентов с нарушением функции почек изменения концентрации амлодипина в плазме крови не коррелируют со степенью почечной недостаточности. Возможно незначительное увеличение $T_{1/2}$.

Амлодипин проникает через гематоэнцефалический барьер, в грудное молоко. При гемодиализе не удаляется.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (монотерапия или в комбинации с другими гипотензивными средствами);

— стабильная стенокардия напряжения и вазоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала) (монотерапия или в комбинации с другими антиангинальными средствами).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Гипотензия
- Стенокардия

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к амлодипину, другим производным дигидропиридина и другим компонентам препарата; выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст.); коллапс, кардиогенный шок; острый инфаркт миокарда (в течение первых 28 дней); нестабильная стенокардия (за исключением стенокардии Принцметала); обструкция выносящего тракта левого желудочка; клинически значимый стеноз аорты; беременность

и период лактации; возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

В связи с тем, что в состав препарата входит лактоза, Амлодифарм не рекомендуется больным с непереносимостью лактозы, дефицитом лактазы, глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

С осторожностью: нарушение функции печени, синдром слабости синусового узла (выраженная брадикардия, тахикардия), ХСН неишемической этиологии III-IV функционального класса по классификации NYHA, артериальная гипотензия, аортальный стеноз, митральный стеноз, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, острый инфаркт миокарда (после первых 28 дней), пожилой возраст.

Способ применения и дозы:

Внутрь, один раз в сут, запивая достаточным количеством воды (100 мл).

Начальная доза для лечения артериальной гипертензии и стенокардии составляет 5 мг препарата 1 раз в сут. Доза максимально может быть увеличена до 10 мг 1 раз в сут.

Повышение дозы рекомендуется проводить через 7-14 дней после начала терапии (более быстрое повышение дозы требует тщательного наблюдения за пациентом).

У больных с нарушенной функцией печени период полувыведения амлодипина увеличивается. Рекомендаций по дозировке препарата в этом случае не разработано, поэтому таким больным препарат следует применять с осторожностью и под наблюдением лечащего врача.

У пациентов пожилого возраста может увеличиваться $T_{1/2}$ амлодипина и снижаться клиренс креатинина (КК). Изменения доз не требуется, но необходимо более тщательное наблюдение за пациентами.

Не требуется изменения дозы при одновременном применении с тиазидными диуретиками, бета-адреноблокаторами и ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (АПФ).

Не требуется изменения дозы у пациентов с почечной недостаточностью.

Побочное действие:

Классификация частоты развития побочных эффектов Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто - более 1/10; часто - более 1/100 и менее 1/10; нечасто - более 1/1000 и менее 1/100; редко - более 1/10000 и менее 1/1000; очень редко - более 1/10000, включая отдельные сообщения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - периферические отеки (лодыжек и стоп), ощущение сердцебиения, ощущение жара и «приливов» крови к коже лица; нечасто - выраженное снижение АД, ортостатическая гипотензия, васкулит; редко - развитие или усугубление течения сердечной недостаточности; очень редко - нарушения ритма (брадикардия, желудочковая тахикардия, мерцание предсердий), инфаркт миокарда, боль в грудной клетке.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: часто - головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, сонливость; нечасто - астения, общее недомогание, гипестезии, парестезии, периферическая нейропатия, тремор, вертиго, обморок, бессонница, лабильность настроения, необычные сновидения, повышенная возбудимость, депрессия, тревога; редко - судороги, апатия, ажитация; очень редко -атаксия, амнезия.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, боль в животе; нечасто - рвота, запор или диарея, метеоризм, диспепсия, анорексия, сухость слизистой оболочки полости рта, жажда; редко - гиперплазия десен, повышение аппетита; очень редко - панкреатит, гастрит, желтуха (обусловленные холестазом), гипербилирубинемия, повышение активности «печеночных» трансаминаз, гепатит.

Со стороны системы кроветворения: очень редко - тромбоцитопеническая пурпура, лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны мочеполовой системы: нечасто - учащенное мочеиспускание, болезненные позывы на мочеиспускание, никтурия, импотенция; очень редко - дизурия, полиурия.

Со стороны кожных покровов: редко - дерматит; очень редко - ксеродермия, нарушение пигментации кожи.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: нечасто - артралгия, судороги мышц, миалгия, боль в спине, артроз; редко - миастения.

Со стороны обмена веществ: очень редко - гипергликемия.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - одышка, ринит; очень редко - кашель. Аллергические реакции: нечасто - кожный зуд, сыпь (в том числе эритематозная, макулопапулезная сыпь); очень редко - крапивница, ангионевротический отек, мультиформная эритема.

Прочие: нечасто - алопеция, «звон» в ушах, гинекомастия, увеличение/снижение массы тела, нарушения зрения, диплопия, нарушение аккомодации, ксерофтальмия, конъюнктивит, боль в глазах, извращение вкуса, озноб, носовое кровотечение; очень редко - паросмия, «холодный» пот.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД с возможным развитием рефлекторной тахикардии и чрезмерной периферической вазодилатации (риск развития выраженной и стойкой артериальной гипотензии, в т.ч. с развитием шока и летального исхода).

Лечение: промывание желудка, применение активированного угля (особенно в первые 2 ч после передозировки), поддержание функции сердечно-сосудистой системы, возвышенное положение нижних конечностей, контроль показателей функции сердца и легких, контроль за объемом циркулирующей крови и диурезом. Для восстановления тонуса сосудов - применение сосудосуживающих средств (при отсутствии противопоказаний к их применению); для устранения последствий блокады кальциевых каналов - внутривенное введение кальция глюконата. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения препарата амлодипина при беременности и в период кормления грудью не установлена, поэтому препарат Амлодифарм не следует назначать беременным и в период лактации.

Женщины детородного возраста в период лечения должны использовать надежные методы контрацепции. При наступлении беременности прием препарата должен быть немедленно прекращен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Амлодипин может безопасно применяться для терапии артериальной гипертензии вместе с тиазидными диуретиками, альфа-адреноблокаторами или ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента (АПФ). У пациентов со стабильной стенокардией амлодипин можно комбинировать с другими антиангинальными средствами, например, с нитратами пролонгированного или короткого действия.

В отличие от других БМКК клинически значимого взаимодействия амлодипина (II поколение БМКК) не было при совместном применении с нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП), в том числе и с индометацином. Возможно усиление антиангинального и антигипертензивного действия БМКК при совместном применении с тиазидными и «петлевыми» диуретиками, ингибиторами АПФ и нитратами, а также усиление их антигипертензивного действия при совместном применении с альфа1-адреноблокаторами.

Эритромицин при совместном применении повышает C_{max} амлодипина у молодых пациентов на 22%, а у пожилых - на 50%.

Бета-адреноблокаторы при одновременном применении с амлодипином могут вызвать обострение течения хронической сердечной недостаточности.

Хотя при изучении амлодипина отрицательного инотропного действия обычно не наблюдали, тем не менее, некоторые БМКК могут усиливать выраженность отрицательного инотропного действия антиаритмических средств, вызывающих удлинение интервала QT (например, амиодарон и хинидин).

Однократный прием 100 мг силденафила у пациентов артериальной гипертензией не оказывает влияния на параметры фармакокинетики амлодипина.

Повторное применение амлодипина в дозе 10 мг и аторвастатина в дозе 80 мг не сопровождается значительными изменениями показателей фармакокинетики аторвастатина.

Этанол (напитки, содержащие алкоголь): амлодипин при однократном и повторном применении в дозе 10 мг не влияет на фармакокинетику этанола.

Антиретровирусные средства (ритонавир) увеличивает плазменные концентрации БМКК, в том числе и амлодипина.

Нейролептики и изофлуран - усиление антигипертензивного действия производных дигидропиридина.

Препараты кальция могут уменьшить эффект БМКК.

При совместном применении амлодипина с препаратами лития возможно усиление проявления нейротоксичности (тошнота, рвота, диарея, атаксия, тремор, шум в ушах). Амлодипин не изменяет фармакокинетику циклоспорина.

Не оказывает влияния на концентрацию в сыворотке крови дигоксина и его почечный клиренс.

Не оказывает существенного влияния на действие варфарина (протромбиновое время). Циметидин не влияет на фармакокинетику амлодипина.

В исследованиях in vitro амлодипин не влияет на связывание с белками плазмы крови дигоксина, фенитоина, варфарина и индометацина.

Грейпфрутовый сок: одновременный однократный прием 240 мг грейпфрутового сока и 10 мг амлодипина внутрь не сопровождается существенным изменением фармакокинетики амлодипина.

Алюминий - или магнийсодержащие антациды: их однократный прием не оказывает существенного влияния на фармакокинетику амлодипина.

Особые указания и меры предосторожности:

В период лечения препаратом Амлодифарм необходимо контролировать массу тела и потребление натрия, показано назначение соответствующей диеты.

Необходимо поддержание гигиены полости рта и наблюдение у стоматолога (предотвращение болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен). При применении препарата Амлодифарм у пациентов с хронической сердечной недостаточностью III и IV функционального класса по классификации NYHA возможно развитие отека легких.

Пациенты с печеночной недостаточностью при необходимости приема препарата Амлодифарм должны находиться под наблюдением врача.

У пожилых пациентов может удлиняться период полувыведения и снижаться клиренс препарата. Изменения доз не требуется, но необходимо тщательное наблюдение за пациентами данной категории.

Эффективность и безопасность применения препарата при гипертоническом кризе не установлена.

Несмотря на отсутствие у БМКК синдрома "отмены", перед прекращением лечения препаратом рекомендуется постепенное уменьшение доз.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и другими сложными механизмами

У некоторых пациентов, преимущественно в начале лечения или при изменении режима дозирования, вследствие возможного выраженного снижения АД могут возникать сонливость, головокружение и другие побочные эффекты. При их возникновении не рекомендуется управление транспортным средством и работа с механизмами, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Не требуется изменения дозы у пациентов с почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

С осторожностью: нарушение функции печени. Пациенты с печеночной недостаточностью при необходимости приема препарата Амлодифарм должны находиться под наблюдением врача.

Применение в пожилом возрасте

У пожилых пациентов может удлиняться период полувыведения и снижаться клиренс препарата. Изменения доз не требуется, но необходимо тщательное наблюдение за пациентами данной категории.

Применение в детском возрасте

Противопоказано: возраст до 18 лет.

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 30°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности - 3 года. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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