Амлодигамма



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)	10 мг

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (30) - пачки картонные.

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

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (30) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Производное дигидропиридина - блокатор медленных кальциевых каналов II поколения, оказывает антиангинальное и гипотензивное 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 главные коронарные артерии и артериолы в неизмененных и ишемизированных зонах миокарда, увеличивает поступление кислорода в миокард (особенно при вазоспастической стенокардии); предотвращает развитие констрикции коронарных артерий (в т.ч. вызванной курением). У больных стенокардией разовая суточная доза увеличивает время выполнения физической нагрузки, замедляет развитие стенокардии и ишемической депрессии сегмента ST, снижает частоту приступов стенокардии и потребления нитроглицерина.

Оказывает длительный дозозависимый гипотензивный эффект. *Гипотензивное 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). Не вызывает резкого снижения АД, снижения толерантности к физической нагрузке, фракции выброса левого желудочка. Уменьшает степень гипертрофии миокарда левого желудочка, оказывает антиатеросклеротическое и кардиопротекторное действие при ишемической болезни сердца. Не оказывает влияния на сократимость и проводимость миокарда, не вызывает рефлекторного увеличения ЧСС, тормозит агрегацию тромбоцитов, повышает скорость клубочковой фильтрации, обладает слабым натрийуретическим действием. При диабетической нефропатии не увеличивает выраженность микроальбуминурии. Не оказывает неблагоприятных влияний на обмен веществ и липиды плазмы крови. Время наступления эффекта - 2-4 ч, длительность эффекта 24 ч.

Фармакокинетика

После приема внутрь амлодипин медленно абсорбируется из ЖКТ. Средняя абсолютная биодоступность составляет 64%, C_{max} в сыворотке крови наблюдается через 6-9 ч. Концентрация стабильного равновесия достигается после 7 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 относительно меньшая - в крови. Большая часть препарата, находящегося в крови (95%), связывается с белками плазмы крови. Амлодипин подвергается медленному, но экстенсивному метаболизму (90%) в печени с образованием неактивных метаболитов, имеет эффект первого прохождения через печень. Метаболиты не обладают значимой фармакологической активностью. После однократного приема внутрь $T_{1/2}$ варьирует от 31 до 48 ч, при повторном назначении $T_{1/2}$ составляет приблизительно 45 ч. Около 60% принятой внутрь дозы экскретируется почками преимущественно в виде метаболитов, 10% в неизмененном виде, а 20-25% - через кишечник, а также с грудным молоком. 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. У пациентов с печеночной недостаточностью предполагается удлинение $T_{1/2}$, и при длительном назначении аккумуляция препарата в организме будет выше ($T_{1/2}$ до 60 ч). Почечная недостаточность не оказывает существенного влияния на кинетику амлодипина. Препарат проникает через гематоэнцефалический барьер. При гемодиализе не удаляется.

Показания к применению:

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

— стенокардия напряжения, вазоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Стенокардия

Противопоказания:

— выраженная артериальная гипотензия;

— коллапс;

— кардиогенный шок;

— нестабильная стенокардия (за исключением стенокардии Принцметала);

— выраженный стеноз устья аорты;

— беременность;

— период лактации;

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

— повышенная чувствительность к амлодипину и другим производным дигидропиридина.

С *осторожностью:* нарушение функции печени, синдром слабости синусового узла (выраженная брадикардия, тахикардия), хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, мягкая или умеренная степень

артериальной гипотензии, аортальный стеноз, митральный стеноз, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, острый инфаркт миокарда (и в течение 1 месяца после), пожилой возраст, одновременное применение бета-адреноблокаторов и дигоксина.

Способ применения и дозы:

Внутрь, начальная доза для лечения *артериальной гипертензии и стенокардии* составляет 5 мг 1 раз/сут. Доза максимально может быть увеличена до 10 мг однократно/сут.

При *артериальной гипертензии* поддерживающая доза - 5 мг/сут.

При *стенокардии напряжения и вазоспастической стенокардии* - 5-10 мг/сут, однократно.

Не требуется изменения дозы при одновременном назначении с тиазидными диуретиками, бета-адреноблокаторами и ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента.

Не требуется изменения дозы у **пациентов с почечной недостаточностью**.

Пациентам с малой массой тела или невысокого роста, а также с выраженной печеночной недостаточностью могут потребоваться меньшие дозы.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение, одышка, выраженное снижение АД, обморок, васкулит, периферические отеки (отечность лодыжек и стоп), приливы крови к коже лица; редко - нарушения ритма (брадикардия, желудочковая тахикардия, трепетание предсердий), инфаркт миокарда, боль в грудной клетке, ортостатическая гипотензия; очень редко - развитие или усугубление сердечной недостаточности, экстрасистолия, мигрень.

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение, утомляемость, сонливость, лабильность настроения, судороги; редко - потеря сознания, гипестезии, периферическая невропатия, парестезии, тремор, вертиго, астения, недомогание, бессонница, депрессия, необычные сновидения; очень редко - атаксия, апатия, ажитация, амнезия.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, боли в эпигастрии; редко - повышение активности печеночных трансаминаз и желтуха (обусловленные холестазом), панкреатит, сухость во рту, жажда, гепатит, метеоризм, гиперплазия десен, запор или диарея; очень редко - гастрит, повышение аппетита, анорексия, гипербилирубинемия.

Со стороны мочеполовой системы: редко - поллакиурия, болезненные позывы на мочеиспускание, никтурия, нарушение сексуальной функции (в том числе снижение потенции); очень редко - дизурия, полиурия.

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

Аллергические реакции: кожный зуд, сыпь (в том числе эритематозная, макулопапулезная сыпь, крапивница), ангионевротический отек, мультиформная эритема.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - артралгия, артроз, судороги мышц, миалгия (при длительном применении); очень редко - миастения.

Прочие: редко - гинекомастия, гиперурикемия, увеличение/снижение массы тела, тромбоцитопения, лейкопения, гипергликемия, нарушение зрения, диплопия, конъюнктивит, боль в глазах, звон в ушах, боль в спине, диспноэ, носовое кровотечение, повышенное потоотделение, жажда; очень редко - холодный липкий пот, кашель, ринит, паросмия, нарушение вкусовых ощущений, нарушение аккомодации, ксерофтальмия.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, тахикардия, чрезмерная периферическая вазодилатация (риск развития выраженной и стойкой артериальной гипотензии, в том числе с развитием шока и летального исхода).

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля (особенно в первые 2 ч после передозировки), поддержание функции сердечно-сосудистой системы, контроль показателей функции сердца и легких, возвышенное положение конечностей, 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 - в/в введение кальция глюконата. Гемодиализ не эффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Ингибиторы микросомального окисления повышают концентрацию амлодипина в плазме крови, усиливая риск развития побочных эффектов, а индукторы микросомальных ферментов печени уменьшают.

В отличие от других БМКК не отмечается клинически значимого взаимодействия с НПВП, особенно с индометацином.

Тиазидные и петлевые диуретики, бета-адреноблокаторы, верапамил, ингибиторы АПФ и нитраты усиливают антиангинальный и гипотензивный эффект.

Амиодарон, хинидин, альфа$_1$-адреноблокаторы, антипсихотические средства (нейролептики) и БМКК могут усиливать гипотензивное действие.

Амлодипин не оказывает влияние на фармакокинетические параметры дигоксина и варфарина.

Циметидин не влияет на фармакокинетику амлодипина.

При совместном применении амлодипина с препаратами лития возможно усиление проявлений их нейротоксичности (тошнота, рвота, диарея, атаксия, тремор, шум в ушах).

Препараты кальция могут уменьшить эффект БМКК.

Противовирусные средства (ритонавир) увеличивают плазменные концентрации БМКК, в т.ч. амлодипина.

Нейролептики и изофлуран - усиление гипотензивного действия производных дигидропиридина.

Грейпфрутовый сок может снижать концентрацию амлодипина в плазме крови, однако это снижение настолько мало, что значимо не изменяет действие амлодипина.

Особые указания и меры предосторожности:

В период лечения необходим контроль за массой тела и потреблением натрия, назначение соответствующей диеты.

Необходимо поддержание гигиены зубов и частое посещение стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен).

Режим дозирования для пожилых такой же, как и для пациентов других возрастных групп. При увеличении дозы необходимо тщательное наблюдение за пожилыми пациентами.

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

Амлодипин не влияет на плазменные концентрации ионов калия, глюкозы, триглицеридов, общего холестерина, липопротедов низкой плотности, мочевой кислоты, креатинина и азота мочевой кислоты.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Не было сообщений о влиянии амлодипина на управление автомобилем или работу с механизмами. Тем не менее, у некоторых пациентов преимущественно в начале лечения могут возникать сонливость и головокружение. При их возникновении пациент должен соблюдать особые меры предосторожности при управлении автомобилем и работе с механизмами.

При нарушениях функции почек

Не требуется изменения дозы у пациентов с почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

Пациентам с выраженной печеночной недостаточностью могут потребоваться меньшие дозы.

С осторожностью**:** нарушение функции печени

Применение в пожилом возрасте

Применять с осторожностью в пожилом возрасте.

Режим дозирования для пожилых такой же, как и для пациентов других возрастных групп. При увеличении дозы необходимо тщательное наблюдение за пожилыми пациентами.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Список Б. Препарат хранить при температуре не выше 25°С. Хранить в местах, недоступных для детей. Не использовать препарат после даты указанной на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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