Амлодипин



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 от белого до почти белого цвета, круглые, плоские, со скошенными краями.

	1 таб.
амлодипин (в форме безилата)	10 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза силикатная микрокристаллическая, крахмал прежелатинизированный, магния стеарат.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки от белого до почти белого цвета, круглые, плоские, со скошенными краями.

	1 таб.
амлодипин (в форме безилата)	5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза силикатная микрокристаллическая, крахмал прежелатинизированный, магния стеарат.

10 шт. - блистеры (2) - 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 в 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 - 24 ч.

Фармакокинетика

Абсорбция - медленная, не зависит от приема пищи, составляет около 90%, биодоступность - 60-65%. C_{max} в сыворотке крови при приеме внутрь - 6-12 ч. Концентрация стабильного равновесия достигается после 7 дней терапии. Пища не влияет на абсорбцию амлодипина. Средний V_d - 21 л/кг, что указывает на то, что большая часть препарата находится в тканях, а относительно меньшая - в крови. Связь с белками плазмы крови - 90-97%.

Интенсивно (90%) метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов, имеет эффект первого прохождения через печень. Метаболиты не обладают значимой фармакологической активностью. $T_{1/2}$ составляет в среднем - 35 ч. Общий клиренс - 500 мл/мин. Выводится почками - 60% в виде метаболитов, 10% в неизмененном виде; с желчью и через кишечник - 20-25% в виде метаболитов, а также с грудным молоком.

$T_{1/2}$ у больных с артериальной гипертензией - 48 ч.

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 применении аккумуляция препарата в организме будет выше ($T_{1/2}$ до 60 ч.).

Почечная недостаточность не оказывает существенного влияния на кинетику амлодипина. Проникает через гематоэнцефалический барьер. При гемодиализе не удаляется.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в монотерапии или в комбинации с другими лекарственными 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);

— беременность;

— период лактации;

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

— повышенная чувствительность к амлодипину и другим производным дигидропиридина.

С*осторожностью:* артериальная гипотензия, аортальный стеноз, хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, мягкая или умеренная степень артериальной гипотензии, аортальный стеноз, митральный стеноз, печеночная недостаточность, острый инфаркт миокарда (и в течение 1 мес после), пожилой возраст, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, синдром слабости синусового узла (выраженная брадикардия, тахикардия), сахарный диабет, нарушение липидного профиля.

Способ применения и дозы:

Внутрь, начальная доза для *лечения артериальной гипертензии и стенокардии* составляет 5 мг 1 раз/сут с постепенным увеличением в течение 7-14 дней до 10 мг/сут, однократно. Максимальная суточная доза составляет 10 мг. 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 АПФ.

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

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение, утомляемость, сонливость, изменение настроения, судороги; редко - потеря сознания, гипестезия, парестезии, тремор, вертиго, астения, недомогание, бессонница, нервозность, депрессия, необычайные сновидения; очень редко - атаксия, апатия, ажитация, амнезия, мигрень.

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

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

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

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

Со стороны кожных покровов: очень редко - ксеродермия, алопеция, дерматит, пурпура, изменение цвета кожи.

Аллергические реакции: кожный зуд, сыпь (в т.ч. эритематозная, макулопапулезная сыпь, крапивница), ангионевротический отек.

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

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, чрезмерная периферическая вазодилатация, тахикардия.

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля, 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 препаратов (при отсутствии противопоказаний к их применению); для устранения последствий блокады кальциевых каналов - внутривенное введение кальция глюконата. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Беременность и период лактации - эффективность и безопасность не установлены.

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.

Гипотензивный эффект ослабляют НПВП, особенно индометацин, (задержка натрия и блокада синтеза простагландинов почками), альфа-адреностимуляторы, эстрогены (задержка натрия), симпатомиметики.

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

Амиодарон, хинидин, альфа$_1$-адреноблокаторы, антипсихотические лекарственные средства (нейролептики) и блокаторы медленных кальциевых каналов могут усиливать гипотензивное действие.

Не оказывает влияние на фармакокинетические параметры дигоксина и варфарина. Циметидин не влияет на фармакокинетику амлодипина.

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

Препараты кальция могут уменьшить эффект блокаторов медленных кальциевых каналов.

Прокаинамид, хинидин и другие лекарственные средства, вызывающие удлинение интервала QT, усиливают отрицательный инотропный эффект и могут повышать риск значительного удлинения интервала QT.

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 людей такой же, как и для пациентов других возрастных групп.

При увеличении дозы необходимо тщательное наблюдение за пожилыми пациентами.

Несмотря на отсутствие у блокаторов медленных кальциевых каналов синдрома отмены, перед прекращением лечения рекомендуется постепенное уменьшение доз.

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

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 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.**

Применение в пожилом возрасте

Режим дозирования для пожилых людей такой же, как и для пациентов других возрастных групп.

При увеличении дозы необходимо тщательное наблюдение за пожилыми пациентами.

Применение в детском возрасте

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

Условия хранения:

Хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте, при температуре от 15° до 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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