Амлодипин-Зт



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 (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
5 кг - пакеты полиэтиленовые (1) - контейнеры.
10 кг - пакеты полиэтиленовые (1) - контейнеры.
15 кг - пакеты полиэтиленовые (1) - контейнеры.
20 кг - пакеты полиэтиленовые (1) - контейнеры.
25 кг - пакеты полиэтиленовые (1) - контейнеры.
50 кг - пакеты полиэтиленовые (1) - контейнеры.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Производное дигидропиридина - блокатор медленных кальциевых каналов (БМКК) II поколения, оказывает антиангинальное и гипотензивное действие. Блокирует кальциевые каналы, снижает трансмембранный переход ионов кальция в клетку (в большей степени в гладкомышечные клетки сосудов, чем в кардиомиоциты).

Антинангинальное действие обусловлено расширением коронарных и периферических артерий и артериол: при стенокардии уменьшает выраженность ишемии миокарда; расширяя периферические артериолы, снижает ОПСС, уменьшает постнагрузку 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 вазоспастнческой стенокардии); предотвращает спазм коронарных артерий (в т.ч. вызванной курением). У больных 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 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). 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 ЧСС, тормозит агрегацию тромбоцитов, увеличивает скорость клубочковой фильтрации, обладает слабым натрийуретическим действием. 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.

У пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы (включая коронарный атеросклероз с поражением одного сосуда и до стеноза 3-х и более артерий, атеросклероза сонных артерий), перенесших инфаркт миокарда, чрезкожную транслюминальную ангиопластику (ТЛАП) коронарных артерий или пациентов со стенокардией, применение амлодипина предупреждает развитие утолщения интимы медии сонных артерий, снижает летальность от инфаркта миокарда, инсульта, ТЛАП, аорто-коронарного шунтирования, что приводит к уменьшению числа госпитализаций по поводу нестабильной стенокардии и уменьшает прогрессирование хронической сердечной недостаточности (ХСН); снижает частоту вмешательств, направленных на восстановление коронарного кровотока.

Не повышает риск смерти или развития осложнений и летальных исходов у пациентов с ХСН (III-IVфункциональный класс по классификации NYHA) на фоне терапии дигоксином, диуретиками и ингибиторами АПФ. У пациентов с ХСН (III-IV функциональный класс по классификации NYHA) неишемической этиологии при применении амлодипина существует вероятность возникновения отека легких.

Фармакокинетика

После приема внутрь амлодипин медленно абсорбируется из ЖКТ. Средняя абсолютная биодоступность составляет 64%, C_{max} в сыворотке крови наблюдается через 6-9 ч. C_{ss} 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 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 приеме$T_{1/2}$ составляет приблизительно 45 ч. Около 60% принятой внутрь дозы выводится почками преимущественно в виде метаболитов, 10% - в неизмененном виде, а 20-25% - через кишечник с желчью. Общий клиренс амлодипина составляет 0.116 мл/с/кт (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 $T_{1/2}$ пациентов с печеночной недостаточностью предполагает, что при длительном применении кумуляция препарата в организме будет выше ($T_{1/2}$ - до 60 ч.). Почечная недостаточность не оказывает существенного влияния на кинетику амлодипина.

Амлодипнн проникает через гематоэнцефатический барьер. При гемодиализе не удаляется.

Показания к применению:

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

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

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Стенокардия

Противопоказания:

— выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст.);

— нестабильная стенокардия (за исключением стенокардии Принцметала);

— клинически значимый стеноз аорты;

— дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

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

— повышенная чувствительность к амлодипину, другим производным дигидропиридина и другим компонентам препарата.

С *осторожностью:* нарушения функции печени, синдром слабости синусового узла (выраженная брадикардия, тахикардия), ХСН неишемической этиологии III-IVфункционального класса по классификации NYHA, артериальная гипотензия, аортальный стеноз, митральный стеноз, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, острый инфаркт миокарда (и в течение 1 месяца после инфаркта миокарда), пожилой возраст.

Способ применения и дозы:

Внутрь, 1 раз/сут, запивая необходимым количеством воды (100 мл).

При *артериальной гипертензии и стенокардии* начальная доза Амлодипина-3Т, таб. по 5 мг составляет 1 таб. (5 мг) 1 раз/сут . При необходимости суточная доза может быть увеличена до 2 таб. (10 мг) в 1 прием.

У **пожилых пациентов** Амлодипин-3Т, таб. по 5 мг рекомендуется применять в средней терапевтической дозе, коррекция дозы не требуется.

У **пациентов с нарушением функции печени** несмотря на то, что $T_{1/2}$ амлодипина, как и всех БМКК, увеличивается, коррекции дозы обычно не требуется.

У **пациентов с почечной недостаточностью** рекомендуется применять Амлодипин-3Т, таблетки по 5 мг в обычных дозах, однако необходимо учитывать возможное незначительное увеличение $T_{1/2}$

Не требуется коррекции дозы при одновременном назначении с тиазидными диуретиками, бета-адреноблокаторами и ингибиторами ЛПФ.

Побочное действие:

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась соответственно следующему (классификация Всемирной организации здравоохранения): очень часто - более 1/10, часто - от более 1/100 до менее 1/10, нечасто - от более 1/1000 до менее 1/100, редко - от более 1/10 000 до менее 1/1000, очень редко - от менее 1/10 000, включая отдельные сообщения.

Со стороны ЦНС: часто - головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, сонливость; нечасто - астения, общее недомогание, гипестезии, парестезии, периферическая невропатия, тремор, бессонница, лабильность настроения, необычные сновидения, повышенная возбудимость, депрессия, тревожность; очень редко — мигрень, повышенное потоотделение, апатия, ажитация, атаксия, амнезия.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, боли 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 сердечно-сосудистой системы: часто - ощущение сердцебиения, периферические отеки (лодыжек и стоп), приливы крови к коже лица; нечасто - чрезмерное снижение АД; очень редко - обморок, одышка, васкулит, ортостатическая гипотензия, развитие или усугубление течения ХСН, нарушения ритма сердца (включая брадикардию, желудочковую тахикардию и мерцание предсердий), инфаркт миокарда, боль в грудной клетке.

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

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

Со стороны дыхательной системы: нечасто - ринит; очень редко - кашель.

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - мышечные судороги, миалгия, артралгия, боль в спине, артроз; редко - миастения.

Со стороны кожных покровов: редко - дерматит; очень редко - алопеция, ксеродермия, холодный пот, нарушение

пигментации кожи.

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

Прочие: нечасто - звон в ушах, диплопия, нарушение аккомодации, ксерофтальмия, конъюнктивит, боль в глазах, озноб, носовое кровотечение, гинекомастия; очень редко - паросмия, гипергликемия.

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, прием активированного угля (особенно в первые 2 ч после передозировки), поддержание функции сердечно-сосудистой системы, возвышенное положение нижних конечностей, мониторинг показателей работы сердца и легких, контроль ОЦК и диуреза. Для восстановления тонуса сосудов - применение сосудосуживающих средств (при отсутствии противопоказании к их применению); для устранения последствий блокады кальциевых каналов - в/в введение кальция глюконата. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения Амлодипина-ЗТ при беременности не установлена, поэтому применение при беременности возможно только в том случае, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Отсутствуют данные, свидетельствующие о выделении амлодипина с грудным молоком. Однако известно, что другие БМКК - производные дигидропиридина, выделяются с грудным молоком. В связи с чем, при необходимости применения Амлодипина-ЗТ в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Амлодипин может безопасно применяться для терапии артериальной гипертензии имеете с тиазидными диуретиками, альфа-адреноблокаторами, бета-адреноблокаторами или ингибиторами АПФ.

У пациентов со стабильной стенокардией амлодипин можно комбинировать с другими антиангинальными средствами, например, с нитратами пролонгированного или короткого действия, бета-адреноблокаторами.

В отличие от других БМКК клинически значимого взаимодействия амлодипина (II поколение БМКК) не было обнаружено при одновременном применении с НПВП, в т.ч. и с индометацином.

Возможно усиление антиангинального и гипотензивного действия БМКК при одновременном применении с тиазидными и петлевыми диуретиками, ингибиторами АПФ, бета-адреноблокаторами и нитратами, а также усиление их гипотензивного действия при совместном применении с альфа$_1$-адреноблокаторами.

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 больных эссенциальной 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.

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

Нейролептики и изофлуран — усиление гипотензивного действия производных дигидропиридина.

Препараты кальция могут уменьшить эффект БМКК.

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

Амлодипин не изменяет фармакокинетику циклоспорина.

Не оказывает влияние 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 терапии Амлодипином-3Т необходимо контролировать массу тела и потребление поваренной соли, показано назначение соответствующей диеты.

Необходимо поддержание гигиены полости рта и наблюдение у стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен).

У пациентов пожилого возраста может увеличиваться $T_{1/2}$ и снижаться клиренс препарата. Изменения доз не требуется, но необходимо более тщательное наблюдение за пациентами данной категории.

Пациентам с низким индексом массы тела и больным с выраженным нарушением функции печени может потребоваться меньшая доза препарата.

Эффективность и безопасность применения Амлодипина-3Т при гипертоническом кризе не установлена.

Несмотря на отсутствие у БМКК синдрома отмены, прекращением лечения Амлодипином-3Т желательно проводить, постепенно уменьшая дозу препарата.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Хотя на фоне приема Амлодипина-3Т какого-либо отрицательного влияния на способность управлять автотранспортом или другими сложными механизмами не наблюдалось, однако, вследствие возможного чрезмерного снижения АД, развития головокружения, сонливости и других побочных реакций, следует соблюдать осторожность в перечисленных ситуациях, особенно в начале лечения и при увеличении дозы.

При нарушениях функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью рекомендуется применять Амлодипин-3Т, таблетки по 5 мг в обычных дозах, однако необходимо учитывать возможное незначительное увеличение $T_{1/2}$

При нарушениях функции печени

С осторожностью: нарушения функции печени.

У пациентов с нарушением функции печени несмотря на то, что $T_{1/2}$ амлодипина, как и всех БМКК, увеличивается, коррекции дозы обычно не требуется.

Применение в пожилом возрасте

У **пожилых пациентов** Амлодипин-3Т, таб. по 5 мг рекомендуется применять в средней терапевтической дозе, коррекция дозы не требуется.

У пациентов пожилого возраста может увеличиваться $T_{1/2}$ и снижаться клиренс препарата. Изменения доз не требуется, но необходимо более тщательное наблюдение за пациентами данной категории.

Применение в детском возрасте

Противопоказан:

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

Условия хранения:

Препарат хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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