Амлодипин Зентива



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 белого или почти белого цвета, продолговатые, с риской на одной стороне и гравировкой "А" слева и "5" справа от риски.

	1 таб.
амлодипина безилат	6.935 мг,
что соответствует содержанию амлодипина	5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 71.356 мг, кальция гидрофосфата дигидрат - 37.5 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 2.4 мг, магния стеарат - 1.8 мг.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Таблетки белого или почти белого цвета, продолговатые, с риской на одной стороне и гравировкой "А" слева и "10" справа от риски.

	1 таб.
амлодипина безилат	13.87 мг,
что соответствует содержанию амлодипина	10 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 142.73 мг, кальция гидрофосфата дигидрат - 75 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 4.8 мг, магния стеарат - 3.6 мг.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Блокатор медленных кальциевых каналов (БМКК) II поколения, производное дигидропиридина. 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).

Антиангинальное 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 главные коронарные артерии и артериолы в неизмененных и в ишемизированных зонах миокарда, увеличивает поступление кислорода в миокард (особенно при вазоспастической стенокардии); предотвращает развитие сужения коронарных артерий (в т.ч. вызванной курением).

При применении у больных стабильной стенокардией в суточной дозе 1 раз/сут повышает 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 и более артерий, атеросклероза сонных артерий), перенесших инфаркт миокарда, чрескожную транслюминальную ангиопластику (ТЛА) коронарных артерий или пациентов со стенокардией, применение амлодипина предупреждает развитие утолщения интимы-медии сонных артерий, снижает летальность от инфаркта миокарда, инсульта, ТЛА, аортокоронарного шунтирования; приводит к снижению частоты приступов нестабильной стенокардии и прогрессирования 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-IV функциональный 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

Всасывание

После приема внутрь амлодипин медленно абсорбируется из ЖКТ. Средняя относительная биодоступность составляет 64%, C_{max} в плазме крови наблюдается через 6-9 ч. C_{ss} достигаются после 7-8 дней терапии.

Прием пищи не влияет на абсорбцию амлодипина.

Распределение

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 проникает через ГЭБ.

Метаболизм

Амлодипин подвергается медленному, но активному метаболизму в печени при отсутствии значимого эффекта "первого прохождения". Метаболиты не обладают существенной фармакологической активностью.

Выведение

После однократного приема $T_{1/2}$ варьирует от 31 до 48 ч, при повторном назначении $T_{1/2}$ 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/кг (7 мл/мин/кг; 0.42 л/ч/кг).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов пожилого возраста (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 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. 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;

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

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность к другим производным дигидропиридина.

С *осторожностью* следует применять препарат при нарушениях функции печени, СССУ (выраженная брадикардия, тахикардия), ХСН неишемической этиологии III-IV функционального класса по классификации NYHA, артериальной гипотензии, аортальном стенозе, митральном стенозе, гипертрофической обструктивиой кардиомиопатии, остром инфаркте миокарда (и в течение 1 месяца после инфаркта миокарда), у пациентов пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

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

При *артериальной гипертензии и стенокардии* начальная доза составляет 5 мг 1 раз/сут. При необходимости суточная доза может быть увеличена до 10 мг в 1 прием.

У пациентов пожилого возраста препарат Амлодипин Зентива рекомендуется применять в средней терапевтической дозе, коррекции дозы не требуется.

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

У **пациентов с почечной недостаточностью** рекомендуется применять препарат Амлодипин Зентива в обычных дозах, однако необходимо учитывать возможное незначительное увеличение $T_{1/2}$.

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

Побочное действие:

Определение частоты побочных реакций (согласно ВОЗ): очень часто (>1/10), часто (>1/100 до < 1/10), нечасто (от >1/1000 до <1/100), редко (от >1/10 000 до < 1/1000), очень редко (от <1/10 000, включая отдельные сообщения).

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

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

Со стороны половой системы: нечасто - импотенция, гинекомастия

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

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

Со стороны кожных покровов: редко - дерматит; очень редко - алопеция, ксеродермия, повышенное потоотделение, холодный пот, нарушение пигментации кожи.

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

Со стороны органов чувств: нечасто - звон в ушах, диплопия, нарушение аккомодации, ксерофтальмия, конъюнктивит, боль в глазах; очень редко - паросмия.

Прочие: нечасто - озноб, носовое кровотечение; очень редко - гипергликемия.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД с возможным развитием рефлекторной тахикардии, 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, больному следует принять горизонтальное положение с возвышенным положением нижних конечностей, контроль показателей работы сердца и легких, ОЦК и диуреза. 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 неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

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

Амлодипин выделяется с грудным молоком, поэтому при необходимости назначения препарата Амлодипин Зентива в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Амлодипин можно безопасно применять для терапии артериальной гипертензии вместе 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 совместном применении с нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП), в т.ч. с индометацином.

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

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 силденафила в дозе 100 мг у больных эссенциальной гипертензией не оказывает влияния на параметры фармакокинетики амлодипина.

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

Амлодипин в дозе 10 мг не влияет на фармакокинетику этанола.

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

Препараты кальция могут уменьшить эффект БМКК.

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

При совместном применении амлодипина с препаратами лития возможно усиление проявлений 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.

Одновременный однократный прием 240 мл грейпфрутового сока и 10 мг амлодипина внутрь не сопровождается существенным изменением фармакокинетики амлодипина.

При однократном приеме алюминий- или магнийсодержащие антациды не оказывают существенного влияния на фармакокинетику амлодипина.

Особые указания и меры предосторожности:

В период терапии препаратом Амлодипин Зентива следует контролировать массу тела и потребление натрия.

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

У пациентов пожилого возраста возможно увеличение $T_{1/2}$ и снижение клиренса амлодипина. Изменения доз не требуется, но необходимо более тщательное наблюдение за пациентами данной категории.

Пациентам невысокого роста с небольшой массой тела и больным с выраженным нарушением функции печени может потребоваться меньшая доза препарата.

Эффективность и безопасность применения препарата Амлодипин Зентива при гипертоническом кризе не установлена

Несмотря на отсутствие у БМКК "синдрома отмены", прекращение лечения препаратом Амлодипин Зентива желательно проводить, постепенно уменьшая дозу препарата.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Хотя на фоне приема препарата Амлодипин Зентива какого-либо отрицательного влияния на способность управлять транспортом или другими сложными механизмами не наблюдалось, вследствие возможного чрезмерного снижения АД, развития головокружения, сонливости и других побочных реакций, пациентам 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 препарат Амлодипин Зентива в обычных дозах, однако необходимо учитывать возможное незначительное увеличение $T_{1/2}$.

При нарушениях функции печени

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

Применение в пожилом возрасте

У пациентов пожилого возраста препарат Амлодипин Зентива рекомендуется применять в средней терапевтической дозе, коррекции дозы не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте. Специальных условий хранения не требуется.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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