Амлорус



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, плоскоцилиндрические, с фаской, допускается наличие мраморности.

	1 таб.
амлодипин (в форме безилата)	2.5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 45.83 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 45.7 мг, кросповидон - 1 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 0.5 мг, тальк - 2.5 мг, кальция стеарат - 1 мг.

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

Таблетки белого или почти белого цвета, плоскоцилиндрические, с фаской, допускается наличие мраморности.

	1 таб.
амлодипин (в форме безилата)	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 63.17 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 62.9 мг, кросповидон - 1.4 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 0.7 мг, тальк - 3.5 мг, кальция стеарат - 1.4 мг.

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

Таблетки белого или почти белого цвета, плоскоцилиндрические, с фаской, допускается наличие мраморности.

	1 таб.
амлодипин (в форме безилата)	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 88.34 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 87.8 мг, кросповидон - 2 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 1 мг, тальк - 5 мг, кальция стеарат - 2 мг.

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Производное дигидропиридина – блокатор медленных кальциевых каналов. Оказывает антигипертензивное и антиангинальное действие. Блокирует кальциевые каналы, снижает трансмембранный переход ионов кальция в клетку (в большей степени в гладкомышечные клетки сосудов, чем в кардиомиоциты).

Антигипертензивное действие обусловлено прямым вазодилатирующим действием на гладкие мышцы сосудов. Оказывает длительное дозозависимое антигипертензивное действие.

Амлодипин уменьшает ишемию миокарда (оказывает антиангинальное действие) двумя путями:

1) расширяет периферические артериолы и таким образом снижает ОПСС, уменьшает постнагрузку на сердце, при этом ЧСС практически не изменяется, что приводит к снижению потребления энергии и потребности миокарда в кислороде;

2) расширяет коронарные и периферические артерии и артериолы в неизмененных и в ишемизированных зонах миокарда, что увеличивает поступление кислорода в миокард (особенно при вазоспастической стенокардии), уменьшает выраженность ишемии миокарда и предотвращает развитие спазма коронарных артерий (в т.ч. вызванного курением).

При артериальной гипертензии разовая доза обеспечивает клинически значимое снижение АД на протяжении 24 ч (в положении больного "лежа" и "стоя"). Благодаря медленному началу действия амлодипин не вызывает резкого снижения АД. Не снижает толерантность к физической нагрузке и фракцию выброса левого желудочка.

У больных стенокардией разовая суточная доза амлодипина увеличивает время выполнения физической нагрузки, замедляет развитие стенокардии и ишемической депрессии сегмента ST (на 1 мм), снижает частоту приступов стенокардии и потребления нитроглицерина и других нитратов.

Уменьшает степень гипертрофии миокарда левого желудочка, оказывает антиатеросклеротическое и кардиопротекторное действие при ИБС.

У пациентов с ИБС (включая коронарный атеросклероз с поражением одного сосуда и до стеноза трех и более артерий и атеросклероза сонных артерий), перенесших инфаркт миокарда, чрескожную транслюминальную ангиопластику коронарных артерий (ТЛАП) или страдающих стенокардией, применение амлодипина предупреждает развитие утолщения интимы-медии сонных артерий, значительно снижает летальность от сердечно-сосудистых причин, 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 (III-IV функционального класса по классификации Нью-Йоркской Ассоциации кардиологов (NYHA)) на фоне терапии дигоксином, диуретиками и ингибиторами АПФ.

У больных с хронической сердечной недостаточностью (III-IV функционального класса по классификации NYHA) неишемической этиологии при применении амлодипина существует вероятность возникновения отека легких.

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 концентрацию липидов в плазме крови и может применяться при лечении больных бронхиальной астмой, сахарным диабетом и подагрой.

Время наступления эффекта препарата - 2-4 ч, длительность эффекта - 24 ч. При длительной терапии максимальное снижение АД наступает через 6-12 ч после приема амлодипина внутрь. Если после продолжительного лечения амлодипин отменить, эффективное снижение АД сохраняется в течение 48 ч после приема последней дозы. Затем показатели АД постепенно возвращаются к исходному уровню в течение 5-6 дней.

Фармакокинетика

Всасывание

Абсорбция медленная, не зависит от приема пищи, составляет около 90%. Биодоступность составляет 60-90%, C_{max} в сыворотке крови наблюдается через 6-12 ч после приема.

Распределение

V_d равен примерно 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 (95-97%), связывается с белками плазмы крови. Амлодипин проникает через ГЭБ. При гемодиализе не удаляется. C_{ss} амлодипина в плазме крови достигается через 7-8 дней постоянного приема препарата.

Метаболизм

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.

Выведение

После однократного приема внутрь $T_{1/2}$ варьирует от 31 до 48 ч, при повторном назначении $T_{1/2}$ составляет приблизительно 45 ч (что соответствует назначению препарата 1 раз/сут). Общий клиренс амлодипина составляет 0.116 мл/с/кг (7 мл/мин/кг, 0.42 л/ч/кг).

Около 60% принятой внутрь дозы выводится почками преимущественно в виде метаболитов, 10% в неизмененном виде, с желчью и через кишечник – 20-25% в виде метаболитов.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пожилых пациентов старше 65 лет выведение амлодипина замедлено ($T_{1/2}$ увеличивается до 65 ч) по сравнению с молодыми пациентам. У пожилых и у молодых пациентов время, необходимое для достижения C_{max} амлодипина в плазме крови, практически одинаковое.

У пациентов с печеночной недостаточностью и с тяжелой хронической сердечной недостаточностью $T_{1/2}$ увеличивается до 56-60 ч.

$T_{1/2}$ из плазмы крови у больных с почечной недостаточностью увеличивается до 60 ч. Изменение концентрации амлодипина в плазме крови не коррелирует со степенью нарушения функции почек.

Показания к применению:

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

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

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Гипотензия
- Стенокардия

Противопоказания:

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

— кардиогенный шок;

— острый инфаркт миокарда в течение первых 28 дней;

— нестабильная стенокардия (за исключением вазоспастической/стенокардии Принцметала);

— обструкция выносящего тракта левого желудочка (включая клинически значимый стеноз аорты);

— возраст до 18 лет;

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

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

С *осторожностью:* нарушение функции печени, синдром слабости синусового узла (выраженная брадикардия, тахикардия), хроническая сердечная недостаточность неишемической этиологии III-IV функционального класса по классификации NYHA, артериальная гипотензия, аортальный стеноз, митральный стеноз, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, пожилой возраст.

Способ применения и дозы:

Таблетки принимают однократно внутрь, запивая необходимым объемом воды (до 100 мл).

Для лечения *артериальной гипертензии и стенокардии* начальная доза составляет 5 мг 1 раз/сут. В зависимости от индивидуальной реакции больного при необходимости доза может быть увеличена максимально до 10 мг 1 раз/сут.

При *артериальной гипертензии* поддерживающая доза может быть 5 мг/сут. При *вазоспастической стенокардии (стенокардии Принцметала)* - 5-10 мг/сут, доза принимается 1 раз/сут.

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

У **пациентов с печеночной недостаточностью, пожилых пациентов** может потребоваться изменение дозы, начальная доза при артериальной гипертензии может составлять 2.5 мг.

При назначении препарата **пациентам с почечной недостаточностью** не требуется изменения режима дозирования.

Побочное действие:

Под частотой побочных реакций понимается: очень часто (≥1/10); часто (≥1/100, <1/10); нечасто (≥1/1000, <1/100); редко (≥1/10 000, <1/1000); очень редко (<1/10 000), 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 - чрезмерное снижение АД, ортостатическая гипотензия, васкулит; редко - развитие или усугубление течения хронической сердечной недостаточности; очень редко - нарушения ритма сердца (включая брадикардию, желудочковую тахикардию и мерцание предсердий), инфаркт миокарда, боль в грудной клетке.

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

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

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

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

Со стороны дыхательной системы: нечасто - одышка, ринит, носовое кровотечение; очень редко - кашель.

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

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

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

Со стороны обмена веществ: очень редко - гипергликемия.

Аллергические реакции: нечасто - кожный зуд, сыпь; очень редко - ангионевротический отек, многоформная эритема, крапивница.

Прочие: нечасто - гинекомастия, увеличение/снижение массы тела, озноб; очень редко - холодный пот.

Передозировка:

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

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля, поддержание функции сердечно-сосудистой системы, контроль показателей функции сердца и легких, возвышенное положение нижних 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 - в/в введение кальция глюконата. Поскольку амлодипин в значительной степени связывается с белками сыворотки крови, 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 применения для матери превышает потенциальный риск для плода.

Отсутствуют данные, свидетельствующие об экскреции амлодипина с грудным молоком. Однако известно, что другие блокаторы медленных кальциевых каналов - производные дигидропиридина, экскретируются с грудным молоком. В связи с чем, при необходимости назначения препарата Амлорус в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Женщины детородного возраста должны использовать надежные методы контрацепции.

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.

Амлодипин не оказывает влияния на фармакокинетические параметры дигоксина и варфарина, не влияет на изменения протромбинового времени, вызванные варфарином.

Циметидин не влияет на фармакокинетику амлодипина.

Препараты кальция могут уменьшить эффект блокаторов медленных кальциевых каналов (в т.ч. амлодипина).

В отличие от других блокаторов медленных кальциевых каналов значимого взаимодействия при совместном применении с НПВП (в т.ч. индометацином) обнаружено не было.

Тиазидные и "петлевые" диуретики, бета-адреноблокаторы, верапамил, ингибиторы АПФ и нитраты усиливают антиангинальное и антигипертензивное действия амлодипина.

Альфа$_1$-адреноблокаторы, нейролептики, амиодарон и хинидин могут усилить антигипертензивное действие амлодипина при совместном применении.

Блокаторы медленных кальциевых каналов (в т.ч. амлодипин) могут усиливать выраженность отрицательного инотропного действия антиаритмических препаратов, вызывающих удлинение интервала QT (амиодарон, хинидин, прокаинамид).

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

Однократный прием силденафила в дозе 100 мг 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.

Противовирусные препараты (ритонавир) увеличивают плазменные концентрации блокаторов медленных кальциевых каналов (в т.ч. амлодипина).

Однократный прием алюминий- и магнийсодержащих антацидов не оказывает существенного влияния на фармакокинетику амлодипина.

Грейпфрутовый сок может снижать концентрацию амлодипина в плазме крови, однако одновременный однократный прием 240 мг грейпфрутового сока и 10 мг амлодипина внутрь не сопровождается существенным изменением фармакокинетики амлодипина.

Особые указания и меры предосторожности:

При лечении артериальной гипертензии Амлорус можно применять в комбинации с тиазидными диуретиками, альфа-адреноблокаторами, бета-адреноблокаторами и ингибиторами АПФ.

Для лечения стенокардии Амлорус можно комбинировать с другими антиангинальными средствами, например, с нитратами пролонгированного или короткого действия, бета-адреноблокаторами.

Амлорус может быть применен и в тех случаях, когда больной предрасположен к сосудистому спазму (вазоконстрикции).

Амлорус не влияет на плазменные концентрации ионов калия, глюкозы, триглицеридов, общего холестерина, липопротеидов низкой плотности, мочевой кислоты, креатинина и азота мочевины и может применяться при лечении больных бронхиальной астмой, сахарным диабетом и подагрой.

Пациентам с малой массой тела, пациентам невысокого роста и больным с выраженным нарушением функции печени в качестве антигипертензивного средства Амлорус назначают в начальной дозе 2.5 мг, в качестве антиангинального средства - 5 мг.

Во время лечения необходимо контролировать массу тела и потребление натрия, показано назначение соответствующей диеты, наблюдение у стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен).

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При назначении препарата **пациентам с почечной недостаточностью** не требуется изменения режима дозирования.

При нарушениях функции печени

У **пациентов с печеночной недостаточностью** может потребоваться изменение дозы, начальная доза при артериальной гипертензии может составлять 2.5 мг.

Применение в пожилом возрасте

У **пожилых пациентов** может потребоваться изменение дозы, начальная доза при артериальной гипертензии может составлять 2.5 мг.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан к применению у детей и подростков в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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