Амлотоп



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 и риской.

	1 таб.
амлодипина безилат	6.93 мг,
что соответствует содержанию амлодипина	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 77.67 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 11.6 мг, кальция стеарат - 1 мг, кроскармеллоза натрия (примеллоза) - 1.8 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 1 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
30 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Таблетки белого или почти белого цвета, плоскоцилиндрические, с фаской и риской.

	1 таб.
амлодипина безилат	13.86 мг,
что соответствует содержанию амлодипина	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 111.7 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 17 мг, кальция стеарат - 1.4 мг, кроскармеллоза натрия (примеллоза) - 2.7 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 3.34 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
30 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Блокатор медленных кальциевых каналов II поколения, производное дигидропиридина. Оказывает антигипертензивное и антиангинальное 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).

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, фракции выброса левого желудочка. Не оказывает влияния на сократимость и проводимость миокарда. Уменьшает степень гипертрофии миокарда.

Антиангинальное действие обусловлено расширением коронарных и периферических артерий и артериол: при стенокардии уменьшает выраженность ишемии миокарда; расширяя периферические артериолы, снижает ОПСС, 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 амлодипина увеличивает время до наступления первого ишемического эпизода во время выполнения физической нагрузки, препятствует развитию приступа стенокардии и ишемической депрессии сегмента ST (на 1 мм) на фоне физической нагрузки, снижает частоту приступов стенокардии и потребления нитроглицерина.

У пациентов с ИБС (включая коронарный атеросклероз с поражением одного сосуда и до стеноза 3 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, снижает летальность от инфаркта миокарда, инсульта, ТЛАП, аортокоронарного шунтирования, приводит к снижению числа госпитализаций по поводу нестабильной стенокардии и вмешательств, направленных на восстановление коронарного кровотока.

Амлодипин не повышает риск смерти или развития осложнений, приводящих к смертельным исходам у пациентов с хронической сердечной недостаточностью (III-IV функциональный класс по классификации NYHA) на фоне терапии дигоксином, диуретиками и ингибиторами АПФ.

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

Амлодипин не оказывает какого-либо неблагоприятного влияния на обмен веществ и концентрацию липидов плазмы крови. Тормозит агрегацию тромбоцитов, повышает скорость клубочковой фильтрации, обладает слабым натрийуретическим действием. При диабетической нефропатии не увеличивает выраженность микроальбуминурии.

Время наступления эффекта - 2-4 ч, длительность эффекта 24 ч.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь амлодипин медленно абсорбируется из ЖКТ. Биодоступность составляет 60-65%, C_{max} в плазме крови наблюдается через 6-12 ч. C_{ss} достигается через 7-8 дней терапии. Прием пищи не влияет на абсорбцию амлодипина.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет 90-97%. Средний V_d - 21 л/кг.

Проникает через ГЭБ. Выделяется с грудным молоком.

Метаболизм

Амлодипин подвергается медленному, но экстенсивному метаболизму (90%) в печени с образованием неактивных метаболитов, имеет низкий печеночный клиренс (подвергается эффекту "первого прохождения" через печень).

Выведение

При приеме препарата 1 раз/сут $T_{1/2}$ составляет в среднем 35 ч (от 35 ч до 50 ч). Общий клиренс - 500 мл/мин. Выводится почками (10% - в неизмененном виде, 60% - в виде метаболитов), с желчью и через кишечник (20-25% - с калом).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов пожилого возраста, пациентов с печеночной недостаточностью и тяжелой хронической сердечной недостаточностью $T_{1/2}$ увеличивается до 60-65 ч.

При почечной недостаточности $T_{1/2}$ не меняется.

При гемодиализе не удаляется.

Показания к применению:

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

— стабильная стенокардия напряжения (в качестве монотерапии или в комбинации с другими антиангинальными средствами);

— вазоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала) (в качестве 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.);

— коллапс;

— кардиогенный шок;

— клинически значимый стеноз аорты;

— беременность;

— период лактации;

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

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

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность к другим производным дигидропиридина.

С *осторожностью* применяют препарат при нарушениях функции печени, СССУ (выраженная брадикардия, тахикардия), хронической сердечной недостаточности неишемической этиологии III-IV функционального класса по классификации NYHA, артериальная гипотензия (систолическое АД более 90 и менее 100 мм рт.ст.), аортальном стенозе, митральном стенозе, гипертрофической обструктивной кардиомиопатии, при остром инфаркте миокарда (и в течение 1 месяца после), у пациентов пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Назначают внутрь, 1 раз/сут. Принимают независимо от приема пищи, запивая достаточным количеством воды (100 мл).

При *лечении артериальной гипертензии и стенокардии* начальная доза препарата составляет 5 мг. В зависимости от индивидуальной реакции пациента доза максимально может быть увеличена до 10 мг/сут. Повышение дозы рекомендуется проводить через 7-14 дней после начала терапии. Более быстрое повышение дозы требует тщательного наблюдения за пациентом.

Пациентам с небольшой массой тела, пациентам невысокого роста, больным пожилого возраста, больным с нарушением функции печени в качестве *антигипертензивного средства* амлодипин назначают в начальной дозе 2.5 мг (1/2 таб. 5 мг), в качестве *антиангинального средства* - 5 мг.

Препарат в начальной дозе 2.5 мг можно также применять при добавлении амлодипина к терапии другими гипотензивными препаратами.

У **пациентов с почечной недостаточностью** не требуется коррекция дозы препарата.

Побочное действие:

Определение частоты побочных реакций: часто (>1%), нечасто (>0.1% и <1%), редко (>0.01% и <0.1%), очень редко (<0.01%).

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 сердечной недостаточности; очень редко - нарушения ритма сердца (включая брадикардию, желудочковую тахикардию и мерцание предсердий), инфаркт миокарда, боли в грудной клетке.

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

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

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

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

Со стороны обмена веществ: нечасто - увеличение/снижение массы тела; очень редко - гипергликемия.

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

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - учащенное мочеиспускание (поллакиурия), болезненные позывы на мочеиспускание, никтурия; очень редко - дизурия, полиурия.

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

Дерматологические реакции: нечасто - алопеция; редко - дерматит; очень редко - ксеродермия, нарушение пигментации кожи.

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

Прочие: нечасто - гинекомастия, озноб, импотенция; очень редко - холодный пот.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД с возможным развитием рефлекторной тахикардии и чрезмерной периферической вазодилатации (риск развития выраженного и стойкого снижения АД, в т.ч. с развитием шока и летального исхода).

Лечение: прием активированного угля (особенно в первые 2 ч после передозировки), промывание желудка (в некоторых случаях), поддержание функции сердечно-сосудистой системы, контроль показателей функции сердца и легких, контроль ОЦК и диуреза. Больному следует принять горизонтальное положение с возвышенным положением нижних конечностей.

При отсутствии противопоказаний - проведение симптоматической терапии: сосудосуживающие препараты, в/в введение кальция глюконата. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Женщины детородного возраста в период лечения амлодипином 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 концентрацию амлодипина.

В отличие от других блокаторов медленных кальциевых каналов не отмечается клинически значимого взаимодействия амлодипина с НПВС, особенно с индометацином.

Возможно усиление антиангинального и гипотензивного действия блокаторов медленных кальциевых каналов при совместном применении с тиазидными и "петлевыми" диуретиками, бета-адреноблокаторами, альфа$_1$-адреноблокаторами, верапамилом, ингибиторами АПФ и нитратами.

При одновременном приеме блокаторов медленных кальциевых каналов с нейролептиками и изофлураном возможно повышение гипотензивного эффекта.

Некоторые блокаторы медленных кальциевых каналов могут усиливать выраженное отрицательное инотропное действие антиаритмических препаратов, вызывающих удлинение интервала QT (амиодарон, хинидин), однако при применении препарата амлодипин отрицательного инотропного действия обычно не наблюдается.

Препараты кальция могут уменьшать эффект блокаторов медленных кальциевых каналов.

При совместном применении блокаторов медленных кальциевых каналов с препаратами лития возможно усиление проявлений их нейротоксичности (тошнота, рвота, диарея, атаксия, тремор, шум в ушах), однако данные о препарате амлодипин отсутствуют.

Циметидин не влияет на фармакокинетику амлодипина.

Амлодипин не вызывает значительных изменений фармакокинетики циклоспорина. Однократный прием антацидов, содержащих алюминий/магний, не оказывает существенного влияния на фармакокинетику амлодипина.

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

Повторное одновременное применение амлодипина в дозе 10 мг и аторвастатина в дозе 80 мг не оказывает существенного влияния на фармакокинетику аторвастатина.

При одновременном применении дигоксина и амлодипина концентрация дигоксина в сыворотке и его клиренс не меняются.

Амлодипин не влияет на изменение протромбинового времени, вызванное варфарином.

При однократном и повторном применении амлодипина в дозе 10 мг не оказывает существенного влияния на фармакокинетику этанола.

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

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

Особые указания и меры предосторожности:

При лечении артериальной гипертензии амлодипин можно применять в комбинации с тиазидными диуретиками, альфа- и бета-адреноблокаторами, ингибиторами АПФ, нитратами короткого и пролонгированного действия, НПВС, антибиотиками и пероральными гипогликемическими средствами.

При лечении стенокардии амлодипин можно назначать в виде монотерапии или в комбинации с другими антиангинальными препаратами, в том числе у больных, рефрактерных к лечению нитратами и/или бета-адреноблокаторами, в адекватных дозах.

В период лечения необходимо контролировать массу тела и потребление натрия. Необходимо соблюдение гигиены полости рта и регулярное посещение стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен).

Амлодипин не влияет на плазменные концентрации калия, глюкозы, триглицеридов, общего холестерина, ЛПНП, мочевой кислоты, креатинина и азота мочевой кислоты и может применяться у больных бронхиальной астмой, сахарным диабетом и подагрой.

Амлодипин можно применять у пациентов, предрасположенных к вазоспазму/вазоконстрикции.

Пациентам с низкой массой тела или низкого роста, пожилым пациентам, а также пациентам с выраженной печеночной недостаточностью могут потребоваться меньшие дозы. 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.

Таблетки амлодипина не рекомендуются при гипертоническом кризе.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

У некоторых пациентов, преимущественно в начале лечения или при изменении режима дозирования, вследствие возможного выраженного снижения АД могут возникать сонливость, головокружение и другие побочные эффекты. При их возникновении не рекомендуется управление автомобилем и работа с механизмами.

При нарушениях функции почек

Почечная недостаточность не оказывает существенного влияния на кинетику амлодипина.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применяют препарат при нарушениях функции печени.

У пациентов с печеночной недостаточностью предполагается удлинение $T_{1/2}$ и при длительном назначении кумуляция препарата в организме будет выше ($T_{1/2}$ - до 60 ч).

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* применяют препарат у пациентов пожилого возраста.

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 к применению пациентам в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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