Эналаприл



Код АТХ:

- C09AA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Эналаприл

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 цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с одной стороны.

	1 таб.
эналаприла малеат	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, магния карбонат, желатин, кросповидон, магния стеарат.

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

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с одной стороны.

	1 таб.
эналаприла малеат	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, магния карбонат, желатин, кросповидон, магния стеарат.

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

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с одной стороны.

	1 таб.
эналаприла малеат	20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, магния карбонат, желатин, кросповидон, магния стеарат.

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Эналаприл - антигипертензивный препарат из группы ингибиторов АПФ. Эналаприл является «пролекарством»: в результате его гидролиза образуется эналаприлат, который и ингибирует АПФ. Механизм его действия связан с уменьшением образования из ангиотензина I ангиотензина II, снижение содержания которого ведет к прямому уменьшению выделения альдостерона. При этом понижается общее периферическое сосудистое сопротивление, систолическое и диастолическое АД, пост- и преднагрузка на миокард.

Расширяет артерии в большей степени, чем вены, при этом рефлекторного повышения частоты сердечных сокращений не отмечается.

Гипотензивный эффект более выражен при высоком уровне ренина плазмы, чем при нормальном или сниженном его уровне. Снижение АД в терапевтических пределах не оказывает влияния на мозговое кровообращение, кровоток в сосудах мозга поддерживается на достаточном уровне и на фоне сниженного артериального давления. Усиливает коронарный и почечный кровоток.

При длительном применении уменьшается гипертрофия левого желудочка миокарда и миоцитов стенок артерий резистивного типа, предотвращает прогрессирование сердечной недостаточности и замедляет развитие дилатации левого желудочка. Улучшает кровоснабжение ишемизированного миокарда. Снижает агрегацию тромбоцитов. Обладает некоторым диуретическим эффектом.

Время наступления гипотензивного эффекта при приеме внутрь - 1 ч, достигает максимума через 4-6 ч и сохраняется до 24 ч. У некоторых больных для достижения оптимального уровня АД необходима терапия на протяжении нескольких недель. При сердечной недостаточности заметный клинический эффект наблюдается при длительном применении - 6 мес и более.

Фармакокинетика

После приема внутрь абсорбируется 60% препарата. Прием пищи не влияет на всасывание эналаприла. Биодоступность препарата - 40%. C_{max} эналаприла в плазме крови достигается через 1 ч, эналаприлата - через 3-4 ч.

Эналаприл до 50% связывается с белками крови. Эналаприлат легко проходит через гистогематические барьеры, исключая ГЭБ, небольшое количество проникает через плаценту и в грудное молоко.

Эналаприл быстро метаболизируется в печени с образованием активного метаболита эналаприлата, который является более активным ингибитором АПФ, чем эналаприл.

$T_{1/2}$ эналаприлата - около 11 ч. Выводится эналаприл преимущественно почками - 60% (20% - в виде эналаприла и 40% - в виде эналаприлата), через кишечник - 33% (6% - в виде эналаприла и 27% - в виде эналаприлата). Удаляется при гемодиализе (скорость - 62 мл/мин) и перитонеальном диализе.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— при хронической сердечной недостаточности (в составе комбинированной терапии).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

— наличие в анамнезе ангионевротического отека, связанного с лечением ингибиторами АПФ;

— порфирия;

— беременность;

— период лактации;

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

— повышенная чувствительность к эналаприлу и другим ингибиторам АПФ.

С *осторожностью* применять при первичном гиперальдостеронизме, двустороннем стенозе почечных артерий, стенозе артерии единственной почки, гиперкалиемии, состоянии после трансплантации почки; аортальном стенозе, митральном стенозе (с нарушениями гемодинамики), идиопатическом гипертрофическом субаортальном стенозе, системных заболеваниях соединительной ткани, ИБС, цереброваскулярных заболеваниях, сахарном диабете, почечной недостаточности (протеинурия - более 1 г/сут), печеночной недостаточности, у пациентов, соблюдающих диету с ограничением соли или находящихся на гемодиализе, при одновременном приеме с иммунодепрессантами и салуретиками, у пожилых людей (старше 65 лет).

Способ применения и дозы:

Назначают внутрь независимо от времени приема пищи.

При *монотерапии артериальной гипертензии* начальная доза - 5 мг 1 раз/сут. При отсутствии клинического эффекта через 1-2 недели дозу повышают на 5 мг. После приема начальной дозы больные должны находиться под медицинским наблюдением в течение 2 ч и дополнительно 1 ч, пока не стабилизируется АД. При необходимости и достаточно хорошей переносимости дозу можно увеличить до 40 мг/сут в 2 приема. Через 2-3 недели переходят на поддерживающую дозу - 10-40 мг/сут, разделенную на 1-2 приема. При *умеренной артериальной гипертензии* средняя суточная доза составляет около 10 мг.

Максимальная суточная доза препарата составляет 40 мг/сут.

В случае назначения пациентам, одновременно получающим диуретики, лечение диуретиком необходимо прекратить за 2-3 дня до назначения Эналаприла. Если это невозможно, то начальная доза препарата должна составлять 2.5 мг/сут.

Больным с гипонатриемией (концентрация ионов натрия в сыворотке крови менее 130 ммоль/л) или концентрацией креатинина в сыворотке крови более 0.14 ммоль/л начальная доза - 2.5 мг 1 раз/сут.

При *реноваскулярной гипертензии* начальная доза - 2.5-5 мг/сут. Максимальная суточная доза составляет 20 мг.

При *хронической сердечной недостаточности* начальная доза составляет 2.5 мг однократно, затем дозу увеличивают на 2.5 - 5 мг через каждые 3-4 дня в соответствии с клинической реакцией до максимально переносимых доз в зависимости от величин АД, но не выше 40 мг/сут однократно или в 2 приема. У больных с низким систолическим АД (менее 110 мм рт.ст.) терапию следует начинать с дозы 1.25 мг/сут. Подбор дозы должен проводиться в течение 2-4 недель или в более короткие сроки. Средняя поддерживающая доза - 5-20 мг/сут за 1-2 приема.

У **пожилых** людей чаще наблюдается более выраженный гипотензивный эффект и удлинение времени действия препарата, что связано с уменьшением скорости выведения эналаприла, поэтому рекомендуемая начальная доза пожилым — 1.25 мг.

При **хронической почечной недостаточности** кумуляция наступает при снижении фильтрации менее 10 мл/мин. При КК 80-30 мл/мин доза обычно составляет 5-10 мг/сут, при КК до 30-10 мл/мин - 2.5-5 мг/сут, при КК менее 10 мл/мин - 1.25-2.5 мг/сут только в дни диализа.

Длительность лечения зависит от эффективности терапии. При слишком выраженном снижении АД дозу препарата постепенно уменьшают.

Препарат применяют как в монотерапии, так и в сочетании с другими антигипертензивными средствами.

Побочное действие:

Эналаприл в целом хорошо переносится и в большинстве случаев не вызывает побочных действий, требующих отмены препарата.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: чрезмерное снижение АД, ортостатический коллапс, редко - загрудинная боль, стенокардия, инфаркт миокарда (обычно связаны с выраженным снижением АД), крайне редко - аритмии (предсердная бради- или тахикардия, мерцание предсердий), сердцебиение, тромбоэмболия ветвей легочной артерии.

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, слабость, бессонница, тревога, спутанность сознания, повышенная утомляемость, сонливость (2-3%), очень редко при применении высоких доз - нервозность, депрессия, парестезии.

Со стороны органов чувств: нарушения вестибулярного аппарата, нарушения слуха и зрения, шум в ушах.

Со стороны пищеварительного тракта: сухость во рту, анорексия, диспепсические расстройства (тошнота, диарея или запор, рвота, боли в области живота), кишечная непроходимость, панкреатит, нарушение функции печени и желчевыделения, гепатит, желтуха.

Со стороны дыхательной системы: непродуктивный сухой кашель, интерстициальный пневмонит, бронхоспазм, одышка, ринорея, фарингит.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек, крайне редко - дисфония, полиморфная эритема, эксфолиативный дерматит, синдром Стивена-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, пемфигус, фотосенсибилизация, серозит, васкулит, миозит, артралгия, артрит, стоматит, глоссит.

Со стороны лабораторных показателей: гиперкреатининемия, повышение содержания мочевины, повышение активности печеночных ферментов, гипербилирубинемия, гиперкалиемия, гипонатриемия. Отмечаются в некоторых случаях снижение гематокрита, повышение СОЭ, тромбоцитопения, нейтропения, агранулоцитоз (у больных с аутоиммунными заболеваниями), эозинофилия.

Со стороны мочевыделительной системы: нарушение функции почек, протеинурия.

Прочие: алопеция, снижение либидо, приливы.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД вплоть до развития коллапса, инфаркта миокарда, острого нарушения мозгового кровообращения или тромбоэмболических осложнений, судороги, ступор.

Лечение: больного переводят в горизонтальное положение с низким изголовьем. В легких случаях показаны промывание желудка и прием внутрь солевого раствора, в более тяжелых случаях - мероприятия, направленные на стабилизацию АД: внутривенное введение физиологического раствора, плазмозаменителей, при необходимости — введение ангиотензина II, гемодиализ (скорость выведения эналаприлата в среднем составляет 62 мл/мин).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном назначении Эналаприла с НПВП возможно снижение гипотензивного эффекта; с калийсберегающими диуретиками (спиронолактон, триамтерен, амилорид) может привести к гиперкалиемии; с солями лития - к замедлению выведения лития (показан контроль концентрации лития в плазме крови).

Одновременный прием с жаропонижающими и болеутоляющими средствами может уменьшить эффективность эналаприла.

Эналаприл ослабляет действие препаратов, содержащих теофиллин.

Гипотензивное действие эналаприла усиливают диуретики, бета-адреноблокаторы, метилдопа, нитраты, блокаторы медленных кальциевых каналов, гидралазин, празозин.

Иммунодепрессанты, аллопуринол, цитостатики усиливают гематотоксичность.

Препараты, вызывающие угнетение костного мозга, повышают риск развития нейтропении и/или агранулоцитоза.

Особые указания и меры предосторожности:

Необходимо соблюдать осторожность при назначении Эналаприла пациентам со сниженным ОЦК (в результате терапии диуретиками, при ограничении потребления поваренной соли, проведении гемодиализа, диарее и рвоте) — повышен риск внезапного и выраженного снижения АД после применения даже начальной дозы ингибитора АПФ. Транзиторная артериальная гипотензия не является противопоказанием для продолжения лечения препаратом после стабилизации АД. В случае повторного выраженного снижения АД следует уменьшить дозу или отменить препарат.

Применение высокопроницаемых диализных мембран повышает риск развития анафилактической реакции. Коррекция режима дозирования в дни, свободные от диализа, должна осуществляться в зависимости от уровня АД.

До и во время лечения ингибиторами АПФ необходим периодический контроль АД, показателей крови (гемоглобина, калия, креатинина, мочевины, активности печеночных ферментов), белка в моче.

Следует тщательно наблюдать за больными с тяжелой сердечной недостаточностью, ишемической болезнью сердца

и заболеваниями сосудов мозга, у которых резкое снижение АД может привести к инфаркту миокарда, инсульту или нарушению функции почек.

Внезапная отмена лечения не приводит к синдрому «отмены» (резкому подъему АД).

За новорожденными и грудными детьми, которые подвергались внутриутробному воздействию ингибиторов АПФ, рекомендуется вести тщательное наблюдение для своевременного выявления выраженного снижения АД, олигурии, гиперкалиемии и неврологических расстройств, возможных вследствие уменьшения почечного и мозгового кровотока при снижении АД, вызванного ингибиторами АПФ. При олигурии необходимо поддержание АД и почечной перфузии путем введения соответствующих жидкостей и сосудосуживающих средств. При наличии почечной недостаточности возможно снижение выведения активного метаболита, приводящее к увеличению его концентрации в плазме крови. Таким пациентам может потребоваться назначение меньших доз препарата.

У пациентов с артериальной гипертензией и односторонним или двусторонним стенозом почечных артерий возможно повышение содержания мочевины и креатинина в сыворотке крови.

У таких пациентов необходимо контролировать функцию почек в течение первых нескольких недель терапии. Может потребоваться снижение дозировки препарата.

Следует учитывать соотношение риска и потенциальной пользы при назначении Эналаприла пациентам с коронарной и цереброваскулярной недостаточностью, в связи с опасностью усиления ишемии при чрезмерной артериальной гипотензии.

Препарат следует назначать с осторожностью пациентам с сахарным диабетом из-за риска развития гиперкалиемии.

Пациенты, имеющие в анамнезе указания на ангионевротический отек, могут иметь повышенный риск развития ангионевротического отека на фоне лечения Эналаприлом.

У пациентов с выраженными аутоимунными заболеваниями, например, системной красной волчанкой или склеродермией, повышен риск развития нейтропении или агранулоцитоза на фоне приема Эналаприла.

Рекомендуется проявлять осторожность при назначении Эналаприла для терапии хронической сердечной недостаточности у пациентов, получавших сердечные гликозиды и/или диуретики.

Перед исследованием функций паращитовидных желез препарат следует отменить. Алкоголь усиливает гипотензивное действие препарата.

Перед хирургическим вмешательством (включая стоматологию) необходимо предупредить хирурга/анестезиолога о применении ингибиторов АПФ.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В начале лечения, до завершения периода подбора дозы, необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, так как возможно головокружение, особенно после начальной дозы ингибитора АПФ у больных, принимающих диуретические средства.

При нарушениях функции почек

При **хронической почечной недостаточности** кумуляция наступает при снижении фильтрации менее 10 мл/мин. При КК 80-30 мл/мин доза обычно составляет 5-10 мг/сут, при КК до 30-10 мл/мин - 2.5-5 мг/сут, при КК менее 10 мл/мин - 1.25-2.5 мг/сут только в дни диализа.

При нарушениях функции печени

С*осторожностью* применять при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

У **пожилых** людей чаще наблюдается более выраженный гипотензивный эффект и удлинение времени действия препарата, что связано с уменьшением скорости выведения эналаприла, поэтому рекомендуемая начальная доза пожилым — 1.25 мг.

Применение в детском возрасте

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

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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