Эналаприл-Убф



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ингибитор АПФ. Является пролекарством, из которого в организме образуется активный метаболит эналаприлат. Полагают, что механизм антигипертензивного действия связан с конкурентным ингибированием активности АПФ, которое приводит к снижению скорости превращения ангиотензина I в ангиотензин II (который оказывает выраженное сосудосуживающее действие и стимулирует секрецию альдостерона в коре надпочечников).

В результате уменьшения концентрации ангиотензина II происходит вторичное увеличение активности ренина плазмы за счет устранения отрицательной обратной связи при высвобождении ренина и прямое снижение секреции альдостерона. Кроме того, эналаприлат, по-видимому, оказывает влияние на кинин-калликреиновую систему, препятствуя распаду брадикинина.

Благодаря сосудорасширяющему действию, уменьшает ОПСС (постнагрузку), давление заклинивания в легочных капиллярах (преднагрузку) и сопротивление в легочных сосудах; повышает минутный объем сердца и толерантность к нагрузке.

Фармакокинетика

При приеме внутрь около 60% абсорбируется из ЖКТ. Одновременный прием пищи не влияет на всасывание. Метаболизируется в печени путем гидролиза с образованием эналаприлата, благодаря фармакологической активности которого реализуется гипотензивное действие. Связывание эналаприлата с белками плазмы составляет 50-60%.

$T_{1/2}$ эналаприлата составляет 11 ч и увеличивается при почечной недостаточности. После приема внутрь 60% дозы выводится почками (20% в виде эналаприла, 40% в виде эналаприлата), 33% выводится через кишечник (6% в виде эналаприла, 27% в виде эналаприлата). После в/в введения эналаприлата 100% выводится почками в неизмененном виде.

Показания к применению:

Артериальная гипертензия (в т.ч. реноваскулярная), хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии).

Относится к болезням:

- Гипертензия

- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

Ангионевротический отек в анамнезе, двусторонний стеноз почечных артерий или стеноз почечной артерии единственной почки, гиперкалиемия, беременность, повышенная чувствительность к эналаприлу и другим ингибиторам АПФ.

Способ применения и дозы:

При приеме внутрь начальная доза - 2.5-5 мг 1 раз/сут. Средняя доза - 10-20 мг/сут в 2 приема.

При в/в введении - по 1.25 мг каждые 6 ч. Для выявления чрезмерной гипотензии пациентам с дефицитом натрия и дегидратацией, обусловленной предшествующей терапией диуретиками, пациентам, получающим диуретики, а также при почечной недостаточности вводят начальную дозу 625 мг. При неадекватном клиническом ответе эту дозу можно повторить через 1 ч и продолжать лечение в дозе 1.25 мг каждые 6 ч.

Максимальная суточная доза при приеме внутрь составляет 80 мг.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, чувство усталости, повышенная утомляемость; очень редко при применении в высоких дозах - расстройства сна, нервозность, депрессия, нарушение равновесия, парестезии, шум в ушах.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия, обморок, сердцебиение, боли в области сердца; очень редко при применении в высоких дозах - приливы.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота; редко - сухость во рту, боли в животе, рвота, диарея, запор, нарушение функции печени, повышение активности печеночных трансаминаз, повышение концентрации билирубина в крови, гепатит, панкреатит; очень редко при применении в высоких дозах - глоссит.

Со стороны системы кроветворения: редко - нейтропения; у пациентов с аутоиммунными заболеваниями - агранулоцитоз.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - нарушения функции почек, протеинурия.

Со стороны дыхательной системы: сухой кашель.

Со стороны репродуктивной системы: очень редко при применении в высоких дозах - импотенция.

Дерматологические реакции: очень редко при применении в высоких дозах - выпадение волос.

Аллергические реакции: редко - кожная сыпь, отек Квинке.

Прочие: редко - гиперкалиемия, мышечные судороги.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан к применению при беременности. При наступившей беременности прием эналаприла следует немедленно прекратить.

Эналаприл выделяется с грудным молоком. При необходимости его применения в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с иммунодепрессантами, цитостатиками повышается риск развития лейкопении.

При одновременном применении калийсберегающих диуретиков (в т.ч. спиронолактона, триамтерена, амилорида), препаратов калия, заменителей соли и БАД к пище, содержащих калий, возможно развитие гиперкалиемии (особенно у пациентов с нарушениями функции почек), т.к. ингибиторы АПФ уменьшают содержание альдостерона, что приводит к задержке калия в организме на фоне ограничения выведения калия или его дополнительного поступления в организм.

При одновременном применении опиоидных анальгетиков и средств для наркоза усиливается антигипертензивное действие эналаприла.

При одновременном применении "петлевых" диуретиков, тиазидных диуретиков усиливается антигипертензивное действие. Имеется риск развития гипокалиемии. Повышение риска нарушения функции почек.

При одновременном применении с азатиоприном возможно развитие анемии, что обусловлено угнетением активности эритропоэтина под влиянием ингибиторов АПФ и азатиоприна.

Описан случай развития анафилактической реакции и инфаркта миокарда при применении аллопуринола у пациента, получающего эналаприл.

Ацетилсалициловая кислота в высоких дозах может уменьшать антигипертензивное действие эналаприла.

Окончательно не установлено, уменьшает ли ацетилсалициловая кислота терапевтическую эффективность ингибиторов АПФ у пациентов с ИБС и сердечной недостаточностью. Характер этого взаимодействия зависит от течения заболевания.

Ацетилсалициловая кислота, ингибируя ЦОГ и синтез простагландинов, может вызывать вазоконстрикцию, что приводит к уменьшению сердечного выброса и ухудшению состояния пациентов с сердечной недостаточностью, получающих ингибиторы АПФ.

При одновременном применении бета-адреноблокаторов, метилдопы, нитратов, блокаторов кальциевых каналов, гидралазина, празозина возможно усиление антигипертензивного действия.

При одновременном применении с НПВС (в т.ч. с индометацином) уменьшается антигипертензивное действие эналаприла, по-видимому, вследствие ингибирования под влиянием НПВС синтеза простагландинов (которые, как полагают, играют определенную роль в развитии гипотензивного эффекта ингибиторов АПФ). Повышается риск развития нарушений функции почек; редко наблюдается гиперкалиемия.

При одновременном применении инсулина, гипогликемических средств производных сульфонилмочевины возможно развитие гипогликемии.

При одновременном применении ингибиторов АПФ и интерлейкина-3 существует риск развития артериальной гипотензии.

При одновременном применении с клозапином имеются сообщения о развитии синкопе.

При одновременном применении с кломипрамином сообщается об усилении действия кломипрамина и развитии токсических эффектов.

При одновременном применении с ко-тримоксазолом описаны случаи развития гиперкалиемии.

При одновременном применении с лития карбонатом увеличивается концентрация лития в сыворотке крови, которая сопровождается симптомами интоксикации литием.

При одновременном применении с орлистатом уменьшается антигипертензивное действие эналаприла, что может привести к значительному повышению АД, развитию гипертонического криза.

Полагают, что при одновременном применении с прокаинамидом возможно повышение риска развития лейкопении.

При одновременном применении с эналаприлом уменьшается действие препаратов, содержащих теофиллин.

Имеются сообщения о развитии острой почечной недостаточности у пациентов после пересадки почки при одновременном применении с циклоспорином.

При одновременном применении с циметидином увеличивается $T_{1/2}$ эналаприла и повышается его концентрация в плазме крови.

Полагают, что возможно уменьшение эффективности антигипертензивных средств при одновременном применении с эритропоэтинами.

При одновременном применении с этанолом увеличивается риск развития артериальной гипотензии.

Особые указания и меры предосторожности:

С особой осторожностью применяют у пациентов с аутоиммунными заболеваниями, сахарным диабетом, нарушениями функции печени, тяжелой формой стеноза аорты, субаортальным мышечным стенозом неясного генеза, гипертрофической кардиомиопатией, при потере жидкости и солей. В случае предшествующего лечения салуретиками, в частности у пациентов с хронической сердечной недостаточностью, повышается риск развития

ортостатической гипотензии, поэтому перед началом лечения эналаприлом необходимо компенсировать потерю жидкости и солей.

При длительном лечении эналаприлом необходимо периодически контролировать картину периферической крови. Внезапное прекращение приема эналаприла не вызывает резкого повышения АД.

При хирургических вмешательствах в период лечения эналаприлом возможно развитие артериальной гипотензии, которую следует корригировать введением достаточного количества жидкости.

Перед исследованием функции паращитовидных желез эналаприл следует отменить.

Безопасность и эффективность применения эналаприла у детей не установлены.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Необходима осторожность при управлении транспортными средствами или выполнении другой работы, требующей повышенного внимания, т.к. возможно головокружение, особенно после приема начальной дозы эналаприла.

При нарушениях функции печени

С особой осторожностью применяют у пациентов с нарушениями функции печени.

Применение в детском возрасте

Безопасность и эффективность применения эналаприла у детей не установлены.

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