Фелодипин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Фелодипин

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный блокатор кальциевых каналов II класса из группы производных дигидропиридина. Подобно другим производным дигидропиридина, фелодипин обладает значительно более высоким сродством к кальциевым каналам гладкомышечных клеток артериальных сосудов, чем к кальциевым каналам кардиомиоцитов. Блокируя кальциевые каналы и нарушая поступление ионов кальция в гладкомышечные клетки артериальных сосудов, вызывает их расширение, уменьшает ОПСС и понижает АД. Уменьшает постнагрузку на сердце.

Практически не оказывает угнетающего действия на сократимость и проводимость миокарда, вызывает умеренно выраженную рефлекторную тахикардию. Увеличивает коронарный кровоток.

Уменьшает поступление внеклеточного кальция в кардиомиоциты и гладкомышечные клетки коронарных и периферических артерий; в высоких дозах снижает высвобождение ионов кальция из внутриклеточных депо. Уменьшает количество функционирующих каналов, не оказывая влияния на время их активации, инактивации и восстановления. Разобщает процессы возбуждения и сокращения в миокарде, опосредуемые тропомиозином и тропонином, и в гладких мышцах сосудов, опосредуемые кальмодулином.

В терапевтических дозах нормализует трансмембранный ток кальция, нарушенный при ряде патологических состояний, прежде всего при артериальной гипертензии. Снижает АД за счет вазодилатации, уменьшения ОПСС. Не влияет на тонус вен и адренергическую вазомоторную иннервацию, поэтому не вызывает ортостатическую гипотензию.

Обладает дозозависимым антиишемическим эффектом. Усиливает коронарный кровоток, улучшает кровоснабжение ишемизированных зон миокарда без развития феномена "обкрадывания", активирует функционирование коллатералей, защищает от осложнений реперфузии, незначительно увеличивает ЧСС. Расширяя периферические артерии, снижает постнагрузку.

Почти не влияет на синоатриальный и AV узлы. Практически не обладает отрицательным инотропным эффектом (рефлекторное увеличение ЧСС в ответ на расширение сосудов маскирует отрицательный инотропный эффект).

Усиливает почечный кровоток, оказывает умеренное натрийуретическое и диуретическое действие.

Действие начинается через 2-5 ч и продолжается в течение 24 ч. Выраженность эффекта коррелирует с дозой и концентрацией в плазме.

Фармакокинетика

После приема внутрь фелодипин почти полностью абсорбируется из ЖКТ и подвергается интенсивному метаболизму при "первом прохождении" через печень. Связывание с белками плазмы (в основном с альбуминами) составляет около 99%. В небольших количествах проникает через ГЭБ и плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком. Фелодипин интенсивно метаболизируется в печени, все известные его метаболиты не обладают фармакологической активностью. Метаболизм происходит при участии изоферментов CYP3A4, CYP3A5, CYP3A7.

Около 70% выводится почками в виде метаболитов и менее 0.5% в неизмененном виде; остальная часть выводится через кишечник. $T_{1/2}$ в α-фазе составляет около 4 ч, в β-фазе - около 24 ч.

У больных пожилого возраста, а также у пациентов с нарушениями функции печени концентрация фелодипина в крови выше, чем у пациентов более молодого возраста.

Не кумулирует даже при длительном применении; при хронической почечной недостаточности наблюдается кумуляция неактивных метаболитов.

Показания к применению:

Артериальная гипертензия, стенокардия (при неэффективности бета-адреноблокаторов и нитратов), синдром Рейно (в качестве симптоматической терапии).

Относится к болезням:

- Гипертензия
- Стенокардия

Противопоказания:

Острый инфаркт миокарда, декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность, возраст до 18 лет, беременность, женщины детородного возраста с высокой вероятностью беременности, повышенная чувствительность к фелодипину.

Способ применения и дозы:

Применяют внутрь преимущественно в виде лекарственных форм, обеспечивающих постоянное высвобождение активного вещества - по 5-10 мг 1 раз/сут, при необходимости - 20 мг 1 раз/сут.

Максимальная суточная доза составляет 20 мг.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: приливы крови к коже лица, сопровождающиеся гиперемией лица, тахикардия, отечность в области голеностопного сустава (как следствие прекапиллярной вазодилатации), обморок, экстрасистолия, выраженная артериальная гипотензия, сопровождающаяся рефлекторной тахикардией и ухудшением течения стенокардии, лейкоцитокластический васкулит.

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение, чувство усталости, парестезия.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, боли в животе, рвота, повышение активности печеночных

трансаминаз, гиперплазия десен, слизистой оболочки языка, гингивит.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - артралгия, миалгия.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек губ или языка, реакция фотосенсибилизации.

Прочие: импотенция/сексуальная дисфункция, частое мочеиспускание, лихорадка, гипергликемия.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан к применению при беременности (в т.ч. возможной).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с ингибиторами микросомальных ферментов печени возможно повышение концентрации фелодипина в плазме крови.

Возможно уменьшение концентрации фелодипина в плазме крови вследствие повышения интенсивности его метаболизма в печени под влиянием карбамазепина, фенитоина и фенобарбитала (которые являются индукторами микросомальных ферментов печени) и ускорение выведения из организма.

При одновременном применении с дигоксином возможно повышение концентрации дигоксина в плазме крови.

При одновременном применении с итраконазолом, кетоконазолом замедляется метаболизм фелодипина в печени, что приводит к увеличению концентрации фелодипина в плазме крови и повышению риска развития побочных эффектов.

При одновременном применении с эритромицином повышается биодоступность фелодипина. Имеется сообщение об усилении терапевтического и побочного действия фелодипина у пациента, получающего эритромицин.

Повышает биодоступность пропранолола. При одновременном применении с бета-адреноблокаторами повышается риск развития хронической сердечной недостаточности).

Уменьшение антигипертензивного действия наблюдается при одновременном применении фелодипина с НПВС, ГКС (задержка натрия и блокада синтеза простагландина почками) и эстрогены (задержка натрия), препараты кальция; усиление антигипертензивного действия происходит при одновременном применении с ингаляционными средствами для наркоза, бета-адреноблокаторами, альфа-адреноблокаторами, симпатомиметиками и другими гипотензивными препаратами.

Препараты, вызывающие увеличение продолжительности интервала QT, усиливают отрицательный инотропный эффект и могут повышать риск значительного удлинения интервала QT.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять у пациентов с сердечной недостаточностью, лабильностью АД, при почечной недостаточности, сердечной недостаточности после инфаркта миокарда.

При применении у пациентов со стенокардией следует учитывать, что в редких случаях фелодипин может вызвать выраженную артериальную гипотензию, которая приводит к ишемии миокарда.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применять у пациентов при почечной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в возрасте до 18 лет.

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