Фелотенз ретард



Код АТХ:

- C08CA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Фелодипин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой, 2,5 мг, 5 мг и 10 мг. По 10, 15 или 30 табл. в контурной ячейковой упаковке из пленки ПВХ и фольги алюминиевой печатной лакированной. По 1, 2, 3, 6 контурных ячейковых упаковок по 10 табл. или по 1, 2, 4 контурных ячейковых упаковки по 15 табл. или по 1, 2 контурных ячейковых упаковки по 30 табл. помещают в пачку из картона.

Состав:

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой	1 табл.
активное вещество:	
фелодипин	2,5 мг
вспомогательные вещества: гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) — 52 мг; кальция гидрофосфата дигидрат — 19 мг; кремния диоксид коллоидный — 1 мг; лактозы моногидрат — 34,8 мг; магния стеарат — 0,7 мг; натрия алгинат — 5 мг; повидон К30 — 5 мг	
оболочка пленочная: Opadry II желтый (поливиниловый спирт — 1,6 мг, макрогол (полиэтиленгликоль) — 0,8 мг, тальк — 0,6 мг, титана диоксид — 0,94 мг, краситель железа оксид желтый — 0,06 мг) — 4 мг	
Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой	1 табл.

активное вещество:	
фелодипин	5 мг
вспомогательные вещества: гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) — 70 мг; кальция гидрофосфата дигидрат — 21 мг; кремния диоксид коллоидный — 1,5 мг; лактозы моногидрат — 72 мг; магния стеарат — 1 мг; натрия альгинат — 2 мг; повидон К30 — 7,5 мг	
оболочка пленочная: Opadry II желтый (поливиниловый спирт — 2,4 мг, макрогол (полиэтиленгликоль) — 1,21 мг; тальк — 0,89 мг, титана диоксид — 1,41 мг, краситель железа оксид желтый — 0,09 мг) — 6 мг	
Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой	1 табл.
активное вещество:	
фелодипин	10 мг
вспомогательные вещества: гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) — 90 мг; кальция гидрофосфата дигидрат — 27 мг; кремния диоксид коллоидный — 2,2 мг; лактозы моногидрат — 126,8 мг; магния стеарат — 1,5 мг; натрия альгинат — 2,5 мг; повидон К30 — 10 мг	
оболочка пленочная: Opadry II желтый (в т.ч. поливиниловый спирт — 3,6 мг, макрогол (полиэтиленгликоль) — 1,818 мг, тальк — 1,332 мг, титана диоксид — 2,115 мг, краситель железа оксид желтый — 0,135 мг) — 9 мг	

Описание:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, от светло-желтого до желтого цвета, круглые, двояковыпуклые.

На изломе видны два слоя: оболочка — от светло-желтого до желтого цвета, ядро — белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — антигипертензивное.

Фармакодинамика

Фелодипин относится к БКК дигидропиридинового ряда. Оказывает антигипертензивное, антиангинальное действие. Снижает АД за счет снижения ОПСС, особенно в артериолах. Обладает дозозависимым антиишемическим эффектом. Уменьшает размеры инфаркта миокарда, защищает от осложнений реперфузии. Проводимость и сократительная способность гладкой мускулатуры сосудов подавляется путем воздействия на кальциевые каналы клеточных мембран. Благодаря высокой селективности в отношении гладкой мускулатуры артериол, фелодипин в терапевтических дозах не оказывает отрицательный инотропный эффект на проводящую систему сердца. Фелодипин расслабляет гладкую мускулатуру дыхательных путей, также оказывает незначительное воздействие на моторику ЖКТ. При длительном применении фелодипин не оказывает клинически значимый эффект на концентрацию липидов крови. У пациентов с сахарным диабетом типа 2 при применении фелодипина в течение 6 мес не отмечен клинически значимый эффект на метаболические процессы. Фелодипин также можно назначать пациентам со сниженной функцией левого желудочка, получающим стандартную терапию, пациентам с бронхиальной астмой, сахарным диабетом, подагрой или гипергликемией.

Антигипертензивный эффект фелодипина обусловлен снижением ОПСС. Фелодипин эффективно снижает АД у пациентов с артериальной гипертензией как в положении лежа, так и в положении сидя и стоя, в состоянии покоя и при физической нагрузке. Поскольку фелодипин не оказывает эффект на гладкую мускулатуру вен или

адренергический вазомоторный контроль, то развитие ортостатической гипотензии не происходит. В начале лечения, в результате снижения АД на фоне приема фелодипина, может наблюдаться временное рефлекторное увеличение ЧСС и сердечного выброса. Увеличению ЧСС препятствует одновременное с фелодипином применение β-адреноблокаторов. Действие фелодипина на АД и ОПСС коррелирует с плазменной концентрацией фелодипина. При равновесном состоянии клинический эффект сохраняется между приемом доз и снижением АД в течение 24 ч.

Лечение фелодипином приводит к регрессии гипертрофии миокарда левого желудочка. Фелодипин обладает натрийуретическим и диуретическим эффектами и не обладает калийуретическим эффектом. При приеме фелодипина снижается канальцевая реабсорбция натрия и воды, что объясняет отсутствие задержки солей и жидкости в организме. Фелодипин снижает сосудистое сопротивление в почках и усиливает перфузию почек. Фелодипин не оказывает влияние на скорость клубочковой фильтрации и экскреции альбумина. Для лечения артериальной гипертензии фелодипин может применяться в монотерапии или в комбинации с другими гипотензивными препаратами, такими как β-адреноблокаторы, диуретики или ингибиторы АПФ.

Антиишемический эффект фелодипина обусловлен улучшением кровоснабжения миокарда за счет дилатации коронарных сосудов. Уменьшение нагрузки на сердце обеспечивается за счет снижения ОПСС (снижение нагрузки, преодолеваемой сердечной мышцей), что приводит к снижению потребности миокарда в кислороде. Фелодипин снимает спазм коронарных сосудов.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Замедленное высвобождение фелодипина из таблеток, покрытых оболочкой, приводит к удлинению фазы всасывания препарата и обеспечивает равномерную концентрацию фелодипина в плазме крови в течение 24 ч.

Фелодипин почти полностью всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается через 3-5 ч. Системная биодоступность фелодипина составляет приблизительно 15% и не зависит от приема пищи. Однако скорость абсорбции, но не ее степень, может меняться в зависимости от приема пищи, C_{max} в плазме крови, таким образом, повышается примерно на 65%.

Фелодипин связывается с белками плазмы крови на 99%, прежде всего с альбуминами. V_d в равновесном состоянии составляет 10 л/кг. Проникает через ГЭБ и выделяется с грудным молоком. Не кумулирует даже при длительном применении.

Метаболизм и выведение

Фелодипин полностью метаболизируется в печени, все метаболиты неактивны.

$T_{1/2}$ фелодипина составляет 25 ч, фаза плато достигается примерно в течение 5 дней. Около 70% принятой дозы выводится почками, остальная часть выводится через кишечник в форме метаболитов. В неизмененном виде почками выводится менее 0.5% принятой дозы. Общий плазменный клиренс в среднем составляет 1200 мл/мин.

Фармакокинетика у особых групп пациентов

У пациентов пожилого возраста и при нарушениях функции печени концентрация фелодипина в плазме крови повышается.

Фармакокинетические показатели фелодипина не изменяются у пациентов с нарушенной функцией почек, в т.ч. и при проведении гемодиализа.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в качестве монотерапии или комбинации с другими антигипертензивными средствами, такими как бета-адреноблокаторы, диуретики, ингибиторы АПФ);

— стабильная стенокардия (в качестве монотерапии и в комбинации с бета-адреноблокаторами).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Стенокардия

Противопоказания:

— нестабильная стенокардия;

— острый инфаркт миокарда и период в течение одного месяца после перенесенного инфаркта миокарда;

— кардиогенный шок;

— гемодинамически значимый аортальный и митральный стеноз;

— гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия;

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— выраженная артериальная гипотензия;

— дефицит лактазы, непереносимость лактозы, синдром мальабсорбции глюкозы/галактозы;

— беременность;

— период лактации;

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

— повышенная чувствительность к фелодипину и к другим производным дигидропиридина.

С осторожностью следует назначать препарат при нарушении функции печени, почечной недостаточности тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин), аортальном и митральном стенозе, лабильности АД и сердечной недостаточности после инфаркта миокарда, пациентам пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, предпочтительно натощак или с небольшим количеством пищи с низким содержанием жиров и углеводов. Таблетку следует проглатывать целиком (не делить, не дробить и не разжевывать), запивая водой.

Дозу всегда определяют индивидуально.

При *артериальной гипертензии* терапию начинают с дозы 5 мг 1 раз/сут. В случае необходимости дозу можно увеличить. Поддерживающая доза составляет 5-10 мг 1 раз/сут. Для определения индивидуальной дозы лучше всего применять таблетки с содержанием фелодипина 2.5 мг.

При *стабильной стенокардии* лечение начинают с дозы 5 мг 1 раз/сут, в случае необходимости можно увеличить дозу до 10 мг 1 раз/сут.

У **пациентов пожилого возраста** или **пациентов с нарушением функции печени** рекомендуемая начальная доза - 2.5 мг 1 раз/сут. Максимальная суточная доза составляет 10 мг.

У **пациентов с нарушением функцией почек** фармакокинетика препарата значимо не меняется, однако необходимо соблюдать осторожность при КК менее 30 мл/мин.

Препарат Фелотенз ретард можно применять в комбинации с бета-адреноблокаторами, ингибиторами АПФ или диуретиками. Комбинированная терапия обычно усиливает антигипертензивное действие препарата. Необходимо остерегаться развития артериальной гипотензии.

Побочное действие:

Также как и при применении других блокаторов медленных кальциевых каналов, препарат может вызвать покраснение лица, головную боль, ощущение сердцебиения, головокружение и повышенную утомляемость. Эти реакции носят обратимый характер и чаще всего проявляются в начале лечения или при увеличении дозы препарата. Также в зависимости от дозы могут появиться периферические отеки, которые являются следствием прекапиллярной вазодилатации. У пациентов с воспалением десен или периодонтитом может возникнуть легкий отек десен. Этому можно воспрепятствовать соблюдением тщательной гигиены полости рта.

Классификация ВОЗ (Всемирной организации здравоохранения) частоты развития побочных эффектов: часто - от ≥1/100 до <1/10 назначений (>1% и <10%); нечасто - от ≥1/1000 до <1/100 назначений (>0.1% и <1%); редко - от ≥1/10000 до <1/1000 назначений (>0.01% и <0.1%); очень редко - <1/10000 назначений (<0.01%).

Со стороны нервной системы: часто - головная боль; нечасто - парестезии, головокружение; редко - обморок.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - "приливы" крови к коже лица, сопровождающиеся гиперемией лица, отек лодыжек; нечасто - тахикардия, ощущение сердцебиения, чрезмерное снижение АД, сопровождающееся рефлекторной тахикардией и ухудшением течения стенокардии; очень редко - экстрасистолия, лейкоцитокластический васкулит.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - тошнота, абдоминальная боль; редко - рвота; очень редко - повышение активности печеночных трансаминаз, гиперплазия десен, слизистой оболочки языка, гингивит.

Со стороны мочевыделительной системы: очень редко - частое мочеиспускание.

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

Аллергические реакции: нечасто - кожная сыпь, зуд; редко - крапивница; очень редко - ангионевротический отек губ или языка, реакция фотосенсибилизации.

Прочие: нечасто - повышенная утомляемость; редко - импотенция/сексуальная дисфункция; очень редко - лихорадка, гипергликемия.

Причинно-следственная связь не установлена: боль в груди, отек лица, гриппоподобный синдром, чрезмерное снижение АД, инфаркт миокарда, обморок, стенокардия, аритмия, экстрасистолия, диарея, сухость слизистой оболочки полости рта, метеоризм, гинекомастия, анемия, артралгия, боль в спине, миалгия, боль в верхних и нижних конечностях, депрессия, бессонница, тревожность, нервозность, сонливость, раздражительность, фарингит, одышка, бронхит, грипп, синусит, носовое кровотечение, эритема, кровоподтеки, лейкоцитокластический васкулит, нарушение зрения, полиурия, дизурия.

Передозировка:

Симптомы: при передозировке симптомы интоксикации проявляются через 12-16 ч после приема препарата, иногда симптомы могут возникать и через несколько дней после приема препарата. Могут отмечаться чрезмерное снижение АД, брадикардия, AV-блокада I-III степени, желудочковая экстрасистолия, предсердно-желудочковая диссоциация, асистолия, фибрилляция желудочков; головная боль, головокружение, нарушение сознания (или кома), судороги; одышка, отек легких (несердечный) и апноэ; у взрослых возможно развитие респираторного дистресс-синдрома; ацидоз, гипокалиемия, гипергликемия, гипокальциемия; покраснение лица, гипотермия; тошнота, рвота.

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля, в ряде случаев эффективно даже на поздней стадии интоксикации. Специфический антидот - препараты кальция. При выраженном снижении АД пациенту следует придать горизонтальное положение с низким изголовьем. При развитии брадикардии показано в/в введение атропина в дозе 0.25-0.5 мг (до промывания желудка, в связи с риском стимуляции блуждающего нерва), контроль ЭКГ. При необходимости обеспечить проходимость дыхательных путей и адекватную вентиляцию легких. Показана коррекция кислотно-основного состояния и электролитов сыворотки крови. В случае брадикардии и AV-блокады назначают атропин 0.5-1.0 мг в/в, при необходимости повторяют введение, или первоначально вводят изопреналин 0.05-0.1 мкг/кг/мин. При острой интоксикации на ранней стадии может понадобиться установка искусственного водителя ритма. Снижение АД корректируют в/в введением жидкости (раствор декстрозы, 0.9% раствор натрия хлорида, декстрана), взрослым в/в вводят раствор кальция глюконата 20-30 мл в течение 5 мин, при необходимости повторяют введение в той же дозе. При необходимости инфузионно вводят норэпинефрин (адреналин) или допамин. При острой интоксикации можно назначать глюкагон. При судорогах назначают диазепам.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат Фелотенз ретард противопоказан при беременности и в период грудного вскармливания.

В настоящее время нет данных о применении фелодипина у беременных. Основываясь на данных о нарушении развития плода, полученных при проведении исследований у животных, фелодипин не следует назначать при беременности. Блокаторы медленных кальциевых каналов могут ингибировать сокращение матки при преждевременных родах, вместе с тем недостаточно данных, подтверждающих увеличение продолжительности физиологических родов. Возможен риск развития гипоксии плода при наличии у матери артериальной гипотензии и уменьшении перфузии в матке за счет перераспределения кровотока и периферической вазодилатации.

Фелодипин выделяется с грудным молоком. При применении кормящей матерью препарата в терапевтических дозах лишь незначительное количество фелодипина выделяется с грудным молоком. Недостаточный опыт применения фелодипина у женщин в период лактации не исключает риск воздействия препарата на детей, находящихся на грудном вскармливании. При необходимости продолжения терапии препаратом Фелотенз ретард для достижения клинического эффекта грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Фелодипин повышает концентрацию дигоксина в плазме крови, однако коррекция дозы фелодипина не требуется.

Ингибиторы изофермента CYP3A4 (циметидин, эритромицин, итраконазол, кетоконазол) замедляют метаболизм фелодипина в печени, повышая концентрацию препарата в плазме крови.

Индукторы изофермента CYP3A4 (фенитоин, карбамазепин, рифампицин, барбитураты, фенобарбитал, препараты зверобоя продырявленного) снижают AUC фелодипина на 93% и C_{max} на 82%. Следует избегать совместного назначения.

НПВП не ослабляют антигипертензивный эффект фелодипина.

Высокая степень связывания фелодипина с белками не влияет на связывание свободной фракции варфарина.

Бета-адреноблокаторы, верапамил, трициклические антидепрессанты и диуретики усиливают антигипертензивный эффект фелодипина.

При одновременном применении с противомикробными препаратами азолового ряда (кетоконазол, итраконазол) AUC фелодипина повышается в 8 раз, C_{max} - в 6 раз.

При совместном назначении с антибиотиками из группы макролидов (эритромицин) AUC и C_{max} фелодипина повышается в 2.5 раза.

Ингибиторы протеазы ВИЧ также увеличивают концентрацию фелодипина в крови.

Грейпфрутовый сок повышает AUC и C_{max} фелодипина в 2 раза, поэтому фелодипин не следует применять, одновременно с грейпфрутовым соком.

Фелодипин повышает концентрацию такролимуса в плазме крови при совместном применении (рекомендуется контроль концентрации такролимуса в плазме крови и возможная коррекция дозы).

Циклоспорин повышает C_{max} фелодипина на 150%, AUC на 60% (воздействие фелодипина на фармакокинетические параметры циклоспорина минимально).

Циметидин повышает C_{max} и AUC фелодипина на 55%.

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат Фелотенз ретард следует назначать с осторожностью пациентам со склонностью к тахикардии и тяжелой дисфункцией левого желудочка. Также как и другие вазодилататоры, в редких случаях фелодипин может вызывать значимую артериальную гипотензию, которая у ряда предрасположенных пациентов может приводить к развитию ишемии миокарда. В настоящее время нет данных о целесообразности применения препарата в качестве вторичной профилактики инфаркта миокарда.

Фелодипин эффективен и хорошо переносится пациентами независимо от пола и возраста, а также пациентами с сопутствующими заболеваниями, такими как бронхиальная астма и другие заболевания легких, нарушение функции почек, сахарный диабет, подагра, гиперлипидемия, синдром Рейно, а также после трансплантации легких.

Препарат Фелотенз ретард не оказывает влияния на концентрацию глюкозы в крови и липидный профиль. Гипергликемия отмечается только в отдельных случаях.

Нарушение функции почек не влияет на концентрацию препарата в плазме крови, поэтому коррекция дозы у пациентов с нарушенной функцией почек не требуется. Однако при назначении препарата пациентам с почечной недостаточностью необходимо соблюдать осторожность.

Необходимо соблюдать тщательную гигиену полости рта в связи с возможным развитием гиперплазии десен и гингивита.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентам, у которых во время лечения препаратом Фелотенз ретард наблюдается слабость, головокружение, следует отказаться от управления автотранспортом и работы, требующей повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения:

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

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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