Инхибейс



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой бледно-желтого цвета, овальные, двояковыпуклые; с гравировкой "CIL 1" с одной стороны таблетки и риской — с другой стороны.

	1 таб.
цилазаприл	1 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, гидроксипропилметилцеллюлоза, тальк, натрия стеарилфумарат, титана диоксид (Е171), оксид железа красный (Е172), железа оксид желтый (Е172).

7 шт. - блистеры (4) - пачки.
7 шт. - блистеры (14) - пачки.
10 шт. - блистеры (3) - пачки.
15 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.
30 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.
50 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.
100 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.

Таблетки, покрытые оболочкой блекло-красного цвета, овальные, двояковыпуклые; с гравировкой "CIL 2.5" с одной стороны таблетки и риской — с другой стороны.

	1 таб.
цилазаприл	2.5 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, гидроксипропилметилцеллюлоза, тальк, натрия стеарилфумарат, титана диоксид (Е171), оксид железа красный (Е172), железа оксид желтый (Е172).

7 шт. - блистеры (4) - пачки.
7 шт. - блистеры (14) - пачки.
10 шт. - блистеры (3) - пачки.
15 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.
30 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.
50 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.
100 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.

Таблетки, покрытые оболочкой от красновато-коричневого до коричневого цвета, овальные, двояковыпуклые; с гравировкой "CIL 5" с одной стороны таблетки и риской — с другой стороны.

	1 таб.
цилазаприл	5 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, гидроксипропилметилцеллюлоза, тальк, натрия стеарилфумарат, титана диоксид (Е171), оксид железа красный (Е172), железа оксид желтый (Е172).

7 шт. - блистеры (4) - пачки.
7 шт. - блистеры (14) - пачки.
10 шт. - блистеры (3) - пачки.
15 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.

30 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.
50 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.
100 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ингибитор АПФ длительного действия. Подавляет ренин-ангиотензин-альдостероновую систему и, тем самым, превращение неактивного ангиотензина I в ангиотензин II , который обладает сильным сосудосуживающим действием. В рекомендуемых дозах эффект Инхибейса у пациентов с артериальной гипертензией и у больных хронической сердечной недостаточностью сохраняется в течение 24 ч.

У пациентов с нормальной функцией почек во время лечения Инхибейсом концентрация калия в сыворотке крови обычно остается в пределах нормы. У больных, одновременно принимающих калийсберегающие диуретики, возможно повышение уровня калия.

Артериальная гипертензия

Инхибейс снижает систолическое и диастолическое АД как в вертикальном, так и в горизонтальном положении, обычно без ортостатических реакций. Препарат эффективен на всех стадиях артериальной гипертензии, а также при почечной гипертензии. Антигипертензивный эффект Инхибейса обычно проявляется в течение первого часа после приема внутрь и достигает максимума через 3-7 ч. Рефлекторной тахикардии не возникает, хотя могут наблюдаться небольшие изменения частоты сердечных сокращений, не имеющие клинического значения. У некоторых пациентов снижение АД может уменьшаться к моменту следующего приема препарата.

При длительном лечении антигипертензивное действие Инхибейса сохраняется. После внезапной отмены препарата быстрого повышения АД не происходит.

У больных с артериальной гипертензией, имеющих умеренную или тяжелую почечную недостаточность, скорость клубочковой фильтрации и почечный кровоток при лечении Инхибейсом, как правило, не меняются, несмотря на клинически значимое снижение артериального давления.

Как и в случае других ингибиторов АПФ, антигипертензивное действие Инхибейса у больных негроидной расы может быть менее выражено, чем у больных других рас. Если, однако, Инхибейс применяется в комбинации с гидрохлоротиазидом, различий в действии препарата у больных разных рас не наблюдается.

Хроническая сердечная недостаточность

При хронической сердечной недостаточности активность ренин-ангиотензин-альдостероновой системы, а также симпатической нервной системы обычно повышена, что приводит к увеличению системной вазоконстрикции и к усилению задержки натрия и воды в организме. У пациентов, получающих диуретики и/или препараты наперстянки, Инхибейс, подавляя ренин-ангиотензин-альдостероновую систему, уменьшает нагрузку на сердце, снижая системное сосудистое сопротивление (постнагрузку) и давление в легочных капиллярах (преднагрузку). Кроме того, у этих больных значительно улучшается переносимость физической нагрузки, что повышает качество их жизни. Гемодинамические и клинические эффекты достигаются быстро и сохраняются в течение длительного времени.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь цилазаприл хорошо всасывается и быстро превращается в активную форму - цилазаприлат. Прием пищи непосредственно перед приемом препарата несколько задерживает и уменьшает всасывание, что не имеет терапевтического значения. После приема внутрь цилазаприла биодоступность цилазаприлата составляет около 60%, судя по результатам определения его в моче. C_{max} в плазме крови достигаются в течение 2 ч после приема и прямо пропорциональны дозе.

Выведение

Цилазаприлат выводится в неизмененном виде почками. $T_{1/2}$ при приеме внутрь 1 раз/сут составляет 9 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов с почечной недостаточностью концентрации цилазаприлата в плазме крови выше, чем у больных с нормальной функцией почек, т.к. клиренс препарата снижается при низком КК. У больных с терминальной стадией почечной недостаточности элиминация отсутствует вообще, однако посредством гемодиализа можно в некоторой степени понизить концентрации как цилазаприла, так и цилазаприлата.

У больных старческого возраста с нормальной для их возраста почечной функцией концентрации цилазаприлата в плазме крови могут быть на 40% выше, а клиренс - на 20% ниже, чем у молодых. Аналогичные изменения фармакокинетики наблюдаются у больных с умеренным или тяжелым циррозом печени.

У больных с хронической сердечной недостаточностью клиренс цилазаприлата коррелирует с КК. Поэтому какой-либо дополнительной коррекции дозы, помимо той, которая рекомендуется для пациентов с нарушениями функции почек, не требуется.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в т.ч. реноваскулярная);

— в качестве вспомогательного средства при хронической сердечной недостаточности (в комбинации с сердечными гликозидами и/или диуретиками).

Относится к болезням:

- Гипертензия
- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

— ангионевротический отек в анамнезе (в т.ч. наследственный, идиопатический, а также ангионевротический отек, вызванный применением других ингибиторов АПФ);

— двусторонний стеноз почечных артерий или стеноз артерии единственной почки;

— гиперкалиемия;

— порфирия;

— беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— гемодиализ через высокопроизводительные мембраны из полиакрилонитритметаллилсульфата (например, AN69), гемофильтрация или ЛПНП-аферез;

— повышенная чувствительность к цилазаприлу или другим ингибиторам АПФ.

С *осторожностью* следует применять препарат при хронической почечной недостаточности (протеинурия более 1 г/сут), при тяжелой недостаточности кровообращения, тяжелых аутоиммунных заболеваниях (в т.ч. системная красная волчанка, склеродермия), при артериальной гипотензии, митральном стенозе, стенозе устья аорты, при ИБС, угнетении костномозгового кроветворения, состоянии после трансплантации почек, у пациентов, находящихся на гемодиализе, при сахарном диабете, подагре, гиперурикемии, на фоне диеты с ограничением соли, при циррозе печени, состояниях, сопровождающихся снижением ОЦК (в т.ч. диарея, рвота), при обструктивных заболеваниях легких, у детей и подростков в возрасте до 18 лет (безопасность и эффективность применения не изучены).

Способ применения и дозы:

Инхибейс следует принимать в 1 раз/сут. Поскольку прием пищи не оказывает клинически значимого влияния на всасывание, препарат можно принимать до или после еды, всегда примерно в одно и то же время суток.

При артериальной гипертензии рекомендуемая начальная доза составляет 1-1.25 мг 1 раз/сут. Дозу следует подбирать индивидуально в зависимости от динамики АД. Стандартный диапазон доз Инхибейса - от 2.5 до 5 мг 1 раз/ сут. Если при дозе 5 мг 1 раз/сут АД снижается недостаточно, для усиления гипотензивного эффекта одновременно можно назначить калийвыводящий диуретик в малой дозе.

При реноваскулярной гипертензии лечение Инхибейсом следует начинать с дозы 500 мкг или менее 1 раз/сут, поскольку у этих больных ингибиторы АПФ могут вызывать более выраженное снижение АД, чем у больных артериальной гипертензией другого генеза. Поддерживающую дозу подбирают индивидуально.

Больные с артериальной гипертензией, получающие диуретики: чтобы снизить вероятность возникновения симптоматической гипотензии, диуретик следует отменить за 2-3 дня до начала лечения Инхибейсом. При необходимости его прием можно потом возобновить. Рекомендуемая начальная доза для этих больных составляет 500 мкг 1 раз/сут.

Хроническая сердечная недостаточность: лечение Инхибейсом следует начинать с дозы 500 мкг 1 раз/сут под тщательным врачебным наблюдением. В зависимости от переносимости препарата и клинического состояния дозу

повышают до наименьшей поддерживающей дозы в 1 мг в сутки. Дальнейший подбор дозы в пределах обычной поддерживающей дозы 1-2.5 мг/сут производится на основании реакции больного на лечение, его клинического состояния и переносимости препарата. Максимальная доза составляет 5 мг 1 раз/сут.

Результаты клинических исследований показали, что клиренс цилазаприлата у больных с хронической сердечной недостаточностью коррелирует с КК. Поэтому *при лечении больных с хронической сердечной недостаточностью* и **нарушением функции почек** следует корректировать режим дозирования в соответствии с приведенными ниже рекомендациями.

Пациентам с почечной недостаточностью может потребоваться снижение дозы в зависимости от КК. Рекомендуемый режим дозирования приведен в таблице.

Клиренс креатинина	Начальная доза	Максимальная доза
> 40 мл/мин	1 мг 1 раз/сут	5 мг 1 раз/сут
10-40 мл/мин	500 мкг 1 раз/сут	2.5 мг 1 раз/сут
< 10 мл/мин	250-500 мкг 1-2 раза/нед., в зависимости от динамики АД	

Если в исключительных случаях пациентам с циррозом печени требуется лечение цилазаприлом, то препарат следует назначать с осторожностью в начальной дозе 250-500 мкг 1 раз/сут, поскольку может развиться выраженная артериальная гипотензия.

При артериальной гипертензии **для пациентов старческого возраста** начальная доза Инхибейса составляет от 0.5-1.25 мг/сут. Поддерживающую дозу подбирают индивидуально в зависимости от переносимости препарата, реакции больного на лечение и его клинического состояния.

При хронической сердечной недостаточности пациентам старческого возраста, принимающим диуретики в высоких дозах, при назначении препарата следует строго придерживаться рекомендуемой начальной дозы 500 мкг.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: наиболее часто - головная боль и головокружение.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: менее 2% - слабость, артериальная гипотензия. При лечении ингибиторами АПФ имеются отдельные сообщения о симптоматической артериальной гипотензии, особенно у пациентов с гипонатриемией и гиповолемией, вызванными рвотой, диареей, предшествующим лечением диуретиками, бессолевой диетой или диализом.

Со стороны пищеварительной системы: менее 2% - диспепсия. Как и при применении других ингибиторов АПФ, при лечении Инхибейсом описаны отдельные случаи панкреатита, иногда с летальным исходом.

Аллергические реакции: как и при лечении другими ингибиторами АПФ, описаны случаи ангионевротического отека, хотя и редкие. При распространении отека на лицо, губы, язык, голосовой аппарат и/или гортань Инхибейс следует отменить и немедленно назначить соответствующее лечение.

Прочие: менее 2% - сыпь и кашель.

Со стороны лабораторных показателей: редко - небольшое, чаще обратимое, увеличение содержания креатинина и мочевины в сыворотке крови (такие изменения происходят в основном у больных со стенозом почечной артерии или с почечной недостаточностью, но иногда - у пациентов с нормальной функцией почек, особенно у тех, которые одновременно получают диуретики).

У больных, у которых функция почек зависит, главным образом, от ренин-ангиотензин-альдостероновой системы, например, при тяжелой недостаточности кровообращения, стенозе почечной артерии и других заболеваниях почек, лечение Инхибейсом, как и другими ингибиторами АПФ, может привести к повышению концентраций азота мочевины крови и креатинина сыворотки. Хотя после отмены Инхибейса и/или диуретиков эти изменения обычно обратимы, описаны случаи тяжелого нарушения функции почек и, редко, острой почечной недостаточности.

Иногда наблюдалось уменьшение уровня гемоглобина, гематокрита и/или лейкоцитов, однако причинная связь этих изменений с приемом Инхибейса не установлена.

В большинстве случаев побочные реакции легкой или умеренной степени тяжести, имеют преходящий характер и не требуют прекращения лечения.

Передозировка:

Симптомы: данных о передозировке препарата у больных очень мало. У здоровых добровольцев, принимавших однократные дозы до 160 мг, нежелательного действия на АД не отмечалось. Наиболее вероятным симптомом является выраженное снижение АД.

Лечение: при выраженном снижении АД – меры, направленные на увеличение ОЦК. По показаниям цилазаприлат можно частично удалить из организма посредством гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований по безопасности применения препарата при беременности не проводилось. Применение других ингибиторов АПФ у беременных было связано со случаями маловодия, гипотензии у новорожденных и/или анурии.

В *экспериментальных исследованиях* на животных ингибиторы АПФ оказывали токсическое действие на плод. Хотя соответствующие данные по Инхибейсу отсутствуют, необходимо информировать беременных о возможном риске для плода.

Неизвестно, выделяется ли цилазаприл с грудным молоком у человека, но поскольку исследования показали его присутствие в молоке крыс, назначать Инхибейс кормящим матерям не следует.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Если Инхибейс применяется в комбинации с другими антигипертензивными средствами, может наблюдаться аддитивное действие, и повышается риск развития артериальной гипотензии.

Инхибейс применялся одновременно с дигоксином, нитратами, фуросемидом, тиазидами, антикоагулянтами кумаринового ряда и блокаторами гистаминовых H_2-рецепторов. При этом увеличения концентрации дигоксина в плазме, а также другого клинически значимого или фармакокинетического взаимодействия не отмечалось.

Комбинированное применение калийсберегающих диуретиков с Инхибейсом может привести к увеличению уровня калия в сыворотке, особенно у больных с почечной недостаточностью.

При одновременном применении с НПВС возможно уменьшение гипотензивного эффекта Инхибейса, как и других ингибиторов АПФ. Этого не наблюдается у больных, получавших Инхибейс до назначения НПВС.

Особые указания и меры предосторожности:

Как и другие ингибиторы АПФ, Инхибейс с осторожностью назначают больным аортальным стенозом.

В случае острой артериальной гипотензии больного следует уложить горизонтально; ему может потребоваться вливание физиологического раствора или препарата, увеличивающего ОЦК. После возмещения ОЦК лечение Инхибейсом можно продолжить. Однако если симптомы не исчезают, следует уменьшить дозу или отменить препарат.

У пациентов с хронической недостаточностью кровообращения, получающих ингибиторы АПФ, возможно значительное снижение АД. Однако, в клинических исследованиях, в которых больные с хронической недостаточностью кровообращения принимали Инхибейс в дозе 500 мкг, симптомы артериальной гипотензии не возникали.

Артериальную гипотензию может вызвать применение ингибиторов АПФ в ходе хирургических вмешательств в сочетании с анестетиками, также обладающими гипотензивным действием. В таких случаях больному может быть показано увеличение ОЦК путем в/в инфузии или - если эта мера не помогает - инфузии ангиотензина II.

При почечной недостаточности, а также при тяжелой сердечной недостаточности необходимо контролировать функцию почек в первые недели терапии.

Одновременное применение калийсберегающих диуретиков может вызывать увеличение уровня калия в сыворотке крови, особенно у больных с почечной недостаточностью. Поэтому если показано одновременное применение этих препаратов, в начале лечения Инхибейсом их дозу следует уменьшить, тщательно контролируя концентрацию калия в сыворотке крови и функцию почек.

Гемодиализ через высокопроизводительные мембраны из полиакрилонитритметаллилсульфата (например, AN 69), гемофильтрация или ЛПНП-аферез могут вызывать у больных, принимающих ингибиторы АПФ, включая цилазаприл, анафилаксию или анафилактоидные реакции, в том числе угрожающий жизни шок. Механизм данного явления точно неизвестен. Поэтому указанных процедур у таких пациентов следует избегать.

Анафилактические реакции могут возникать у больных, проходящих гипосенсибилизацию с применением осиного

или пчелиного яда и получающих одновременно ингибитор АПФ. Поэтому прием Инхибейса следует прекратить до начала гипосенсибилизации. Кроме того, в данной ситуации Инхибейс нельзя заменять бета-адреноблокаторами.

Применение ингибиторов АПФ у больных сахарным диабетом может потенцировать гипогликемизирующий эффект пероральных гипогликемических препаратов.

Использование в педиатрии

Переносимость и эффективность Инхибейса у детей не установлены, поэтому применять препарат в педиатрии не рекомендуется.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует применять препарат при хронической почечной недостаточности (протеинурия более 1 г/сут), состоянии после трансплантации почек.

У пациентов с почечной недостаточностью концентрации цилазаприлата в плазме крови выше, чем у больных с нормальной функцией почек, т.к. клиренс препарата снижается при низком КК. У больных с терминальной стадией почечной недостаточности элиминация отсутствует вообще, однако посредством гемодиализа можно в некоторой степени понизить концентрации как цилазаприла, так и цилазаприлата.

Протиаопоказано применение препарата при двустороннем стенозе почечных артерий или стенозе артерии единственной почки.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять препарат при циррозе печени.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре до 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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