Изоптин (раствор)



Код АТХ:

- C08DA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Верапамил

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Раствор для в/в введения прозрачный, бесцветный.

	1 амп.
верапамила гидрохлорид	5 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота 36%, вода д/и.

2 мл - ампулы бесцветного стекла (5) - поддоны (1) - пачки картонные.
2 мл - ампулы бесцветного стекла (10) - поддоны (1) - пачки картонные.
2 мл - ампулы бесцветного стекла (50) - поддоны (1) - пачки картонные.
2 мл - ампулы бесцветного стекла (5) - блистеры (1) - пачки картонные.
2 мл - ампулы бесцветного стекла (10) - блистеры (1) - пачки картонные.
2 мл - ампулы бесцветного стекла (50) - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Верапамил блокирует трансмембранное поступление ионов кальция (и возможно ионов натрия) в клетки проводящей системы миокарда и гладкомышечные клетки миокарда и сосудов. Антиаритмическое действие верапамила вероятно связано с его воздействием на медленные каналы в клетках проводящей системы сердца.

Электрическая активность синоатриального и AV-узлов в значительной степени зависит от поступления в клетки кальция по медленным каналам. Ингибируя это поступление кальция, верапамил замедляет атриовентрикулярное проведение и увеличивает эффективный рефрактерный период в AV-узле пропорционально ЧСС. Этот эффект приводит к снижению частоты сокращений желудочков у больных с мерцательной аритмией и/или трепетанием предсердий. Прекращая повторный вход возбуждения в AV-узле, верапамил может восстановить правильный

синусовый ритм у больных с пароксизмальной наджелудочковой тахикардией, включая синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта (WPW). Верапамил не оказывает влияния на проведение по дополнительным проводящим путям.

Верапамил не влияет на неизмененный потенциал действия предсердий и время внутрижелудочкового проведения, но снижает амплитуду, скорость деполяризации и проведения в измененных волокнах предсердий.

Верапамил не вызывает спазма периферических артерий и неизменяет общее содержание кальция в плазме крови. Верапамил снижает постнагрузку и сократимость миокарда. У большинства больных, включая пациентов с органическими поражениями сердца, отрицательное инотропное действие верапамила нивелируется снижением постнагрузки, сердечный индекс обычно не изменяется, но у больных с умеренной и тяжелой сердечной недостаточностью (давление заклинивания в легочной артерии более 20 мм рт.ст., фракция выброса менее 30%), может наблюдаться прогрессирование недостаточности кровообращения. Максимум терапевтического действия отмечается через 3-5 мин после болюсного в/в введения верапамила.

Обычные дозы верапамила 5-10 мг при в/в введении вызывают преходящее обычно бессимптомное снижение нормального АД , системного сосудистого сопротивления и сократимости, давление заполнения левого желудочка незначительно повышается.

Фармакокинетика

Верапамила гидрохлорид при внутривенном введении быстро метаболизируется. Кривая изменения концентрации в крови носит биэкспоненциальный характер с быстрой ранней фазой распределения ($T_{1/2}$ около 4 мин), которая сопровождается более медленной терминальной фазой выведения ($T_{1/2}$ 2-5 ч).

Связь с белками плазмы крови составляет около 90%. Препарат подвергается интенсивному метаболизму с образованием большого количества метаболитов (при приеме препарата внутрь идентифицировано 12, большинство из которых обнаруживаются лишь в следовых концентрациях). Среди метаболитов только норверапамил обладает фармакологическим действием(около 20% по сравнению с исходным соединением).

Верапамила гидрохлорид и его метаболиты выводятся 70% почками (3-5% в неизмененном виде), 25% - с желчью. Не выводится при гемодиализе.

Нарушение функции почек не оказывает влияния на фармакокинетику верапамила гидрохлорида, как показано в сравнительных исследованиях у больных с терминальной почечной недостаточностью и здоровых пациентов.

$T_{1/2}$ увеличивается у больных с нарушением функции печени вследствие снижения метаболизма при первом прохождении и увеличения объема распределения.

Верапамил проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, экскретируется с грудным молоком.

Показания к применению:

Для лечения наджелудочковых тахиаритмий, а именно:

— восстановления синусового ритма при пароксизмальной наджелудочковой тахикардии, включая состояния, связанные с наличием дополнительных проводящих путей (синдромы Вольфа-Паркинсона-Уайта (WPW) и Лоуна-Ганонга-Левина (LGL));

— контроля частоты сокращений желудочков при трепетании и мерцании предсердий (тахиаритмический вариант) за исключением случаев когда трепетание или мерцание предсердий связано с наличием дополнительных проводящих путей (синдромы Вольфа - Паркинсона -Уайта (WPW) и Лоуна-Ганонга-Левина LGL)).

Относится к болезням:

- Пароксизм
- Синусит
- Тахикардия

Противопоказания:

— артериальная гипотензия или кардиогенный шок(за исключением вызванного аритмией);

— AV-блокада II и III степени (исключая больных с искусственным водителем ритма);

— синдром Морганьи-Адамса-Стокса;

— синдром слабости синусового узла(исключая больных с искусственным водителем ритма);

— синоаурикулярная блокада;

— синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта (WPW) и Лоуна-Ганонга- Левина (LGL) в сочетании с трепетанием или фибрилляцией предсердий (кроме больных с кардиостимулятором);

— желудочковая тахикардия с широкими комплексами QRS (> 0.12 сек);

— хроническая сердечная недостаточность IIБ-III стадии (за исключением вызванной наджелудочковой тахикардией, подлежащей лечению верапамилом);

— одновременное применение бета-адреноблокаторов (в/в);

— предварительное (в пределах 48 ч) использование дизопирамида;

— беременность;

— период лактации;

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

— повышенная чувствительность к препарату и его компонентам.

С *осторожностью* препарат следует назначать при AV блокаде I степени, брадикардии, тяжелом стенозе устья аорты, сердечной недостаточности, легкой или умеренной артериальной гипотензии, инфаркте миокарда с левожелудочковой недостаточностью, печеночной и/или почечной недостаточности и у больных пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Только внутривенно!

В/в введение следует проводить медленно на протяжении по крайней мере 2 мин при непрерывном контроле ЭКГ и АД. У пациентов пожилого возраста введение осуществляют на протяжении по крайней мере 3 мин для уменьшения риска нежелательных эффектов.

Начальная доза составляет 5-10 мг (0.075-0.15 мг/кг массы тела). Повторная доза 10 мг (0.15 мг/кг массы тела) вводится через 30 мин после первого введения при неадекватном ответе на первое введение.

Побочное действие:

Большинство из перечисленных ниже побочных эффектов наиболее характерны для таблеток Изоптина.

Со стороны сердечно - сосудистой системы: покраснение лица, выраженная брадикардия, атриовентрикулярная блокада, выраженное снижение АД, появление симптомов сердечной недостаточности при использовании препарата в высоких дозах, особенно у предрасположенных больных; остановка синусового узла, тахикардия, сердцебиение; редко - стенокардия вплоть до развития инфаркта миокарда (особенно у больных с тяжелым обструктивным поражением коронарных артерий), аритмия(в т.ч. мерцание и трепетание желудочков), брадикардия.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, запор, кишечная непроходимость, чувство дискомфорта и боли в животе: в отдельных случаях - транзиторное повышение активности печеночных трансаминаз и щелочной фосфатазы в плазме крови; редко - диарея, гиперплазия десен (кровоточивость, болезненность, отечность), повышение аппетита.

Со стороны нервной системы: тревожность, общая слабость, сонливость, депрессия, экстрапирамидные нарушения (атаксия, маскообразное лицо, шаркающая походка, тугоподвижность рук или ног, дрожание кистей и пальцев рук, затруднение глотания), головокружение, головная боль, судороги во время введения верапамила гидрохлорида, парестезии, тремор, в редких случаях - повышенная нервная возбудимость, заторможенность, утомляемость.

Аллергические реакции: кожная сыпь, гиперемия кожи лица, мультиформная экссудативная эритема, синдром Стивенса - Джонсона, зуд, бронхоспазм.

Прочие: увеличение массы тела; очень редко - агранулоцитоз, артрит, транзиторная слепота на пике концентрации препарата в крови, отек легких, бессимптомная тромбоцитопения, развитие периферических отеков, гинекомастия, гиперпролактинемия, галакторрея, импотенция, повышенное потоотделение, мышечная слабость, миалгии, боли в суставах, утомляемость.

Передозировка:

Симптомы: синусовая брадикардия, переходящая в атриовентрикулярную блокаду, иногда асистолию, выраженное

снижение АД, сердечная недостаточность, шок, синоатриальная блокада, гипергликемия, метаболический ацидоз.

Лечение: при нарушении ритма и проводимости - в/в введение изопреналина, норадренапина, 10-20 мл 10% раствора кальция глюконата, искусственный водитель ритма; в/в инфузия плазмозамещающих растворов. Гемодиализ не эффективен. Для повышения АД у больных гипертрофической кардиомиопатией назначают альфа-адреностимуляторы (фенилэфрин); не следует применить изопреналин и норадреналин.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказание: беременность и период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное введение верапамила с препаратами, которые снижают адренергическую активность, может привести к чрезмерному снижению АД.

Так как верапамипа гидрохлорид в высокой степени связывается с белками плазмы крови, он должен применяться с осторожностью одновременно с препаратами, которые также в высокой степени связываются с белками плазмы крови.

При одновременном применении верапамила гидрохлорида с ингаляционными анестетиками, дозы препаратов должны подбираться с осторожностью для того, чтобы избежать чрезмерного угнетения сердечно-сосудистой системы.

При одновременном назначении верапамила гидрохлорида с дигоксином необходимо тщательное мониторирование пациентов на предмет развития атриовентрикулярной блокады или чрезмерной брадикардии.

При одновременном применении верапамила с:

антиаритмическими средствами, бета-адреноблокаторами и ингаляционными анестетиками наблюдается усиление кардиотоксического эффекта(повышение опасности возникновения атриовентрикулярной блокады, резкого снижения ЧСС, развитие сердечной недостаточности, резкого падения АД);

антигипертензивными средствами, диуретиками, празозином и другими альфа-адреноблокаторами - возможно усиление гипотензивного эффекта верапамила;

миорелаксантами - возможно усиление миорелаксирующего действия;

ацетилсалициловой кислотой - усиливается возможность возникновения кровотечений;

карбамазепином и литием - увеличивается опасность возникновения нейротоксических эффектов;

хинидином - повышается уровень концентрации хинидина в плазме крови, усиливается угроза снижения АД, а у больных с гипертрофической кардиомиопатией возможно возникновение выраженной артериальной гипотензии и отека легких;

флекаинидом - возможно снижение сократительной способности миокарда, замедление атриовентрикулярного проведения и удлинение периода реполяризации.

Дизопирамид не должен применяться в течение 48 ч до и 24 ч после применения верапамила гидрохлорида.

Прокаинамид, хинидин и другие лекарственные средства, вызывающие удлинение интервала QT, повышают риск его значительного удлинения.

Верапамил повышает концентрацию в крови дигоксина, теофиллина, празозина, циклоспорина, карбамазепина, миорелаксантов, хинидина, вальпроевой кислоты вследствие подавления метаболизма с участием цитохрома P450. Возможно повышение концентрации в крови мидазолама, симвастатина, ловастатина, этанола.

Рифампицин, барбитураты, никотин, ускоряя метаболизм в печени, приводят к снижению концентрации верапамила в крови, уменьшают выраженность антиангинального, гипотензивного и антиаритмического действий.

НПВС снижают гипотензивный эффект вследствие подавления синтеза простагландинов, задержки натрия и жидкости в организме.

Симпатомиметики снижают гипотензивный эффект верапамила.

Эстрогены снижают гипотензивный эффект вследствие задержки жидкости в организме.

Циметидин не оказывает влияния на фармакокинетику вводимого в/в верапамила гидрохлорида.

Особые указания и меры предосторожности:

В/в введение Изоптина часто вызывает преходящее снижение АД обычно не проявляющееся клинически, но которое может сопровождаться головокружением.

Недостаточность кровообращения (кроме тяжелой или вызванной аритмией) следует компенсировать сердечными гликозидами и диуретиками до начала терапии Изоптином. У больных с умеренной и тяжелой сердечной недостаточностью(давление заклинивания в легочной артерии более 20 мм рт.ст., фракция выброса менее 30%), при назначении Изоптина может наблюдаться острое прогрессирование недостаточности кровообращения.

Раствор не содержит бактериостатических или антимикробных агентов и предназначен для одновременного в/в введения.

Верапамила гидрохлорид остается стабильным по крайней мере на протяжении 24 ч при 25°С и защите от света в большинстве парентеральных растворов большого объема. Оставшийся неиспользованным раствор должен уничтожаться немедленно после забора порции содержимого любою объема.

Во избежание нарушения стабильности на рекомендуется разводить Изоптин растворами натрия лактата в пластиковых пакетах из ПВХ. Следует избегать смешивания растворов Изоптина и альбумина, амфотерицина В, гидралазина гидрохлорида или триметоприма и сульфаметоксазола.

Верапамила гидрохлорид преципитирует в любых растворах с pH более 6.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В зависимости от индивидуальных особенностей пациента Изоптин может изменять скорость реакции, нарушая способность к управлению автомобилем, работе с механизмами или в опасных условиях.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* препарат следует назначать при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* препарат следует назначать при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

У пациентов пожилого возраста введение осуществляют на протяжении по крайней мере 3 мин для уменьшения риска нежелательных эффектов.

Применение в детском возрасте

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

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в местах, недоступных для детей при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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