Кардилопин

Код АТХ:

- C08CA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Амлодипин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого, почти белого или желтовато-белого цвета, круглые, плоские, с фаской, с гравировкой в виде буквы "E" на одной стороне и номером "251" - на другой.

	1 таб.
амлодипина безилат	3.475 мг,
что соответствует содержанию амлодипина	2.5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, натрия карбоксиметилкрахмал (тип А), магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки белого, почти белого или желтовато-белого цвета, круглые, плоские, с фаской, с гравировкой в виде буквы "E" на одной стороне и номером "252" - на другой.

	1 таб.
амлодипина безилат	6.95 мг,
что соответствует содержанию амлодипина	5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, натрия карбоксиметилкрахмал (тип А), магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки белого, почти белого или желтовато-белого цвета, круглые, плоские, с фаской, с гравировкой в виде буквы "Е" на одной стороне и номером "253" - на другой.

	1 таб.
амлодипина безилат	13.9 мг,
что соответствует содержанию амлодипина	10 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, натрия карбоксиметилкрахмал (тип А), магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Блокатор кальциевых каналов. Амлодипин подавляет трансмембранный входящий ток ионов кальция в гладкомышечные клетки сердца и сосудов за счет блокирования медленных кальциевых каналов.

Антигипертензивный эффект амлодипина обусловлен прямым релаксирующим действием на гладкомышечные клетки сосудов, что ведет к снижению сопротивления периферических сосудов.

Механизм антиангинального действия не вполне понятен, однако, скорее всего он связан с двумя следующими эффектами:

1.Расширение периферических артериол снижает ОПСС, т.е. постнагрузку. Поскольку амлодипин не вызывает рефлекторной тахикардии, потребление энергии и кислорода миокардом снижается.

2. Расширение крупных коронарных артерий и коронарных артериол улучшает снабжение кислородом как нормальных, так и ишемизированных зон миокарда. Благодаря этим эффектам улучшается снабжение кислородом миокарда, даже при спазме коронарных артерий (стенокардия Принцметала или нестабильная стенокардия).

У пациентов с артериальной гипертензией прием препарата 1 раз/сут вызывает клинически существенное снижение АД в положении лежа и стоя на протяжении всего 24-часового интервала между приемами препарата. В связи с медленным развитием эффекта препарат не вызывает острую артериальную гипотензию. У больных со стенокардией прием препарата 1 раз/сут увеличивает общее время выполнения возможной физической нагрузки до развития приступа стенокардии и время до значительного снижения интервала ST, а также снижает частоту приступов стенокардии и потребность сублингвального приема нитроглицерина.

Не обнаружено отрицательного влияния амлодинина на обмен веществ. Препарат не влияет на уровни липидов, глюкозы и мочевой кислоты сыворотки крови. Безопасен для пациентов с бронхиальной астмой.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема препарата внутрь амлодипин хорошо абсорбируется из ЖКТ; при этом C_{max} амлодипина в плазме крови отмечается через 6-12 ч. Одновременный прием пищи не изменяет всасывание амлодипина. Абсолютная биодоступность составляет примерно 64-80%.

Распределение

Кажущийся V_d - 21 л/кг. Связывание с белками плазмы составляет 93-98%. C_{ss} достигается на 7-8 день приема препарата и составляет 5-15 нг/мл.

Метаболизм и выведение

Амлодипин подвергается интенсивному метаболизму в печени. Примерно 90% принятой дозы преобразуется в неактивные производные пиридина. Общий клиренс составляет 7 мл/мин/кг (25 л/ч для больного с массой тела 60 кг). Выводится главным образом в виде метаболитов: 60% - с мочой, 20-25% - с калом, около 10% выделяется в неизмененном виде с мочой. $T_{1/2}$ - 30-35 ч (что позволяет назначать препарат 1 раз/сут).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Фармакокинетические параметры амлодипина не изменяются при почечной недостаточности.

У лиц пожилого возраста общий клиренс составляет примерно 19 л/ч, остальные параметры не меняются.

При снижении клиренса у пациентов с печеночной недостаточностью препарат следует назначать в меньших дозах.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в виде монотерапии или при необходимости в составе комбинированной терапии с другими антигипертензивными средствами);

— стабильная стенокардия (в виде монотерапии или в составе комбинированной терапии с другими антиангинальными средствами);

— ангиоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала) (в виде монотерапии или в составе комбинированной терапии с другими антиангинальными средствами).

Относится к болезням:

- Ангина
- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Стенокардия

Противопоказания:

— нестабильная стенокардия;

— клинически значимый аортальный стеноз;

— тяжелая артериальная гипотензия;

— детский и подростковый возраст до 18 лет (из-за отсутствия клинического опыта);

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— повышенная чувствительность к амлодипину и другим компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при нарушении функции печени, СССУ (выраженная брадикардия, тахикардия), хронической сердечной недостаточности в стадии декомпенсации, мягкой или умеренной степени артериальной гипотензии, аортальном стенозе, митральном стенозе, гипертрофической обструктивной кардиомиопатии, остром инфаркте миокарда (и в течение 1 месяца после), сахарном диабете, пациентам пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Для *лечения артериальной гипертензии или стенокардии* обычная начальная доза составляет 5 мг 1 раз/сут (желательно в одно и тоже время). С учетом реакции больного начальная доза может быть увеличена до 10 мг 1 раз/сут. Дозу Кардилопина не изменяют в случае его одновременного применения с диуретиками из группы тиазидов, бета-адреноблокаторами или ингибиторами АПФ.

При **почечной недостаточности** и у **пациентов пожилого возраста** коррекции режима дозирования не требуется.

При назначении Кардилопина **пациентам с нарушением функции печени** рекомендуемая доза составляет 2.5 мг/сут, т.к. у этих больных увеличивается $T_{1/2}$ препарата.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, чрезмерная утомляемость, сонливость, изменение настроения, судороги; редко - потеря сознания, гипестезия, парестезии, тремор, астения, недомогание, бессонница, нервозность, депрессия, необычные сновидения, тревога; очень редко - атаксия, апатия, ажитация, амнезия.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, боль в животе; редко - гипербилирубинемия, желтуха, повышение активности печеночных трансаминаз, сухость во рту, анорексия, рвота, запор или диарея, диспепсия, метеоризм, гиперплазия десен; очень редко - извращение вкуса, гастрит, повышение аппетита, панкреатит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение, отеки лодыжек и стоп, одышка, приливы крови к лицу; редко - нарушения ритма (брадикардия, желудочковая тахикардия, трепетание предсердий), боль в грудной клетке, чрезмерное снижение АД, ортостатическая гипотензия; очень редко - развитие или усугубление сердечной недостаточности, экстрасистолия, мигрень.

Со стороны мочеполовой системы: редко - поллакиурия, болезненные позывы на мочеиспускание, никтурия, нарушение сексуальной функции (в т.ч. снижение потенции); очень редко - дизурия, полиурия.

Со стороны дыхательной системы: редко - диспноэ; очень редко - кашель, ринит.

Со стороны органов чувств: редко - нарушение зрения, конъюнктивит, диплопия, боль в глазах, нарушение аккомодации, ксерофтальмия, звон в ушах.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - артралгия, артроз, миалгия (при длительном применении), боль в спине; очень редко - миастения.

Со стороны кожных покровов: очень редко - ксеродермия, алопеция, дерматит, пурпура.

Аллергические реакции: кожный зуд, сыпь (в т.ч. эритематозная, макуло-папулезная сыпь, крапивница).

Прочие: редко - гинекомастия, ощущение жара, озноб, увеличение массы тела, носовое кровотечение, повышенное потоотделение, жажда; очень редко - холодный липкий пот, паросмия, гипергликемия.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, тахикардия, чрезмерная периферическая вазодилатация.

Лечение: больному следует придать горизонтальное положение с приподнятыми ногами. Проводят промывание желудка, назначение активированного угля, поддержание функции сердечно-сосудистой системы, контроль показателей функции сердца и легких, контроль за ОЦК и диурезом. Проводят интенсивную симптоматическую терапию. Для восстановления тонуса сосудов показано применение сосудосуживающих препаратов (при отсутствии противопоказаний к их применению); для устранения последствий блокады кальциевых каналов - в/в введение кальция глюконата. Гемодиализ не эффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Учитывая недостаточный клинический опыт применения амлодипина при беременности и в период лактации, препарат не следует назначать беременным женщинам, а также женщинам репродуктивного возраста, не применяющим эффективных методов контрацепции, за исключением случаев, когда терапевтическая польза препарата оправдывает возможный риск.

При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Возможно одновременное применение амлодипина с тиазидными диуретиками, бета-адреноблокаторами, нитратами длительного действия, сублингвальными препаратами нитроглицерина, НПВС, антибиотиками и пероральными гипогликемическими средствами.

Тиазидные и "петлевые" диуретики, бета-адреноблокаторы, верапамил, ингибиторы АПФ и нитраты усиливают антиангинальный и гипотензивный эффекты амлодипина.

Амиодарон, хинидин, альфа$_1$-адреноблокаторы, антипсихотические лекарственные средства (нейролептики) и блокаторы медленных кальциевых каналов могут усиливать гипотензивное действие амлодипина.

Препараты кальция могут уменьшить эффект блокаторов медленных кальциевых каналов (в т.ч. амлодипина).

Ингибиторы микросомального окисления, повышая концентрацию амлодипина в плазме крови, усиливают риск развития побочных эффектов, а индукторы микросомальных ферментов печени - уменьшают.

Гипотензивный эффект амлодипина ослабляют НПВС, особенно индометацин (за счет задержки натрия и блокады синтеза простагландинов почками), альфа-адреномиметики, эстрогены (за счет задержки натрия), симпатомиметики.

Прокаинамид, хинидин и другие лекарственные средства, вызывающие удлинение интервала QT, усиливают отрицательный инотропный эффект амлодипина и могут повышать риск значительного удлинения интервала QT.

Циметидин не влияет на фармакокинетику амлодипина.

Амлодипин не оказывает влияния на фармакокинетические параметры дигоксина и варфарина.

Грейпфрутовый сок может несколько повысить уровень амлодипина в сыворотке крови, однако это не приводит к существенным изменениям АД.

Особые указания и меры предосторожности:

Исследования у пациентов с сердечной недостаточностью II и III функционального класса по классификации NYHA при приеме амлодипина не выявили снижения переносимости физической нагрузки, функции изгнания левого желудочка или ухудшения клинических симптомов. Результаты клинических исследований с участием пациентов с сердечной недостаточностью III-IV функционального класса по классификации NYHA показали, что амлодипин не повышает частоту сердечно-сосудистых нарушений или смертность при совместном применении с ингибиторами АПФ, диуретиками или дигоксином.

В период лечения необходимо поддержание гигиены зубов и посещение стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен).

Режим дозирования для пожилых такой же, как и для пациентов других возрастных групп. При увеличении дозы необходимо тщательное наблюдение за пожилыми пациентами.

Сосудорасширяющий эффект амлодипина развивается постепенно. Поэтому острая артериальная гипотензия после его применения отмечается очень редко, однако, перед прекращением лечения рекомендуется постепенное уменьшение доз.

Амлодипин не влияет на плазменные концентрации калия, глюкозы, триглицеридов, общего холестерина, ЛПНП, мочевой кислоты, креатинина и азота мочевой кислоты.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Не было сообщений о влиянии амлодипина на управление автомобилем или работу с механизмами. Тем не менее, у некоторых пациентов преимущественно в начале лечения могут возникать сонливость и головокружение. При их возникновении пациент должен соблюдать особые меры предосторожности при управлении автомобилем и работе с механизмами.

При нарушениях функции почек

При нарушении функции почек коррекции режима дозирования не требуется.

При нарушениях функции печени

При назначении Кардилопина **пациентам с нарушением функции печени** рекомендуемая доза составляет 2.5 мг/сут, т.к. у этих больных увеличивается $T_{1/2}$ препарата.

Применение в пожилом возрасте

Режим дозирования для пожилых такой же, как и для пациентов других возрастных групп. При увеличении дозы необходимо тщательное наблюдение за пожилыми пациентами.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 18 лет (из-за отсутствия клинического опыта);

Условия хранения:

Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре от 15° до 25°C.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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