Нормодипин



Код АТХ:

- C08CA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Амлодипин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого или почти белого цвета, двояковыпуклые, продолговато-округлой формы, с гравировкой "5" на одной стороне.

	1 таб.
амлодипина безилат	6.944 мг,
что соответствует содержанию амлодипина	5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кальция гидрофосфат безводный, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А), магния стеарат.

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

Таблетки белого или почти белого цвета, двояковыпуклые, продолговато-округлой формы, с гравировкой "10" на одной стороне и риской - на другой.

	1 таб.
амлодипина безилат	13.889 мг,
что соответствует содержанию амлодипина	10 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кальция гидрофосфат безводный, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А), магния стеарат.

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Блокатор медленных кальциевых каналов, производное дигидропиридина, оказывает антиангинальное и гипотензивное действие. Связываясь с сегментами S6 III и IV доменов альфа1-субъединицы кальциевого канала L-типа, блокирует кальциевые каналы, снижает трансмембранный переход ионов кальция в клетку (в большей степени в гладкомышечные клетки сосудов, чем в кардиомиоциты). Антиангинальное действие обусловлено расширением коронарных и периферических артерий и артериол: при стенокардии уменьшает выраженность ишемии миокарда; расширяя периферические артериолы, снижает ОПСС, уменьшает преднагрузку на сердце, снижает потребность миокарда в кислороде. Расширяет коронарные артерии и артериолы в неизмененных и ишемизированных зонах миокарда, увеличивает поступление кислорода в миокард (особенно при вазоспастической стенокардии); предотвращает развитие спазма коронарных артерий (в т.ч. вызванного курением). У больных стабильной стенокардией разовая суточная доза увеличивает толерантность к физической нагрузке, замедляет развитие стенокардии и "ишемической" депрессии сегмента ST, снижает частоту приступов стенокардии и потребления нитроглицерина и других нитратов.

Оказывает длительный дозозависимый гипотензивный эффект. Гипотензивное действие обусловлено прямым вазодилатирующим влиянием на гладкие мышцы сосудов. При артериальной гипертензии разовая доза обеспечивает клинически значимое снижение АД на протяжении 24 ч (в положении больного "лежа" и "стоя").

Ортостатическая гипотензия при назначении амлодипина встречается достаточно редко. Не вызывает снижения толерантности к физической нагрузке, фракции выброса левого желудочка. Уменьшает степень гипертрофии миокарда левого желудочка. Не оказывает влияния на сократимость и проводимость миокарда, не вызывает рефлекторного увеличения ЧСС, тормозит агрегацию тромбоцитов, повышает скорость клубочковой фильтрации, обладает слабым натрийуретическим действием. При диабетической нефропатии не увеличивает выраженность микроальбуминурии. Не оказывает какого-либо неблагоприятного влияния на обмен веществ и концентрацию липидов плазмы крови и может применяться при лечении больных бронхиальной астмой, сахарным диабетом и подагрой.

Время наступления эффекта - 2-4 ч, длительность эффекта - 24 ч.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь медленно и почти полностью абсорбируется из ЖКТ. Прием пищи не влияет на всасывание. C_{max} в плазме крови достигается через 6-9 ч, как у пожилых, так и у молодых пациентов. Средняя абсолютная биодоступность составляет 64%.

Распределение

C_{ss} амлодипина в плазме крови достигается после непрерывного применения в течение 7-8 дней.

V_d составляет приблизительно 21 л/кг, что указывает на превалирующее распределение в тканях. Проникает через ГЭБ и в грудное молоко.

Связывание с белками плазмы - 97%.

Метаболизм

Около 90% амлодипина биотрансформируется в печени с образованием неактивных метаболитов.

Выведение

Амлодипин выводится из организма с мочой (10% дозы - в неизмененном виде и 60% - в виде неактивных метаболитов) и с калом (20-25% в виде метаболитов). Выведение является двухфазным, $T_{1/2}$ в среднем составляет 31-48 ч. Общий клиренс амлодилина составляет 7 мл/мин/кг. При гемодиализе амлодипин не удаляется.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пожилых пациентов (старше 65 лет) выведение амлодипина замедлено ($T_{1/2}$ - 65 ч) по сравнению с молодыми пациентами, однако эти различия не имеют клинического значения.

Удлинение $T_{1/2}$ у пациентов с печеночной недостаточностью предполагает, что при длительном назначении кумуляция препарата в организме будет выше ($T_{1/2}$ - до 60 ч).

Наличие у пациента почечной недостаточности не оказывает существенного влияния на фармакокинетику амлодипина.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в виде монотерапии или в комбинации с другими антигипертензивными средствами);

— стабильная стенокардия напряжения (в виде монотерапии или в комбинации с другими антиангинальными средствами);

— вазоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала) (в виде монотерапии или в комбинации с другими антиангинальными средствами).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Стенокардия

Противопоказания:

— выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт. ст.);

— коллапс;

— кардиогенный шок;

— клинически значимый стеноз аорты;

— нестабильная стенокардия (за исключением стенокардии Принцметала);

— беременность;

— период лактации;

— возраст до 18 лет (из-за отсутствия клинического опыта по применению);

— повышенная чувствительность к амлодипину и другим производным дигидропиридина.

С *осторожностью* следует назначать препарат при нарушениях функции печени, СССУ (выраженная брадикардия, тахикардия), хронической сердечной недостаточности неишемической этиологии III-IV функционального класса по классификации NYHA, артериальной гипотензии, митральном стенозе, гипертрофической обструктивной кардиомиопатии, остром инфаркте миокарда (и в течение 1 мес после него), пациентам пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Внутрь, начальная доза для *лечения артериальной гипертензии и стенокардии* составляет 5 мг 1 раз/сут. Максимальная суточная доза - 10 мг. При *артериальной гипертензии* поддерживающая доза составляет 5 мг/сут.

Не требуются изменения дозы при одновременном назначении с тиазидными диуретиками, бета-адреноблокаторами и ингибиторами АПФ.

У **пациентов пожилого возраста** может увеличиваться $T_{1/2}$ амлодипина и снижаться клиренс креатинина. Изменения доз не требуется, но необходимо более тщательное наблюдение за пациентами.

У **пациентов с почечной недостаточностью** не требуются изменения дозы.

Побочное действие:

Частота побочных реакций представлена в соответствии со следующей градацией: очень часто (>1/10), часто (>1/100, <1/10), нечасто (>1/1000, <1/100), редко (>1/10 000, <1/1000), очень редко (<10 000), включая отдельные сообщения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - сердцебиение, периферические отеки (отечность лодыжек и стоп), приливы крови к коже лица; нечасто - чрезмерное снижение АД; очень редко - развитие или усугубление течения сердечной недостаточности, нарушения ритма (брадикардия, желудочковая тахикардия, мерцание предсердий),

инфаркт миокарда, боль в грудной клетке, ортостатическая гипотензия, васкулит.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: часто - головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, сонливость; нечасто - астения, общее недомогание, гипестезия, парестезии, периферическая невропатия, тремор, вертиго, обморок, бессонница, лабильность настроения, необычные сновидения, повышенная возбудимость, депрессия, тревога; очень редко - апатия, атаксия, ажитация, амнезия.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, боли в животе; иногда - рвота, запор или диарея, метеоризм, диспепсия, анорексия, сухость слизистой оболочки полости рта, жажда; редко - гиперплазия десен, повышение аппетита; очень редко - панкреатит, гастрит, желтуха (обусловленные холестазом), гипербилирубинемия, повышение активности печеночных трансаминаз, гепатит.

Со стороны органов кроветворения: очень редко - тромбоцитопеническая пурпура, лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны мочеполовой системы: редко - учащенное мочеиспускание, болезненное мочеиспускание, никтурия, импотенция; очень редко - дизурия, полиурия.

Со стороны кожных покровов: редко - дерматит; очень редко - пурпура, ксеродермия, нарушение пигментации кожи.

Аллергические реакции: нечасто - кожный зуд, сыпь (в т.ч. эритематозная, макулопапулезная сыпь); очень редко - крапивница, ангионевротический отек, многоформная эритема.

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

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

Прочие: редко - алопеция, гинекомастия, гиперурикемия, увеличение/снижение массы тела, диспноэ, носовое кровотечение, повышенное потоотделение; очень редко - холодный липкий пот, кашель, ринит, паросмия, нарушение вкусовых ощущений, нарушение аккомодации, гипергликемия.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, тахикардия, чрезмерная периферическая вазодилатация (риск развития выраженной и стойкой артериальной гипотензии, в т.ч. с развитием шока и летального исхода).

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля, поддержание функции сердечно-сосудистой системы, контроль показателей функции сердца и легких, приподнятое, выше уровня головы, положение нижних конечностей, контроль ОЦК и диуреза. Для восстановления тонуса сосудов — применение сосудосуживающих средств (при отсутствии противопоказаний к их применению); с целью устранения последствий блокады кальциевых каналов — в/в введение кальция глюконата. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

В исследованиях на животных не было выявлено тератогенного действия амлодипина, однако отсутствует клинический опыт его применения при беременности и в период лактации. Поэтому амлодипин не следует назначать беременным и кормящим женщинам, а также **женщинам детородного возраста**, если они не используют надежные методы контрацепции.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Амлодипин может безопасно применяться для лечения артериальной гипертензии вместе с тиазидными диуретиками, альфа-адреноблокаторами, бета-адреноблокаторами или ингибиторами АПФ. У пациентов со стабильной стенокардией препарат можно комбинировать с другими антиангинальными средствами, например, с нитратами пролонгированного действия, бета-адреноблокаторами или нитратами короткого действия.

Амлодипин можно одновременно применять с НПВП (особенно индометацином), антибактериальными средствами и гипогликемическими средствами для приема внутрь.

Возможно усиление антиангинального и гипотензивного действия блокаторов медленных кальциевых каналов дигидропиридинового ряда при совместном применении с тиазидными и "петлевыми" диуретиками, верапамилом, ингибиторами АПФ, бета-адреноблокаторами и нитратами, а так же усиление их гипотензивного действия при совместном применении с альфа$_1$-адреноблокаторами, нейролептиками.

Хотя при изучении амлодипина отрицательного инотропного действия обычно не наблюдали, тем не менее, некоторые блокаторы медленных кальциевых каналов могут усиливать выраженность отрицательного инотропного

действия антиаритмических средств, вызывающих удлинение интервала QT (например, амиодарон и хинидин).

Однократный прием сильденафила в дозе 100 мг у больных эссенциальной гипертензией не оказывает влияния на параметры фармакокинетики амлодипина.

Повторное применение амлодипина в дозе 10 мг и аторвастатина в дозе 80 мг не сопровождается значительными изменениями показателей фармакокинетики аторвастатина.

Амлодипин при однократном и повторном применении в дозе 10 мг не влияет на фармакокинетику этанола (напитки, содержащие алкоголь).

Противовирусные средства (ритонавир) увеличивает плазменные концентрации блокаторов медленных кальциевых каналов, в т.ч. амлодипина.

Нейролептики и изофлуран усиливают гипотензивное действие производных дигидропиридина.

Препараты кальция могут уменьшать эффект блокаторов медленных кальциевых каналов.

При совместном применении амлодипина с препаратами лития возможно усиление проявления нейротоксичности (тошнота, рвота, диарея, атаксия, тремор, шум в ушах).

Амлодипин не изменяет фармакокинетику циклоспорина.

Не оказывает влияние на концентрацию в сыворотке крови дигоксина и его почечный клиренс.

Не оказывает существенного влияние на действие варфарина (протромбиновое время).

Циметидин не влияет на фармакокинетику амлодипина.

В исследованиях in vitro амлодипин не влияет на связывание с белками крови дигоксина, фенитоина, варфарина и индометацина.

Одновременный однократный прием 240 мг грейпфрутового сока и 10 мг амлодипина внутрь не сопровождается существенным изменением фармакокинетики амлодипина.

Особые указания и меры предосторожности:

В период лечения препаратом Нормодипин необходимо контролировать массу тела и потребление натрия, показано назначение соответствующей диеты. Необходимо поддержание гигиены зубов и наблюдение у стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен).

Пациентам с малой массой тела, пациентам невысокого роста и больным с выраженным нарушением функции печени может потребоваться меньшая доза.

При нарушении функции печени также может удлиняться $T_{1/2}$ препарата. Поэтому таким пациентам Нормодипин необходимо назначать с осторожностью.

Несмотря на то, что прекращение приема препарата Нормодипин не сопровождается развитием синдрома отмены, прекращение лечения желательно проводить, постепенно уменьшая дозу препарата.

Эффективность и безопасность препарата при гипертоническом кризе не установлена.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управление механизмами

Не было сообщений о влиянии препарата Нормодипин на управление автомобилем или работу с механизмами. Тем не менее, у некоторых пациентов, преимущественно в начале лечения, могут возникать сонливость, головокружение и другие побочные эффекты со стороны нервной системы. При их возникновении пациент должен соблюдать особые меры предосторожности при управлении автомобилем и работе со сложными механизмами.

При нарушениях функции почек

При **почечной недостаточности** изменения дозы не требуется, т.к. концентрация амплодипина в плазме крови не зависит от степени снижения функции почек.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует назначать препарат при нарушениях функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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