Осмо-Адалат



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки с контролируемым высвобождением, покрытые оболочкой розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с маркировкой черным шрифтом "Adalat 30" с одной стороны; на поверхности таблеток с любой из сторон с произвольным расположением относительно центра имеется пора в виде лунки неправильной формы диаметром до 1 мм.

	1 таб.
нифедипин	30 мг

Вспомогательные вещества: гипромеллоза - 8.2 мг, магния стеарат - 400 мкг, макрогол - 122.2 мг; осмотический слой - гипромеллоза - 4.1 мг, магния стеарат - 200 мкг, натрия хлорид - 23.9 мг, макрогол - 52.9 мг, краситель железа оксид красный - 800 мкг; пленочная оболочка - целлюлозы ацетат - 32.3 мг, макрогол - 1.7 мг; светозащитной оболочки - опадрай розовый OY-S-24914 - 16 мг (или альтернативно гипролоза - 7.1 мг, титана диоксид - 5 мг, гипромеллоза - 2.3 мг, полиэтиленгликоль - 1.3 мг, краситель железа оксид красный - 300 мг); полировочный слой, надпись - гипромеллоза - 1.5 мг, чернила черные Opacode S-1-8106 (следовые количества).

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки с контролируемым высвобождением, покрытые оболочкой розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с маркировкой черным шрифтом "Adalat 60" с одной стороны; на поверхности таблеток с любой из сторон с произвольным расположением относительно центра имеется пора в виде лунки неправильной формы диаметром до 1 мм.

	1 таб.
нифедипин	60 мг

Вспомогательные вещества: гипромеллоза - 16.4 мг, магния стеарат - 800 мкг, макрогол - 244.4 мг; осмотический слой - гипромеллоза - 8.2 мг, магния стеарат - 400 мкг, натрия хлорид - 47.8 мг, макрогол - 105.8 мг, краситель железа оксид красный - 1.6 мг; пленочная оболочка - целлюлозы ацетат - 38 мг, макрогол - 2 мг; светозащитной оболочки - опадрай розовый OY-S-24914 - 29 мг (или альтернативно гипролоза - 12.8 мг, титана диоксид - 9.1 мг, гипромеллоза - 4.1 мг, полиэтиленгликоль - 2.4 мг, краситель железа оксид красный - 600 мг); полировочный слой, надпись - гипромеллоза - 2.5 мг, чернила черные Opacode S-1-8106 (следовые количества).

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный блокатор медленных кальциевых каналов, производное 1,4-дигидропиридина. Оказывает антиангинальное и гипотензивное действие.

Уменьшает ток ионов кальция через медленные кальциевые каналы внутрь клеток, преимущественно кардиомиоцитов, гладкомышечных клеток коронарных и периферических артерий, понижая при этом ОПСС и

расширяя коронарные артерии, крупные сосуды и интактные сегменты стенок частично стенозированных сосудов. Нифедипин снижает тонус гладкой мускулатуры коронарных артерий, тем самым предотвращает ангиоспазм, усиливает кровоток в постстенотических отделах сосудов и увеличивает доставку кислорода к миокарду. Уменьшает потребность миокарда в кислороде за счет снижения ОПСС (постнагрузки), а при длительном приеме способен предотвращать развитие новых атеросклеротических повреждений в коронарных артериях. Нифедипин снижает тонус гладкой мускулатуры артериол, тем самым, уменьшая повышенное ОПСС и, следовательно, АД.

В начале лечения нифедипином возможно временное рефлекторное повышение ЧСС и, как следствие, сердечного выброса. Однако это повышение не настолько значительно, чтобы компенсировать расширение кровеносных сосудов. Кроме того, нифедипин и при кратковременном, и при длительном применении увеличивает выведение ионов натрия и воды из организма. Гипотензивное действие нифедипина особенно выражено у пациентов с артериальной гипертензией. У пациентов с артериальной гипертензией и наличием, по крайней мере, еще одного фактора риска, снижает частоту сердечно-сосудистых и цереброваскулярных эпизодов в такой же степени, как комбинация диуретиков.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

После приема внутрь нифедипин почти полностью всасывается из ЖКТ. Биодоступность нифедипина из таблеток составляет 45-56% вследствие эффекта "первого прохождения" через печень. Биодоступность нифедипина из таблеток с контролируемым высвобождением относительно таблеток составляет 68-86%. Прием пищи незначительно снижает начальную скорость абсорбции, но не влияет на величину биодоступности. Нифедипин выделяется из таблетки с контролируемым высвождением через особую мембрану по осмотическому градиенту с константой скорости нулевого порядка, при этом происходит контролируемое повышение концентрации нифедипина в плазме крови, которая достигает плато приблизительно через 6-12 ч после приема. В течение 24 ч поддерживается постоянная концентрация препарата в плазме крови. Скорость высвобождения нифедипина не зависит от pH среды и моторики ЖКТ. При приеме Осмо-Адалата в дозе 30 мг и 60 мг C_{max} в плазме крови составляет соответственно 20-21 нг/мл и 43-55 нг/мл и достигается через 12-15 ч и 7-9 ч соответственно. Связывание с белками плазмы крови (альбумином) - около 95%.Проникает через ГЭБ и плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком.

Метаболизм

После приема внутрь нифедипин метаболизируется в стенке кишечника и в печени с образование неактивных метаболитов.

Выведение

$T_{1/2}$ нифедипина при приеме таблеток составляет 1.7-3.4 ч. Концентрация нифедипина при приеме таблеток с контролируемым высвобождением в плазме крови поддерживается в виде плато в течение всего периода высвобождения и всасывания, и только после высвобождения последней дозы нифедипина из таблетки с контролируемым высвобождением его концентрация в плазме начинает снижаться, и $T_{1/2}$ соответствует таковому при приеме нифедипина в форме таблеток. Нифедипин выводится из организма в виде неактивных метаболитов через почки, только 5-15% - с желчью через кишечник. В неизмененном виде нифедипин присутствует в моче в незначительных количествах (менее 0.1%).

Во время прохождения по пищеварительному тракту биологически неактивные компоненты таблетки остаются неизмененными и выводятся из организма в виде нерастворимой оболочки.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При нарушении функции почек фармакокинетика не изменяется.

При нарушении функции печени клиренс нифедипина снижается.

Гемодиализ и перитонеальный диализ не влияют на фармакокинетику нифедипина, плазмаферез усиливает его выведение.

Показания к применению:

— ИБС: стабильная стенокардия (стенокардия напряжения);

— артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Стенокардия

Противопоказания:

— кардиогенный шок;

— выраженная артериальная гипотензия (систолическое давление <90 мм рт.ст.);

— илеостома, установленная после проктоколэктомии;

— одновременное применение рифампицина;

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

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

— повышенная чувствительность к нифедипину.

С *осторожностью* следует назначать препарат при сердечной недостаточности, тяжелом аортальном стенозе, субаортальном стенозе, остром инфаркте миокарда с левожелудочковой недостаточностью, выраженной брадикардии, при печеночной недостаточности, стенозе любого отдела ЖКТ, тяжелых нарушениях мозгового кровообращения, легкой или умеренной артериальной гипотензии, пациентам пожилого возраста, пациентам со злокачественной артериальной гипертензией и гиповолемией, находящимся на гемодиализе.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь.

Начальная доза составляет 30 мг 1 раз/сут. В дальнейшем при необходимости дозу можно постепенно увеличить до 60 мг 1 раз/сут и даже до 120 мг 1 раз/сут в зависимости от степени тяжести заболевания и индивидуальной реакции пациента. Продолжительность лечения определяется врачом.

Таблетку следует проглатывать целиком, не разжевывая и не разламывая, запивая небольшим количеством жидкости, принимать независимо от приема пищи, беречь от воздействия влаги и вынимать из фольги непосредственно перед самым приемом.

При **тяжелых нарушениях функции печени** проводят коррекцию режима дозирования.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ≥1-<10% - сердцебиение, ощущение приливов крови к лицу (вазодилатация), периферические отеки; ≥0.1-<1% - артериальная гипотензия (в т.ч. ортостатическая), обморок, тахикардия; ≥0.01-<0.1% - стенокардия.

Со стороны пищеварительной системы: ≥1-<10% - запор; ≥0.1-<1% - боль в животе, диарея, сухость во рту, диспепсия, метеоризм, тошнота; ≥0.01-<0.1% - анорексия, отрыжка, гингивит, гиперплазия десен, повышение активности печеночных трансаминаз (АЛТ, АСТ, ГГТ), рвота; <0.01% - безоар (комки из непереваренных остатков пищи в желудке), дисфагия, эзофагит, кишечная непроходимость, язвы кишечника, желтуха.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: ≥1-<10% - головокружение, головная боль; ≥0.1-<1% - нервозность, парестезии, бессонница, сонливость; ≥0.01-<0.1% - гипестезия, тремор.

Со стороны эндокринной системы: <0.01% - гипергликемия, снижение массы тела, гинекомастия.

Со стороны дыхательной системы: ≥0.1-<1% - одышка; ≥0.01-<0.1% - носовые кровотечения.

Со стороны мочевыделительной системы: ≥0.1-<1% - никтурия, полиурия; ≥0.01-<0.1% - дизурия, учащенное мочеиспускание, ухудшение функции почек (у пациентов с почечной недостаточностью).

Со стороны костно-мышечной системы: ≥0.1-<1% - судороги в икроножных мышцах; ≥0.01-<0.1% - артралгия, миалгия.

Дерматологические реакции: ≥0.1-<1% - кожный зуд, сыпь (экзантема, эритема, крапивница); ≥0.01-<0.1% - ангионевротический отек, макуло-папулезная, пустулезная, везикуло-буллезная сыпь, крапивница; <0.01% - фотодерматит, эксфолиативный дерматит, пурпура.

Аллергические реакции: ≥0.01-<0.1% - отек языка, снижение АД, тахикардия, лихорадка; <0.01% - анафилактические реакции.

Со стороны системы кроветворения: <0.01% - лейкопения.

Со стороны органов чувств: ≥0.01-<0.1% - диплопия, амблиопия, боли в глазных яблоках; <0.01% - нечеткость зрения.

Со стороны вегетативной нервной системы: ≥0.01-<0.1% - повышенное потоотделение.

Прочие: ≥1-<10% - астения, отеки лица (в т.ч. вокруг глаз); ≥0.1-<1% - боли в области грудной клетки, боли в нижних конечностях, недомогание, боли неопределенной локализации; ≥0.01-<0.1% - озноб, загрудинная боль.

При приеме нифедипина встречаются также такие побочные эффекты, как бессимптомный агранулоцитоз, тромбоцитопения, развитие или усугубление сердечной недостаточности, редко - отек легких (затруднение дыхания, кашель или стридорозное дыхание), транзиторная потеря зрения, отечность суставов.

Передозировка:

Симптомы: потеря сознания вплоть до комы, выраженное снижение АД. тахикардия/брадикардия, гипергликемия, метаболический ацидоз, гипоксия, кардиогенный шок, сопровождающийся отеком легких.

Лечение: мероприятия по оказанию неотложной помощи при передозировке в первую очередь должны быть направлены на выведение нифедипина из организма и восстановление стабильной гемодинамики. Рекомендуется промывание желудка и при необходимости ирригация тонкого кишечника для предотвращения дальнейшего всасывания препарата. Проведение гемодиализа нецелесообразно, поскольку нифедипин не выводится при диализе; рекомендуется назначение плазмафереза (т.к. для нифедипина характерна высокая степень связывания с белками плазмы крови и относительно небольшой V_d).

При брадикардии назначают β-адреномиметики, при жизнеугрожающей брадикардии - имплантация временного искусственного водителя ритма.

При выраженном снижении АД рекомендуется медленное в/в введение 10-20 мл 10% раствора кальция глюконата (допустимо повторное введение), при неэффективности - назначение сосудосуживающих симпатомиметиков допамина или норэпинефрина (дозы подбирают в зависимости от полученного терапевтического эффекта).

Введение жидкости следует ограничивать в связи с риском перегрузки сердца.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Осмо-Адалат противопоказан к применению при беременности, т.к. возможно эмбриотоксическое, фетотоксическое и тератогенное действие препарата.

Нифедипин выделяется с грудным молоком, поэтому при необходимости применения препарата Осмо-Адалат в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Гипотензивный эффект нифедипина может усилиться при одновременном применении с препаратами, снижающими АД, а также с ингаляционными анестетиками, празозином и другими альфа-адреноблокаторами.

Гипотензивный эффект нифедипина снижают симпатомиметики, НПВС из-за подавления синтеза простагландинов в почках и задержки натрия и жидкости в организме, эстрогены (за счет задержки жидкости в организме) и препараты кальция.

Нифедипин метаболизируется с помощью изофермента CYP3A4, поэтому препараты, которые ингибируют или индуцируют эти ферменты, могут взаимодействовать с нифедипином при его приеме внутрь, нарушая клиренс или эффект "'первого прохождения" через печень.

Нифедипин снижает клиренс дигоксина, что приводит к повышению его концентрации в плазме крови, поэтому пациенты требуют тщательного наблюдения для выявления симптомов передозировки сердечного гликозида, а его доза при необходимости должна быть снижена.

Нифедипин снижает концентрацию хинидина в плазме крови, однако при его отмене содержание хинидина может значительно возрасти, что требует корректировки его дозы. В некоторых случаях может повыситься концентрация нифедипина в плазме крови, поэтому при наличии показаний следует снизить его дозу. В период сочетанной терапии необходимо контролировать концентрацию хинидина в плазме крови и уровень АД. При одновременном приеме с нифедипином повышает риск удлинения интервала QT.

При сочетании с прокаинамидом существует риск удлинения интервала QT и усиления отрицательного инотропного эффекта обоих препаратов.

Нифедипин индуцирует изофермент CYP3A4 и уменьшает биодоступность нифедипина и, как следствие этого, снижает его эффективность, что может потребовать повышения его дозы.

Нифедипин ингибирует изофермент CYP3A4 и вызывает повышение концентрации нифедипина в плазме крови, усиливая тем самым его гипотензивное действие.

Нифедипин относится к мощным индукторам ферментов печени, ускоряя метаболизм нифедипина, что приводит к ослаблению его эффективности.

Дилтиазем замедляет выведение нифедипина из организма, поэтому комбинированную терапию следует проводить очень осторожно, при необходимости снижая дозу нифедипина.

Цизаприд повышает концентрацию нифедипина в плазме крови, поэтому следует контролировать АД и при необходимости снизить дозу нифедипина.

Грейпфрутовый сок ингибирует изофермент CYP3A4 и повышает концентрацию нифедипина в плазме, вследствие снижения эффекта "первого прохождения" через печень.

Поскольку вальпроевая кислота вызывает повышение в плазме концентрации нимодипина, по структуре близкого к нифедпину блокатора медленных кальциевых каналов, то не исключается повышение в плазме концентрации нифедипина и усиление его эффективности.

Нифедипин не изменяет антиагрегантное действие ацетилсалициловой кислоты в дозе 100 мг (агрегацию тромбоцитов и длительность кровотечения). Ацетилсалициловая кислота, в свою очередь, не влияет на фармакокинетические параметры нифедипина.

Поскольку карбамазепин и фенабарбитал вызывают снижение в плазме концентрации нимодипина, по структуре близкого к нифедипину блокатора медленных кальциевых каналов, то возможно снижение в плазме концентрации нифедипина и уменьшение его эффективности.

Нифедипин может вытеснять из связи с белками препараты, характеризующиеся высокой степенью связывания (непрямые антикоагулянты - производные кумарина и индандиона, хинин, сульфинпиразон, противосудорожные препараты, салицилаты, НПВС) с последующим возможным повышением их концентрации в плазме.

Поскольку эритромицин, флуоксетин, ритонавир, индинавир, ампренавир, нелфинавир, саквинавир, кетоконазол, итраконазол, флуконазол ингибируют изофермент CYP3A4, то не исключается повышение концентрации нифедипина в плазме крови в результате их взаимодействия. Рекомендуется контролировать уровень АД и при необходимости снизить дозу нифедипина.

В случае одновременного применения с дизопирамидом возможно усиление отрицательного инотропного эффекта. Препараты, содержащие литий, при сочетании с нифедипином могут вызвать нейротоксические симптомы (тошноту, рвоту, диарею, атаксию, тремор и/или шум в ушах).

Аймалин, омепразол, беназеприл, ирбесартан, орлистат, ранитидин, розиглитазон, доксазозин, пантопразол, талинолол, триамтерена гидрохлортиазид не влияют на фармакокинетику нифедипина.

Особые указания и меры предосторожности:

С особой осторожностью следует назначать нифедипин пациентам с выраженным стенозом любого отдела ЖКТ, поскольку возможно развитие кишечной непроходимости. В отдельных случаях симптомы кишечной непроходимости могут наблюдаться у пациентов без патологии со стороны ЖКТ.

Следует иметь в виду, что при проведении рентгена кишечника с барием можно выявить ложноположительные симптомы полипа (дефект наполнения).

При печеночной недостаточности рекомендуется наблюдение за пациентами; при необходимости следует уменьшить дозу препарата или применять нифедипин в других лекарственных формах.

При одновременном применении препарата Осмо-Адалат и блокаторов β-адренорецепторов пациенту требуется тщательное наблюдение, поскольку возможно развитие выраженного снижения АД и усугубление симптомов сердечной недостаточности.

При одновременном приеме с грейпфрутовым соком возможно усиление гипотензивного действия, которое сохраняется в течение 3 дней после последнего приема сока.

Нифедипин вызывает ложноположительное увеличение концентрации ванилилминдальной кислоты в моче при определении спектрофотометрическим методом и не влияет на результат этой реакции при использовании метода высокоэффективной жидкостной хроматографии (ВЭЖХ).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, и воздерживаться от применения этанола.

При нарушениях функции печени

При **нарушениях функции печени тяжелой степени** проводят коррекцию режима дозирования.

При печеночной недостаточности рекомендуется наблюдение за пациентами, при необходимости - снижение дозы или применение препарата в других лекарственных формах.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью следует назначать пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Эффективность и безопасность применения препарата до 18 лет не установлены.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Osmo-Adalat