Рамиприл



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Рамиприл

Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ингибитор АПФ. Является пролекарством, из которого в организме образуется активный метаболит рамиприлат. Полагают, что механизм антигипертензивного действия связан с конкурентным ингибированием активности АПФ, которое приводит к снижению скорости превращения ангиотензина I в ангиотензин II, являющийся мощным сосудосуживающим веществом. В результате уменьшения концентрации ангиотензина II происходит вторичное увеличение активности ренина плазмы за счет устранения отрицательной обратной связи при высвобождении ренина и прямое снижение секреции альдостерона. Благодаря сосудорасширяющему действию уменьшает ОПСС (постнагрузку), давление заклинивания в легочных капиллярах (преднагрузку) и сопротивление в легочных сосудах; повышает минутный объем сердца и толерантность к нагрузке.

У пациентов с признаками хронической сердечной недостаточности после инфаркта миокарда рамиприл снижает риск внезапной смерти, прогрессирование сердечной недостаточности в тяжелую/резистентную недостаточность и уменьшает число госпитализаций по поводу сердечной недостаточности.

Известно, что рамиприл значительно снижает частоту инфаркта миокарда, инсульта и сердечно-сосудистой смерти у пациентов с повышенным кардиоваскулярным риском вследствие сосудистых заболеваний (ИБС, перенесенный инсульт или заболевания периферических сосудов) или сахарного диабета, у которых имеется как минимум один дополнительный фактор риска (микроальбуминурия, артериальная гипертензия, повышение уровня общего холестерина, низкий уровень ЛПВП, курение). Снижает общую смертность и потребность в процедурах по реваскуляризации, замедляет возникновение и прогрессирование хронической сердечной недостаточности. Как у пациентов с сахарным диабетом, так и без него, рамиприл значительно снижает имеющуюся микроальбуминурию и риск развития нефропатии. Эти эффекты отмечаются у пациентов как с повышенным, так и с нормальным АД.

Гипотензивный эффект рамиприла развивается примерно через 1-2 ч, достигает максимума в пределах 3-6 ч, продолжается не менее 24 ч.

Фармакокинетика

При приеме внутрь абсорбция составляет 50-60%, пища не влияет на степень всасывания, но замедляет абсорбцию. C_{max} достигается через 2-4 ч. В печени метаболизируется с образованием активного метаболита рамиприлата (в 6 раз активней ингибирует АПФ, чем рамиприл), неактивного дикетопиперазина и глюкуронизируется. Все образуемые метаболиты, за исключением рамиприлата, фармакологической активности не имеют. Связывание с белками плазмы для рамиприла - 73%, рамиприлата - 56%. Биодоступность после приема внутрь 2.5-5 мг рамиприла - 15-28%; для рамиприлата - 45%. После ежедневного приема рамиприла в дозе 5 мг/сут устойчивая концентрация рамиприлата в плазме достигается к 4 дню.

$T_{1/2}$ для рамиприла - 5.1 ч; в фазе распределения и элиминации падение концентрации рамиприлата в сыворотке крови происходит с $T_{1/2}$ - 3 ч, затем следует переходная фаза с $T_{1/2}$ - 15 ч, и длительная конечная фаза с очень низкими концентрациями рамиприлата в плазме и $T_{1/2}$ - 4-5 дней. $T_{1/2}$ увеличивается при хронической почечной недостаточности. V_d рамиприла - 90 л, рамиприлата - 500 л. Почками выводится 60%, через кишечник - 40% (преимущественно в виде метаболитов). При нарушении функции почек выведение рамиприла и его метаболитов замедляется пропорционально снижению КК; при нарушении функции печени замедляется превращение в рамиприлат; при сердечной недостаточности концентрация рамиприлата повышается в 1.5-1.8 раза.

Показания к применению:

Артериальная гипертензия; хроническая сердечная недостаточность; сердечная недостаточность, развившаяся в первые несколько дней после острого инфаркта миокарда; диабетическая и недиабетическая нефропатия; снижение риска развития инфаркта миокарда, инсульта и сердечно-сосудистой смертности у пациентов с высоким сердечно-сосудистым риском, включая пациентов с подтвержденной ИБС (с инфарктом в анамнезе или без него), пациентов, перенесших чрескожную транслюминальную коронарную ангиопластику, коронарное шунтирование, с инсультом в анамнезе и пациентов с окклюзионными поражениями периферических артерий.

Относится к болезням:

- Ангина
- Гипертензия
- Инсульт
- Миокардит
- Нефрит
- Окклюзия
- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

Выраженные нарушения функции почек и печени, двусторонний стеноз почечных артерий или стеноз артерии единственной почки; состояние после трансплантации почки; первичный гиперальдостеронизм, гиперкалиемия, стеноз устья аорты, беременность, лактация (грудное вскармливание), детский и подростковый возраст до 18 лет, повышенная чувствительность к рамиприлу и другим ингибиторам АПФ.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь. Начальная доза - 1.25-2.5 мг 1-2 раза/сут. При необходимости возможно постепенное повышение дозы. Поддерживающая доза устанавливается индивидуально, в зависимости от показаний к применению и эффективности лечения.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипотензия; редко - боли в груди, тахикардия.

Со стороны ЦНС: головокружение, слабость, головная боль; редко - нарушения сна, настроения.

Со стороны системы пищеварения: диарея, запор, потеря аппетита; редко - стоматит, боли в животе, панкреатит, холестатическая желтуха.

Со стороны дыхательной системы: сухой кашель, бронхит, синусит.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - протеинурия, повышение концентрации креатинина и мочевины в крови (главным образом у пациентов с нарушением функции почек).

Со стороны системы кроветворения: редко - нейтропения, агранулоцитоз, тромбоцитопения, анемия.

Со стороны лабораторных показателей: гипокалиемия, гипонатриемия.

Аллергические реакции: кожная сыпь, ангионевротический отек и другие реакции гиперчувствительности.

Прочие: редко - мышечные спазмы, импотенция, алопеция.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Рамиприл противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении калийсберегающих диуретиков (в т.ч. спиронолактона, триамтерена, амилорида), препаратов калия, заменителей соли и БАД к пище, содержащих калий, возможно развитие гиперкалиемии (особенно у пациентов с нарушениями функции почек), т.к. ингибиторы АПФ уменьшают содержание альдостерона, что приводит к задержке калия в организме на фоне ограничения выведения калия или его дополнительного поступления в организм.

При одновременном применении с НПВС возможно уменьшение гипотензивного эффекта рамиприла, нарушение функции почек.

При одновременном применении с петлевыми или тиазидными диуретиками усиливается антигипертензивное действие. Выраженная артериальная гипотензия, особенно после приема первой дозы диуретика, по-видимому, возникает за счет гиповолемии, которая приводит к транзиторному усилению гипотензивного эффекта рамиприла. Имеется риск развития гипокалиемии. Повышается риск нарушения функции почек.

При одновременном применении со средствами, оказывающими гипотензивный эффект, возможно усиление гипотензивного эффекта.

При одновременном применении с иммунодепрессантами, цистостатиками, аллопуринолом, прокаинамидом возможно усиление риска развития лейкопении.

При одновременном применении с инсулином, гипогликемическими средствами производными сульфонилмочевины, метформином возможно развитие гипогликемии.

При одновременном применении с аллопуринолом, цистостатиками, иммунодепрессантами, прокаинамидом возможно усиление риска развития лейкопении.

При одновременном применении с лития карбонатом возможно повышение концентрации лития в сыворотке крови.

Особые указания и меры предосторожности:

У пациентов с сопутствующим нарушением функции почек дозы подбирают индивидуально в соответствии со значениями КК. Перед началом лечения всем больным необходимо проведение исследования функции почек. В процессе лечения рамиприлом регулярно осуществляется контроль функции почек, электролитного состава крови, уровня печеночных ферментов в крови, а также картины периферической крови (особенно у пациентов с диффузными заболеваниями соединительной ткани, у пациентов, получающих иммунодепрессанты, аллопуринол). Больным, у которых имеется дефицит жидкости и/или натрия, перед началом лечения необходимо провести коррекцию водно-электролитных нарушений. Во время лечения рамиприлом нельзя проводить гемодиализ с использованием полиакрилонитрильных мембран (повышен риск возникновения анафилактических реакций).

При нарушениях функции почек

Противопоказан при выраженных нарушениях функции почек, состоянии после трансплантации почки. У пациентов с сопутствующим нарушением функции почек дозы подбирают индивидуально в соответствии со значениями КК. Перед началом лечения всем больным необходимо проведение исследования функции почек.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при выраженных нарушениях функции печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

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