# Верапамил-Эском



# Код АТХ:

• C08DA01

# Международное непатентованное название (Действующее вещество):

• Верапамил

#### Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель Госреестр $^{\mathrm{MHH}}$  Википедия $^{\mathrm{MHH}}$  РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com $^{\mathrm{ahr}}$ 

## Фармакотерапевтическая группа:

• Органотропные средства

### Фармакологические свойства:

#### Фармакодинамика

Селективный блокатор кальциевых каналов I класса, производное дифенилалкиламина. Оказывает антиангинальное, антиаритмическое и антигипертензивное действие.

Антиангинальный эффект связан как с прямым действием на миокард, так и с влиянием на периферическую гемодинамику (снижает тонус периферических артерий, ОПСС). Блокада поступления кальция в клетку приводит к уменьшению трансформации заключенной в макроергических связях АТФ энергии в механическую работу, снижению сократимости миокарда. Уменьшает потребность миокарда в кислороде, оказывает вазодилатирующее, отрицательное ино- и хронотропное действие.

Верапамил существенно снижает AV проводимость, удлиняет период рефрактерности и подавляет автоматизм синусового узла. Увеличивает период диастолического расслабления левого желудочка, уменьшает тонус стенки миокарда (является вспомогательным средством для лечения гипертрофической обструктивной кардиомиопатии). Оказывает антиаритмическое действие при наджелудочковых аритмиях.

#### Фармакокинетика

При приеме внутрь абсорбируется более 90% дозы. Связывание с белками - 90%. Подвергается метаболизму при "первом прохождении" через печень. Основным метаболитом является норверапамил, обладающий менее выраженной гипотензивной активностью, чем неизмененный верапамил.

 $T_{1/2}$  при приеме однократной дозы составляет 2.8-7.4 ч, при приеме повторных доз - 4.5-12 ч (в связи с насыщением ферментных систем печени и повышением концентрации верапамила в плазме крови). После в/в введения начальный  $T_{1/2}$  - около 4 мин, конечный - 2-5 ч.

Выводится преимущественно почками и 9-16% через кишечник.

## Показания к применению:

Стенокардия (напряжения, стабильная без ангиоспазма, стабильная вазоспастическая), суправентрикулярная тахикардия (в т.ч. пароксизмальная, при WPW-синдроме, синдроме Лауна-Ганонга-Левина), синусовая тахикардия, мерцательная тахиаритмия, трепетание предсердий, предсердная экстрасистолия, артериальная гипертензия, гипертонический криз (в/в введение), гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, первичная гипертензия в малом круге кровообращения.

## Относится к болезням:

- Ангина
- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Гипертонический криз
- Гипертония
- Кардиомиопатия
- Кардит
- Пароксизм
- Синусит
- Синусовая тахикардия
- Тахикардия
- Экстрасистолия

## Противопоказания:

Тяжелая артериальная гипотензия, AV-блокада II и III степени, синоатриальная блокада и СССУ (кроме больных с кардиостимулятором), WPW-синдром или синдром Лауна-Ганонга-Левина в сочетании с трепетанием или фибрилляцией предсердий (кроме больных с кардиостимулятором), беременность, период лактации, повышенная чувствительность к верапамилу.

# Способ применения и дозы:

Индивидуальный. Внутрь взрослым - в начальной дозе 40-80 мг 3 раза/сут. Для лекарственных форм пролонгированного действия разовую дозу следует увеличивать, а частоту приема уменьшать. Детям в возрасте 6-14 лет - 80-360 мг/сут, до 6 лет - 40-60 мг/сут; частота приема - 3-4 раза/сут.

При необходимости верапамил можно вводить в/в струйно (медленно, под контролем АД, ЧСС и ЭКГ). Разовая доза для взрослых составляет 5-10 мг, при отсутствии эффекта через 20 мин возможно повторное введение в той же дозе. Разовая доза для детей в возрасте 6-14 лет составляет 2.5-3.5 мг, 1-5 лет - 2-3 мг, до 1 года - 0.75-2 мг. Для пациентов с выраженными нарушениями функции печени суточная доза верапамила не должна превышать 120 мг.

Максимальная суточная доза для взрослых при приеме внутрь составляет 480 мг.

# Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: брадикардия (менее 50 уд./мин), выраженное снижение АД, развитие или усугубление сердечной недостаточности, тахикардия; редко - стенокардия, вплоть до развития инфаркта миокарда (особенно у больных с тяжелым обструктивным поражением коронарных артерий), аритмия (в т.ч. мерцание и трепетание желудочков); при быстром в/в введении - AV-блокада III степени, асистолия, коллапс.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, обморок, тревожность, заторможенность, повышенная утомляемость, астения, сонливость, депрессия, экстрапирамидные нарушения (атаксия, маскообразное лицо, шаркающая походка, тугоподвижность рук или ног, дрожание кистей и пальцев рук, затруднение глотания).

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, запор (редко - диарея), гиперплазия десен (кровоточивость, болезненность, отечность), повышение аппетита, повышение активности печеночных трансаминаз и ЩФ.

*Аллергические реакции*: кожный зуд, кожная сыпь, гиперемия кожи лица, многоформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона).

*Прочие*: увеличение массы тела, очень редко - агранулоцитоз, гинекомастия, гиперпролактинемия, галакторея, артрит, транзиторная потеря зрения на фоне максимальной концентрации в плазме (при в/в введении), отек легких,

тромбоцитопения бессимптомная, периферические отеки.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

Верапамил противопоказан при беременности и в период лактации.

# Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с антигипертензивными препаратами (вазодилататорами, тиазидными диуретиками, ингибиторами АПФ) происходит взаимное усиление антигипертензивного действия.

При одновременном применении с бета-адреноблокаторами, антиаритмическими средствами, средствами для ингаляционного наркоза повышается риск развития брадикардии, AV-блокады, выраженной артериальной гипотензии, сердечной недостаточности, в связи с взаимным усилением угнетающего влияния на автоматизм синоатриального узла и AV-проводимость, сократимость и проводимость миокарда.

При парентеральном введении верапамила пациентам, недавно получавшим бета-адреноблокаторы, существует риск развития артериальной гипотензии и асистолии.

При одновременном применении с нитратами усиливается антиангинальное действие верапамила.

При одновременном применении с амиодароном усиливается отрицательное инотропное действие, брадикардия, нарушение проводимости, AV-блокада.

Поскольку верапамил ингибирует изофермент СҮРЗА4, который участвует в метаболизме аторвастатина, ловастатина и симвастатина, теоретически возможны проявления лекарственного взаимодействия, обусловленные повышением концентраций статинов в плазме крови. Описаны случаи развития рабдомиолиза.

При одновременном применении с ацетилсалициловой кислотой описаны случаи увеличения времени кровотечения вследствие аддитивного антиагрегантного действия.

При одновременном применении с буспироном концентрация буспирона в плазме крови повышается, усиливаются его терапевтические и побочные эффекты.

При одновременном применении описаны случаи повышения концентрации дигитоксина в плазме крови.

При одновременном применении с дигоксином повышается концентрация дигоксина в плазме крови.

При одновременном применении с дизопирамидом возможны тяжелая артериальная гипотензия и коллапс, особенно у пациентов с кардиомиопатией или декомпенсированной сердечной недостаточностью. Риск развития тяжелых проявлений лекарственного взаимодействия связан, по-видимому, с усилением отрицательного инотропного действия.

При одновременном применении с диклофенаком уменьшается концентрация верапамила в плазме крови; с доксорубицином - увеличивается концентрация доксорубицина в плазме крови и повышается его эффективность.

При одновременном применении с имипрамином повышается концентрация имипрамина в плазме крови и возникает риск развития нежелательных изменений на ЭКГ. Верапамил повышает биодоступность имипрамина за счет уменьшения его клиренса. Изменения на ЭКГ обусловлены повышением концентрации имипрамина в плазме крови и аддитивным угнетающим действием верапамила и имипрамина на AV-проводимость.

При одновременном применении с карбамазепином усиливается действие карбамазепина и повышается риск развития побочных эффектов со стороны ЦНС вследствие ингибирования метаболизма карбамазепина в печени под влиянием верапамила.

При одновременном применении с клонидином описаны случаи остановки сердца у пациентов с артериальной гипертензией.

При одновременном применении с лития карбонатом проявления лекарственного взаимодействия неоднозначны и непредсказуемы. Описаны случаи усиления эффектов лития и развития нейротоксичности, уменьшения концентрации лития в плазме крови, тяжелой брадикардии.

Вазодилатирующее действие альфа-блокаторов и блокаторов кальциевых каналов может быть аддитивным или синергичным. При одновременном применении теразозина или празозина и верапамила развитие выраженной артериальной гипотензии частично обусловлено фармакокинетическим взаимодействием: повышение  $C_{\text{max}}$  и AUC теразозина и празозина.

При одновременном применении рифампицин индуцирует активность ферментов печени, ускоряя метаболизм верапамила, что приводит к уменьшению его клинической эффективности.

При одновременном применении повышается концентрация теофиллина в плазме крови.

При одновременном применении с тубокурарина хлоридом, векурония хлоридом возможно усиление миорелаксирующего действия.

При одновременном применении с фенитоином, фенобарбиталом возможно значительное уменьшение концентрации верапамила в плазме крови.

При одновременном применении с флуоксетином усиливаются побочные эффекты верапамила вследствие замедления его метаболизма под влиянием флуоксетина.

При одновременном применении снижается клиренс хинидина, повышается его концентрация в плазме крови и возрастает риск развития побочных эффектов. Наблюдались случаи развития артериальной гипотензии.

При одновременном применении верапамил ингибирует метаболизм циклоспорина в печени, что приводит к уменьшению его выведения и повышению концентрации в плазме крови. Это сопровождается усилением иммунодепрессивного действия, отмечено уменьшение проявлений нефротоксичности.

При одновременном применении с циметидином усиливаются эффекты верапамила.

При одновременном применении с энфлураном возможно пролонгирование анестезии.

При одновременном применении с этомидатом увеличивается продолжительность анестезии.

# Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять при AV-блокаде I степени, брадикардии, тяжелом стенозе устья аорты, хронической сердечной недостаточности, при легкой или умеренной артериальной гипотензии, инфаркте миокарда с левожелудочковой недостаточностью, печеночной и/или почечной недостаточности, у пациентов пожилого возраста, у детей и подростков в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность применения не исследованы).

При необходимости возможна комбинированная терапия стенокардии и артериальной гипертензии верапамилом и бета-адреноблокаторами. Однако следует избегать в/в введения бета-адреноблокаторов на фоне применения верапамила.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

После приема верапамила возможны индивидуальные реакции (сонливость, головокружение), влияющие на способность пациента выполнять работу, требующую высокой концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

### При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять при почечной недостаточности.

### При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять при печеночной недостаточности.

### Применение в пожилом возрасте

С осторожностью следует применять у пациентов пожилого возраста.

#### Применение в детском возрасте

С осторожностью следует применять у детей и подростков в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность применения не исследованы).

Источник: http://drugs.thead.ru/Verapamil-Eskom