Верапамил-Эском



Код АТХ:

- C08DA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Верапамил

Полезные ссылки:

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

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 макроэргических 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 CYP3A4, 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_{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