

ИНСТРУКЦИЯ
(информация для пациента)
по медицинскому применению препарата
ВАСКОПИН

Торговое название препарата: Васкопин (Vascopin)

Международное непатентованное название: амлодипин, amlodipin.

Лекарственная форма: таблетки

1 таблетка содержит: амлодипин 5 мг (в форме бесилата);

вспомогательные вещества: натрия крахмалгликолят, целлюлоза

микrokристаллическая, кальция фосфат двухосновной, кроскармеллоза натрия (ацдисол), магния стеарат.

Описание: белые продолговатые таблетки.

Фармакотерапевтическая группа:

Селективные блокаторы кальциевых каналов с преимущественным влиянием на сосуды. Дигидропириновые производные.

Код АТХ: C08CA01.

Механизм действия

Активный ингредиент Васкопина - амлодипин является блокатором медленных кальциевых каналов, производным дигидропиридина. Он блокирует поступление ионов кальция через мембраны в гладкомышечные клетки миокарда и сосудов.

Фармакологические свойства

Блокатор медленных кальциевых каналов, производное дигидропиридина.

Связываясь с дигидропиридиновыми рецепторами, блокирует медленные кальциевые каналы, ингибирует трансмембранный переход кальция внутрь клеток гладкой мышцы сердца и сосудов (в большей степени - в гладкомышечные клетки сосудов, чем в кардиомиоциты).

Оказывает антигипертензивный и антиангинальный эффект.

Механизм антигипертензивного действия амлодипина обусловлен прямым расслабляющим влиянием на гладкие мышцы сосудов.

Антиангинальный эффект обусловлен расширением периферических артериол и таким образом снижением ОПСС (постнагрузки), при этом ЧСС практически не изменяется, что приводит к снижению потребления энергии и потребности миокарда в кислороде; а также расширением коронарных и периферических артерий и артериол как в нормальных, так и в ишемизированных зонах миокарда, что увеличивает поступление кислорода в миокард у больных вазоспастической стенокардией (стенокардия Принцметала) и предотвращает развитие коронарospазма, вызванного курением.

У больных с артериальной гипертензией разовая суточная доза Васкопина обеспечивает снижение АД на протяжении 24 ч как в положении лежа, так и стоя. Благодаря медленному началу действия амлодипин не вызывает резкого снижения АД.

У больных со стенокардией разовая суточная доза амлодипина увеличивает время выполнения физической нагрузки, задерживает развитие очередного приступа

стенокардии и депрессии сегмента ST во время ее выполнения, снижает частоту приступов стенокардии и потребление таблеток нитроглицерина.

У пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями (включая коронарный атеросклероз с поражением одного сосуда и до стеноза 3 и более артерий и атеросклероза сонных артерий), перенесших инфаркт миокарда, чрескожную транслюминальную ангиопластику коронарных артерий (ТЛП) или страдающих стенокардией, применение Васкопина предупреждает развитие утолщения интимы-медии сонных артерий, значительно снижает летальность от сердечно-сосудистых причин, инфаркта миокарда, инсульта, ТЛП, аорто-коронарного шунтирования, приводит к снижению числа госпитализаций по поводу нестабильной стенокардии и прогрессирования хронической сердечной недостаточности, снижает частоту вмешательств, направленных на восстановление коронарного кровотока.

Васкопин не повышает риск смерти или развития осложнений, приводящих к смертельным исходам у больных с хронической сердечной недостаточностью (III-IV функциональный класс по классификации NYHA) на фоне терапии дигоксином, диуретиками и ингибиторами АПФ.

У больных с хронической сердечной недостаточностью (III-IV функциональный класс по классификации NYHA) неишемической этиологии при применении Васкопина существует вероятность возникновения отека легких.

Васкопин не оказывает какого-либо неблагоприятного влияния на обмен веществ и концентрацию липидов плазмы крови.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

После приема внутрь в терапевтических дозах амлодипин хорошо абсорбируется, C_{max} в крови достигается через 6-12 ч после приема. Абсолютная биодоступность составляет 64-80%. Прием пищи не влияет на абсорбцию амлодипина.

V_d равен примерно 21 л/кг. Связывание с белками плазмы составляет примерно 97.5%. Амлодипин проникает через гематоэнцефалический барьер.

C_{ss} в плазме достигается через 7-8 дней постоянного приема препарата.

Метаболизм и выведение

Амлодипин биотрансформируется в печени с образованием неактивных метаболитов. $T_{1/2}$ из плазмы составляет около 35-50 ч, что соответствует назначению препарата 1 раз/сут. Общий клиренс - 0.43 л/ч/кг.

10% неизмененного активного вещества и 60% метаболитов выводится с мочой.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов с печеночной недостаточностью и тяжелой хронической сердечной недостаточностью $T_{1/2}$ увеличивается до 56-60 ч.

$T_{1/2}$ из плазмы у больных с почечной недостаточностью увеличивается до 60 ч. Изменение концентрации амлодипина в плазме не коррелирует со степенью нарушения функции почек.

У пожилых и более молодых людей время, необходимое для достижения C_{max} амлодипина в плазме крови, практически одинаковое. У людей пожилого возраста с хронической сердечной недостаточностью отмечена тенденция к снижению клиренса амлодипина, что приводит к увеличению AUC и $T_{1/2}$ (до 65 ч).

Показания к применению

Артериальная гипертензия (как в качестве монотерапии, так и в сочетании с другими антигипертензивными средствами);

Стабильная стенокардия и вазоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала) (как в качестве монотерапии, так и в сочетании с другими антиангинальными средствами).

Способ применения и режим дозирования

При *артериальной гипертензии и стенокардии* средняя начальная доза составляет 5 мг 1 раз/сут, при необходимости можно увеличить до максимальной дозы, составляющей 10 мг.

Таблетки принимают внутрь 1 раз/сут, запивая необходимым объемом воды (до 100 мл).

Изменения режима дозирования Васкопина при одновременном применении тиазидных диуретиков, бета-адреноблокаторов или ингибиторов АПФ не требуется.

У пожилых пациентов препарат рекомендуется применять в средних терапевтических дозах, изменение дозы препарата не требуется.

У больных с нарушениями функции печени, несмотря на то, что $T_{1/2}$ амлодипина, как и всех блокаторов кальциевых каналов, увеличивается, каких-либо изменений дозы препарата у данной категории больных обычно не требуется.

При почечной недостаточности рекомендуется применять Васкопин в обычных дозах, однако необходимо учитывать возможное незначительное увеличение $T_{1/2}$. Амлодипин не удаляется во время гемодиализа.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к дигидропиридинам;

Тяжелая артериальная гипотензия.

Побочные эффекты

Под частотой побочных реакций понимается: часто ($>1\%$), иногда ($<1\%$), редко ($<0.1\%$), очень редко ($<0.01\%$).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - периферические отеки (лодыжек и стоп), сердцебиение; иногда - чрезмерное снижение АД, ортостатическая гипотензия, васкулит; редко - развитие или усугубление сердечной недостаточности; очень редко - нарушения ритма сердца (включая брадикардию, желудочковую тахикардию и мерцание предсердий), инфаркт миокарда, боли в грудной клетке, мигрень.

Со стороны костно-мышечной системы: иногда - артралгия, судороги мышц, миалгия, боль в спине, артроз; редко - миастения.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: часто - ощущение жара и "приливов" крови к коже лица, повышенная утомляемость, головокружение, головная боль, сонливость; иногда - недомогание, обморок, повышенное потоотделение, астения, гипестезии, парестезии, периферическая невропатия, тремор, бессонница, лабильность настроения, необычные сновидения, нервозность, депрессия, тревога; редко - судороги, апатия, ажитация; очень редко - атаксия, амнезия.

Со стороны пищеварительной системы: часто - боль в брюшной полости, тошнота; иногда - рвота, запор, метеоризм, диспепсия, диарея, анорексия, сухость во рту, жажда; редко - гиперплазия десен, повышение аппетита; очень редко -

гастрит, панкреатит, гипербилирубинемия, желтуха (обычно холестатическая), повышение активности печеночных трансаминаз, гепатит.

Со стороны системы кровотока: очень редко - тромбоцитопеническая пурпура, лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны обмена веществ: очень редко — гипергликемия.

Со стороны дыхательной системы: иногда - одышка, ринит; очень редко — кашель.

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

Аллергические реакции: иногда - кожный зуд, сыпь; очень редко - ангионевротический отек, многоформная эритема, крапивница.

Прочие: иногда - алопеция, звон в ушах, гинекомастия, увеличение/снижение массы тела, нарушения зрения, диплопия, нарушение аккомодации, ксерофтальмия, конъюнктивит, боль в глазах, извращение вкуса, озноб, носовое кровотечение; редко - дерматит; очень редко - паросмия, ксеродермия, холодный пот, нарушение пигментации кожи.

Применение при беременности и кормлении грудью

Безопасность применения Васкопина при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) не установлена, поэтому применение при беременности возможно только в том случае, когда польза для матери превышает риск для плода и новорожденного.

Данные по выведению амлодипина с грудным молоком отсутствуют, поэтому в период лактации (грудного вскармливания) следует прекратить либо прием препарата, либо грудное вскармливание.

Особые указания

С осторожностью следует применять препарат у пациентов с нарушениями функции печени, хронической сердечной недостаточностью (III-IV функционального класса по классификации NYHA) неишемической этиологии, аортальным стенозом, острым инфарктом миокарда (и в течение 1 мес после него).

Как и при назначении других блокаторов кальциевых каналов, необходимо соблюдать осторожность при приеме Васкопина пациентами с СССУ, митральным стенозом, гипертрофической обструктивной кардиомиопатией, артериальной гипотензией.

При лечении артериальной гипертензии Васкопин можно применять в комбинации с тиазидными диуретиками, альфа- и бета-адреноблокаторами, ингибиторами АПФ, нитратами пролонгированного действия, сублингвальным нитроглицерином, НПВП, антибиотиками и пероральными гипогликемическими средствами.

Для лечения стенокардии Васкопин можно назначать в виде монотерапии или в комбинации с другими антиангинальными препаратами в т.ч. у больных, рефрактерных к лечению нитратами и/или бета-адреноблокаторами в адекватных дозах.

Васкопин не оказывает какого-либо неблагоприятного влияния на обмен веществ и липиды плазмы крови и может применяться при лечении больных бронхиальной астмой, сахарным диабетом и подагрой.

Васкопин может быть применен и в тех случаях, когда больной предрасположен к сосудистому спазму (вазоконстрикции).

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

Использование в педиатрии

С осторожностью следует назначать препарат детям и подросткам в возрасте до 18 лет, т.к. эффективность и безопасность его применения у данной группы пациентов точно не установлены.

Эффекты передозировки

Симптомы: выраженное снижение АД с возможным развитием рефлекторной тахикардии и чрезмерной периферической вазодилатации (существует вероятность появления выраженной и стойкой артериальной гипотензии, в т.ч. с развитием шока и летального исхода).

Лечение: назначение активированного угля (особенно в первые 2 ч после передозировки), промывание желудка (в отдельных случаях), придание возвышенного положения конечностям, активное поддержание функции сердечно-сосудистой системы, мониторинг показателей работы сердца и легких, контроль за ОЦК и диурезом. Для восстановления тонуса сосудов и АД, если нет противопоказаний, возможно применение сосудосуживающих препаратов. Используют в/в введение глюконата кальция. Поскольку амлодипин в значительной степени связывается с белками сыворотки крови - гемодиализ не эффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами, пищевыми продуктами

При одновременном применении Васкопина с циметидином фармакокинетика амлодипина не меняется.

При совместном применении Васкопина с НПВП, особенно с индометацином, значимого взаимодействия препарата обнаружено не было.

Возможно усиление антиангинального и гипотензивного действия блокаторов кальциевых каналов при совместном применении с тиазидными и "петлевыми" диуретиками, верапамилом, ингибиторами АПФ, бета-адреноблокаторами и нитратами; а также повышение их гипотензивного действия при совместном применении с альфа₁-адреноблокаторами, нейролептиками.

Амлодипин не влияет *in vitro* на степень связывания с белками плазмы крови дигоксина, фенитоина, варфарина и индометацина.

Однократный прием алюминий/магнийсодержащих антацидов не оказывает существенного влияния на фармакокинетику амлодипина.

Однократный прием силденафила 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.

При одновременном применении амлодипина с дигоксином у здоровых добровольцев сывороточные уровни и почечный клиренс дигоксина не изменяются.

При однократном и повторном применении в дозе 10 мг амлодипин не оказывает существенного влияния на фармакокинетику этанола.

Амлодипин не влияет на изменения протромбинового времени, вызванные варфарином.

Амлодипин не вызывает значительных изменений фармакокинетики циклоспорина.

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и работу с опасными приспособлениями и механизмами

На фоне приема Васкопина какого-либо отрицательного влияния на управление транспортными средствами и на работу с опасными приспособлениями и механизмами не наблюдалось.

Условия хранения

Хранить в защищенном от света месте при комнатной температуре не выше +25°C. Отпускают по рецепту.

Срок годности. 4 года.

Упаковка. Таблетки 5 мг № 20, 40.

Фирма-производитель, страна

Фармакар Инт Ко/Джефарм, Палестина

Палестина, Иерусалим, п/о, а/я 51621.

Представительство компании «Фармакар ПЛС» в Республике Беларусь:
г.Минск, 220020 а/я 7.

e-mail: pharmacare@pharmacare.by

Сайт: www.pharmacare.by