

ИНСТРУКЦИЯ по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название: Авторекс-А.

Международное непатентованное название: Амлодипин + Атенолол .

Лекарственная форма: таблетки для приема внутрь.

Состав: каждая таблетка содержит:

Амлодипин 5 мг;

(в виде Амлодипина бисалата ВР)

Атенолол ВР 50 мг;

Вспомогательные вещества q.s.

Использованы отвержденные красители

Фармакотерапевтическая группа: Гипотензивное комбинированное средство (бета-адреноблокатор и блокатор «медленных» кальциевых каналов).

Код АТХ: C08CA01 (Амлодипин).

Код АТХ: C07AB03 (Атенолол).

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика:

Авторекс А - комбинированный препарат, эффект которого обусловлен действием двух компонентов - бета-1-адреноблокатора (атенолол) и БМКК (амлодипин), оказывает *гипотензивное, антиангинальное, антиаритмическое действие.*

Атенолол оказывает гипотензивное, антиангинальное и антиаритмическое действие. Не обладает мембраностабилизирующей и внутренней симпатомиметической активностью. Уменьшает стимулирование катехоламинами образования цАМФ и АТФ, снижает внутриклеточный ток Са В первые 24 ч после перорального приема на фоне снижения минутного объема крови отмечается реактивное повышение ОПСС, выраженность которого в течение 1–3 суток постепенно снижается.

Гипотензивный эффект связан с уменьшением ударного и минутного объема крови, снижением активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы, модулирующей чувствительности барорецепторов и влиянием на ЦНС. Гипотензивное действие проявляется снижением САД, ДАД. В средних терапевтических дозах не оказывает влияния на тонус периферических артерий. Гипотензивный эффект продолжается 24 ч, при регулярном приеме стабилизируется к концу 2 недели лечения.

Антиангинальный эффект определяется снижением потребности миокарда в кислороде в результате уменьшения ЧСС (удлинение диастолы и улучшения перфузии миокарда) и сократимости, а также снижением чувствительности миокарда к воздействию симпатической иннервации. За счет увеличения натяжения мышечных волокон желудочков и конечного диастолического давления в левом желудочке может повышать потребность миокарда в кислороде, особенно у больных с хронической сердечной недостаточностью.

Антиаритмическое действие связано с устранением аритмогенных симпатических влияний на проводящую систему сердца, торможением гетерогенного автоматизма, уменьшением скорости распространения возбуждения через сино-атриальный узел и удлинением рефрактерного периода. Угнетает проведение импульсов в антеградном и, в меньшей степени, в ретроградном направлениях через АВ узел и по дополнительным путям. Увеличивает выживаемость больных, перенесших инфаркт миокарда (снижает частоту желудочковых аритмий и приступов стенокардии).

В терапевтических концентрациях не влияет на бета-адренорецепторы, оказывает менее выраженное влияние на гладкую мускулатуру бронхов и периферических артерий, а также на липидный обмен. Незначительно уменьшает жизненную емкость легких, практически не ослабляет бронходилатирующее действие изопроterenола. При приеме более 100 мг в сутки может оказывать бета-адреноблокирующее действие.

Снижает ЧСС в покое и при физической нагрузке. Отрицательный хронотропный эффект проявляется через 1 ч после приема, достигает максимума спустя 2–4 ч и продолжается до 24 ч.

Амлодипин производное дигидропиридина. Обладает гипотензивным, антиангинальным, спазмолитическим и сосудорасширяющим действием. Блокирует поступление ионов Са²⁺ через клеточные мембраны в гладкомышечные клетки сосудов и сосудов. Механизм гипотензивного действия связан с прямым расслабляющим влиянием на гладкие мышечные сосуды. Антиангинальный эффект обусловлен, во-первых, способностью расширять периферические артериолы, что приводит к снижению ОПСС, уменьшению нагрузки на сердце и снижению потребности миокарда в кислороде. Во-вторых, за счет расширения коронарных артерий увеличивается поступление кислорода в миокард (особенно при вазоспастической стенокардии). Амлодипин не оказывает неблагоприятного влияния на обмен веществ и липиды плазмы, обладает антиатеросклеротической, антитромботической активностью, повышает скорость клубочковой фильтрации, обладает слабым натрийуретическим действием. При диабетической нефропатии не увеличивает выраженность микроальбуминурии.

Фармакокинетика:

После приема внутрь атенолол быстро всасывается из ЖКТ (50% дозы). Растворимость в жирах — плохая, биодоступность — 40–50%. Т_{max} — 2–4 ч. Связывание с белками плазмы — 6–16%. Плохо проникает через ГЭБ, в незначительных количествах проникает через плацентарный барьер и в грудное молоко. Практически не метаболизируется. Т_{1/2} — 6–9 ч (увеличивается у пациентов пожилого возраста). Выводится почками путем клубочковой фильтрации (85–100% в неизменном виде). Нарушение функции почек сопровождается удлинением Т_{1/2} и кумуляцией: Т_{1/2} при клиренсе креатинина ниже 35 мг/мин/1,73 м² — 16–27 ч, при клиренсе креатинина ниже 15 мг/мин/1,73 м² — более 27 ч. Выводится при гемодиализе.

Амлодипин после приема внутрь быстро и полно (90%) абсорбируется из ЖКТ. Биодоступность — 60–65%, связывание с белками плазмы — более 95%. Т_{max} — 6–12 ч. Равновесная концентрация отмечается через 7–8 дней. Объем распределения — около 20 л/кг. Проникает через ГЭБ и в грудное молоко. Метаболизируется в основном в печени с образованием неактивных метаболитов. Т_{1/2} составляет 35–45 ч. Выводится почками (60% — в виде неактивных метаболитов, 10% — в неизменном виде), а также с желчью и через кишечник (20–25% в виде метаболитов).

Показания к применению:

• профилактика приступов стенокардии;

• артериальная гипертензия.

Противопоказания:

• повышенная чувствительность к составу препарата;

• выраженная артериальная гипотензия Атриовентрикулярная блокада II и III степени;

• синдром слабости синусового узла;

• синоаурикулярная блокада;

• острая сердечная недостаточность;

• хроническая сердечная недостаточность II Б - III стадии декомпенсированная;

• выраженная брадикардия;

• метаболический ацидоз, бронхиальная астма, хроническая обструктивная болезнь легких;

• стенокардия Принцметала;

• кардиомиопатия без признаков сердечной недостаточности;

• одновременный прием с ингибиторами МАО,

• возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

С осторожностью: атриовентрикулярная блокада I степени, нарушение функции печени, стеноз устья аорты, ХСН (в стадии компенсации), ХПН, феохромоцитомы, сахарный диабет, гипогликемия, тиреотоксикоз, облитерирующие заболевания периферических сосудов («перемежающая» хромота, синдром Рейно), миастения, депрессия (в т.ч. в анамнезе), псориаз, пожилой возраст.

Беременность и период лактации:

Беременными следует назначать Авторекс-А только в тех случаях, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Препарат выделяется с грудным молоком, поэтому в период кормления его следует принимать только в исключительных случаях с большой осторожностью.

Способ применения и дозы:

Внутрь, запивая необходимым количеством жидкости.

При *артериальной гипертензии* и *стенокардии* доза составляет 1 таблетка в сутки.

При необходимости суточная доза может быть увеличена до 2 таблеток в сутки.

Нельзя резко прерывать лечение из-за опасности развития тяжелых аритмий и инфаркта миокарда. Отмену проводят постепенно, снижая дозу в течение 2 недель и более (снижают дозу на 25% в 3–4 дня).

Побочные действия:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердечная недостаточность, нарушение AV проводимости, брадикардия, выраженное снижение АД, сердцебиение, одышка, приливы крови к коже лица.

Со стороны пищеварительного тракта: сухость во рту, тошнота, рвота, диарея, абдоминальная боль, запор; редко - повышение активности «печеночных» трансаминаз, холестатическая желтуха.

Со стороны нервной системы и органов чувств: головокружение, нарушение сна, снижение способности к концентрации внимания, сонливость, депрессия, галлюцинации, вялость, чувство усталости, головная боль; редко - изменение настроения, астения, нарушение зрения, парестезии.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: мышечные судороги, миалгия.

Со стороны дыхательной системы: диспноэ, бронхоспазм, апноэ.

Со стороны органов кровообращения: тромбоцитопеническая пурпура, анемия (апластическая), тромбоз. *Со стороны эндокринной системы:* снижение потенции и/или либидо, гинекомастия.

Аллергические реакции: крапивница, дерматиты, зуд, фотосенсибилизация, редко - мультиформная экссудативная эритема.

Прочие: учащение мочеиспускания, периферические отеки, гиперплазия десен, гиперлипидемия, гипогликемия.

Передозировка:

Симптомы: выраженная брадикардия, атриовентрикулярная блокада II–III степени, нарастание симптомов сердечной недостаточности, выраженное снижение АД, бронхоспазм, гипогликемия.

Лечение: при выраженной брадикардии показан внутривенное введение 1 мл 0,1% раствора атропина. При атриовентрикулярной блокаде II и III степени возможно назначение изопrenalина в таблетках по 5 мг под язык (при необходимости — повторный прием через 2–4 ч), внутривенное капельное или медленное струйное его введение в дозе 0,5–1 мг; при возникновении бронхоспазма показаны бета-адреномиметики; для восстановления тонуса сосудов — сосудосуживающие препараты (при отсутствии противопоказаний к их применению); эффективен гемодиализ.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение атенолола с инсулином и др. пероральными гипогликемическими средствами может маскировать симптомы гипогликемии. Гипотензивный эффект ослабляют эстрогены, ГКС, минералокортикостероиды, НПВП (задержка Na⁺). Одновременное применение атенолола с сердечными гликозидами повышает риск развития брадикардии и нарушения AV проводимости; с резерпином, метилдопом, клонидином, верапамилом - риск возникновения выраженной брадикардии. Лидокаин замедляет выведение атенолола и повышает риск возникновения побочных эффектов. Фенитоин при внутривенном введении, средства для общей анестезии (производные углеводородов) усиливают кардиодепрессивный эффект атенолола и риск чрезмерного снижения АД. Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами МАО. Аллергены, используемые для иммунотерапии, или экстракты аллергенов для кожных проб и йодосодержащие рентгеноконтрастные вещества для внутривенного введения повышают риск возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии. Амидарон повышает риск развития брадикардии и замедление AV проводимости. Циметидин увеличивает концентрацию атенолола в плазме (тормозит метаболизм). Пролонгирует действие недеполяризующих миорелаксантов, антикоагуляционный эффект кумаринов.

Особые указания:

Мониторинг больных должен включать наблюдение за ЧСС и АД (в начале лечения - ежедневно, затем 1 раз в 3–4 месяца), контроль концентрации глюкозы крови у больных сахарным диабетом (1 раз в 4–5 месяцев). У пожилых пациентов рекомендуется оценивать функцию почек (1 раз в 4–5 мес). Следует обучить больного методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50 ударов/мин. При тиреотоксикозе препарат может маскировать некоторые клинические признаки гипертиреоза (например тахикардию). Резкая отмена у больных с тиреотоксикозом противопоказана (во избежание риска обострения заболевания). В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов практически не усиливает выраженную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление концентрации глюкозы в крови до нормального уровня. У больных с ИБС резкая отмена препарата может вызвать увеличение частоты или тяжести ангинальных приступов, поэтому прекращение приема у больных ИБС необходимо проводить постепенно. Особого внимания также требует подбор доз у больных с компенсированной ХСН, а также в случаях, когда требуется хирургическое вмешательство под общей анестезией. Прием препарата следует прекратить за 48 ч до хирургического вмешательства. В качестве анестетика следует выбирать препарат с возможным минимальным отрицательным инотропным действием. При необходимости прекращения лечения одновременно назначаемых атенолола и клонидина прием атенолола прекращают на несколько дней раньше клонидина (во избежание развития синдрома «отмены» последнего). Возможно усиление выраженности аллергических реакций и отсутствие эффекта от обычных доз эпинефрина на фоне отягощенного аллергологического анамнеза. Препараты, снижающие запасы катехоламинов (например резерпин), могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому бета-адреноблокаторы такие сочетания препаратов, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления чрезмерного снижения АД или брадикардии. В случае появления у больных пожилого возраста выраженной брадикардии (менее 50 ударов/мин), чрезмерного снижения АД (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.), атриовентрикулярной блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени и почек необходимо уменьшить дозу или прекратить лечение. При развитии депрессии, вызванной приемом препарата, рекомендуется прекратить терапию. Внутривенное введение верапамила следует делать не менее чем через 48 ч после приема препарата. При применении атенолола возможно уменьшение продукции слезной жидкости, что имеет значение для пациентов, пользующихся контактными линзами. Нельзя резко прерывать лечение из-за опасности развития тяжелых аритмий и инфаркта миокарда. Отмену проводят постепенно, снижая дозу в течение 2 недель и более (снижают дозу на 25% в 3–4 дня). Следует отменить препарат перед исследованием концентрации в крови и моче катехоламинов, ванилилиндиальной кислоты, титров антинуклеарных антител.

У курящих эффективность бета-адреноблокаторов снижается.

Не следует резко отменять препарат у больных, страдающих ИБС.

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций (в т.ч. вождение транспорта).

Форма выпуска:

10 таблеток для приема внутрь в каждом блистере алу-алу. 3 блистера вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С и в местах, недоступных для детей.

Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

По рецепту врача.

Произведено для:

BELINDA Laboratories

Лондон, Великобритания

Производитель:

Юнимакс Лабораторис

Индия

belinda.tj



Belinda