Инструкция по применению
Амиодарон Таблетки 200 мг 30 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Авва Рус
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Амиодарон
Количество в упаковке: 1



Описание

Круглые плоскоцилиндрические таблетки от белого до светло-коричневого цвета с фаской и риской.

Действующее вещество

Амиодарон

Состав

Состав на одну таблетку: Действующее вещество: амиодарона гидрохлорид - 200,0 мг. Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая 102 - 61,6 мг, крахмал картофельный - 20,0 мг, повидон К-17 - 8,6 мг, кроскармеллоза натрия - 6,0 мг, магния стеарат - 3,0 мг, кремния диоксид коллоидный - 0,8 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Абсорбция медленная и вариабельная - 30-50%, биодоступность - 30-50%. Максимальная концентрация в плазме крови (Cmax) отмечается через 4-7 ч. Диапазон терапевтической плазменной-концентрации - 1-2,5 мг/л (но при определении дозы необходимо иметь в виду и клиническую картину). Объем распределения - 60 л, что свидетельствует об интенсивном распределении в, ткани. Обладает высокой, жирорастворимостью, в высоких концентрациях находится в жировой ткани и органах с хорошим кровоснабжением (концентрация в жировой ткани, печени, почках, миокарде выше, чем в плазме - соответственно, в 300, 200, 50 и 34 раза). Особенности фармакокинетики амиодарона обусловливают необходимость применения препарата в высоких нагрузочных дозах. Проникает через гематоэнцефалический барьер (ГЭБ) и плаценту (10-50%), секретируется с грудным молоком (25% дозы, полученной матерью). Связь с белками плазмы крови около 95% (62% - с альбумином, 33,5% - с бета-липопротеинами). Метаболизируется в печени. Основной метаболит - дезэтиламиодарон - фармакологически активен и может усиливать антиаритмический эффект основного соединения. Возможно, также путем дейодирования (при дозе 300 мг выделяется примерно 9 мг элементарного йода). При продолжительном лечении концентрации йода могут достигать 60-80 % концентраций амиодарона. Амиодарон является ингибитором изоферментов, CYP2C9, CYP2D6 и CYP3A4, CYP3A5, CYP3A7 в печени. Учитывая способность к кумуляции и связанную с этим, большую вариабельность фармакокинетических параметров, данные по периоду полувыведения (T1/2) противоречивы. Выведение амиодарона после приема внутрь осуществляется в 2 фазы: начальный период - 4-21 ч, во второй фазе T1/2 - 25-110 дней. После продолжительного приема внутрь средний T1/2 - 40 дней (это имеет важное значение при выборе дозы, т.к., возможно, необходим, по крайней мере, 1 мес. для стабилизации новой плазменной концентрации, в то время как полное выведение может продлиться более 4 месяцев). Выведение амиодарона начинается через несколько дней, а достижение равновесия между поступлением и выведением препарата (достижение равновесного состояния) наступает спустя от одного до нескольких месяцев, в зависимости от индивидуальных особенностей пациента. Выводится с желчью (85-95%), почками выводится менее 1% принятой внутрь дозы (поэтому при нарушенной функции почек нет необходимости в изменении дозировки). Амиодарон и его метаболиты не подвергаются гемодиализу.

Показания

Профилактика рецидивов: угрожающих жизни желудочковых аритмий (в т.ч. желудочковая тахикардия, фибрилляция желудочков). наджелудочковых пароксизмальных тахикардий (в, т.ч. при органических заболеваниях сердца, а также при неэффективности или невозможности др. антиаритмической терапии, связанные с синдромом Вольфа-Паркинсона-Уайта (WPW-синдром): мерцательной аритмии (фибрилляции предсердий) и трепетания предсердий. Профилактика внезапной смерти вследствие аритмии у пациентов из группы высокого риска: пациенты после недавно перенесенного инфаркта миокарда с количеством желудочковых экстрасистол более 10 в ч, клинические проявления хронической сердечной недостаточности и фракцией выброса левого желудочка менее 40%.

Способ применения и дозы

Применять только по назначению врача. Таблетки принимают внутрь целиком во время или после приема пищи, запивая достаточным количеством жидкости. Режим дозирования устанавливается индивидуально и корректируется врачом. Насыщающая доза В стационаре: начальная доза, разделенная на несколько приемов, составляет от 600-800 мг (до максимальной 1200 мг) в сутки до достижения суммарной дозы 10 г (обычно в течение 5-8 дней). Амбулаторно: начальная доза, разделенная на несколько приемов, составляет от 600 до 800 мг в сутки до достижения суммарной дозы 10 г (обычно в течение 10-14 дней). Поддерживающая доза При поддерживающем лечении применяется наименьшая эффективная доза в зависимости от индивидуальной реакции пациента и обычно составляет от 100-400 мг/сут. (1/2-2 таб.) в 1-2 приема. Вследствие длительного периода полувыведения препарат можно принимать через день или делать перерыв в приеме препарата 2 дня в неделю. Средняя терапевтическая разовая доза - 200 мг. Средняя терапевтическая суточная доза - 400 мг. Максимальная разовая доза - 400 мг. Максимальная суточная доза - 1200 мг.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к йоду, к амиодарону или к другим препарата синдром слабости синусового узла, синусовая брадикардия и синоатриальная блокада (при отсутствии кардиостимулятора) атриовентрикулярная блокада II-III степени, двух-, трехпучковые блокады (при отсутствии кардиостимулятора) врожденное или приобретенное удлинение интервала QT гипомагниемия нарушение функции щитовидной железы (гипо- и гипертиреоз) беременность и период лактации (грудное вскармливание) гипокалиемия интерстициальные болезни легких прием ингибиторов моноаминоксидазы (МАО) возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены) одновременный приём с препаратами, которые могут удлинять интервал QT и вызывать развитие пароксизмальных тахикардий, включая полиморфную желудочковую тахикардию типа "пируэт": 1. антиаритмические средства IA класса (хинидин, дизопирамид, прокаинамид), антиаритмические средства III класса (дофетилид, ибутилид, бретилия тозилат), соталол,2. другие (не антиаритмические) средства, такие как, бепридил, винкамин, некоторые нейролептики: фенотиазины (хлорпромазин, циамемазин, левомепромазин, тиоридазин, трифлуоперазин, флуфеназин), бензамиды (амисульприд, сультоприд, сульпирид, тиаприд, вералиприд), бутирофеноны (дроперидол, галоперидол), сертиндол, пимозид, цизаприд, трициклические антидепрессанты, макролидные антибиотики (в частности эритромицин при внутривенном введении, спирамицин), азолы, противомалярийные средства (хинин, хлорохин, мефлохин, галофантрин), пентамидин при парентеральном введении, дифеманила метилсульфат, мизоластин, астемизол, терфенадин, фторхинолоны.

Применение при беременности и кормлении грудью

Противопоказан к применению в период беременности. Амиодарон выделяется с грудным молоком в значительных количествах, поэтому препарат противопоказан к применению в период грудного вскармливания. При необходимости применения препарата в период лактации следует отменить грудное вскармливание.

Побочные действия

Частота побочных эффектов была определена следующим образом: очень часто (≥ 10%), часто (≥1%, Со стороны сердечно-сосудистой системы: Часто Умеренная брадикардия, выраженность которой зависит от дозы препарата. Снижение артериального давления (обычно умеренное или преходящее). Нечасто Нарушения проводимости (синоатриальная блокада, атриовентрикулярная блокада различных степеней). Проаритмогенное действие (имеются сообщения о возникновении новых аритмий, или усугублении существующих, в некоторых случаях - с последующей

остановкой сердца). Выраженная брадикардия или, в исключительных случаях, остановка синусового узла, которые отмечались у некоторых пациентов (пациенты с дисфункцией синусового узла и пациенты пожилого возраста). Частота неизвестна Прогрессирование хронической сердечной недостаточности (при длительном применении). Со стороны органов кроветворения: Очень редко Тромбоцитопения. Гемолитическая анемия. Апластическая анемия. Частота неизвестна Нейтропения. Агранулоцитоз. Со стороны пищеварительной системы: Очень часто Тошнота, рвота, притупление или потеря вкусовых ощущений, металлический привкус во рту, ощущение тяжести в эпигастрии особенно в начале лечения, проходящие после уменьшения дозы. Повышение активности "печеночных" трансаминаз в сыворотке крови, обычно умеренное (1,5-3 кратное превышение нормальных значений) и снижающееся при уменьшении дозы или даже спонтанно. Часто Острое поражение печени с повышением "печеночных" трансаминаз и/или желтухой, включая развитие печеночной недостаточности, иногда фатальной (см. Особые указания). Очень редко Хронические заболевания печени (псевдоалкогольный гепатит, цирроз), иногда фатальные. Частота неизвестна Панкреатит/острый панкреатит. Сухость слизистой оболочки полости рта. Запор. Снижение аппетита. Со стороны дыхательной системы: Часто Интерстициальный или альвеолярный пневмонит и облитерирующий бронхиолит с пневмонией (иногда заканчивающихся летальным исходом), плеврит. Выраженная одышка или сухой кашель, как сопровождающиеся, так и не сопровождающиеся ухудшением общего состояния (повышенной утомляемостью, снижением массы тела, повышением температуры тела). Очень редко Бронхоспазм у пациентов с тяжелой дыхательной недостаточностью, особенно у пациентов с бронхиальной астмой. Острый респираторный дистресс синдром, иногда с летальным исходом и иногда непосредственно после хирургических вмешательств (предполагается возможность взаимодействия с высокими дозами кислорода) (см. "Особые указания"). Частота неизвестна Легочное кровотечение. Со стороны органов чувств: Очень часто Микроотложения в эпителии роговицы, состоящие из сложных липидов, включая липофусцин, исчезающие после отмены препарата. Перерождение роговицы. Скотома. Очень редко Неврит зрительного нерва/зрительная нейропатия. Частота неизвестна Паросмия. Со стороны обмена веществ: Часто Гипотиреоз с его классическими проявлениями: увеличением массы тела, зябкостью, апатией, сниженной активностью, сонливостью, чрезмерной по сравнению с ожидаемым действием амиодарона брадикардией. Гипертиреоз. Очень редко Синдром нарушения секреции антидиуретического гормона. Со стороны кожных покровов: Очень часто Фоточувствительность. Часто Сероватая или голубоватая пигментация кожи (в случае продолжительного применения препарата в высоких суточных дозах). Очень редко Случаи эритемы (в ходе лучевой терапии), кожная сыпь, обычно малоспецифичная, крапивница, отдельные случаи эксфолиативного дерматита (связь с препаратом не

установлена). Алопеция. Частота неизвестна Ангионевротический отек. Мультиформная эритема. Экзема. Тяжелые кожные реакции, иногда фатальные, включая токсический эпидермальный некролиз/синдром Стивенса-Джонсона. Буллезный дерматит. Со стороны центральной нервной системы: Часто Тремор или другие экстрапирамидные симптомы. Нарушения сна, в том числе кошмарные сновидения. Редко Сенсомоторные, моторные и смешанные периферические нейропатии и/или миопатия, обычно обратимые после отмены препарата. Очень редко Мозжечковая атаксия, доброкачественная внутричерепная гипертензия (псевдоопухоль головного мозга), головная боль. Частота неизвестна Паркинсонизм. Спутанность сознания / делирий. Галлюцинации. Аллергические реакции: Частота неизвестна Анафилактические/анафилактоидные реакции, включая шок. Лекарственная реакция с эозинофилией и системными симптомами. Прочие: Очень редко Васкулит, эпидидимит, несколько случаев импотенции (связь с препаратом не установлена), боли в поясничном и крестцовом отделе позвоночника, перерождение желтого тела. Частота неизвестна Снижение либидо.

Передозировка

В случае появления токсичности в виде проаритмогенного эффекта препарат отменяют. Симптомы: усугубление течения хронической сердечной недостаточности, снижение артериального давления синусовая брадикардия, аритмии, атриовентрикулярная блокада, остановка сердца, приступы желудочковой тахикардии, пароксизмальной тахикардии типа „пируэт”, нарушения функции печени. Лечение: промывание желудка и прием активированного угля, в случае если препарат принят недавно. В остальных случаях проводят симптоматическую терапию. Специфического антидота нет, гемодиализ не эффективен, Амиодарон и его метаболиты не удаляются при диализе. При развитии брадикардии возможно назначение атропина, бета1-адреностимуляторов, в тяжелых случаях - постановка искусственного водителя ритма (или кардиостимулятора). При тахикардии типа "пируэт" - внутривенное введение солей магния, постановка искусственного водителя ритма (или кардиостимулятора).

Взаимодействие с другими препаратами

Противопоказанные комбинации: Одновременный прием с препаратами, которые могут удлинять интервал QT и вызывать развитие пароксизмальных тахикардий, включая полиморфную желудочковую тахикардию типа "пируэт": антиаритмические средства IA класса (хинидин, дизопирамид, прокаинамид), антиаритмические средства III класса (дофетилид, ибутилид, бретилия тозилат), соталол, другие (не антиаритмические) средства, такие как, бепридил, винкамин, некоторые

нейролептики: фенотиазины (хлорпромазин, циамемазин, левомепромазин, тиоридазин, трифлуоперазин, флуфеназин), бензамиды (амисульприд, сультоприд, сульпирид, тиаприд, вералиприд), бутирофеноны (дроперидол, галоперидол), сертиндол, пимозид, цизаприд, трициклические антидепрессанты, макролидные антибиотики (в частности эритромицин, при внутривенном введении, спирамицин), азолы, противомалярийные средства (хинин, хлорохин, мефлохин, галофантрин), пентамидин при парентеральном введении,, дифеманила метилсульфат, мизоластин, астемизол, терфенадин, фторхинолоны. Нерекомендуемые комбинации: с бета-адреноблокаторами, некоторыми блокаторами "медленных" кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), т.к. могут развиться нарушения автоматизма (брадикардия) и проводимости, со слабительными средствами, которые могут вызвать гипокалиемию, т. к. увеличивается риск развития желудочковой тахикардии типа "пируэт" Комбинации, при которых следует проявить осторожность: с препаратами, вызывающими гипокалиемию (диуретики, системные глюкокортикостероидами, тетракозактид, амфотерицин В (внутривенно), т.к. возможно развитие желудочковой тахикардии типа "пируэт",. с антикоагулянтами, для приема внутрь, т.к. увеличивается риск, развития кровотечений (необходимо контролировать МНО (международное нормализованное отношение) и корректировать дозу антикоагулянтов), с сердечными гликозидами, т.к. могут наблюдаться нарушения автоматизма (проявляются брадикардией) и нарушения атриовентрикулярной проводимости. Кроме того, возможно увеличение концентрации дигоксина в плазме крови, за счет снижения его клиренса (необходимо контролировать концентрацию дигоксина в плазме крови, ЭКГ (электрокардиограмма) - контроль), прокаинамид - риск развития побочных эффектов прокаинамида (Амиодарон повышает плазменную концентрацию прокаинамида и его метаболита N-ацетилпрокаинамида), эсмолол - нарушение сократимости, автоматизмами проводимости (подавление компенсаторных реакций симпатической нервной системы). Требуется клинический и электрокардиографический (ЭКГ) контроль. фенитоин, фосфенитоин - риск развития неврологических нарушений (Амиодарон повышает концентрацию фенитоина за счет ингибирования изофермента CYP2C9), флекаинид - Амиодарон повышает его концентрацию (за счет ингибирования изофермента CYP2D6), лекарственные средства, метаболизирующиеся с участием изофермента CYP3A4 (циклоспорин, фентанил, лидокаин, такролимус, силденафил, мидазолам, триазолам, дигидроэрготамин, эрготамин, ингибиторы ГМГ-КоА-редуктазы, в т.ч. симвастатин) - Амиодарон повышает их концентрацию (риск развития их токсичности и/или усиление фармакодинамических эффектов), орлистат - снижает концентрацию амиодарона и его активного метаболита в плазме крови, клонидин, гуанфацин, ингибиторы холинэстеразы (донепезил, галантамин, ривастигмин, такрин, амбенония хлорид, пиридостигмин, неостигмин), пилокарпин - риск развития выраженной брадикардии (кумулятивный эффект), циметидин, грейпфрутовый сок -

замедляют метаболизм амиодарона и повышают его плазменную концентрацию, лекарственные средства, для ингаляционного наркоза риск развития брадикардии (резистентной к введению атропина), снижения артериального давления, нарушения проводимости, снижения сердечного выброса, острого дыхательного дистресс-синдрома, в т.ч. фатального, развитие которого связывают с высокими концентрациями кислорода, радиоактивный йод - Амиодарон (содержит в своем составе йод) может нарушать поглощение радиоактивного йода, что может искажать результаты радиоизотопного исследования щитовидной железы, рифампицин и препараты зверобоя продырявленного (мощные индукторы - изофермента CYP3A4) - снижают концентрацию амиодарона в плазме, ингибиторы ВИЧ-протеазы (ингибиторы изофермента CYP3A4) - могут повышать плазменные концентрации амиодарона, клопидогрел - возможно снижение его плазменной концентрации, декстрометорфан (субстрат изоферментов CYP3A4 и CYP2D6) -. возможно повышение его концентрации (Амиодарон ингибирует изофермент CYP2D6).

Особые указания

Перед началом приема Амиодарона рекомендуется провести исследование ЭКГ и определение уровня калия в крови. Гипокалиемия должна быть откорректирована до начала применения амиодарона. В связи с тем, что Амиодарон может вызывать гипотиреоз и гипертиреоз, перед приемом препарата следует провести клиническое и лабораторное (ТТГ) обследование щитовидной железы. Пациентов следует предупредить о том, чтобы они во время лечения избегали воздействия прямых солнечных лучей или принимали защитные меры (например, применение солнцезащитного крема, ношение соответствующей одежды). Частота и тяжесть побочных эффектов зависят от дозы препарата, поэтому следует применять минимальные эффективные поддерживающие дозы Амиодарона, чтобы минимизировать возможность их возникновения. У пациентов длительно получающих лечение по поводу нарушений ритма сердца сообщалось о случаях повышения частоты фибрилляции желудочков и/или увеличения порога срабатывания кардиостимулятора или имплантированного дефибриллятора, что может снижать их эффективность. Поэтому перед началом и во время лечения препаратом Амиодарон следует регулярно проверять правильность их функционирования. Во время лечения необходимо каждые 3 месяца контролировать ЭКГ (ширина комплекса QRS и длительность интервала QT), при этом необходимо учитывать, что у пожилых пациентов отмечается более выраженная брадикардия. При применении амиодарона возможны изменения ЭКГ: удлинение интервала QT с возможным появлением зубца U. При появлении атриовентрикулярной блокады II и III степени, синоатриальной блокады, а также блокады ножек пучка Гисса лечение Амиодароном следует

немедленно прекратить. В период лечения Амиодароном необходимо регулярно проводить контроль активности трансаминаз (при повышении уровня трансаминаз в 3 раза или в 2 раза, в случае исходно повышенной их активности, дозу Амиодарона уменьшают вплоть до полного прекращения терапии) и других показателей функции печени. Препарат содержит йод, поэтому может оказывать влияние на результаты тестов накопления радиоактивного йода в щитовидной железе. Поэтому перед началом лечения, во время его проведения и на протяжении нескольких месяцев после окончания лечения необходимо проводить исследования функции щитовидной железы. Во время лечения амиодароном и в течение нескольких месяцев после его прекращения следует регулярно оценивать функцию щитовидной железы (уровень содержания гормонов). При выявлении гипертиреоза Амиодарон должен быть отменен. Прогрессирующая одышка и непродуктивный кашель могут быть признаками поражения легких. Вне зависимости от наличия или отсутствия во время лечения амиодароном легочной симптоматики рекомендуется каждые 6 месяцев проводить рентгенологическое исследование грудной клетки и легочные функциональные пробы. Перед проведением хирургических вмешательств, а также оксигенотерапии необходимо предупредить врача о применении Амиодарона, поскольку отмечались редкие случаи развития острого респираторного дистресс-синдрома у взрослых в послеоперационном периоде. Следует соблюдать осторожность при применении препарата во время проведения общей анестезии, возможен риск развития брадикардии, выраженного снижения артериального давления, нарушения проводимости и уменьшения ударного объема сердца. В процессе лечения следует проводить офтальмологическое исследование (выявление значительных отложений на роговице и нарушение зрения требуют отмены Амиодарона). При отмене препарата возможны рецидивы нарушений ритма. После отмены фармакодинамический эффект сохраняется в течение 10-30 дней.Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.:В период лечения Амиодароном следует воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения

В оригинальной упаковке (пачке) при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.