



ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата

Каптоприл

Регистрационный номер: P N001920/01

Торговое название: Каптоприл

Международное непатентованное название: каптоприл

Лекарственная форма: таблетки

Состав:

1 таблетка содержит

Активное вещество: каптоприл 25 мг или 50 мг

Вспомогательные вещества: гранулят Лудипресс (лактозы моногидрат, повидон, кросповидон), магния стеарат или лактозы моногидрат, повидон, кросповидон, магния стеарат.

Описание:

Таблетки белого цвета плоскоцилиндрические с фаской и риской (Каптоприл 25 мг) или крестообразной риской (Каптоприл 50 мг), с характерным запахом. Допускается легкая неровность поверхности.

Фармакотерапевтическая группа: ингибитор ангиотензин-превращающего фермента (АПФ)

КОД АТХ: C09AA01

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Каптоприл - ингибитор ангиотензин-превращающего фермента (АПФ). Уменьшает образование ангиотензина II из ангиотензина I. Снижение содержания ангиотензина II ведет к прямому уменьшению выделения альдостерона. При этом снижается общее периферическое сосудистое сопротивление, артериальное давление, пост- и преднагрузка на сердце. Расширяет артерии в большей степени, чем вены. Вызывает уменьшение деградации брадикинина (один из эффектов АПФ) и увеличение синтеза простагландина.

Гипотензивный эффект не зависит от активности ренина плазмы, снижение артериального давления отмечают при нормальном и даже сниженном уровне гормона, что обусловлено воздействием на тканевые ренин-ангиотензивные системы. Усиливает коронарный и почечный кровоток.

При длительном применении снижает выраженность гипертрофии миокарда и стенок артерий резистивного типа. Улучшает кровоснабжение ишемизированного миокарда. Уменьшает агрегацию тромбоцитов. Способствует снижению содержания ионов натрия у больных с сердечной недостаточностью.

Снижение артериального давления (АД) в отличие от прямых вазодилататоров (гидразина, миноксидила и пр.) не сопровождается рефлекторной тахикардией и приводит к снижению потребности миокарда в кислороде. При сердечной недостаточности в адекватной дозе не влияет на величину АД.

Максимальное снижение АД после приема внутрь наблюдается через 60-90 мин. Длительность гипотензивного эффекта дозозависимо и достигает оптимальных значений в течение нескольких недель.

Фармакокинетика

Абсорбция – быстрая, достигает 75 % (прием пищи снижает на 30-40 %), биодоступность – 35-40 % (эффект «первого прохождения» через печень). Связь с белками плазмы крови (преимущественно с альбуминами) – 25-30 %; максимальная концентрация в плазме крови (114 нг/мл) при пероральном приеме – 30-90 мин. Через гематоэнцефалический барьер и плацентарный барьер проникает плохо (менее 1 %).

Метаболизируется в печени с образованием дисульфидного димера каптоприла и каптоприл-цистеиндисульфида. Метаболиты фармакологически неактивны.

Период полувыведения составляет – 3 ч; выводится почками 95 % (40-50 % в неизменном виде), остальная часть в виде метаболитов. Секретируется с материнским молоком. Через 4 ч после однократного приема внутрь в моче содержится 38 % неизменного каптоприла и 28 % в виде метаболитов, через 6 ч – только в виде метаболитов; в суточной моче – 38 % неизменного каптоприла и 62 % - в виде метаболитов.

Период полувыведения при нарушенной почечной функции – 3,5-32 ч. Кумулирует при хронической почечной недостаточности.

Показания к применению

Артериальная гипертензия, в т.ч. реноваскулярная; хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии); нарушения функции левого желудочка после перенесенного инфаркта миокарда при клинически стабильном состоянии; диабетическая нефропатия на фоне сахарного диабета типа 1 (при альбуминурии более 30 мг/сут).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к каптоприлу или другим ингибиторам АПФ; ангионевротический отек (в анамнезе на фоне терапии ингибиторами АПФ или наследственный); выраженные нарушения функции печени и/или почек; гиперкалиемия; двусторонний стеноз почечных артерий, стеноз артерии единственной почки с прогрессирующей азотемией, состояние после трансплантации почек, стеноз устья аорты и аналогичные изменения, затрудняющие отток крови из левого желудочка; беременность, период лактации, возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

С осторожностью

Тяжелые аутоиммунные заболевания соединительной ткани (в т.ч. системная красная волчанка, склеродермия), угнетение костномозгового кроветворения (риск развития нейтропении и агранулоцитоза), ишемия головного мозга, сахарный диабет (повышен риск развития гиперкалиемии), больные, находящиеся на гемодиализе, диета с ограничением натрия, первичный гиперальдостеронизм, ишемическая болезнь сердца, состояния, сопровождающиеся снижением объема циркулирующей крови (в том числе рвота, диарея), пожилой возраст (требуется коррекция доз).

Применение при беременности и в период лактации

Препарат противопоказан при беременности и в период вскармливания.

При наступлении беременности прием препарата должен быть немедленно прекращен.

Способ применения и дозы

Каптоприл назначают внутрь за час до еды. Режим дозирования устанавливается индивидуально.

При артериальной гипертензии Каптоприл назначают в начальной дозе 12,5 мг 2 раза в сутки. При необходимости дозу постепенно (с интервалом 2-4 недели) увеличивают до достижения оптимального эффекта. При мягкой и умеренной артериальной гипертензии обычная поддерживающая доза составляет 25 мг 2 раза в сутки; максимальная доза – 50 мг 2 раза в сутки. При тяжелой артериальной гипертензии начальная доза составляет 12,5 мг 2 раза в сутки. Дозу постепенно увеличивают до максимальной суточной дозы 150 мг (по 50 мг 3 раза в сутки).

Для лечения хронической сердечной недостаточности Каптоприл назначают в тех случаях, когда применение диуретиков не обеспечивает адекватного эффекта. Начальная суточная доза составляет 6,25 мг 3 раза в сутки. В дальнейшем, при необходимости, дозу постепенно (с интервалами не менее 2-х недель) увеличивают. Средняя поддерживающая доза составляет 25 мг 2-3 раза в сутки, а максимальная -150 мг в сутки.

При нарушениях функции левого желудочка после перенесенного инфаркта миокарда у пациентов, находящихся в клинически стабильном состоянии, применение Каптоприла можно начинать уже через 3 дня после инфаркта миокарда. Начальная доза составляет 6,25 мг в сутки, затем суточную дозу можно увеличивать до 37,5-75 мг за 2-3 приема (в зависимости от переносимости каптоприла) вплоть до максимальной – 150 мг в сутки.

При диабетической нефропатии Каптоприл назначают в дозе 75-100 мг, разделенной на 2-3 приема. При инсулинзависимом диабете с микроальбуминурией (выделение альбумина 30-300 мг в сутки) доза препарата составляет 50 мг 2 раза в сутки. При общем клиренсе белка более 500 мг в день препарат эффективен в дозе 25 мг 3 раза в сутки.

Пациентам с нарушением функции почек при умеренной степени нарушения функции почек (клиренс креатинина (КК) не менее 30 мл/мин/1,73 м²) Каптоприл можно назначать в дозе 75-100 мг/сут. При более выраженной степени нарушений функции почек (КК менее 30 мл/мин/1,73 м²) начальная доза должна составлять не более 12,5 мг/сут; в дальнейшем, при необходимости, с достаточно длительными интервалами дозу Каптоприла постепенно повышают, но используют меньшую, чем обычно, суточную дозу препарата.

В пожилом возрасте доза Каптоприла подбирается индивидуально, терапию рекомендуется начинать с дозы 6,25 мг 2 раза в сутки и по возможности поддерживать ее на этом уровне.

При необходимости дополнительно назначают петлевые диуретики, а не диуретики тиазидного ряда.

Побочное действие

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия, тахикардия, периферические отеки, снижение артериального давления.

Со стороны дыхательной системы: сухой кашель, обычно проходящий после отмены препарата, бронхоспазм, отек легких.

Аллергические реакции: ангионевротический отек конечностей, лица, губ, слизистых оболочек, языка, глотки и гортани.

Со стороны центральной нервной системы: головная боль, головокружение, атаксия, парестезия, сонливость, нарушение зрения.

Со стороны водно-электролитного обмена: гиперкалиемия, гипонатриемия, протеинурия, повышенное содержание азота мочевины и креатинина в крови, ацидоз.

Со стороны органов кроветворения: нейтропения, агранулоцитоз, тромбоцитопения, анемия, положительный тест на антитела к ядерному антигену (редко).

Со стороны пищеварительной системы: нарушение вкуса, сухость во рту, стоматит, повышение активности ферментов печени, боли в животе, диарея, гепатит, гипербилирубинемия.

Передозировка

Симптомы: резкое снижение артериального давления.

Лечение: введение 0,9 % раствора натрия хлорида или других плазмозамещающих растворов, гемодиализ.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Повышает концентрацию дигоксина в плазме крови на 15-20 %.

Увеличивает биодоступность пропранолола.

Циметидин, замедляя метаболизм в печени, повышает концентрацию Каптоприла в плазме крови.

Комбинация с тиазидными диуретиками, вазодилататорами (миноксидил), верапамилом, бета-адреноблокаторами, трициклическими антидепрессантами, этанолом усиливает гипотензивный эффект Каптоприла.

Одновременное применение с калийсберегающими диуретиками (например, триамтерен, спиронолактон, амилорид), препаратами калия, калиевыми добавками, заменителями соли (содержат значительные количества калия) увеличивает риск развития гиперкалиемии.

При совместном применении Каптоприла с эстрогенами и индометацином (и, возможно, с другими нестероидными противовоспалительными препаратами) может отмечаться снижение гипотензивного действия.

При одновременном применении солей лития возможно увеличение концентрации лития в сыворотке крови.

Клонидин снижает выраженность гипотензивного эффекта Каптоприла.

Применение Каптоприла у пациентов, принимающих аллопуринол или прокаинамид, повышает риск развития нейтропении и/или синдрома Стивенса-Джонсона.

Применение Каптоприла у пациентов, принимающих иммунодепрессанты (например, циклофосфамид или азатиоприн), повышает риск развития гематологических нарушений.

Особые указания

Перед началом, а также регулярно в процессе лечения Каптоприлом следует контролировать функцию почек. У пациентов с хронической сердечной недостаточностью применяют под тщательным медицинским контролем.

На фоне длительного применения Каптоприла приблизительно у 20 % пациентов наблюдается увеличение мочевины и креатинина сыворотки крови более чем на 20 %, по сравнению с нормой или исходным значением. Менее чем у 5 % пациентов, особенно при тяжелых нефропатиях, требуется прекращение лечения из-за роста концентрации креатинина.

У пациентов с артериальной гипертензией при применении Каптоприла выраженная артериальная гипотензия наблюдается лишь в редких случаях; вероятность развития этого состояния повышается при повышенной потере жидкости и солей (например, после интенсивного лечения диуретиками), у пациентов с сердечной недостаточностью или находящихся на диализе.

Возможность резкого снижения артериального давления может быть сведена к минимуму при предварительной отмене (за 4-7 дней) диуретика или увеличении поступления натрия хлорида (приблизительно за неделю до начала приема), либо путем назначения Каптоприла в начале лечения в малых дозах (6,25-12,5 мг/сут).

В первые 3 месяца терапии ежемесячно контролируют число лейкоцитов крови, далее – 1 раз в 3 мес; у больных аутоиммунными заболеваниями в первые 3 мес – через каждые 2 нед, затем – каждые 2 мес. Если число лейкоцитов ниже 4000/мкл, показано проведение общего анализа крови, ниже 1000/мкл – прием препарата прекращают.

В некоторых случаях на фоне применения ингибиторов АПФ, в т.ч. Каптоприла, наблюдается повышение концентрации калия в сыворотке крови. Риск развития гиперкалиемии при применении ингибиторов АПФ повышен у пациентов с почечной недостаточностью и сахарным диабетом, а также принимающих калийсберегающие диуретики, препараты калия или др. препараты, вызывающие увеличение концентрации калия в крови (например, гепарин). Следует избегать одновременного применения калийсберегающих диуретиков и препаратов калия.

При проведении гемодиализа у пациентов, получающих Каптоприл, следует избегать использования диализных мембран с высокой проницаемостью (например, AN69), поскольку в таких случаях повышается риск развития анафилактических реакций.

В случае развития ангионевротического отека препарат отменяют и осуществляют тщательное медицинское наблюдение. Если отек локализуется на лице, специального лечения обычно не требуется (для уменьшения выраженности симптомов могут быть применены антигистаминные препараты); в том случае, если отек распространится на язык, глотку или гортань и имеется угроза развития обструкции дыхательных путей, следует немедленно ввести эпинефрин (адреналин) подкожно (0,5 мл в разведении 1: 1000).

При приеме Каптоприла может наблюдаться ложноположительная реакция при анализе мочи на ацетон.

В период лечения следует воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, т.к. возможно головокружение, особенно после приема начальной дозы.

С осторожностью назначают больным, находящимся на малосолевой или бессолевой диете (повышенный риск развития гипотензии) и гиперкалиемии.

В случае возникновения после приема Каптоприла симптоматической артериальной гипотензии пациенту следует принять горизонтальное положение с приподнятыми ногами.

Форма выпуска

Таблетки по 25 мг и 50 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Претензии направлять в адрес предприятия-производителя:

ООО «ФАРМАКОР ПРОДАКШН», Россия

Адрес производства:

198216, г. Санкт-Петербург, Ленинский пр., д. 140, лит. Ж

Адрес юридический:

194021, г. Санкт-Петербург, 2-й Муринский пр., д. 41, лит. А

тел./факс: (812) 325-23-15