ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
БЛОКОРДИЛ®
BLOCORDIL®

Регистрационный номер:
Торговое название: Блокордил®
Международное непатентованное название (МНН): каптоприл
Лекарственная форма: таблетки

Состав
1 таблетка содержит:

Активное вещество:	*12,5 mg*	*25 mg*	*50 mg*
Каптоприл	12,50 мг	25,00 мг	50,00 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, стеариновая кислота.

Описание
Таблетки 12,5 мг: круглые, слегка двояковыпуклые таблетки белого цвета, с фаской.
Таблетки 25 мг: круглые, слегка двояковыпуклые таблетки белого цвета с фаской и риской на одной стороне.
Таблетки 50 мг: круглые, слегка двояковыпуклые таблетки белого цвета с фаской и риской на одной стороне.

Фармакотерапевтическая группа: ангиотензинпревращающего фермента ингибитор
Код АТХ: C09AA01

Фармакологические свойства
Фармакодинамика
Ингибитор ангиотензинпревращающего 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 (ОПСС), артериальное давление (АД), пост- и преднагрузка на миокард. Расширяет артерии в большей степени, чем вены. Вызывает уменьшение деградации брадикинина (один из эффектов АПФ) и увеличение синтеза простагландинов. Гипотензивный эффект не зависит от активности ренина плазмы крови, снижение АД отмечается при нормальной и даже сниженной концентрации гормона, что обусловлено воздействием на ренин-ангиотензин-альдостероновую систему (РААС). Усиливает коронарный и почечный кровоток.
При длительном применении уменьшает выраженность гипертрофии миокарда и стенок артерий резистивного типа. Улучшает кровоснабжение ишемизированного миокарда. Уменьшает агрегацию тромбоцитов. Способствует снижению содержания натрия у больных с хронической сердечной недостаточностью (ХСН).
При приеме внутрь в дозе 50 мг/сут проявляет ангиопротекторные свойства в отношении сосудов микроциркуляторного русла и позволяет замедлить прогрессирование хронической почечной недостаточности (ХПН) при диабетической нефроангиопатии. Снижение АД не сопровождается рефлекторной тахикардией и приводит к снижению потребности миокарда в кислороде.
Максимальное снижение АД после приема внутрь наблюдается через 60-90 мин. Длительность гипотензивного эффекта дозозависима и достигает оптимальных значений в течение нескольких недель терапии.

Фармакокинетика

Абсорбция - быстрая, достигает 75% (при одновременном приеме с пищей всасывание снижается на 30-40%), биодоступность - 35-40% (имеет эффект "первого прохождения" через печень). Связь с белками плазмы крови (преимущественно с альбуминами) - 25-30%. Время достижения максимальной концентрации в плазме крови (114 нг/мл) при приеме внутрь - 30-90 мин. Через гематоэнцефалический барьер и плацентарный барьер проникает незначительно (менее 1%).
Метаболизируется в печени с образованием дисульфидного димера каптоприла и каптоприл-цистеиндисульфида. Метаболиты фармакологически неактивны.
Период полувыведения (T1/2) составляет 3 ч. Выводится почками 95% (40-50% в неизмененном виде), остальная часть - в виде метаболитов. Через 4 ч после однократного приема внутрь в моче определяется 38% неизмененного каптоприла и 28% в виде метаболитов, через 6 ч – только в виде метаболитов; в суточной моче – 38% неизмененного каптоприла и 62% - в виде метаболитов. Секретируется с грудным молоком.
T 1/2 при нарушении функции почек – 3,5-32 ч. Кумулирует при хронической почечной недостаточности.
Фармакокинетика каптоприла у здоровых добровольцев пожилого возраста такая же, как у здоровых добровольцев молодого возраста. Пожилые пациенты с артериальной гипертензией и сохранной функцией почек могут принимать обычные дозы каптоприла.

Показания к применению

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

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к каптоприлу, другим компонентам препарата или другим ингибиторам АПФ (в т.ч. и в анамнезе);
- наследственный отек Квинке или идиопатический отек, ангионевротический отек (на фоне предшествующей терапии другими ингибиторами АПФ);
- гемодинамически значимый двусторонний стеноз почечных артерий или стеноз артерии единственной почки с азотемией;
- порфирия;
- возраст до 18 лет (безопасность и эффективность не установлены);
- беременность и период лактации;
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция.

С осторожностью

Гемодинамически значимый стеноз аорты, цереброваскулярные заболевания (в т.ч. недостаточность мозгового кровообращения) ишемия головного мозга, заболевания соединительной ткани, угнетение костномозгового кроветворения, сахарный диабет (риск развития гиперкалиемии), состояние после трансплантации почки, почечная и/или печеночная недостаточность, диета с ограничением потребления поваренной соли, состояния, сопровождающиеся снижением объема циркулирующей крови (ОЦК), в т.ч. диарея, рвота; пожилой возраст.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания
Препарат Блокордил® противопоказан к применению во время беременности и в период грудного вскармливания, т.к. обладает доказанным эмбриотоксическим действием и проникает в грудное молоко.
В случае необходимости применения препарата Блокордил® в период лактации, грудное вскармливание следует отменить.

Способ применения и дозы
Внутрь, регулярно, за 1 ч до или 2 ч после еды, запивая небольшим количеством жидкости, желательно в одно и тоже время суток.

Артериальная гипертензия
Рекомендуемая начальная доза составляет 12,5 мг 2 раза в сутки.
При необходимости дозу постепенно (с интервалом в 2-4 нед) увеличивают до достижения оптимального эффекта.
При артериальной гипертензии мягкой и умеренной степени тяжести, обычно, поддерживающая доза составляет 25 мг 2 раза в сутки; максимальная доза – 50 мг 2 раза в сутки.
При тяжелой артериальной гипертензии суточная доза – 150 мг (50 мг 3 раза в сутки).
Максимальная суточная доза – 150 мг.
У пациентов со злокачественной артериальной гипертензией рекомендуемая начальная доза составляет 12,5 мг или 25 мг препарата Блокордил® 2-3 раза в сутки.

Хроническая сердечная недостаточность
Начальная доза препарата Блокордил® составляет 12,5 мг 2-3 раза в сутки.
При необходимости, доза может быть увеличена через 2 - 4 недели до максимальной суточной дозы 150 мг.
Средняя поддерживающая доза от 25 мг до 50 мг 2-3 раза в сутки.

Нарушение функции левого желудочка (после инфаркта миокарда)
Терапию обычно начинают между 3-м и 16-м днем после перенесенного инфаркта миокарда.
Начальная доза – 6,25 мг в сутки (возможно применение каптоприла в другой лекарственной форме: таблетки по 12,5 мг с риской). Дозу постепенно, в течение нескольких недель, можно увеличить до 50 мг 3 раза в сутки.

Диабетическая нефропатия
Препарат Блокордил® применяют в дозе 75-100 мг в сутки в 2-3 приема. При сахарном диабете 1 типа 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. При умеренной степени нарушения функции почек (клиренс креатинина (КК) - не менее 30 мл/мин./1,73 $м^2$) препарат Блокордил® можно применять в дозе 75-100 мг/сут. При более выраженной степени нарушений функции почек (КК - менее 30 мл/мин./1.73 $м^2$) начальная доза должна составлять не более 12,5 мг/сут; в дальнейшем, при необходимости, дозу препарата Блокордил® увеличивают постепенно.
При необходимости дополнительно применяют «петлевые» диуретики.

Пожилые пациенты
При применении препарата Блокордил® у пожилых пациентов доза подбирается индивидуально, терапию рекомендуется начинать с дозы 6,25 мг 2 раза в сутки и по

возможности поддерживать ее на этом уровне (возможно применение каптоприла в другой лекарственной форме: таблетки по 12,5 мг с риской).
При необходимости дополнительно применяют «петлевые» диуретики.

Если пропущен приём одной дозы препарата Блокордил®, её необходимо принять как можно скорее, но если приближается время приёма следующей дозы, пропущенная таблетка не принимается, а приём препарата продолжается по прежней схеме. Пропущенный прием препарата не следует восполнять за счет разового увеличения дозы.

Побочное действие
Классификация частоты развития побочных эффектов Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ):
очень часто >1/10
часто от > 1/100 до < 1/10
нечасто от > 1/1000 до < 1/100
редко от >1/10000 до < 1/1000
очень редко от < 1/10000, включая отдельные сообщения.
Со стороны иммунной системы:
- очень редко: аутоиммунные заболевания и/или повышение титров антинуклеарных антител.

Со стороны нервной системы:
- часто: расстройства сна, нарушения вкуса, головокружение;
- редко: сонливость, головная боль и парестезии, чувство усталости, астения, общая слабость;
- очень редко: спутанность сознания, депрессия, цереброваскулярные нарушения, включая инсульт и обморок.

Со стороны органов чувств:
- очень редко: нарушения зрения.

Со сторны сердечно-сосудистой системы:
- редко: тахикардия, тахиаритмия, стенокардия напряжения, ощущение сердцебиения, выраженное снижение АД, периферические отеки;
- очень редко: остановка сердца, кардиогенный шок, синдром Рейно.

Со стороны дыхательной системы:
- часто: сухой, раздражающий (непродуктивный) кашель, одышка, бронхоспазм;
- очень редко: бронхоспазм, ринит, аллергический альвеолит/эозинофильный пневмонит.

Со стороны пищеварительной системы:
- часто: тошнота, рвота, гастрит, боль в животе, диарея, запор, сухость слизистой оболочки полости рта;
- редко: афтозные язвы внутренней поверхности слизистой оболочки щёк и языка, гипербилирубинемия;
- очень редко: глоссит, пептические язвы, панкреатит, нарушения функции печени, холестаз (в т.ч. желтуха), гепатит, в т.ч. некротический, повышение активности «печеночных» трансаминаз, интестинальный ангионевротический отек.

Со стороны кожных покровов:
- часто: кожный зуд, сыпь, алопеция;
- редко: ангионевротический отёк;
- очень редко: крапивница, синдром Стивенса-Джонсона, мультиформная эритема, фоточувствительность в форме эритемы, пемфигоидные реакции и эксфолиативный дерматит.

Со стороны опорно-двигательного аппарата:
- очень редко: миалгия, артралгия;

Со стороны половой и мочевыделительной системы:

59259

- редко: нарушения функции почек, полиурия, олигурия, учащенное мочеиспускание;
- очень редко: нефротический синдром, импотенция, гинекомастия;

Со стороны системы кроветворения и лимфатической системы:

- очень редко: нейтропения/агранулоцитоз, панцитопения (особенно у пациентов с нарушением функции почек), анемия (апластическая или гемолитическая), тромбоцитопения, лимфаденопатия, эозинофилия.

Общие:

- нечасто: боль в груди, слабость;
- очень редко: лихорадка;

Лабораторные показатели:

- очень редко: протеинурия, гиперкалиемия, гипонатриемия, повышение концентрации мочевины, креатинина и билирубина, повышение гематокрита, лейкопения, увеличение скорости оседания эритроцитов.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД, вплоть до коллапса, инфаркт миокарда, острое нарушение мозгового кровообращения, тромбоэмболические осложнения.

Лечение: перевести пациента в положение «лежа» на спине с приподнятыми вверх ногами; далее - промывание желудка, прием активированного угля, введение внутривенно 0,9% раствора натрия хлорида и проведение мероприятий, направленных на восстановление АД и увеличение ОЦК.

Симптоматическая терапия: эпинефрин (подкожно или внутривенно), антигистаминные средства.

Гемодиализ эффективен. Гемодиализный клиренс составляет от 4,8 л/ч до 7,2 л/ч, в зависимости от типа применяемого диализатора.

Перитонеальный диализ неэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Гипотензивный эффект каптоприла ослабляют индометацин и другие нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП), в т.ч. селективные ингибиторы циклооксигеназы-2 (задержка ионов натрия, снижение синтеза простагландинов, особенно на фоне низкой активности ренина) и эстрогены.

Комбинированное применение с калийсберегающими диуретиками, препаратами калия, калиевыми добавками, заменителями соли (содержат значительные количества ионов калия) увеличивает риск развития гиперкалиемии.

Применение ингибиторов АПФ у больных, подвергающихся хирургическому вмешательству с применением общей анестезии, может привести к выраженному снижению АД, особенно при применении средств для общей анестезии, оказывающих гипотензивное действие.

Замедляет выведение препаратов лития, повышая концентрацию лития в крови.

При применении каптоприла на фоне приема аллопуринола или прокаинамида повышается риск развития синдрома Стивенса-Джонсона и нейтропении.

При одновременном применении ингибиторов АПФ и препаратов золота (в/в натрия ауротиомалат) описан симптомокомплекс, включающий гиперемию лица, тошноту, рвоту и снижение АД.

Инсулин и гипогликемические средства для приема внутрь увеличивают риск развития гипогликемии.

Одновременный приём каптоприла с пищей или антацидами замедляет всасывание каптоприла в желудочно-кишечном тракте.

Во время терапии каптоприлом не рекомендуется употребление этанола, поскольку этанол усиливает гипотензивный эффект каптоприла.

Гипотензивный эффект каптоприла потенцируется при одновременном применении с алдеслейкином, алпростадилом, бета-адреноблокаторами, альфа$_1$-адреноблокаторами, центральными альфа$_2$-адреномиметиками, диуретиками, кардиотониками, блокаторами «медленных» кальциевых каналов, миноксидилом, миорелаксантами, нитратами и вазодилататорами.

Антидепрессанты, нейролептики, анксиолитики и снотворные средства также могут усиливать гипотензивное действие каптоприла.

Гипотензивный эффект каптоприла ослабляется эпоэтинами, эстрогенами и комбинированными пероральными контрацептивами, карбеноксолоном, глюкокортикостероидами и налоксоном.

Пробенецид уменьшает почечный клиренс каптоприла и повышает его сывороточные концентрации в крови.

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

Особые указания

Препарат Блокордил® в дозе 25 мг можно применять для лечения повышения АД (гипертонического криза). Пациент должен разжевать таблетку и оставить её во рту, под языком до полного рассасывания. Эффект развивается в течение 15-30 минут; если эффект недостаточен, через 1 ч возможно повторно принять препарат Блокордил® в дозе 25 мг по той же схеме.

После приёма первой дозы препарата Блокордил ® может развиться артериальная гипотензия со всеми её клиническими симптомами (начиная с обморока и тошноты, до острой почечной недостаточности и/или летального исхода), особенно у пациентов со сниженным ОЦК или гипонатриемией вследствие приёма высоких доз диуретиков или вследствие проведения гемодиализа. Артериальная гипотензия может развиться через несколько часов после приема первой дозы препарата. Ее можно избежать путём отмены диуретика и бессолевой диеты до начала применения препарата Блокордил®.

При повторных эпизодах симптоматической артериальной гипотензии необходимо уменьшить дозу препарата Блокордил® или отменить терапию.

Применение препарата Блокордил ® противопоказан пациентам с двусторонним стенозом почечных артерий или стенозом артерии единственной почки. Вследствие расширения приносящих (эфферентных) артериол почечных клубочков может развиться снижение функции почек вплоть до острой почечной недостаточности. Перед началом и в ходе терапии препаратом Блокордил® обязателен контроль функции почек.

Препарат Блокордил® должен с осторожностью применяться у пожилых пациентов, поскольку у этой группы пациентов повышен риск развития нежелательных эффектов.

Во время применения препарата Блокордил® может развиться ангионевротический отёк лица, шеи, языка, глотки, гортани. В этом случае следует немедленно ввести подкожно эпинефрин (адреналин) (в разведении 1:1000 (0,3 или 0,5 мл) и/или обеспечить проходимость дыхательных путей.

На фоне терапии препаратом Блокордил® может развиться гиперкалиемия, особенно у пациентов с ХПН, сахарным диабетом, при сопутствующей терапии калийсберегающими диуретиками (такими как спиронолактон, триамтерен или амилорид) или одновременном применении препаратов калия. Поэтому не рекомендуется одновременный приём препарата Блокордил® и описанных выше средств. Если требуется дополнительный приём препаратов калия, например, вследствие гипокалиемии, необходимо регулярно контролировать содержание калия в сыворотке крови.

Препарат Блокордил® необходимо с большой осторожностью применять у пациентов с заболеваниями соединительной ткани и одновременно получающих иммуносупрессивную терапию (аллопуринол или прокаинамид), особенно при

существующих нарушениях функции почек. У таких пациентов могут развиваться тяжёлые инфекции, не поддающиеся интенсивной антибиотикотерапии. В случае применения препарата Блокордил® рекомендуется периодически контролировать количество лейкоцитов в крови. Пациент должен быть предупреждён о том, что в случае появления каких-либо признаков инфекционного заболевания (боль в горле, повышение температуры) необходимо немедленно обратиться к врачу.

Препарат Блокордил® должен с осторожностью применяться у пациентов с сахарным диабетом. Некоторым пациентам может потребоваться уменьшение дозы инсулина или гипогликемических средств для приема внутрь.

Имеются отдельные сообщения о развитии длительных, угрожающих жизни анафилактоидных реакций у больных, получающих ингибиторы АПФ во время проведения десенсибилизирующей терапии ядом перепончатокрылых насекомых (пчелы, осы). Ингибиторы АПФ необходимо применять с осторожностью у пациентов, склонных к аллергическим реакциям, проходящих процедуру десенсибилизации. Следует избегать применения ингибиторов АПФ у пациентов, получающих терапию ядом перепончатокрылых. Тем не менее, развития анафилактоидных реакций можно избежать путем временной отмены ингибитора АПФ не менее чем за 24 ч до начала проведения процедуры десенсибилизации.

В редких случаях у пациентов, получающих ингибиторы АПФ, при проведении афереза липопротеидов низкой плотности (ЛПНП) с использованием декстрана сульфата могут развиваться угрожающие жизни анафилактоидные реакции. Для предотвращения анафилактоидных реакций следует прекратить терапию ингибитором АПФ перед каждой процедурой афереза ЛПНП с применением высокопроточных мембран.

Рекомендуется прекратить прием ингибиторов АПФ, в том числе препарата Блокордил®, за 12 ч до хирургического вмешательства, предупредив врача-анестезиолога о применении ингибиторов АПФ.

Во время терапии ингибиторами АПФ сообщалось о нескольких случаях нарушения функции печени с холестатической желтухой, фульминантным некрозом печени (в отдельных случаях) с летальным исходом. Если на фоне терапии препаратом Блокордил® может развиться желтуха или повыситься активность «печёночных» трансаминаз, препарат Блокордил® должен быть немедленно отменён; пациент должен находиться под тщательным наблюдением и при необходимости получить соответствующую терапию.

Влияние на способность к управлению автотранспортом и другими механизмами

Необходимо соблюдать осторожность при управлении автотранспортом и другими техническими устройствами, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, в связи с возможностью развития побочных эффектов (чрезмерное снижение АД, головокружение и др.).

Форма выпуска

Таблетки по 12,5 мг, 25 мг, 50 мг.
По 10 таблеток в блистер.
2 блистера вместе с инструкцией по применению помещают в пачку картонную.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.
Не использовать препарат после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек
Отпускают по рецепту.

Производитель: КРКА, д.д., Ново место, Шмарьешка цеста 6, 8501 Ново место, Словения

По всем вопросам обращаться по адресу Представительства в РФ:
123022, Москва, ул.2-я Звенигородская, д.13 , стр.41
Тел.: (495) 739-66-00, факс: (495) 739-66-01

При расфасовке и/или упаковке на российском предприятии указывается:

ООО "КРКА-РУС", 143500, Россия, Московская обл., г. Истра, ул. Московская, д. 50
Тел.: (495) 994-70-70
Факс: (495) 994-70-78

Представитель фирмы
КРКА (Словения) в РФ

KRKA
KRKA, tovarna zdravil, d.d., Novo mesto
9452

И.К. Моногова

РОСЗДРАВНАДЗОРА
ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ
ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ
ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА
0 0 0 0 0 0 0 0 0 4

59259