

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

ФЕЛОДИП (FELODIP)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: фелодипін; 4-(2,3-дихлорфеніл)-1,4-дигідро – 2,6-диметил-3,5-піридинедикарбоксилітової кислоти 3-етил,5 метиловий ефір ;

основні фізико-хімічні властивості:

Фелодип 2,5 мг - таблетки з пролонгованою дією, вкриті оболонкою, округлої форми, випуклі з обох боків, з відбитком (2,5), жовтого кольору;

Фелодип 5 мг - таблетки з пролонгованою дією, вкриті оболонкою, округлої форми, випуклі з обох боків, з відбитком (5), рожевого кольору;

Фелодип 10 мг - таблетки з пролонгованою дією, вкриті оболонкою, округлої форми, випуклі з обох боків, з відбитком (10), червоно-коричневого кольору;

склад: 1 таблетка містить 2,5 мг, 5 мг або 10 мг фелодипіну;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікросталічна, гіпромелоза, повідон, пропілгалат, магнію стеарат, кремнезем колоїдний безводний, заліза оксид, титану діоксид, тальк, пропіленгліколь.

Форма випуску. Таблетки, вкриті оболонкою, пролонгованої дії.

Фармакотерапевтична група. Селективні антагоністи кальцію з переважною дією на судини. Код АТС С0А02.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.* Фелодип – похідне дигідропіридину, селективний блокатор кальцієвих каналів L-типу. Має більшу спорідненість з клітинами гладких м'язів периферичних артеріол, коронарних артерій. Фелодип розширює артеріоли, зменшує загальний периферичний судинний опір, знижує артеріальний тиск. У терапевтичних дозах практично не впливає на скоротність міокарда. Фелодип справляє антиангіальну дію завдяки зниженню судинного опору коронарних судин, поліпшенню коронарного кровообігу та постачання міокарда киснем, а також послаблює післянавантаження на серце, що веде до зниження потреби міокарда в кисні. Фелодип поліпшує переносимість навантаження і зменшує частоту виникнення нападів у хворих на стабільну стенокардію, справляє протиішемічну дію у хворих на вазоспастичну стенокардію. Первинною гемодинамічною дією Фелодипу є зниження загальної периферичної судинної резистентності, завдяки чому знижується кров'яний тиск. Ця дія залежить від дози. Як правило, зниження кров'яного тиску спостерігається через 2 години після одноразового прийому і продовжується не менше 24 годин, співвідношення Т/Р (trough/pick) досягає величин значно вищих, ніж 50%. Існує позитивне співвідношення між концентрацією препарату в плазмі, рівнем зниження периферичної судинної резистентності і зниженням кров'яного тиску.

Фелодип має незначну натрійуретичну та діуретичну дію, оскільки знижує тубулярну реабсорбцію натрію. Фелодип не впливає на добове виділення калію. У пацієнтів з порушеною функцією нирок в процесі лікування Фелодипом гломерулярна швидкість фільтрації може підвищуватися. Фелодип добре переносять пацієнти після трансплантації нирок.

Фелодип не впливає на концентрацію глюкози в крові і ліпідний профіль.

Фармакокінетика. Фелодип повністю всмоктується у травному тракті.

Біодоступність Фелодипу становить приблизно 15% і не залежить від прийнятої дози (ефект «першого проходження» крізь печенку).

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

99% Фелодипу зв'язується з плазмовими протеїнами, переважно з альбумінами. Завдяки особливостям лікарської форми пролонговане вивільнення Фелодипу подовжує фазу всмоктування та забезпечує його рівномірну концентрацію в плазмі протягом 24 годин. Препарат проникає крізь гематоенцефалічний та плацентарний бар'єри і в грудне молоко.

Фелодип повністю метаболізується в печінці, всі його метаболіти неактивні. Період напіввиведення фелодипіну становить 25 годин. При тривалому застосуванні кумуляція діючої речовини не відбувається.

У пацієнтів літнього віку та з порушенням функції печінки плазматична концентрація Фелодипу вища, ніж у молодих пацієнтів. Фармакокінетика Фелодипу не змінюється у пацієнтів з порушенням функції нирок, у тому числі і при проведенні гемодіалізу. Приблизно 70% прийнятої дози препарату виводиться із сечею, а 30 % - з калом у формі метаболітів. У незміненому вигляді із сечею виводиться менше 0,5% прийнятої дози.

Показання для застосування. Артеріальна гіпертензія, стенокардія (стабільна стенокардія, вазоспастична стенокардія).

Спосіб застосування та дози. При артеріальній гіпертензії режим дозування дорослим (у тому числі особам літнього віку) визначається індивідуально. Терапія починається з дози 5 мг один раз на день. У разі необхідності дозу можна збільшити чи додати інший антигіпертензивний препарат. Як правило, підтримуюча доза становить 5-10 мг один раз на день. У період підбору дози рекомендуються таблетки по 2,5 мг. Для осіб літнього віку початкова доза становить 2,5 мг на добу.

При стабільній стенокардії дози визначаються індивідуально. Лікування починається з дози 5 мг на добу, у разі необхідності дозу можна збільшити до 10 мг один раз на добу.

Максимальна доза становить 20 мг на добу.

Хворим з тяжкими порушеннями функції печінки терапевтичну дозу необхідно знизити (рекомендується початкова доза 2,5 мг на день). У хворих з порушенням функції нирок зміни фармакокінетики незначні, тому корекція доз не потрібна.

Препарат краще приймати вранці, перед їдою або після легкого сніданку. Таблетки Фелодипу не можна розжовувати, ділити чи подрібнювати.

Досвіду застосування Фелодипу в педіатрії немає.

Побічна дія. Як і інші антагоністи кальцію, препарат може спричинювати почервоніння обличчя, головний біль, відчуття серцебиття, запаморочення, втомлюваність. Ці реакції можуть бути тимчасовими і найчастіше виявляються на початку лікування чи при підвищенні дози. Також можуть виникнути, залежно від дози, набряки в ділянці щиколоток, які є наслідком прекапілярної вазодилатації. У хворих із запаленням ясен чи з періодонтитом може виникнути легкий набряк ясен. Цьому можна запобігти при дотриманні гігієни ротової порожнини. Як і при застосуванні інших дигідропіридинів, в окремих випадках спостерігались погіршення проявів стенокардії, в основному на початку лікування.

Серцево-судинна система. Тахікардія, відчуття серцебиття, рідко – синкопе, периферичні набряки, гіперемія обличчя.

Центральна і периферична нервова система. Головний біль, запаморочення, рідко – парестезії.

Шлунково-кишковий тракт. Нудота, біль у животі, в поодиноких випадках – гіперплазія, запалення ясен.

Печінка. У поодиноких випадках спостерігається підвищення рівнів печінкових ензимів.

Скелетно-м'язовий апарат. Рідко спостерігається біль у суглобах і м'язах.

Алергічні реакції. Гіперемія обличчя, висипання, свербіж. Рідко спостерігається кропив'янка; у поодиноких випадках – фотосенсибілізація, васкуліт.

Сечовидільна система. У поодиноких випадках спостерігається полакізурия.

Інші. Рідко спостерігаються втомлюваність, сексуальні порушення, імпотенція;

в поодиноких випадках – реакції гіперчутливості, наприклад ангіоневротичний шок, підвищення

температури тіла.

Протипоказання. Вагітність і лактація, дитячий вік до 18 років. Алергічні реакції на компоненти Фелодипу чи інші дигідропіридини (можливість виникнення перехресної реакції). Клінічно значущий аортальний стеноз, серцева недостатність у стадії декомпенсації, гострий інфаркт міокарда чи період тривалістю 1 місяць після інфаркту міокарда, виражена артеріальна гіпотензія, кардіогенний шок, нестабільна стенокардія.

Передозування. При передозуванні спостерігається артеріальна гіпотензія та брадикардія.

Лікування. При передозуванні Фелодипу промивають шлунок, застосовують активоване вугілля з подальшим розміщенням пацієнта у палаті інтенсивного спостереження для моніторингу функцій серця і легенів. При тяжкій артеріальній гіпотензії необхідно надати пацієнту горизонтальне положення з піднятими догори ногами, підвищити об'єм плазми (введення фізіологічного розчину натрію хлориду, глюкози, декстрану, симпатоміметиків – норадреналіну, мезатону, допаміну, добутаміну, а також кальцію хлориду).

При брадикардії, атріовентрикулярній блокаді II та III ступеня, появі асистолії внутрішньовенно вводять атропіну сульфат, норадреналіну гідротартрат або кальцію хлорид. За необхідності та наявності показань застосовують штучний водій ритму.

Особливості застосування. Під час лікування Фелодипом слід утримуватися від занять потенційно небезпечною діяльністю, що потребує концентрації уваги і швидкості психомоторних реакцій. Хворим на стенокардію слід брати до уваги, що препарат може спричинювати артеріальну гіпотензію, яка може призвести до ішемії міокарда або погіршити її.

При порушенні функції печінки необхідна корекція доз препарату.

Фелодип не має впливу на концентрацію глюкози в плазмі крові та на ліпідний профіль.

Фелодип не слід приймати разом з грейпфрутовим соком у зв'язку з тим, що останній містить флавоноїд, який підвищує концентрацію фелодипіну у крові.

Фелодип ефективний і добре переноситься хворими незалежно від статі і віку, хворими на бронхіальну астму, з іншими обструктивними захворюваннями легенів, з порушеннями функції нирок, хворими на цукровий діабет, подагру, гіперліпідемію, із синдромом Рейно, після трансплантації легенів.

З обережністю призначають Фелодип, особливо у сполученні з бета-адреноблокаторами, хворими із серцевою недостатністю.

Взаємодія з лікарськими засобами. Гіпотензивну дію Фелодипу посилюють інші антигіпертензивні засоби (бета-адреноблокатори, інгібітори АПФ, діуретики), трициклічні антидепресанти, алкоголь. При застосуванні Фелодипу, бета-адреноблокаторів та органічних нітратів сумується антиангінальний ефект препаратів.

При одночасному застосуванні з Фелодипом нестероїдних протизапальних засобів антигіпертензивна дія Фелодипу не зменшується.

Інгібітори мікросомальних ензимів (циметидин, еритроміцин, ранітидин, кетоконазол, ітраконазол, ритонавір, саквінавір, хінідин) підвищують концентрацію фелодипіну в плазмі, тому дози Фелодипу, що призначаються, повинні бути зменшені при одночасному застосуванні з цими препаратами.

Індуктори мікросомальних ензимів (наприклад фенітоїн, карбамазепін, рифампіцин і барбітурати) можуть знижувати концентрацію фелодипіну в плазмі крові, тому дозу Фелодипу необхідно коригувати при одночасному застосуванні. При одночасному застосуванні Фелодипу з дигоксином концентрація останнього підвищується, але зміна дози Фелодипу не потрібна. Значне зв'язування фелодипіну з плазматичними білками не впливає на частку вільних фракцій інших ліків, які також характеризуються значним зв'язуванням з плазматичними білками (наприклад, варфарин). Грейпфрутовий сік через наявність у ньому флавоноїду, підвищує плазматичний рівень і біодоступність фелодипіну, тому не може застосовуватись разом з Фелодипом.

Умови та термін зберігання. Зберігати при температурі до 30 С в недоступному для дітей, сухому, захищеному від світла місці.

Термін придатності – 4 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 10 таблеток в алюмінієвому блістері; по 3 або по 10 блістерів у картонній коробці.

Виробник. АЙВЕКС Фармасьютикалз с.р.о.

Адреса. Вул. Остравска 29, 74770 Опава-Комаров, Чеська Республіка.