

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

АМЛО[®]

(AMLO[®])

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: amlodipine; 3-етил-5-метил (-)-2-((2-аміноетокси)-метил)-4-(2-хлорфеніл)-1,4-дигідро-6-метил-3,5-піридиндикарбоксилат;

основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого кольору, без оболонки, круглі, плоскі, зі скошеними краями та лінією розлому з одного боку;

склад: 1 таблетка містить амлодипіну бесилату еквівалентно амлодипіну 10 мг;

допоміжні речовини: лактоза, целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, кремнію діоксид колоїдний, кальцію гідрофосфат, повідон, тальк очищений, магнію стеарат, натрію крохмальгліколят.

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Селективні антагоністи кальцію з переважною дією на судини. Похідні дигідропіридину. Амлодипін. Код АТС С08С А01.

Фармакологічні властивості. Амло[®] – антагоніст іонів кальцію групи дигідропіридину.

Фармакодинаміка. Амлодипін зв'язується з дигідропіридиновими рецепторами і є блокатором повільних кальцієвих каналів (антагоніст іонів кальцію). Блокує надходження іонів кальцію крізь мембрани в клітини міокарда та гладенькі м'язи судин.

Механізм антигіпертензивної дії амлодипіну зумовлений безпосереднім впливом на гладкі м'язи судин. Антиангінальний ефект амлодипіну може реалізовуватися двома шляхами:

1. Амлодипін розширює периферичні артерії та в такий спосіб знижує загальний периферичний опір (після навантаження). Оскільки внаслідок цього частота серцевих скорочень практично не змінюється, зниження навантаження на серце призводить до зменшення споживання енергії та потреби в кисні.
2. Амлодипін також розширює коронарні артерії та артерії в незмінених та ішемізованих зонах міокарда. Така дія збільшує надходження кисню до міокарда у хворих на вазоспастичну стенокардію (стенокардія варіантна) і запобігає розвитку коронарної вазоконстрикції.

Для хворих на артеріальну гіпертензію разова добова доза амлодипіну забезпечує зниження артеріального тиску протягом 24 год як у положенні лежачи, так і стоячи. Завдяки повільному розвитку дії амлодипіну препарат не викликає симптомів гострої гіпотензії. У хворих на стенокардію амлодипін знижує частоту нападів стенокардії та необхідну дозу нітрогліцерину.

Гемодинамічні дослідження та контрольовані клінічні випробування з фізичним навантаженням у хворих на серцеву недостатність III–IV функціонального класу (NYHA) виявили, що амлодипін не спричиняє погіршення стану хворих за такими критеріями, як толерантність до фізичного навантаження, фракція викиду лівого шлуночка та клінічна симптоматика. Амлодипін не спричиняє негативного впливу на метаболізм, у тому числі на ліпідний спектр плазми крові.

Фармакокінетика. Після прийому таблеток Амло[®] внутрішньо амлодипін добре всмоктується (90 %), досягає максимальної концентрації в крові через 6 – 12 год. Біодоступність становить 64 – 80 %. Об'єм розподілу приблизно дорівнює 21 л/кг. Майже 97,5 % циркулюючого препарату зв'язується з білками плазми.

Прийом їжі не впливає на всмоктування амлодипіну. Стабільна рівноважна концентрація в плазмі досягається через 7–8 днів постійного прийому препарату. Амлодипін біотрансформується в печінці з утворенням неактивних метаболітів. Період напіввиведення з плазми становить приблизно 35–50 год, що вимагає призначення препарату 1 раз на добу. Амлодипін виводиться з сечею, як у незміненому вигляді (10 %), так і у вигляді метаболітів (60 %), 20–25 % виводиться у вигляді метаболітів з жовчю, а також з грудним молоком. Проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр.

У хворих літнього і молодшого віку час, необхідний для досягнення максимальної концентрації

амлодипіну в плазмі крові, практично однаковий.

У літніх пацієнтів відзначено тенденцію до зниження кліренсу амлодипіну, що призводить до підвищення АУС (площа зони під кривою концентрація - час) та періоду напіввиведення.

Показання для застосування. Артеріальна гіпертензія, ішемічна хвороба серця: стабільна, а також варіантна вазоспастична стенокардія.

Спосіб застосування та дози. Застосовують внутрішньо. При артеріальній гіпертензії і стенокардії звичайна початкова доза Амло[®] становить 5 мг (1/2 таблетки) один раз на добу; залежно від індивідуальної реакції хворого дозу можна збільшити до максимальної, що становить 10 мг (1 таблетка) один раз на добу. Тривалість лікування визначається індивідуально.

Побічна дія. Можливі такі побічні ефекти з боку *серцево-судинної системи*: відчуття серцебиття, задишка, зниження артеріального тиску, непритомність, васкуліт, периферичні набряки, припливи крові до обличчя; зрідка – порушення ритму серцевої діяльності (брадикардія, шлуночкова тахікардія, тріпотіння передсердь).

З боку центральної нервової системи: головний біль, запаморочення, втомлюваність, сонливість, зміна настрою, судоми; зрідка – втрата свідомості, знервованість, парестезії, тремор, безсоння, депресія, периферична нейропатія.

З боку системи травлення: нудота, блювання, біль в епігастральній ділянці, сухість у роті, метеоризм, гіперплазія ясен, запор або діарея; в окремих випадках – підвищення рівня печінкових трансаміназ та жовтяниця, що обумовлені холестаазом.

З боку сечостатевої системи: незначне збільшення добового діурезу і частоти сечовипускання.

З боку шкіри: алергічні реакції, гіперемія, висип, алопеція, дерматит, свербіж, поліморфна еритема.

З боку опорно-рухового апарату: зрідка – артралгія, артроз, міалгія.

Інші: підвищена пітливість, гінекомастія, тромбоцитопенія, лейкопенія, гіперглікемія, астенія, біль у спині. Після відміни препарату побічні ефекти повністю зникають.

Протипоказання. Підвищена чутливість до амлодипіну або інших компонентів препарату та похідних дигідропіридину, гострий інфаркт міокарда (до 4 тижнів від початку захворювання), кардіогенний шок, нестабільна стенокардія, виражений аортальний стеноз, артеріальна гіпотензія (систолический артеріальний тиск - нижче 90 мм рт. ст.), період вагітності та годування груддю, дітячий вік до 18 років.

Передозування. Можлива надмірна вазодилатація з наступною тривалою гіпотензією. Лікування: промивати шлунок. Слід підтримувати функцію серцево-судинної системи, включаючи моніторинг показників роботи серця і легень, контролювати об'єм циркулюючої крові, діурез. Хворого перевести у положення лежачи з піднятими нижніми кінцівками. Для відновлення тону судин та артеріального тиску можна застосовувати симпатоміметики (*допамін, фенілефрин*), якщо немає протипоказань для застосування. З метою усунення наслідків блокади кальцієвих каналів можливе внутрішньовенне введення кальцію глюконату. Гемодіаліз не ефективний.

Особливості застосування. Під час лікування Амло[®] необхідно щоденно контролювати артеріальний тиск. Необхідно з обережністю призначати Амло[®] пацієнтам з порушенням функції печінки, тому що у цих хворих період напіввиведення зростає. Добова доза для таких пацієнтів не повинна перевищувати 2,5 мг (вказане дозування забезпечується застосуванням препарату іншого виробника).

У хворих літнього віку добова доза препарату не повинна перевищувати 5 мг. Пацієнтам з тяжкими формами серцевої недостатності препарат призначати з обережністю. Хворі з порушенням функції нирок не потребують корекції дози препарату. Ступінь безпечності застосування Амло[®] для лікування жінок у період вагітності та годування груддю не встановлений.

Дані про застосування Амло[®] для лікування дітей відсутні.

Вплив на здатність керувати автомобілем або працювати зі складними механізмами.

У період застосування препарату слід утримуватися від керування автотранспортом або роботи, що потребує підвищеної уваги та швидкості психомоторних реакцій.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Амло[®] можна застосовувати разом з тiazидними діуретиками, альфа-адреноблокаторами, бета-адреноблокаторами, інгібіторами ангіотензинперетворюючого ферменту, нітратами тривалої дії, нітроглицерином при сублінгвальному прийомі, нестероїдними протизапальними препаратами, антибіотиками та синтетичними гіпоглікемічними препаратами для перорального застосування.

Дослідження показали, що одночасне застосування Амло[®] та дигоксину здоровими добровольцями не призводить до змін рівня дигоксину в сироватці крові та його ниркового кліренсу.

Результати досліджень *in vitro* з використанням плазми крові людини свідчать, що Амло[®] не впливає на зв'язування з білками препаратів (дигоксин, фенітоїн, варфарин, індометацин).

У здорових чоловіків-добровольців при одночасному застосуванні Амло[®] не змінював вплив варфарину на протромбіновий час. Одночасний прийом циметидину не змінює фармакокінетику Амло[®]. Амло[®] не впливає на фармакокінетику циклоспорину, не взаємодіє з рифампіцином. Засоби для інгаляційного наркозу (фторотан, метоксифлуран), нейролептики (аміназин), аміодарон, хінідин можуть підсилювати дію Амло[®]. При застосуванні Амло[®] та препаратів літію (літію карбонат) можливе посилення проявів нейротоксичності (нудота, блювання, діарея, атаксія, тремор, шум у вухах). Препарати кальцію (кальцію хлорид) можуть зменшити ефект дії Амло[®]. Прокаїнамід, хінідин збільшують негативну інотропну дію і можуть підвищувати ризик значного подовження інтервалу QT на електрокардіограмі. Оскільки алкоголь у I стадії своєї дії підвищує артеріальний тиск, а у II стадії – знижує, вживання алкоголю при лікуванні Амло[®] не рекомендується.

Грейпфрутовий сік підвищує біодоступність амлодипіну, що може підсилювати його гіпотензивну дію.

Умови та термін зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °C у сухому, захищеному від світла та недоступному для дітей місці.

Термін придатності – 3 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. 10 таблеток у стрипі; 2 стрипи в картонній коробці.

Виробник. Дженом Біотек ПВТ. ЛТД.

Адреса. 504, Делфі, Хіранандані Гарденс,
Повай, Мумбаї, 400 076, Індія.