

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**  
**А М Л О**  
**(А М L O)**

**Склад:**

*діюча речовина:* амлодипін;

1 таблетка містить амлодипіну бесилату еквівалентно амлодипіну 5 мг;

*допоміжні речовини:*

лактоза моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, кремнію діоксид колоїдний безводний, кальцію гідрофосфат, повідон, тальк, магнію стеарат, натрію крохмальгліколят Тип А.

**Лікарська форма.**

Таблетки.

**Фармакотерапевтична група.**

Селективні антагоністи кальцію з переважною дією на судини. Похідні дигідопіридину. Амлодипін. Код АТС С08С А01.

**Клінічні характеристики.****Показання.**

Артеріальна гіпертензія, ішемічна хвороба серця, стабільна, а також варіантна вазоспастична стенокардія.

**Протипоказання.**

Підвищена чутливість до амлодипіну або до інших компонентів препарату та до похідних дигідопіридину; гострий інфаркт міокарда (до 4 тижнів від початку захворювання), кардіогенний шок, нестабільна стенокардія (за винятком стенокардії Принцметала), виражений аортальний стеноз, артеріальна гіпотензія (систолический артеріальний тиск нижче 90 мм рт. ст.), період вагітності та годування груддю, дитячий вік.

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

При ішемічній хворобі серця рекомендована доза становить 5-10 мг 1 раз на добу. При сумісному призначенні тiazидних діуретиків, β-адреноблокаторів і інгібіторів АПФ дозу препарату не змінюють.

**Побічні реакції.**

Можливі побічні ефекти.

*З боку серцево-судинної системи:* серцебиття та неприємні відчуття у ділянці серця, задишка, зниження артеріального тиску, непритомність, пітливість, васкуліт, периферичні набряки, відчуття жару у ділянці обличчя; зрідка – порушення ритму серцевої діяльності (брадикардія або тахікардія).

Як і під час прийому інших антагоністів кальцію, були описані поодинокі небажані явища, які неможливо відокремити від наслідків природного перебігу основного захворювання: інфаркт міокарда, аритмія (включаючи шлуночкову тахікардію та мерехтіння передсердь), а також біль за грудиною.

*З боку центральної нервової системи:* головний біль, запаморочення, загальна слабкість, втомлюваність, сонливість, нездужання, зміна настрою, судоми м'язів; зрідка – втрата свідомості, знервованість, гіпестезії, парестезії, тремор, безсоння, депресія, периферична нейропатія, розлади зору, шум у вухах, зміна смаку.

*З боку системи травлення:* нудота, блювання, біль в епігастральній ділянці, сухість у роті, метеоризм,

гастрит, гіперплазія ясен, запор або діарея; в окремих випадках – підвищення рівня печінкових трансаміназ та жовтяниця, що обумовлені холестаазом, гепатит, панкреатит, диспепсія.

*З боку системи кровотворення:* лейкопенія, тромбоцитопенія.

*З боку сечостатевої системи:* незначне збільшення добового діурезу і частоти сечовипускання, імпотенція, гінекомастія, ніктурія.

*Шкірні прояви:* алергічні реакції у вигляді гіперемії шкіри, висипу, свербіж; алопеція, дерматит, поліморфна еритема, пурпура, зміна забарвлення шкіри, кропив'янка .

*З боку імунної системи:* ангіоневротичний набряк, пастозність та набряк обличчя, набряк повік, губ, язика, м'якого піднебіння, кропив'янка, васкуліт.

*З боку опорно-рухового апарату:* зрідка – артралгія, артроз, міалгія гіпертонус м'язів.

*З боку системи дихання:* кашель, задишка, риніт.

*Інші:* підвищене потовиділення, гіперглікемія, астенія, біль у спині, втомлюваність, збільшення або зменшення ваги.

Після відміни препарату побічні ефекти повністю зникають.

### ***Передозування.***

Досвід лікування навмисного передозування амлодипіну у людини обмежений. Показане промивання шлунка. Існуючі дані дають підстави вважати, що значне передозування може призвести до надмірної периферійної вазодилатації і ймовірної рефлекторної тахікардії із подальшим помітним і, можливо, тривалим зниженням артеріального тиску. Описані випадки суттєвої і ймовірно тривалої системної артеріальної гіпотензії, включаючи шок з летальним наслідком. Клінічно значуща артеріальна гіпотензія, спричинена передозуванням амлодипіну потребує проведення активних заходів, спрямованих на підтримку функцій серцево-судинної системи, включаючи моніторинг показників роботи серця і легень, положення хворого лежачи з піднятими ногами, контроль об'єму циркулюючої крові, діурезу. 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 застосування кальцію глюконату. Оскільки амлодипін значною мірою зв'язується з білками, то ефективність діалізу малоімовірна.

***Застосування у період вагітності або годування груддю.*** Препарат протипоказаний у період вагітності та годування груддю.

***Діти.*** Препарат Амло протипоказаний для застосування дітям.

### ***Особливості застосування.***

Під час лікування амлодипіном необхідно здійснювати щоденний контроль артеріального тиску.

***Застосування для лікування хворих із серцевою недостатністю.***

При застосуванні амлодипіну для лікування хворих із серцевою недостатністю III-IV ст. (за класифікацією NYHA) було відзначено зростання частоти випадків розвитку набряку легень.

***Застосування хворим із порушенням функції печінки.***

Необхідно обережно призначати Амло хворим із порушенням функції печінки, тому що у цих хворих період напіввиведення зростає. Застосовувати препарат таким хворим слід з особливою обережністю і лише під ретельним наглядом лікаря.

Для пацієнтів із печінковою недостатністю рекомендована доза становить 2,5 мг на добу.

***Застосування хворим із нирковою недостатністю.***

Хворі з порушенням функції нирок не потребують корекції дози препарату. Для цієї категорії хворих амлодипін застосовувати у звичайних дозах. Зміна концентрації амлодипіну у плазмі крові не корелює зі ступенем тяжкості ниркової недостатності. Амлодипін не виводиться під час діалізу.

***Застосування хворим літнього віку.***

При одних і тих самих дозах пацієнти як літнього, так і молодшого віку однаково добре переносять амлодипін. Для хворих літнього віку рекомендована доза становить 2,5 мг на добу.

Препарат містить лактозу, тому пацієнтам із рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції не слід застосовувати препарат.

**Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.** Питання про здатність пацієнта керувати автомобільним транспортом і виконувати роботу, що потребує підвищеної уваги, слід вирішувати тільки після оцінки індивідуальної реакції.

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.**

Амло можна застосовувати разом із тiazидними діуретиками,  $\alpha$ -адреноблокаторами,  $\beta$ -адреноблокаторами, інгібіторами ангіотензинперетворювального 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 не призводить до змін рівня дигоксину у сироватці крові та його ниркового кліренсу.

Результати досліджень із використанням плазми крові людини свідчать, що Амло не впливає на зв'язування з білками препаратів (дигоксин, фенітоїн, варфарин, індометацин).

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 під час застосування Амло не рекомендується.

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

Сумісне застосування алюміній/магнієвих антацидів з разовою дозою амлодипіну не впливало на фармакокінетику амлодипіну.

Одноразова доза силденафілу 100 мг у хворих на есенціальну артеріальну гіпертензію не впливала на фармакокінетичні параметри амлодипіну. При комбінованому застосуванні амлодипіну і силденафілу кожен з препаратів незалежно один від одного виявляв гіпотензивний ефект.

Вплив амлодипіну на фармакокінетику інших препаратів.

Сумісне багаторазове застосування 10 мг амлодипіну і 80 мг аторвастатину не впливало на рівноважні фармакокінетичні параметри аторвастатину.

**Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.*

Амло – антагоніст іонів кальцію групи дигідропіридину.

Амлодипін є блокатором повільних кальцієвих каналів (антагоніст іонів кальцію). Він блокує надходження іонів кальцію крізь мембрани у клітини міокарда та гладкі 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 артеріоли і в такий спосіб знижує загальний периферичний опір (після навантаження), на подолання якого витрачається робота серця. Оскільки частота серцевих скорочень практично не змінюється, то зниження навантаження на серце призводить до зменшення споживання енергії та потреби у кисні.

2. Амлодипін також розширює коронарні артерії та артеріоли у 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 годин як у положенні лежачи, так і стоячи. Завдяки повільному розвитку дії амлодипіну препарат не викликає симптомів гострої артеріальної гіпотензії. У хворих на стенокардію амлодипін збільшує час виконання фізичного навантаження, затримує розвиток нападу стенокардії та депресії сегмента ST при фізичному навантаженні, знижує частоту нападів стенокардії та зменшує потребу у нітрогліцерині.

Амлодипін не чинить жодного несприятливого впливу на обмін речовин та ліпіди плазми крові, тому його можна застосовувати для лікування хворих на бронхіальну астму, цукровий діабет і подагру.

Гемодинамічні дослідження та контрольовані клінічні випробування у хворих на серцеву недостатність II-III функціонального класу за класифікацією Нью-Йоркської асоціації кардіологів (NYHA) показали, що амлодипін не викликає погіршення їхнього стану за такими критеріями як толерантність до фізичного навантаження, фракція викиду лівого шлуночка та клінічні симптоми.

Застосування амлодипіну не призводить до підвищення ризику летального кінця або комбінованого показника летальності у пацієнтів із серцевою недостатністю III-IV класу (NYHA), які отримували дигоксин, діуретики та інгібітори АПФ.

#### *Фармакокінетика.*

Після прийому таблеток Амло всередину у терапевтичних дозах амлодипін добре всмоктується (90 %), досягає максимальної концентрації у крові через 6-12 годин у пацієнтів як середнього, так і літнього віку. Біодоступність становить 64-80 %. Об'єм розподілу приблизно дорівнює 21 л/кг. Майже 97,5 % циркулюючого препарату зв'язується з білками плазми крові.

Прийом їжі не впливає на всмоктування амлодипіну. Стійка рівноважна концентрація у плазмі крові досягається через 7-8 днів регулярного застосування препарату. Амлодипін біотрансформується у печінці з утворенням неактивних метаболітів. Період напіввиведення з плазми крові становить приблизно 35-50 годин, що дозволяє призначати препарат 1 раз на добу. Амлодипін виводиться з сечею, як у незмінному вигляді (10 %), так і у вигляді метаболітів

(60 %), 20-25 % виводиться у вигляді метаболітів з жовтю кишечника. Потрапляє у грудне молоко.

Проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр.

У пацієнтів літнього віку та хворих із застійною серцевою недостатністю відзначена тенденція до зниження кліренсу амлодипіну, що призводить до підвищення AUC (площі під кривою «концентрація/час») та періоду напіввиведення препарату.

#### **Фармацевтичні характеристики.**

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

**Термін придатності.** 3 роки.

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

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

**Категорія відпуску.** За рецептом.

**Виробник.** Дженом Біотек ПВТ. ЛТД.

**Місцезнаходження.** Плот номер Д 121-123, Малєгаон, ЕМ.АЙ.ДІ.СІ., Сіннар, Насік 422 103, Індія.