

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
АМЛОПРИЛ®-ДАРНИЦЯ
(AMLOPRIL-DARNITSA)

Склад:

діюча речовина: amlodipine; 1 таблетка містить амлодипіну бесилату (у перерахуванні на 100 % сухої речовини) – 6,9 мг або 13,9 мг; у перерахуванні на амлодипін – 5 мг або 10 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрористалічна, кукурудзяний крохмаль, діоксид кремнію колоїдний безводний (аеросил), магнію стеарат, повідон (полівінілпіролідон низькомолекулярний медичний).

Лікарська форма. Таблетки.

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

Клінічні характеристики.

Показання. Артеріальна гіпертензія, ішемічна хвороба серця: стабільна стенокардія та вазоспастична стенокардія (стенокардія Принцметала або варіантна стенокардія).

Протипоказання. Артеріальна гіпотензія. Гіперчутливість до похідних дигідропіридину. Період годування груддю. Дитячий вік.

Спосіб застосування та дози. Амлоприл®-Дарниця дорослі приймають внутрішньо незалежно від прийому їжі 1 раз на добу, запиваючи достатньою кількістю води. Початкова доза становить 5 мг, за необхідності через 7–14 днів дозу збільшують до максимальної – 10 мг.

Літнім пацієнтам та хворим при нирковій недостатності призначають у звичайних дозах.

Для хворих із печінковою недостатністю добова доза не повинна перевищувати 2,5 мг (застосовуються препарати амлодипіну з можливістю такого дозування).

Побічні реакції. В окремих випадках спостерігаються: периферичні набряки, головний біль, підвищена стомлюваність, сонливість, нудота, припливи крові, серцебиття та запаморочення. Рідше – свербіж шкіри, висипання, ядуха, астенія, судоми, диспепсія, гіперплазія ясен, поліморфна еритема. У деяких випадках можливі алопеція, запор, алтралгія, біль у спині, гінекомастія, гіперглікемія, артеріальна гіпотензія, підвищена частота сечовиділення, зміна настрою, міалгія, періодична нейтропенія, лейкопенія, тромбоцитопенія. Дуже рідко спостерігається жовтяниця та підвищення активності печінкових ферментів.

Передозування. Симптоми інтоксикації, ймовірно, обумовлені пролонгованою системною гіпотензією та порушенням перфузії життєво важливих органів. У тяжких випадках можливі тахікардія, гіпоксія, колапс із втратою свідомості, кардіогенний шок.

Лікування: заходи невідкладної допомоги, в першу чергу, повинні бути спрямовані на відновлення стабільної гемодинаміки. У хворих необхідно постійно контролювати функції серцево-судинної та дихальної систем, діурез. Можливе введення препаратів кальцію. Якщо введення кальцію недостатньо ефективно, доцільним є застосування симпатоміметиків (допамін або норадреналін) для стабілізації

артеріального тиску. Дози цих препаратів підбирають з урахуванням досягнутого лікувального ефекту. Брадикардію можна усунути симпатоміметиками. При уповільненні серцевого ритму, що загрожує життю, рекомендується застосування штучного водія ритму.

До додаткового введення рідини слід підходити дуже обережно, оскільки при цьому підвищується небезпека перевантаження серця.

Зважаючи на те, що Амлоприл®-Дарниця значною мірою зв'язується з білками плазми, застосування гемодіалізу недоцільне.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Безпека застосування Амлоприлу®-Дарниця у період вагітності та годування груддю не встановлена. Призначення препарату вагітним можливо тільки у випадку, якщо очікуваний терапевтичний ефект для матері перевищує потенційний ризик для плода. У період лікування слід припинити годування груддю.

Діти. Амлоприл®-Дарниця протипоказаний дітям віком до 18 років.

Особливості застосування. У період лікування необхідний контроль за масою тіла та вживанням натрію, призначення відповідної дієти, а також щоденний контроль артеріального тиску.

Необхідна підтримка гігієни зубів і часте відвідування стоматолога (для запобігання захворювання, кровоточивості та гіперплазії ясен).

Режим дозування для літніх пацієнтів такий самий, як і для пацієнтів інших вікових груп, але при збільшенні дози необхідно ретельне спостереження за такими пацієнтами.

Незважаючи на відсутність у блокаторів «повільних» кальцієвих каналів синдрому «відміни», перед припиненням лікування рекомендується поступове зменшення доз.

З обережністю застосовують при порушенні функції печінки.

Здатність впливати на швидкість реакцій при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. Під час лікування слід утримуватися від керування автотранспортом та від занять потенційно небезпечними видами діяльності, що потребують підвищеної уваги та швидкості психічних і рухових реакцій.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші форми взаємодій. Інгібітори мікросомального окиснення підвищують концентрацію Амлоприлу®-Дарниця в плазмі крові, підсилюючи ризик розвитку побічних ефектів, а індуктори мікросомальних ферментів печінки зменшують.

Гіпотензивний ефект послаблює нестероїдні протизапальні препарати, особливо індометацин (затримка натрію та блокада синтезу простагландинів нирками), альфа-адреностимулятори, естрогени (затримка натрію), симпатоміметики. Тіазидні та «петльові» діуретики, бета-адреноблокатори, верапаміл, інгібітори АПФ і нітрати підсилюють антиангінальний і гіпотензивний ефекти.

Аміодарон, хінідин, альфа1-адреноблокатори, антипсихотичні лікарські засоби (нейролептики) і блокатори «повільних» кальцієвих каналів можуть підсилювати гіпотензивну дію. Не чинить впливу на фармакокінетичні параметри дигоксину та варфарину.

Циметидин не впливає на фармакокінетику амлодипіну.

При спільному застосуванні із препаратами літію можливе посилення проявів їх нейротоксичності (нудота, блювання, діарея, атаксія, тремор, шум у вухах).

Препарати кальцію можуть зменшити ефект блокаторів «повільних» кальцієвих каналів.

Прокаїнамід, хінідин і інші лікарські засоби, що викликають подовження інтервалу QT, підсилюють негативний інотропний ефект і можуть підвищувати ризик значного подовження інтервалу QT.

Грейпфрутовий сік може підвищувати концентрацію Амлоприлу®-Дарниця в плазмі крові, однак це

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Амлоприл®-Дарниця – дигідропіридиновий антагоніст кальцію другого покоління. Блокує повільні Ca²⁺-канали, пригнічує трансмембранне переміщення іонів Ca²⁺ переважно в клітини гладких м'язів судин, а також міокарду. Має вазодилатуючі, антигіпертензивні, антиангінальні, спазмолітичні властивості.

Механізм антигіпертензивної дії обумовлений прямим розслаблюючим впливом на гладкі м'язи судин. Завдяки повільному початку дії та пролонгованому ефекту не спричиняє артеріальної гіпотензії, забезпечуючи клінічно відчутне плавне зниження артеріального тиску протягом 24 год. Антиангінальна дія Амлоприлу®-Дарниця пов'язана з розширенням як коронарних судин, так і периферичних артерій, зменшенням постнавантаження на серце без рефлекторного підвищення частоти серцевих скорочень, що приводить до зниження споживання енергії та кисню в міокарді. Зменшує гіпертрофію міокарда лівого шлуночка. Є відомості про антиатеросклеротичні властивості препарату. Амлоприл®-Дарниця гальмує агрегацію тромбоцитів, збільшує швидкість клубочкової фільтрації, натрієурез і діурез. На відміну від дигідропіридинових антагоністів кальцію першого покоління, Амлоприл®-Дарниця не підвищує суттєво рівень катехоламінів у плазмі крові та не стимулює ренін-ангіотензивну систему. При прийманні внутрішньо швидко всмоктується із травного тракту (всмоктування – 100 %).

Фармакокінетика. Після перорального прийому Амлоприл®-Дарниця повільно абсорбується зі шлунково-кишкового тракту. Середня абсолютна біодоступність становить 64 %, максимальна концентрація в сироватці крові спостерігається через 6–9 годин. Концентрація стабільної рівноваги досягається після 7 днів терапії. Їжа не впливає на абсорбцію Амлоприл®-Дарниця. Середній об'єм розподілу становить 21 л/кг маси тіла, що вказує на те, що більша частина препарату перебуває в тканинах, а відносно менша – у крові. Більша частина препарату, що перебуває в крові (95 %), зв'язується з білками плазми крові. Амлоприл®-Дарниця піддається повільному, але екстенсивному метаболізму (90 %) у печінці з утворенням неактивних метаболітів, має ефект «першого проходження» через печінку. Метаболіти не мають значимої фармакологічної активності.

Після одноразового перорального прийому період напіввиведення (T_{1/2}) варіює від 31 до 48 годин, при повторному призначенні T_{1/2} становить приблизно 45 годин. Близько 60 % прийнятої внутрішньо дози екскретується із сечею переважно у вигляді метаболітів, 10 % у незмінному виді, а 20–25 % з калом, а також із грудним молоком. Загальний кліренс Амлоприл®-Дарниця становить 0,116 мл/с/кг (7 мл/хв/кг, 0,42 л/год/кг).

У літніх пацієнтів (старше 65 років) виведення Амлоприл®-Дарниця вповільнена (T_{1/2} 65 год) у порівнянні з молодими пацієнтами, однак ця різниця не має клінічного значення.

У пацієнтів з печіночною недостатністю передбачається подовження T_{1/2}, і при тривалому призначенні акумуляція препарату в організмі буде вище (T_{1/2} до 60 год).

Ниркова недостатність не чинить істотного впливу на кінетику Амлоприл®-Дарниця. Препарат проникає через гематоенцефалічний бар'єр. При гемодіалізі не виділяється.

Фармацевтичні характеристики.

основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого або білого з жовтуватим відтінком кольору, плоскоциліндричної форми з фаскою.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати в недоступному для дітей місці, в оригінальній упаковці, при температурі не вище 25°C.

Упаковка. По 10 таблеток у контурній чарунковій упаковці, по дві контурні чарункові упаковки в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ЗАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження.

Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.