

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

Фелодипін САНДОЗ
(Felodipin SANDOZ)

Склад:

діюча речовина: felodipine;

1 таблетка містить фелодипіну 5 мг або 10 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, натрію лаурилсульфат, гідроксипропілметилцелюлоза, целюлоза мікрокристалічна, магнію стеарат;

оболонка: опадрі білий (до складу входять лактози моногідрат, титану діоксид (E 171), гідроксипропілметилцелюлоза, макрогол 4000), заліза оксид червоний (E 172), заліза оксид жовтий (E 172).

Лікарська форма. Таблетки з пролонгованим вивільненням.

Фармакотерапевтична група.

Селективні антагоністи кальцію з переважним впливом на судини; похідні дигідропіридину.

Код АТС С08С А02.

Клінічні характеристики.**Показання.**

Лікування есенціальної гіпертензії.

Протипоказання.

Підвищена індивідуальна чутливість до фелодипіну та інших інгредієнтів препарату. Інсульт протягом останніх 6 місяців, кардіогенний шок, нестабільна стенокардія, виражений аортальний/мітральний стеноз, обструктивна форма гіпертрофічної кардіоміопатії, гострий інфаркт міокарда (протягом 8 тижнів), порушення передсердно-шлуночкової провідності II або III ступеня, тяжкі порушення функції печінки або нирок, хронічна серцева недостатність. Період вагітності і годування груддю. Дитячий вік.

Спосіб застосування та дози.

Дозу препарату і тривалість лікування визначає лікар.

Звичайна доза фелодипіну становить 5 мг 1 раз на добу. За необхідності доза може бути збільшена до максимальної добової – 10 мг в один прийом. Враховуючи індивідуальні особливості, для деяких пацієнтів початкова доза може бути зменшена до 2,5 мг 1 раз на добу (наприклад, для хворих літнього віку).

За необхідності прийому таблеток фелодипіну по 2,5 мг застосовують препарат у меншій дозі.

Таблетки слід приймати зранку, натщесерце або з легкою їжею. Їжа зі значним вмістом жиру має бути виключена. Таблетки фелодипіну приймають цілими, не розжовуючи та не подрібнюючи, запиваючи достатньою кількістю води. Не слід запивати таблетки грейпфрутовим соком.

Побічні реакції.

Нервова система: поширені – головний біль (особливо на початку лікування, при підвищенні дози або при дуже великій дозі), запаморочення, втомлюваність, порушення сну, сонливість; рідко – неприємність; дуже рідко – збудження, парестезії.

З боку органа слуху: дуже рідко – шум у вухах.

З боку серцево-судинної системи: непоширені – відчуття серцебиття, тахікардія; рідко – артеріальна гіпотензія; дуже рідко – інфаркт міокарда; можливе виникнення нападів стенокардії, особливо на початку лікування, або може збільшуватися їх частота, тривалість і тяжкість у пацієнтів з існуючою

стенокардією; лейкоцитокластичний васкуліт.

Порушення з боку респіраторної системи: дуже рідко – задишка.

Шлунково-кишкові порушення: поширені – нудота, біль у черевній порожнині; рідко – блювання; дуже рідко – діарея, запор.

Печінка: дуже поширені – підвищення рівнів печінкових трансаміназ.

Шкіра: поширені – припливи, особливо на початку лікування, коли підвищується доза або вводиться висока доза; непоширені – свербіж, висипи на шкірі; рідко – кропив'янка; дуже рідко – фоточутливість, ексфолюативний дерматит, гіперплазія ясен і гінгівіт.

Кістково-м'язова система і сполучна тканина: рідко – міалгія, м'язовий тремор, артралгія.

Сечовидільна система: дуже рідко – часте сечовипускання.

Репродуктивні органи: рідко – порушення ерекції; дуже рідко – гінекомастія, менорагія.

Загальні порушення: поширені – периферичний набряк (ступінь вираженості набряку залежав від дози фелодипіну); дуже рідко – ангіоневротичний набряк, пірексія, збільшення маси тіла, підвищене потовиділення.

Передозування.

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

Лікування. Заходи для надання невідкладної допомоги перш за все повинні бути спрямовані на відновлення стабільної гемодинаміки. У хворих необхідно постійно контролювати функції серцево-судинної та дихальної систем, діурез. Можливо введення препаратів кальцію. Якщо введення кальцію є недостатньо ефективним, доцільним є застосування симпатоміметиків (допаміну або норадреналіну) для стабілізації артеріального тиску. Дози цих препаратів підбирають з урахуванням досягнутого лікувального ефекту. Брадикардію можна усунути симпатоміметиками, атропіном. 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.

Через те, що фелодипін значною мірою зв'язується з білками плазми, шляхом діалізу препарат видаляється в мінімальній кількості (близько 9 %).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Фелодипін не слід застосовувати у період вагітності. Перед початком лікування фелодипіном слід виключити вагітність, а у процесі терапії необхідно застосовувати безпечну контрацепцію.

Фелодипін проникає в грудне молоко, тому його не слід застосовувати у період годування груддю.

Діти.

Фелодипін не слід застосовувати дітям, оскільки ефективність і безпека для цієї категорії пацієнтів не встановлені.

Особливості застосування.

Хворі літнього віку можуть виявити більшу чутливість до препарату, навіть при мінімальній дозуванні.

При схильності до артеріальної гіпотензії, при вираженій серцевій недостатності, гемодинамічно значущому аортальному та мітральному стенозах, обструктивній формі гіпертрофічної кардіоміопатії, тяжких порушеннях функції нирок (кліренс креатиніну < 30 мл/хв) застосування препарату можливо лише за умови оцінки співвідношення користь/ризик і вимагає особливої обережності та постійного клінічного контролю. При порушеннях функцій печінки можливо суттєве посилення антигіпертензивного ефекту, що потребує корекції режиму дозування та постійного клінічного нагляду. З обережністю слід застосовувати фелодипін пацієнтам, які перебувають на гемодіалізі, за умов зляканої гіпертензії або гіповолемії (зменшення об'єму крові, що циркулює), оскільки розширення

кровоносних судин може спричинювати у них значне зниження артеріального тиску.

В окремих випадках при раптовому припиненні лікування фелодипіном можливий розвиток гіпертензивного кризу.

Фелодипін може спричинювати значну артеріальну гіпотензію (вазодилататорний ефект) з подальшою тахікардією, що може призвести до ішемії міокарда в окремих пацієнтів.

Як і при застосуванні інших блокаторів кальцієвих каналів, у пацієнтів з тяжкими формами гінгівіту або парадонтиту спостерігалися випадки легкої гіперплазії ясен. Зазначена гіперплазія може бути попереджена або, в крайньому разі, пом'якшена завдяки ретельному дотриманню гігієни ротової порожнини.

Під час терапії фелодипіном слід уникати вживання грейпфрутового соку.

Фелодипін не можна застосовувати одночасно з циметидином, ітраконазолом, кетоконазолом, еритроміцином, інгібіторами ВІЛ-протеази.

Препарат містить лактозу, тому його не слід призначати пацієнтам з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, дефіцитом лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

До з'ясування індивідуальної реакції на препарат рекомендується дотримуватися обережності при керуванні автотранспортом або роботі зі складними механізмами, особливо на початку терапії, після підвищення дози, при завершенні терапії.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Фелодипін метаболізується ферментами CYP3A4. Відповідно комбінація з лікарськими препаратами, що є потужними інгібіторами або індукторами CYP3A4, вимагає обережності та медичного контролю. Одночасний прийом фелодипіну та препаратів, що пригнічують ізоформу 3A4 цитохрому P₄₅₀ (у тому числі циметидину, азольних протигрибкових засобів – ітраконазолу, кетоконазолу, макролідних антибіотиків – еритроміцину, телітроміцину або інгібіторів ВІЛ-протеази), призводить до підвищення рівнів фелодипіну в плазмі. Так, прийом фелодипіну разом з ітраконазолом підвищує максимальну концентрацію в плазмі (C_{max}) у 8 разів. При сумісному прийомі фелодипіну та еритроміцину C_{max} підвищується приблизно у 2,5 разу. Грейпфрутовий сік пригнічує цитохром P₄₅₀ 3A4. Одночасний прийом фелодипіну та вживання грейпфрутового соку підвищує C_{max} та AUC фелодипіну приблизно у 2 рази. Зазначені комбінації є протипоказаними.

Одночасний прийом з такими препаратами, як карбамазепін, фенітоїн, барбітурати (в тому числі фенобарбітал) та рифампіцин знижує рівні фелодипіну в плазмі шляхом ферментативної індукції в печінці (система цитохрому P₄₅₀). При одночасному прийомі фелодипіну з рифампіцином, карбамазепіном, фенітоїном, фенобарбіталом C_{max} знижується на 82 %. Аналогічний ефект імовірний при застосуванні препаратів звіробою. Таким чином, за необхідності подібних комбінацій може виникнути потреба в корекції дози фелодипіну. Рекомендовано враховувати доцільність подібних комбінацій.

Антигіпертензивний ефект фелодипіну може посилюватися іншими антигіпертензивними засобами та трициклічними антидепресантами.

Гідрохлоротіазид може посилювати антигіпертензивний ефект фелодипіну.

Застосування фелодипіну з нітратами може посилити вплив на артеріальний тиск та частоту серцевих скорочень. Клінічно значущий негативний інотропний ефект для фелодипіну не характерний. Проте застосування препарату разом з бета-адреноблокаторами може призвести до вираженої артеріальної гіпотензії та відповідної симптоматики серцевої недостатності у пацієнтів, які мають ризик розвитку серцевої недостатності.

Фелодипін може індукувати підвищення C_{max} циклоспорину. Крім того, циклоспорин може пригнічувати метаболізм фелодипіну, що є потенціальним фактором ризику проявів токсичності фелодипіну.

При одночасному застосуванні з фелодипіном підвищуються рівні дигоксину в плазмі, що необхідно

враховувати, призначаючи подібну комбінацію.

Через недостатність інформації стосовно взаємодії фелодипіну та антиаритмічних засобів (аміодарон, хінідин та ін.) необхідна обережність при їх одночасному призначенні.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Фелодипін є антагоністом кальцію класу дигідропіридинів. Механізм дії фелодипіну пов'язується з блокадою трансмембранного надходження іонів кальцію через селективні потенціалзалежні „повільні” L-канали у клітині гладкої мускулатури артеріальних судин і міокарда. Фелодипін має виражену селективність відносно гладкої мускулатури судин порівняно з міокардом. Тому основним гемодинамічним ефектом препарату вважають системну периферичну вазодилатацію, що призводить до зниження системного периферичного судинного опору і зумовлює його антигіпертензивний ефект. Препарат знижує систолічний та діастолічний артеріальний тиск, ефект фелодипіну є дозозалежним. Серед інших ефектів відмічають незначну діуретичну дію.

Фармакокінетика. Фелодипін всмоктується практично повністю; біодоступність становить приблизно 15 % за рахунок первинного печінкового метаболізму. Біодоступність фелодипіну може змінюватись при одночасному вживанні жирної їжі. Значно збільшує названий показник грейпфрутовий сік. При порушенні функції печінки спостерігалось збільшення концентрації препарату в плазмі крові (до 100 %). Підвищені концентрації фелодипіну спостерігались у плазмі крові пацієнтів літнього віку.

Максимальна концентрація препарату в плазмі крові реєструється через 3 - 5 годин після перорального прийому. Приблизно 99 % введеного фелодипіну зв'язується з білками плазми крові. Стан стабільної рівноважної концентрації реєструється через 3 - 5 днів від початку лікування.

Період напіввиведення фелодипіну – 25 годин, тривалість дії таблеток з пролонгованим вивільненням – понад 24 години.

До 70 % введеної дози фелодипіну виводиться нирками, решта – з фекаліями.

Фармацевтичні характеристики:

основні фізико-хімічні властивості: круглі, двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, від світло-червоного до сіро-червоного кольору, з написом “F5” (для таблеток по 5 мг) та “F10” (для таблеток по 10 мг) з одного боку.

Термін придатності.

Таблетки по 5 мг – 3 роки.

Таблетки по 10 мг – 4 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °С в оригінальній упаковці.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 2 (2 – 10) блістери в картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Салютас Фарма ГмбХ, Німеччина, підприємство компанії Сандоз.

Місцезнаходження.

Д-39179 Барлебен, Отто-вон-Гюріке-Аллее, 1, Німеччина.