

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
А М Л О®
(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 аmlодипіну бесилату еквівалентно аmlодипіну 10 мг;

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

Форма випуску. Таблетки.

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

Фармакологічні властивості. Аmlо® – антагоніст іонів кальцію групи дигідропіридину.

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

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

1. Аmlодипін розширює периферичні артерії і 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. Аmlодипін 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 аmlодипіну забезпечує зниження артеріального тиску протягом 24 год як у положенні лежачи, так і стоячи. Завдяки повільному розвитку дії аmlодипіну препарат не викликає симптомів гострої гіпотензії. У хворих на стенокардію аmlодипін 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 аmlодипін не спричиняє погіршення стану хворих за такими критеріями, як толерантність до фізичного навантаження, фракція викиду лівого шлуночка та клінічна симптоматика. Аmlодипін не спричиняє негативного впливу на метаболізм, у тому числі на ліпідний спектр плазми крові.

Фармакокінетика. Після прийому таблеток Аmlо® внутрішньо аmlодипін 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 аmlодипіну. Стабільна рівноважна концентрація в плазмі досягається через 7–8 днів постійного прийому препарату. Аmlодипін біотрансформується в печінці з утворенням неактивних метаболітів. Період напіввиведення з плазми становить приблизно 35–50 год, що вимагає призначення препарату 1 раз на добу. Аmlодипін 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 аmlодипіну в плазмі крові, практично однаковий.

У літніх пацієнтів відзначено тенденцію до зниження кліренса аmlодипіну, що призводить до підвищення АUC (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 Аmlо® 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, гіперлазія ясен, запор або діарея; в окремих випадках – підвищення рівня печінкових трансаміназ та жовтяниця, що обумовлені холестазом.

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 аmlодипіну 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, дитячий вік до 18 років.

Передозування. Можлива надмірна вазодилатація з наступною тривалою гіпотензією. Лікування: промити 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, фенілефрін*), 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 Аmlо® необхідно щоденно контролювати артеріальний тиск. Необхідно з обережністю призначати Аmlо® 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 безпеки застосування Аmlо® для лікування жінок у період вагітності та годування груддю не встановлений.

Дані про застосування Аmlо® 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. Аmlо® можна застосовувати разом з тiazидними діуретиками, альфа-адреноблокаторами, бета-адреноблокаторами, інгібіторами ангіотензинперетворюючого ферменту,

нітратами тривалої дії, нітрогліцерином при сублінгвальному прийомі, нестероїдними протизапальними препаратами, антибіотиками та синтетичними гіполікемічними препаратами для перорального застосування.

Дослідження показали, що одночасне застосування Аmlо® і дигосину здоровими добровольцями не призводить до змін рівня дигосину в сироватці крові та його ниркового кліренсу.

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

У здорових чоловіків-добровольців при одночасному застосуванні Аmlо® не змінював вплив варфарину на протромбіновий час. Одночасний прийом циметидину не змінює фармакокінетику Аmlо®. Аmlо® не впливає на фармакокінетику циклопорину, не взаємодіє з рифампіцином. Засоби для інгаляційного наркозу (фторотан, метоксифлуран), нейролептики (аміназин), аміодарон, хінідин можуть підсилювати дію Аmlо®. При застосуванні Аmlо® та препаратів літію (літію карбонат) можливе підсилення проявів нейротоксичності (нудота, блювання, діарея, атаксія, тремор, шум у вухах). Препарати кальцію (кальцію хлорид) можуть зменшити ефект дії Аmlо®. 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 Аmlо® не рекомендується.

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

Умови та термін зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °С 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. Джебом Біотек ПБТ. ЛТД.

Адреса. 504, Делфі, Хіранандані Гарденс,

Повай, Мумбаї, 400 076, Індія.