Инструкция по применению
Амлодипин Медисорб Таблетки 5 мг 90 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Медисорб
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Амлодипин
Количество в упаковке: 1



Описание

Круглые таблетки белого или почти белого цвета плоскоцилиндрической формы с фаской с двух сторон.

Действующее вещество

Амлодипин

Состав

1 таблетка содержит: Действующее вещество: амлодипина бесилата (в пересчете на амлодипин) 7 мг (50 мг). вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 64 мг, повидон-30 (поливинилпирролидон среднемолекулярный) 64 мг, кальция карбонат 20 мг, крахмал картофельный 5 мг, кальция стеарат 1 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Абсорбция После приема внутрь Амлодипин хорошо абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Средняя абсолютная биодоступность составляет 64–80 %, максимальная концентрации (Cmax)в сыворотке крови наблюдается через 6–12 часов. Равновесные концентрации (Css) достигаются после 7–8 дней терапии. Одновременный прием пищи не влияет на абсорбцию амлодипина. Распределение Средний объем распределения составляет 21 л/кг массы тела, что указывает на то, что большая часть препарата находится в тканях, а меньшая - в крови. Большая часть препарата, находящегося в крови (97,5 %) связывается с белками плазмы крови. Метаболизм Амлодипин подвергается медленному, но активному метаболизму в печени при отсутствии значимого эффекта "первичного прохождения" через печень. Метаболиты не обладают существенной фармакологической активностью. Выведение После однократного приема период полувыведения (T½) варьирует от 35 до 50 ч, при повторном назначении T½ составляет приблизительно 45 ч. Около 60 % принятой внутрь дозы выводится почками преимущественно в виде метаболитов, 10 % - в неизмененном виде, а 20–25 % через кишечник с желчью. Общий клиренс амлодипина составляет 0,116 мл/с/кг (7 мл/мин/кг, 0,42 л/ч/кг). Пациенты пожилого возраста У пациентов пожилого возраста (старше 65 лет) выведение амлодипина замедленно (T½ - 65 ч) по сравнению с молодыми пациентами, однако эта разница не имеет клинического значения. Пациенты с печеночной недостаточностью Удлинение T½ у пациентов с печеночной недостаточностью предполагает, что при длительном применении кумуляция препарата в организме будет выше (T½ - до 60 ч). Пациенты с почечной недостаточностью Почечная недостаточность не оказывает существенного влияния на кинетику амлодипина. Амлодипин проникает через гематоэнцефалический барьер. При гемодиализе не удаляется. Применение у пациентов детского возраста Популяционное фармакокинетическое исследование было проведено с участием 74 пациентов детского возраста с гипертонической болезнью в возрасте от 1 до 17 лет (34 пациента в возрасте от 6 до 12 лет и 28 пациентов в возрасте от 13 до 17 лет), получавших Амлодипин в дозе от 1,25 до 20 мг один или два раза в сутки. Средний пероральный клиренс (CL/F) у детей в возрасте от 6 до 12 лет и у подростков от 13 до 17 лет составлял 22,5 и 27,4 л/час соответственно у мальчиков и 16,4 и 21,3 л/ч соответственно у девочек. Наблюдались большие различия в экспозиции среди пациентов. Данные о детях младше 6 лет ограничены

Показания

Амлодипин Медисорб показан к применению у взрослых и детей от 6 лет. Артериальная гипертензия у взрослых (как в монотерапии, так и в сочетании с другими гипотензивными средствами). Артериальная гипертензия у детей в возрасте 6–17 лет. Стабильная стенокардия и вазоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала или вариантная стенокардия) как в монотерапии, так и в сочетании с другими антиангинальными средствами.

Способ применения и дозы

Внутрь. Препарат принимают 1 раз в сутки, запивая необходимым количеством воды (100 мл). При артериальной гипертензии, стенокардии обычно начальная доза составляет 5 мг, в зависимости от терапевтического ответа ее можно увеличить до максимальной суточной дозы - 10 мг. Применение у пожилых пациентов Амлодипин рекомендуется применять в средней терапевтической дозе, коррекции дозы не требуется. Применение у пациентов с нарушенной функцией печени Несмотря на то, что Т½ амлодипина, как и всех БМКК, увеличивается у пациентов с нарушениями функции печени, коррекции дозы обычно не требуется (см. раздел "Особые указания"). Применение у пациентов с нарушенной функцией почек Рекомендуется применять Амлодипин в обычных дозах, однако необходимо учитывать возможное незначительное увеличение Т½. Не требуется коррекции дозы при одновременном применении с тиазидными диуретиками, бета-адреноблокаторами и ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента. Применение у пациентов детского возраста Дети и подростки от 6 до 17 лет с артериальной гипертензией Рекомендуемая антигипертензивная пероральная доза у пациентов детского возраста от 6 до 17 лет составляет 2,5 мг один раз в сутки в качестве начальной дозы с повышением до 5 мг один раз в сутки, если целевое артериальное давление не достигается через 4 недели. Применение у детей доз, превышающих 5 мг в сутки, не изучалось (см. разделы "Фармакодинамика" и "Фармакокинетика"), Для обеспечения указанного режима дозирования при необходимости применения амлодипина в дозе 2,5 мг следует назначать препараты других производителей в лекарственной форме "таблетки 2,5 мг" или "таблетки 5 мг" с разделительной риской. Пациенты детского возраста до 6 лет Безопасность и эффективность препарата Амлодипин Медисорб у детей до 6 лет не установлены. Данные отсутствуют.

Противопоказания

Гиперчувствительность к амлодипину и другим компонентам препарата. Тяжелая артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст.). Обструкция выносящего тракта левого желудочка (включая тяжелый аортальный стеноз). Шок (включая кардиогенный). Гемодинамически нестабильная сердечная недостаточность после инфаркта миокарда. Детский возраст до 6 лет (эффективность и безопасность не установлены при артериальной гипертензии), для остальных показаний препарат противопоказан у пациентов младше 18 лет. Редкая наследственная непереносимость галактозы, дефицит лактазы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Применение при беременности и кормлении грудью

Безопасность применения препарата Амлодипин Медисорб во время беременности и в период грудного вскармливания не установлена, поэтому применение во время беременности и грудного вскармливания возможно только в случае, когда ожидаемая польза для матери превышает возможный риск для плода и новорожденного. Опыт применения препарата показывает, что Амлодипин выделяется в женское грудное молоко. Среднее соотношение молоко/плазма для концентрации амлодипина составило 0,85 среди 31 кормящей женщины, которые страдали артериальной гипертензией, обусловленной беременностью и получали Амлодипин в начальной дозировке 5 мг в сутки. Дозировка препарата при необходимости корректировалась (в зависимости от средней суточной дозы и веса: 6 мг и 98,7 мкг/кг соответственно). Предполагаемая суточная доза амлодипина, получаемая младенцем через грудное молоко, составляет 4,17 мкг/кг.

Побочные действия

Частота нежелательных реакций была определена в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто (⩾1/10), часто (от ⩾1/100 до Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: очень редко: тромбоцитопеническая пурпура, лейкопения, тромбоцитопения. Нарушения со стороны иммунной системы: нечасто: кожный зуд, сыпь (в том числе эритематозная, макулопапулезная сыпь, крапивница), очень редко: ангионевротический отек, мультиформная эритема. Нарушения метаболизма и питания: нечасто: увеличение /снижение массы тела, очень редко: гипергликемия. Психические нарушения: нечасто: бессонница, необычные сновидения, депрессия, тревога. Нарушения со стороны нервной системы: часто: головные боли, головокружение, повышенная утомляемость, сонливость, нечасто: астения, общее недомогание, гипестезия, парестезия, периферическая нейропатия, тремор, лабильность настроения, повышенная возбудимость, извращение вкуса, очень редко: мигрень, повышенное потоотделение,

апатия, ажитация, атаксия, амнезия, частота неизвестна: экстрапирамидные нарушения. Нарушения со стороны органа зрения: нечасто: диплопия, нарушение аккомодации, ксерофтальмия, конъюнктивит, боль в глазах, нарушения зрения. Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта: нечасто: звон в ушах. Нарушения со стороны сердца: часто: ощущение сердцебиения, очень редко: одышка, развитие или усугубление течения ХСН, нарушение ритма сердца (включая брадикардию, желудочковую тахикардию и фибрилляцию предсердий), инфаркт миокарда, боль в грудной клетке. Нарушения со стороны сосудов: часто: периферические отеки (лодыжек и стоп), "приливы" крови к коже лица, нечасто: чрезмерное снижение АД, очень редко: обморок, васкулит, ортостатическая гипотензия, Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: нечасто: одышка, ринит, носовое кровотечение, очень редко: кашель. Желудочно-кишечные нарушения: часто: тошнота, боли в животе, нечасто: рвота, запор или диарея, метеоризм, диспепсия, анорексия, сухость слизистой оболочки полости рта, жажда, редко: гиперплазия десен, повышение аппетита, очень редко: панкреатит, гастрит. Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: очень редко: желтуха (обусловленная холестазом), гипербилирубинемия, повышение активности "печеночных" трансаминаз, гепатит. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: редко: дерматит, очень редко: алопеция, ксеродермия, холодный пот, нарушение пигментации кожи. Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани: нечасто: артралгия, судороги мышц, миалгия, боль в спине, артроз, редко: миастения. Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: нечасто: учащенное мочеиспускание, болезненное мочеиспускание, никтурия, очень редко: дизурия, полиурия. Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез: нечасто: нарушение эректильной функции, гинекомастия. Общие нарушения и реакции в месте введения: нечасто: озноб, боль неуточненной локализации, очень редко: паросмия. Лабораторные и инструментальные данные: очень редко: гипергликемия.

Передозировка

Опыт лечения преднамеренной передозировки у человека ограничен. Симптомы Доступные данные свидетельствуют о том, что сильная передозировка может привести к чрезмерному расширению периферических сосудов и, возможно, к рефлекторной тахикардии. Сообщалось о выраженной и, вероятно, продолжительной системной гипотензии, в том числе приводившей к шоку с летальным исходом. О некардиогенном отеке легких редко сообщалось как следствие передозировки амлодипином, которая может проявляться с задержкой (24–48 часов после приема внутрь) и требует поддержки вентиляции легких. Ранние реанимационные мероприятия (включая перегрузку жидкостью) для поддержания перфузии и сердечного выброса могут быть провоцирующими факторами. Лечение Клинически значимая гипотензия вследствие передозировки амлодипина требует активной поддержки функции сердечно-сосудистой системы, включающей частый мониторинг сердечной и дыхательной функции, подъем конечностей, контроль объема циркулирующей жидкости и объема выводимой мочи. Восстановлению сосудистого тонуса и артериального давления может способствовать применение сосудосуживающего средства, если нет противопоказаний к его применению. Внутривенное введение глюконата кальция может способствовать устранению блокады кальциевых каналов. В некоторых случаях может быть оправданным промывание желудка через зонд. Было показано, что у здоровых добровольцев применение активированного угля в течение периода до 2 часов после приема амлодипина в дозе 10 мг снижает скорость всасывания амлодипина. В связи с высокой степенью связывания амлодипина с белками крови эффективность диализа маловероятна.

Взаимодействие с другими препаратами

Амлодипин может безопасно применяться для терапии артериальной гипертензии вместе с тиазидными диуретиками, альфа-адреноблокаторами, бета-адреноблокаторами или ингибиторами АПФ. У пациентов со стабильной стенокардией Амлодипин можно комбинировать с другими антиангинальными средствами, например, с нитратами пролонгированного или короткого действия, бета-адреноблокаторами. В отличие от других БМКК клинически значимого взаимодействия амлодипина (III поколение БМКК) не было обнаружено при совместном применении с нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП), в том числе и с индометацином. Возможно усиление антиангинального и гипотензивного действия БМКК при совместном применении с тиазидными и "петлевыми" диуретиками, ингибиторами АПФ, бета-адреноблокаторами и нитратами, а также усиление их гипотензивного действия при совместном применении с альфа1-

адреноблокаторами, нейролептиками. Хотя при изучении амлодипина отрицательного инотропного действия обычно не наблюдали, тем не менее, некоторые БМКК могут усиливать выраженность отрицательного инотропного действия антиаритмических средств, вызывающих удлинение интервала QT (например, амиодарон и хинидин). Амлодипин может также безопасно применяться одновременно с антибиотиками и гипогликемическими средствами для приема внутрь. Однократный прием 100 мг силденафила у пациентов с эссенциальной гипертензией не оказывает влияния на параметры фармакокинетики амлодипина. Повторное применение амлодипина в дозе 10 мг и аторвастатина в дозе 80 мг не сопровождается значительными изменениями показателей фармакокинетики аторвастатина. Симвастатин: одновременное многократное применение амлодипина в дозе 10 мг и симвастатина в дозе 80 мг приводит к повышению экспозиции симвастатина на 77 %. В таких случаях следует ограничить дозу симвастатина до 20 мг. Этанол (напитки, содержащие алкоголь): Амлодипин при однократном и повторном применении в дозе 10 мг не влияет на фармакокинетикуэтанола. Противовирусные средства (ритонавир): увеличивает плазменные концентрации БМКК, в том числе и амлодипина. Нейролептики и изофлуран: усиление гипотензивного действия производных дигидропиридина. Препараты кальция могут уменьшить эффект БМКК. При совместном применении БМКК с препаратами лития (для амлодипина данные отсутствуют) возможно усиление проявления их нейротоксичности (тошнота, рвота, диарея, атаксия, тремор, шум в ушах). Исследования одновременного применения амлодипина и циклоспорина у здоровых добровольцев и всех групп пациентов, за исключением пациентов после трансплантации почки, не проводились. Различные исследования взаимодействия амлодипина с циклоспорином у пациентов после трансплантации почки показывают, что применение данной комбинации может не приводить к какому-либо эффекту, либо повышать минимальную концентрацию циклоспорина в различной степени до 40 %. Следует принимать во внимание эти данные и контролировать концентрацию циклоспорина у этой группы пациентов при одновременном применении циклоспорина и амлодипина. Не оказывает влияние на концентрацию в сыворотке крови дигоксина и его почечный клиренс. Не оказывает существенного влияния на действие варфарина (протромбиновое время). Циметидин не влияет на фармакокинетику амлодипина. В исследованиях in vitro Амлодипин не влияет на связывание с белками плазмы крови дигоксина, фенитоина, варфарина и индометацина. Грейпфрутовый сок: одновременный однократный прием 240 мг грейпфрутового сока и 10 мг амлодипина внутрь не сопровождается существенным изменением фармакокинетики амлодипина. Тем не менее, не рекомендуется применять грейпфрутовый сок и Амлодипин одновременно, так как при генетическом полиморфизме изофермента CYP3A4 возможно повышение биодоступности амлодипина и, вследствие этого, усиление гипотензивного эффекта. Алюминий- или

магнийсодержащие антациды: их однократный прием не оказывает существенного влияния на фармакокинетику амлодипина. Ингибиторы изофермента CYP3A4: при одновременном применении дилтиазема в дозе 180 мг и амлодипина в дозе 5 мг у пациентов от 69 до 87 лет с артериальной гипертензией, отмечается повышение системной экспозиции амлодипина на 57 %. Одновременное применение амлодипина и эритромицина у здоровых добровольцев (от 18 до 43 лет) не приводит к значительным изменениям экспозиции амлодипина (увеличение площади под кривой "концентрация-время" (AUC) на 22 %). Несмотря на то, что клиническое значение этих эффектов до конца не ясно, они могут быть более ярко выражены у пожилых пациентов. Мощные ингибиторы изофермента CYP3A4 (например, кетоконазол, итраконазол) могут приводить к увеличению концентрации амлодипина в плазме крови в большей степени, чем дилтиазем. Следует с осторожностью применять Амлодипин и ингибиторы изофермента CYP3A4. Кларитромицин: ингибитор изофермента CYP3A4. У пациентов, принимающих одновременно кларитромицин и Амлодипин, повышен риск снижения артериального давления. Пациентам, принимающим такую комбинацию, рекомендуется находиться под тщательным медицинским наблюдением. Индукторы изофермента CYP3A4: данных о влиянии индукторов изофермента CYP3A4 на фармакокинетику амлодипина нет. Следует тщательно контролировать артериальное давление при одновременном применении амлодипина и индукторов изофермента CYP3A4. Такролимус: при одновременном применении с амлодипином есть риск увеличения концентрации такролимуса в плазме крови. Для того, чтобы избежать токсичности такролимуса при одновременном применении с амлодипином, следует контролировать концентрацию такролимуса в плазме крови пациентов и корректировать дозу такролимуса в случае необходимости. Ингибиторы механистической мишени для рапамицина у млекопитающих (mTOR): ингибиторы mTOR, такие как сиролимус, темсиролимус и эверолимус представляют собой субстраты изофермента CYP3A. Амлодипин является слабым ингибитором изофермента CYP3A. При одновременном применении с ингибиторами mTOR Амлодипин может повышать их экспозицию.

Особые указания

Сердечно-сосудистые заболевания Эффективность и безопасность применения амлодипина при гипертоническом кризе не установлена. На фоне применения амлодипина у пациентов с ХСН класс III и IV функционального класса по классификации NYHA неишемического генеза отмечалось повышение частоты развития отека легких, несмотря на отсутствие признаков прогрессирования сердечной недостаточности. Синдром "отмены" Несмотря на отсутствие у БМКК синдрома "отмены", прекращение лечения амлодипином желательно проводить, постепенно уменьшая дозу препарата. Пациенты пожилого возраста У пациентов пожилого возраста может увеличиваться T½ и снижаться клиренс амлодипина. В клинических исследованиях частота нежелательных реакций у пациентов в возрасте ⩾65 лет была примерно на 6 % выше, чем у более молодых пациентов. Изменение доз амлодипина не требуется, но необходимо более тщательное наблюдение за пациентами данной категории. Прочее Необходимо поддержание гигиены зубов и наблюдение у стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен). Вспомогательные вещества Лактоза Препарат Амлодипин Медисорб содержит лактозы моногидрат. Пациентам с редко встречающимися наследственными заболеваниями, такими как непереносимость галактозы, непереносимость лактозы вследствие дефицита лактазы или синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции, не следует принимать данный лекарственный препарат. Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.:Не было сообщений о влиянии препарата Амлодипин Медисорб на управление транспортными средствами или работу с механизмами. Тем не менее, у некоторых пациентов, преимущественно в начале лечения, могут возникать сонливость и головокружение. При их возникновении пациент должен соблюдать осторожность при управлении транспортным средством и работе со сложными механизмами.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.