Инструкция по применению
Амлодипин Таблетки 10 мг 30 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Нижфарм
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Амлодипин
Количество в упаковке: 30



Описание

Таблетки белого или почти белого цвета плоскоцилиндрические с фаской с двух сторон и риской с одной стороны.

Действующее вещество

Амлодипин

Состав

Состав на одну таблетку: Действующее вещество: амлодипина безилат - 6,93 мг или 13,86 мг (в пересчете на амлодипин - 5,00 мг или 10,00 мг), вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кальция стеарат, кроскармеллоза натрия, кремния диоксид коллоидный.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание После приема внутрь амлодипин хорошо абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Средняя абсолютная биодоступность составляет 64-80%, максимальная концентрация в сыворотке крови определяется через 6-12 ч. Равновесные концентрации 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 (T1/2) варьирует от 35 до 50 ч, при повторном назначении T1/2 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). Применение у пожилых пациентов У пожилых пациентов (старше 65 лет) выведение амлодипина замедлено (T1/2 - 65 ч) по сравнению с молодыми пациентами, однако эта разница не имеет клинического значения. Применение у пациентов с печёночной недостаточностью Удлинение T1/2 у пациентов с печеночной недостаточностью предполагает, что при длительном применении кумуляция препарата в организме будет выше (T1/2 - до 60 ч). Применение у пациентов 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

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, один раз в сутки, запивая необходимым количеством воды (100 мл). При артериальной гипертензии, стенокардии обычно начальная доза составляет 5 мг, в зависимости от терапевтического ответа её можно увеличить до максимальной суточной дозы - 10 мг. Применение у пожилых пациентов Препарат Амлодипин рекомендуется применять в средней терапевтической дозе, коррекции дозы не требуется. Применение у пациентов с нарушенной функцией печени Несмотря на то, что T1/2 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 T1/2. 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»). Патенты детского возраста до 6 лет Данные отсутствуют. Для обеспечения указанного выше режима дозирования при необходимости применения амлодипина в дозе 2,5 мг следует назначать препараты амлодипина других производителей в лекарственной форме «таблетки 2,5 мг» или «таблетки 5 мг» с разделительной риской.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к амлодипину и другим производным дигидропиридина, а также вспомогательным веществам, входящим в состав препарата. Тяжёлая артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст.). Обструкция выносящего тракта левого желудочка (включая тяжёлый 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. Непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция (препарат содержит лактозу).

Применение при беременности и кормлении грудью

Безопасность применения амлодипина во время беременности и в период грудного вскармливания не установлена, поэтому применение во время беременности и грудного вскармливания возможно только в случае, когда польза для матери превышает 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. Не было выявлено влияния амлодипина на фертильность при исследовании на крысах.

Побочные действия

Частота приведённых ниже возможных побочных эффектов указана в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения: очень часто - более 1/10, часто - от более 1/100 до менее 1/10, нечасто - от более 1/1000 до менее 1/100, редко - от более 1/10000 до менее 1/1000, очень редко - от менее 1/10000, включая отдельные сообщения, неизвестно - невозможно оценить частоту на основании имеющихся данных. Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: очень редко - тромбоцитопеническая пурпура, лейкопения, тромбоцитопения. Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко - аллергические реакции. Нарушения со стороны обмена веществ и питания: очень редко - гипергликемия, нечасто - увеличение/снижение массы тела. Нарушения со стороны нервной системы: часто -

головные боли, головокружение, повышенная утомляемость, сонливость, нечасто - астения, общее недомогание, гипестезия, парестезия, периферическая нейропатия, тремор, бессонница, лабильность настроения, необычные сновидения, повышенная возбудимость, депрессия, тревога, звон в ушах, извращение вкуса, очень редко - мигрень, повышенное потоотделение, апатия, ажитация, атаксия, амнезия, неизвестно - экстрапирамидные нарушения. Нарушения со стороны органа зрения: нечасто - диплопия, нарушение аккомодации, ксерофтальмия, конъюнктивит, боль в глазах, нарушения зрения. Нарушения со стороны сердца: часто - ощущение сердцебиения, очень редко - развитие или усугубление течения ХСН, нарушения ритма сердца (включая брадикардию, желудочковую тахикардию и мерцание 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, одышка, васкулит, ортостатическая гипотензия. Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: нечасто - одышка, ринит, носовое кровотечение, очень редко - кашель. Нарушения со стороны пищеварительной системы, 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, желтуха (обусловленные холестазом), гипербилирубинемия, повышение активности «печеночных» трансаминаз, гепатит. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - алопеция, пурпура, нарушение пигментации кожи, повышенное потоотделение, кожный зуд, кожная сыпь, экзантема, крапивница, очень редко - ангионевротический отек, мультиформная эритема, эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона, фоточувствительность, неизвестно - токсический эпидермальный некролиз. Нарушения со стороны скелетно-мышечной 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 половых органов и молочной железы: нечасто - нарушение эректильной функции, гинекомастия. Общие расстройства и нарушения в месте введения: нечасто - озноб, боль неуточненной локализации, очень редко - паросмия.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД с возможным развитием рефлекторной тахикардии и чрезмерной периферической вазодилатации (риск развития выраженной и стойкой артериальной гипотензии, в том числе с развитием шока и летального исхода). Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля (особенно в первые 2 ч после передозировки), поддержание функции сердечно-сосудистой системы, возвышенное положение нижних конечностей, мониторинг показателей работы сердца и легких, контроль объема циркулирующей крови (ОЦК) и диуреза. Для восстановления тонуса сосудов - применение сосудосуживающих средств (при отсутствии противопоказаний к их применению), для устранения последствий блокады кальциевых каналов - внутривенное введение глюконата кальция. Гемодиализ неэффективен.

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 фармакокинетику этанола. 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

Внутрь, один раз в сутки, запивая необходимым количеством воды (100 мл). При артериальной гипертензии, стенокардии обычно начальная доза составляет 5 мг, в зависимости от терапевтического ответа её можно увеличить до максимальной суточной дозы - 10 мг. Применение у пожилых пациентов Препарат Амлодипин рекомендуется применять в средней терапевтической дозе, коррекции дозы не требуется. Применение у пациентов с нарушенной функцией печени Несмотря на то, что T1/2 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 T1/2. 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»). Патенты детского возраста до 6 лет

Данные отсутствуют. Для обеспечения указанного выше режима дозирования при необходимости применения амлодипина в дозе 2,5 мг следует назначать препараты амлодипина других производителей в лекарственной форме «таблетки 2,5 мг» или «таблетки 5 мг» с разделительной риской. Эффективность и безопасность применения амлодипина при гипертоническом кризе не установлена. Несмотря на отсутствие у БМКК синдрома «отмены», прекращение лечения амлодипином желательно проводить, постепенно уменьшая дозу препарата. На фоне применения амлодипина у пациентов с хронической сердечной недостаточностью класс III и IV функционального класса по классификации NYHA неишемического генеза отмечалось повышение частоты развития отека легких, несмотря на отсутствие признаков ухудшения сердечной недостаточности. У пациентов с нарушением функции печени T1/2 и показатели AUC амлодипина могут быть увеличены, рекомендации по дозированию препарата не установлены. Поэтому применение амлодипина следует начинать с нижней границы диапазона терапевтических доз и соблюдать осторожность как в начале лечения, так и при повышении дозы. У пациентов с тяжелым нарушением функции печени может возникнуть необходимость в постепенном подборе дозы и тщательном мониторинге состояния пациента. У пациентов пожилого возраста может увеличиваться T1/2 и снижаться клиренс препарата. Изменения доз не требуется, но необходимо более тщательное наблюдение за пациентами данной категории. В период лечения необходимо контролировать массу тела и потребление натрия. Необходимо соблюдение гигиены полости рта и регулярное посещение стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен). Хотя на фоне применения амлодипина какого-либо отрицательного влияния на способность управлять автотранспортом или другими сложными механизмами не наблюдалось, однако, вследствие возможного чрезмерного снижения АД, развития головокружения, сонливости и других побочных реакций, следует соблюдать осторожность в перечисленных ситуациях, особенно в начале лечения и при увеличении дозы.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С в потребительской упаковке (в пачке картонной). Хранить в недоступном для детей месте.