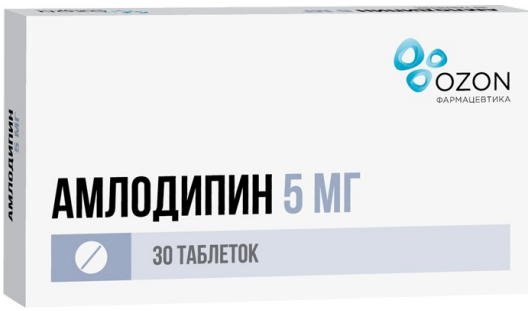
Инструкция по применению
Амлодипин-Озон Таблетки 5 мг 30 шт



Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Озон
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Амлодипин
Количество в упаковке: 1
Дозировка действующего вещества: 5 мг

Действующее вещество

Амлодипин

Состав

Действующее вещество: амлрдипина безилат в пересчете на амлодипин - 5.00 мг;
Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая -82,55 мг, крахмал кукурузный - 6,50 мг, повидон-К25 - 3,00 мг, магния стеарат -1,00 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

После приема внутрь амлодипин медленно абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Средняя абсолютная биодоступность составляет 64-80%, максимальная концентрация в сыворотке крови наблюдается через 6-12 часов. Равновесные концентрации достигаются после 7-8 дней терапии. Одновременный прием пищи не влияет на абсорбцию амлодипина. Средний объем распределения составляет 21 л/кг массы тела, что указывает на то, что большая часть препарата находится в тканях, а относительно меньшая - в крови. Большая часть препарата, находящегося в крови (97,5%), связывается с белками плазмы крови. Амлодипин подвергается медленному, но активному метаболизму (90%) в печени с образованием неактивных метаболитов, при отсутствии значимого эффекта "первичного прохождения" через печень. Метаболиты не обладают значимой фармакологической активностью. После однократного приема внутрь период полувыведения (Т 1Д) варьирует от 31 до 50 ч, при повторном применении Т1Й 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). У пожилых пациентов (старше 65 лет) выведение амлодипина замедлено (Т1/2 - 65 ч) по сравнению с молодыми пациентами, однако эта разница не имеет клинического значения. У пациентов с печеночной недостаточностью предполагается удлинение Т1Д и при длительном применении кумуляция препарата в организме будет выше (Т1/2 до 60 ч). Почечная недостаточность не оказывает существенного влияния на кинетику амлодипина. Амлодипин проникает через гематоэнцефалический барьер. При гемодиализе не удаляется.

Показания

Артериальная гипертензия (монотерапия или в комбинации с другими гипотензивными средствами). Стенокардия напряжения, вазоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала) (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 и стенокардии начальная доза составляет 5 мг 1 раз в сутки. При отсутствии терапевтического эффекта в течение 2-4 недель доза препарата может быть увеличена до максимальной суточной дозы 10 мг. У пожилых пациентов Амлодипин рекомендуется применять в средней терапевтической дозе, коррекции дозы не требуется. У пациентов с нарушением функции печени Несмотря на то, что T1 /2 амлодипина, как и всех БМКК, увеличивается, у пациентов с нарушением функции печени, коррекции дозы обычно не требуется (см. раздел «Особые указания»). У пациентов с почечной недостаточностью Рекомендуется применять амлодипин в обычных дозах, однако необходимо учитывать возможное незначительное увеличение T1/2 (см. раздел «Особые указания»). Не требуется изменения дозы при одновременном назначении с тиазидными диуретиками, бета-ад реноблокаторами и ингибиторами ангиотензинпревращающега фермента (АПФ). Со стороны кроветворной и лимфатической систем: очень редко - тромбоцитопеническая пурпура, лейкопения, тромбоци-топения. Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - учащенное мочеиспускание, болезненное мочеиспускание, никтурия;

Противопоказания

- повышенная чувствительность к амлодипину и другим производным дигидропиридина, а также к другим компонентам препарата; - гемодинамическая нестабильная сердечная недостаточность после инфаркта миокарда; - обструкция выносящего тракта левого желудочка (включая тяжелый аортальный стеноз); - тяжелая артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст.); - шок, включая кардиогенный; - нестабильная стенокардия (за исключением стенокардии Принцметала); - беременность и период грудного вскармливания; - возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены). С осторожностью Нарушения функции печени, синдром слабости синусового узла (выраженная брадикардия, тахикардия), артериальная гипотензия, аортальный стеноз, митральный стеноз, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, острый инфаркт миокарда (и в течение 1 месяца после), пожилой возраст, хроническая сердечная недостаточность неишемической этиологии III-IV функционального класса по классификации NYHA, нестабильная стенокардия, при одновременном применении с ингибиторами и индукторами изофермента CYP3A4 (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»). Применение при беременности и в период грудного вскармливания Безопасность применения препарата Амлодипин во время беременности не установлена. В экспериментальных исследованиях фетотоксическое и эмбриотоксическое действие амлодипина не установлены, применение при беременности возможно только в том случае, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Отсутствуют данные, свидетельствующие о выделении амлодипина с грудным молоком. Однако известно, что другие БМКК - производные дигидропиридина, выделяются в грудное молоко. В связи с чем, при необходимости применения препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания. Фертильность Обратимые биохимические изменения головок сперматозоидов отмечены у некоторых пациентов, принимавших БМКК. Клинические данные в отношении потенциального воздействия амлодипина на фертильность недостаточны. В исследованиях на крысах отмечалось нежелательное воздействие на фертильность самцов.

Побочные действия

По данным Всемирной организации здравоохранения нежелательные эффекты классифицированы в соответствии с их частотой развития следующим образом: очень часто (210% назначений); часто (21% и <10%); нечасто (20,1% и <1%); редко (20,01% и <0,1%); очень редко (<0,01 %); частота неизвестна (недостаточно данных для оценки частоты развития). Со стороны центральной нервной системы: часто - головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, сонливость; нечасто - общее недомогание, астения, гипестезия, парестезия, периферическая нейропатия, тремор, бессонница, лабильность настроения, необычные сновидения, повышенная возбудимость, депрессия, тревога, извращение вкуса; очень редко - мигрень, апатия, ажитация, атаксия, амнезия, астения, повышенное потоотделение; частота неизвестна - экстрапира-мидные 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. Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - ощущение сердцебиения, «приливы» крови к коже лица, периферические отеки (лодыжек и стоп); нечасто - чрезмерное снижение АД; очень редко - обморок, одышка, васкулит, ортостатическая гипотензия, развитие или усугубление течения ХСН, нарушения ритма сердца (включая брадикардию, желудочковую тахикардию и фибрилляция предсердий), инфаркт миокарда, боль в грудной клетке, отек легких. чень редко - дизурия, полиурия. Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: нечасто - гинекомастия, эректильная дисфункция. Со стороны дыхательной системы: нечасто - одышка, ринит, носовое кровотечение; очень редко - кашель. Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - судороги мышц, миалгия, артралгия, боль в спине, артроз; редко -миастения. Со стороны кожных покровов: редко - дерматит; очень редко -алопеция, ксеродермия, холодный пот, нарушение пигментации кожи. Аллергические реакции: нечасто - кожный зуд, кожная сыпь (в т.ч. эритематозная, макулопапулезная сыпь, крапивница); очень редко - ангионевротический отек, мультиформная эритема. Со стороны органов чувств: нечасто - звон в ушах, диплопия, нарушение аккомодации, ксерофтальмия, конъюнктивит, боль в глазах, нарушения зрения; очень редко - паросмия. Со стороны обмена веществ: очень редко - гипергликемия; нечасто - увеличение/снижение массы тела. Прочие: нечасто - озноб, боль неуточненной локализации.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД с возможным развитием рефлекторной тахикардии и чрезмерной периферической вазодилатации (риск развития выраженной и стойкой артериальной гипотензии, в т.ч. с развитием шока и летального исхода). Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля (особенно в первые 2 часа 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 и бета-адреноблокаторами или ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (АПФ). У пациентов со стабильной стенокардией амлодипин можно применять с другими антиангинальными средствами, например, с нитратами пролонгированного или короткого действия, бета-адреноблокаторами. В отличие от других БМКК клинически значимого взаимодействия амлодипина не было обнаружено при совместном применении с нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП), в том числе и с индометацином. Возможно усиление антиангинального и антигипертензивного действия БМКК при совместном применении с тиазидными и «петлевыми» диуретиками, ингибиторами АПФ и с нитратами, бета-адреноблокаторами, а также усиление их антигипертензивного действия при совместном применении с альфа 1-адреноблокаторами, нейролептиками. Бета-адреноблокаторы при одновременном применении с амлодипином могут вызвать обострение течения хронической сердечной недостаточности. Амлодипин может безопасно применяться с антибиотиками и гипогликемическими средствами для приема внутрь. Хотя при изучении амлодипина отрицательного инотропного действия обычно не наблюдалось, тем не менее, некоторые БМКК могут усиливать выраженность отрицательного инотропного действия антиаритмических средств, вызывающих удлинение интервала QT (например, амиодарон и хинидин). Одновременное длительное применение симвастатина в дозе 80 мг в сутки и амлодипина в дозе 10 мг в сутки ведет к 77% увеличению экспозиции симвастатина. Рекомендуется снизить дозу симвастатина у пациентов, принимающих амлодипин, до 20 мг в сутки. Однократный прием 100 мг силденафила у пациентов с артериальной

гипертензией не оказывает влияния на параметры фармакокинетики амлодипина. При одновременном применении с силденафилом необходим контроль АД (риск развития артериальной гипотензии). Повторное применение амлодипина в дозе 10 мг и аторвастатина в дозе 80 мг не сопровождается значительными изменениями показателей фармакокинетики аторвастатина. 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 антигипертензивного 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 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. При одновременном применении амлодипин может повышать системную экспозицию тасонермина в плазме крови. В таких случаях необходим регулярный контроль тасонермина в крови и коррекция дозы при необходимости. 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 антигипертензивного действия. 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 в возрасте от 69 до 87 лет с артериальной гипертензией, отмечалось 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 неясно, 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, принимавших одновременно кларитромицин и амлодипин, повышен риск снижения АД. 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 АД 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 и корректировать дозу такролимуса в случае необходимости.

Особые указания

Эффективность и безопасность применения амлодипина при гипертоническом кризе не установлена. В период терапии препаратом Амлодипин необходимо контролировать массу тела и потребление поваренной соли, показано назначение соответствующей диеты. Необходимо поддержание гигиены полости рта и наблюдение у стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен). При применении амлодипина у пациентов с хронической сердечной недостаточностью III и IV функционального класса по классификации NYHA неишемического генеза отмечалось повышение частоты развития отека легких, несмотря на отсутствие признаков ухудшения течения хронической сердечной недостаточности. При остром инфаркте миокарда амлодипин применяют после стабилизации показателей гемодинамики (см. раздел « Противопоказания»). Пациенты с печеночной недостаточностью при необходимости приема препарата Амлодипин должны находиться под наблюдением врача. У пациентов пожилого возраста может увеличиваться Т1Д и снижаться клиренс препарата. Изменения доз не требуется, но необходимо более тщательное наблюдение за пациентами данной категории. Пациентам с малой массой тела, пациентам невысокого роста и пациентам с выраженным нарушением функции печени может потребоваться меньшая доза препарата. У пациентов с нарушением функции почек необходим контроль состояния. Несмотря на отсутствие у блокаторов "медленных" кальциевых каналов синдрома "отмены", перед прекращением лечения рекомендуется постепенное уменьшение доз. Влияние на способность к управлению автотранспортом и другими сложными механизмами Хотя на фоне приема 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

от 2# до 25#