Инструкция по применению
Норваск таблетки 10 мг 14 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Германия
Производитель: Пфайзер
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Амлодипин
Количество в упаковке: 14
Дозировка действующего вещества: 10 мг



Действующее вещество

Амлодипин

Состав

Амлодипина безилат 13.889 мг, что соответствует содержанию амлодипина 10 мгвспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 248.111 мг, кальция гидрофосфат - 126 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 8 мг, магния стеарат - 4 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание и распределениеПосле приема внутрь амлодипин хорошо абсорбируется, Cmax в крови достигается через 6-12 ч после приема. Абсолютная биодоступность составляет 64-80%. Прием пищи не влияет на абсорбцию амлодипина.Средний Vd равен примерно 21 л/кг массы тела, что указывает на то, что большая часть препарата находится в тканях, а меньшая - в крови. Связывание с белками плазмы составляет примерно 97.5%. Амлодипин проникает через ГЭБ.Css в плазме достигается через 7-8 дней терапии.Метаболизм и выведениеАмлодипин подвергается медленному, но активному метаболизму в печени при отсутствии значимого эффекта первого прохождения через печень. Метаболиты не обладают существенной фармакологической активностью.После однократного приема T1/2 варьирует от 35 до 50 ч, при повторном назначении T1/2 составляет примерно 45 ч. Общий клиренс амлодипина составляет 0.116 мл/с/кг (7 мл/мин/кг, 0.42 л/ч/кг).Около 60% принятой внутрь дозы выводится с мочой преимущественно в виде метаболитов, 10% - в неизмененном виде, а 20-25% - через кишечник с желчью.Амлодипин не удаляется при гемодиализе.Фармакокинетика в особых клинических случаяхУ пациентов пожилого возраста (старше 65 лет) выведение амлодипина замедлено (T1/2 - 65 ч) по сравнению с молодыми пациентами, однако эта разница не имеет клинического значения.Удлинение T1/2 у пациентов с печеночной недостаточностью предполагает, что при длительном применении кумуляция препарата в организме будет выше (T1/2 - до 60 ч).Почечная недостаточность не оказывает существенного влияния на кинетику амлодипина.

Показания

- артериальная гипертензия (как в качестве монотерапии, так и в сочетании с другими антигипертензивными средствами);- стабильная стенокардия и ангиоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала) (как в качестве монотерапии, так и в сочетании с другими антиангинальными средствами).

Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь 1 раз/сут, запивая необходимым количеством воды (100 мл).При артериальной гипертензии и стенокардии начальная доза составляет 5 мг, в зависимости от индивидуальной реакции пациента ее можно увеличить до максимальной дозы, составляющей 10 мг.Не требуется коррекция дозы препарата Норваск при одновременном применении тиазидных диуретиков, бета-адреноблокаторов или ингибиторов АПФ.У пациентов пожилого возраста препарат рекомендуется применять в средней терапевтической дозе, изменение дозы препарата не требуется.Несмотря на то, что T1/2 амлодипина, как и всех блокаторов кальциевых каналов, увеличивается у пациентов с нарушениями функции печени, коррекции дозы препарата у данной категории пациентов обычно не требуется.У пациентов с нарушениями функции почек рекомендуется применять Норваск в обычных дозах, однако необходимо учитывать возможное незначительное увеличение T1/2.

Противопоказания

- тяжелая артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст.);- обструкция выносящего тракта левого желудочка (включая тяжелый аортальный стеноз);- гемодинамически нестабильная сердечная недостаточность после инфаркта миокарда;- детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);- повышенная чувствительность к амлодипину и другим производным дигидропиридина, а также вспомогательным веществам, входящим в состав препарата.С осторожностью следует применять препарат у пациентов с печеночной недостаточностью, хронической сердечной недостаточностью неишемической этиологии III-IV функционального класса по классификации NYHA, нестабильной стенокардией, аортальным стенозом, митральным стенозом, гипертрофической обструктивной кардиомиопатией, острым инфарктом миокарда (и в течение 1 мес после него), СССУ (выраженная тахикардия, брадикардия), артериальной гипотензией, при одновременном применении с ингибиторами или индукторами изофермента CYP3A4.

Применение при беременности и кормлении грудью

Безопасность применения препарата Норваск при беременности не установлена, поэтому применение при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превосходит потенциальный риск для плода. Данные, свидетельствующие о выведении амлодипина с грудным молоком отсутствуют. Однако известно, что другие блокаторы медленных кальциевых каналов (производные дигидропиридина) выделяются с грудным молоком. В связи с этим при необходимости применения препарата Норваск в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Побочные действия

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась в соответствии с классификацией ВОЗ: очень часто (больше1/10), часто (от больше1/100 до меньше1 /10), нечасто (от больше1/1000 до меньше1/100), редко (от больше1/10 000 до меньше1/1000), очень редко (от меньше1/10 000), включая отдельные сообщения.Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - ощущение сердцебиения, периферические отеки (лодыжек и стоп), приливы крови к лицу; нечасто - чрезмерное снижение АД; очень редко - обморок, одышка, васкулит, ортостатическая гипотензия, развитие или усугубление течения хронической сердечной недостаточности, нарушения ритма сердца (включая брадикардию, желудочковую тахикардию и мерцание предсердий), инфаркт миокарда, боль в грудной клетке.Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - артралгия, судороги мышц, миалгия, боль в спине, артроз; редко - миастения.Со стороны нервной системы: часто - головные боли, головокружение, повышенная утомляемость, сонливость; нечасто - астения, общее недомогание, гипестезии, парестезии, периферическая невропатия, тремор, бессонница, лабильность настроения, необычные сновидения, повышенная возбудимость, депрессия, тревожность, звон в ушах, извращение вкуса; очень редко - мигрень, повышенное потоотделение, апатия, ажитация, атаксия, амнезия.Со стороны пищеварительной системы: часто - боль в животе, тошнота; нечасто - рвота, запор или диарея, метеоризм, диспепсия, анорексия, сухость во рту, жажда; редко - гиперплазия десен, повышение аппетита; очень редко - гастрит, панкреатит, гипербилирубинемия, желтуха (обычно холестатическая), повышение активности печеночных трансаминаз, гепатит.Со стороны системы кроветворения: очень редко - тромбоцитопеническая пурпура, лейкопения, тромбоцитопения.Со стороны дыхательной системы: нечасто - одышка, ринит, носовое кровотечение; очень редко - кашель.Со стороны органа зрения: нечасто - диплопия, нарушение аккомодации, ксерофтальмия, конъюнктивит, боль в глазах, нарушения зрения.Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - учащенное мочеиспускание, болезненное мочеиспускание, никтурия; очень редко - дизурия, полиурия.Со стороны половой системы: нечасто - нарушение эректильной функции, гинекомастия.Со стороны кожных покровов: редко - дерматит; очень редко - алопеция, ксеродермия, холодный пот, нарушение пигментации кожи.Со стороны обмена веществ: нечасто - увеличение/снижение массы тела; очень редко - гипергликемия.Аллергические реакции: нечасто - кожный зуд, сыпь (в т.ч. эритематозная, макуло-папулезная сыпь, крапивница); очень редко - ангионевротический отек, многоформная эритема.Прочие: нечасто - озноб; очень редко - паросмия.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД с возможным развитием рефлекторной тахикардии и чрезмерной периферической вазодилатации (существует вероятность появления выраженной и стойкой артериальной гипотензии, в т.ч. с развитием шока и летального исхода).Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля (особенно в первые 2 ч после передозировки), горизонтальное положение с низким изголовьем, активное поддержание функции сердечно-сосудистой системы, мониторинг показателей работы сердца и легких, контроль ОЦК и диуреза. Для восстановления тонуса сосудов - применение сосудосуживающих препаратов (при отсутствии противопоказаний к их применению); для устранения последствий блокады кальциевых каналов - в/в 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 блокаторов медленных кальциевых каналов клинически значимого взаимодействия амлодипина (III поколение блокаторов медленных кальциевых каналов) не было обнаружено при совместном применении с НПВС в т.ч. и с индометацином.Возможно усиление антиангинального и антигипертензивного действия блокаторов медленных кальциевых каналов при совместном применении с тиазидными и петлевыми диуретиками, ингибиторами АПФ, бета-адреноблокаторами и нитратами, а так же усиление их антигипертензивного действия при совместном применении с альфа1-адреноблокаторами, нейролептиками. Хотя при изучении амлодипина отрицательного инотропного действия обычно не наблюдали, тем не менее, некоторые блокаторы медленных кальциевых каналов 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 силденафила в дозе 100 мг у больных 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.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.Амлодипин при однократном и повторном применении в дозе 10 мг не влияет на фармакокинетику этанола.Противовирусные препараты (например, ритонавир) увеличивают плазменные концентрации блокаторов медленных кальциевых каналов, в т.ч. амлодипина.Нейролептики и изофлуран усиливают антигипертензивное действие производных дигидропиридина.Препараты кальция могут уменьшить эффект блокаторов медленных кальциевых каналов.При совместном применении блокаторов медленных кальциевых каналов с препаратами лития (для амлодипина данные отсутствуют), возможно усиление проявлений нейротоксичности последних (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.Амлодипин не оказывает влияния на концентрацию в сыворотке крови дигоксина и его почечный клиренс. Норваск 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.Одновременный однократный прием 240 мл грейпфрутового сока и 10 мг амлодипина внутрь не сопровождается существенным изменением фармакокинетики амлодипина. Тем не менее, не рекомендуется применять грейпфрутовый сок и амлодипин одновременно, т.к. при генетическом полиморфизме изофермента CYP3A4 возможно повышение биодоступности амлодипина и, вследствие этого, усиление гипотензивного эффекта. Однократный прием алюминий/магнийсодержащих антацидов не оказывает существенного влияния на фармакокинетику амлодипина.При одновременном применении дилтиазема (ингибитор изофермента CYP3A4) в дозе 180 мг и амлодипина в дозе 5 мг у пациентов пожилого возраста (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 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.Данных о влиянии индукторов изофермента CYP3A4 на фармакокинетику амлодипина нет. Следует тщательно контролировать АД при одновременном применении амлодипина и индукторов изофермента CYP3A4.

Особые указания

Во время лечения препаратом необходимо поддержание гигиены полости рта и наблюдение у стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен).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.Эффективность и безопасность применения препарата Норваск при гипертоническом кризе не установлена.Несмотря на отсутствие у блокаторов медленных кальциевых каналов синдрома отмены, прекращение лечения препаратом Норваск желательно проводить, постепенно уменьшая дозу препарата.На фоне применения амлодипина у пациентов с хронической сердечной недостаточностью (класс III и IV по классификации NYHA) неишемического генеза отмечалось повышение частоты развития отека легких, несмотря на отсутствие признаков ухудшения сердечной недостаточности.Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмамиХотя на фоне приема препарата Норваск какого-либо отрицательного влияния на способность управлять автомобилем или другими техническими средствами не наблюдалось, однако вследствие возможного чрезмерного снижения АД, развития головокружения, сонливости и других побочных явлений следует внимательно относиться к индивидуальному действию препарата в указанных ситуациях, особенно в начале лечения и при изменении режима дозирования.