

ИНСТРУКЦИЯ
(информация для пациентов)
по применению лекарственного средства
АМЛОДИПИН

Торговое название: Амлодипин.

Международное непатентованное название: Амлодипин (Amlodipine).

Форма выпуска: таблетки.

Описание: таблетки белого или почти белого цвета, плоскоцилиндрические, с фаской.

Состав: каждая таблетка содержит *активное вещество*: амлодипин (в виде амлодипина бесилата) – 5 мг; *вспомогательные вещества*: целлюлоза микрокристаллическая, крахмал картофельный, кальция стеарат, лактозы моногидрат.

Фармакотерапевтическая группа: Блокаторы кальциевых каналов. Селективные блокаторы кальциевых каналов с преимущественным влиянием на сосуды.

Код АТС: C08CA01.

Фармакологическое действие

Производное дигидропиридина – блокатор медленных кальциевых каналов II поколения, оказывает антиангинальное и гипотензивное действие. Связываясь с сегментом S6 III и IV доменов альфа1-субъединицы кальциевого канала L-типа, блокирует кальциевые каналы, снижает трансмембранный переход Ca^{2+} в клетку (в большей степени в гладкомышечные клетки сосудов, чем в кардиомиоциты). Оказывает гипотензивный и антиангинальный эффекты. Механизм гипотензивного действия обусловлен прямым расслабляющим влиянием на гладкие мышцы сосудов. Антиангинальное действие обусловлено расширением коронарных и периферических артерий и артериол: при стенокардии уменьшает выраженность ишемии миокарда; расширяя периферические артериолы, снижает общее периферическое сопротивление сосудов, уменьшает постнагрузку на сердце, снижает потребность миокарда в кислороде. Расширяя главные коронарные артерии и артериолы в неизмененных и в ишемизированных зонах миокарда, увеличивает поступление кислорода в миокард (особенно при вазоспастической стенокардии); предотвращает развитие констрикции коронарных артерий (в т.ч. вызванной курением). У больных стенокардией разовая суточная доза увеличивает время выполнения физической нагрузки, замедляет развитие очередного приступа стенокардии и "ишемической" депрессии сегмента S-T, снижает частоту приступов стенокардии и потребления нитроглицерина. Оказывает длительный дозозависимый гипотензивный эффект. Гипотензивное действие обусловлено прямым вазодилатирующим влиянием на гладкие мышцы сосудов. При артериальной гипертензии разовая доза обеспечивает клинически значимое снижение АД на протяжении 24 ч (в положении больного "лежа" и "стоя"). Не вызывает резкого снижения АД, снижения толерантности к физической нагрузке, фракции выброса ЛЖ. Уменьшает степень гипертрофии миокарда левого желудочка, оказывает антиатеросклеротическое и кардиопротекторное действие при ИБС. Не повышает риск смерти у пациентов, страдающих хронической сердечной недостаточностью (III-IV класс по NYHA), на фоне терапии дигоксином, диуретиками и ингибиторами АПФ. Не оказывает влияния на сократимость и проводимость миокарда, не вызывает рефлекторного увеличения частоты сердечных сокращений, тормозит агрегацию тромбоцитов, повышает скорость клубочковой

филътрации, обладает слабым натрийуретическим действием. При диабетической нефропатии не увеличивает выраженность микроальбуминурии. Не оказывает неблагоприятных влияний на обмен веществ и липиды плазмы. Время наступления эффекта – 2-4 ч; длительность – 24 ч.

Показания к применению

Артериальная гипертензия (монотерапия или в комбинации с другими гипотензивными ЛС), стабильная стенокардия напряжения и вазоспастическая стенокардия (монотерапия или в комбинации с другими антиангинальными ЛС).

Способ применения и дозы

Внутрь, однократно. Начальная доза при артериальной гипертензии и стенокардии – 5 мг/сутки, которую, при необходимости, повышают до максимальной – 10 мг/сутки. Пациентам с малой массой тела или невысокого роста, а также с выраженной печеночной недостаточностью могут потребоваться меньшие дозы.

У пациентов с артериальной гипертензией амлодипин применяется в сочетании с тиазидными мочегонными, альфа-блокаторами, бета-блокаторами или ингибиторами АПФ.

При стенокардии амлодипин может применяться в качестве монотерапии или в комбинации с другими лекарственными средствами для стенокардии у пациентов, у которых отсутствовал эффект от приема нитратов и/или адекватной дозы бета-блокаторов.

При сопутствующей терапии тиазидными диуретиками, бета-блокаторами или ингибиторами АПФ требуется корректировка дозы амлодипина.

Особые группы населения

Пациенты пожилого возраста

Коррекция дозы не требуется. Рекомендуются обычный дозовый режим, но увеличение дозы проводится с осторожностью.

Нарушения функций печени

Для пациентов с нарушениями функций печени легкой и средней степени тяжести дозовые рекомендации не разработаны, поэтому подбор дозы следует проводить с осторожностью, начиная с наиболее низкой дозы. Фармакокинетика амлодипина при нарушениях функций печени тяжелой степени не изучена. Поэтому у таких пациентов лечение следует начинать с наименьшей возможной дозы и титровать дозу медленно.

Нарушения функций почек

Изменения концентрации амлодипина в плазме крови не коррелирует со степенью почечной недостаточности, поэтому рекомендуются обычные дозы. Амлодипин не выводится при диализе.

Побочное действие

Амлодипин относительно хорошо переносится, в терапевтических дозах не вызывает выраженного побочного действия. Наиболее частыми побочными эффектами амлодипина являются:

со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение, отеки лодыжек и стоп, одышка, "приливы" крови к лицу, редко – нарушения ритма (брадикардия, желудочковая тахикардия, трепетание предсердий), боль в грудной клетке, снижение АД, ортостатическая гипотензия, обмороки; очень редко – развитие или усугубление сердечной недостаточности, экстрасистолия, мигрень, инфаркт миокарда, васкулит;

со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, чрезмерная утомляемость, сонливость, изменение настроения, судороги; редко – потеря сознания, гипестезия, парестезии, тремор, астения, недомогание, бессонница, нервозность, депрессия, необычайные сновидения, тревога; очень редко – атаксия, апатия, ажитация, амнезия, спутанность сознания, периферическая нейропатия, гипертония;

со стороны пищеварительной системы: тошнота, боль в животе; гипербилирубинемия, желтуха, повышение активности "печеночных" трансаминаз; редко – сухость во рту, анорексия, рвота, запор или диарея, диспепсия, метеоризм, гиперплазия десен; очень редко – гастрит, повышение аппетита, панкреатит;

со стороны мочеполовой системы: редко – поллакиурия, болезненные позывы на мочеиспускание, никтурия, нарушение сексуальной функции (в т.ч. снижение потенции); очень редко – дизурия, полиурия;

со стороны опорно-двигательного аппарата: редко – артралгия, артроз, миалгия (при длительном применении), мышечные спазмы; очень редко – миастения, отек коленного сустава, проявления экстрапирамидных расстройств;

со стороны кожных покровов: очень редко – ксеродермия, алоpecia, дерматит, эксфолиативный дерматит, пурпура, синдром Стивенса-Джонсона, светочувствительность;

аллергические реакции: кожный зуд, сыпь (в т.ч. эритематозная, макулопапулезная сыпь, крапивница); очень редко: отек Квинке;

со стороны крови и лимфатической системы: очень редко: лейкопения, тромбоцитопения;

прочие: редко – нарушение зрения, конъюнктивит, диплопия, боль в глазах, нарушение аккомодации, ксерофтальмия, звон в ушах, гинекомастия, боль в спине, ощущение жара, озноб, увеличение массы тела, диспноэ, носовое кровотечение, повышенное потоотделение, жажда; очень редко – гепатит, холодный липкий пот, кашель, ринит, паросмия, извращение вкуса, гипергликемия, отек, слабость.

Противопоказания

Гиперчувствительность к амлодипину, другим дигидропиридинам и вспомогательным компонентам препарата, выраженная артериальная гипотензия (САД менее 90 мм рт. ст.), шок (включая кардиогенный шок), обструкция выносящего тракта левого желудочка (например, тяжелая степень аортального стеноза), гемодинамически нестабильная сердечная недостаточность после острого инфаркта миокарда, возраст до 18 лет, беременность, период лактации.

Передозировка

Симптомы: чрезмерная периферическая вазодилатация, снижение АД, тахикардия. Были зарегистрированы случаи выраженной и длительной системной гипотензии, которая приводила к шоку со смертельным исходом.

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля до двух часов после приема амлодипина, поддержание функций сердечно-сосудистой системы, контроль показателей функции сердца и легких, возвышенное положение конечностей, контроль за ОЦК и диурезом, симптоматическая и поддерживающая терапия, в/в введение кальция глюконата и сосудосуживающих средств, если это не противопоказано. Гемодиализ неэффективен.

Меры предосторожности

Во время лечения необходимо контролировать массу тела и наблюдаться у стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен). Амлодипин не влияет на плазменные концентрации K^+ , глюкозы, ТГ, общего холестерина, ЛПНП, мочевой кислоты, креатинина и азота мочевины. Следует избегать резкой отмены препарата из-за риска ухудшения течения стенокардии. Таблетки амлодипина не рекомендуются при гипертоническом кризе. Женщины детородного возраста в период лечения должны использовать надежные методы контрацепции.

Следует строго соблюдать режим и схемы лечения, принимать препарат через равные промежутки времени и не пропускать дозу. При пропуске дозы следует принять ее как можно быстрее, если же наступило время приема следующей дозы – не принимать удвоенную дозу взамен пропущенной.

В состав препарата входит лактоза, в связи с чем его не рекомендуется применять у пациентов с редкой врожденной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы Лаппа и глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

Пациенты с сердечной недостаточностью

У пациентов с сердечной недостаточностью амлодипин следует применять с осторожностью.

В плацебо контролируемых долгосрочных исследованиях у пациентов с тяжелой сердечной недостаточностью неишемической этиологии (NYHA класса III и IV), принимавших

амлодипин, частота развития отека легких была выше, чем в группе плацебо. Блокаторы кальциевых каналов, включая амлодипин, должны с осторожностью использоваться у пациентов с хронической сердечной недостаточностью, так как они увеличивают риск сердечно-сосудистых осложнений в будущем и смертность.

Дети. Опыт применения у детей отсутствует.

Применение во время беременности и в период лактации

Беременность. В исследованиях на животных была выявлена репродуктивная токсичность при использовании амлодипина в высоких дозах. Безопасность применения во время беременности не установлена.

Кормящие женщины. Неизвестно, проникает ли амлодипин в грудное молоко. На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Фертильность. У некоторых пациентов, которые получали лечение блокаторами кальциевых каналов, наблюдались обратимые изменения сперматозоидов. Клинические данные о потенциальном влиянии амлодипина на рождаемость относительно недостаточны. В одном исследовании на крысах были обнаружены побочные эффекты на мужскую фертильность.

Влияние на способность к управлению автотранспортом и другими потенциально опасными механизмами. У пациентов, принимающих амлодипин, могут развиваться головокружение, головная боль, симптомы усталости или тошноты, поэтому в период лечения следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстрой психомоторных реакций.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Ингибиторы микросомального окисления могут повышать концентрацию амлодипина в плазме, усиливая риск развития побочных эффектов, а индукторы микросомальных ферментов печени – снижать. В отличие от других блокаторов медленных кальциевых каналов, не отмечается клинически значимого взаимодействия с НПВС, особенно индометацином. Тиазидные и "петлевые" диуретики, бета-адреноблокаторы, верапамил, ингибиторы АПФ и нитраты усиливают антиангинальный или гипотензивный эффекты. Не оказывает влияние на фармакокинетические параметры дигоксина и варфарина. Циметидин не влияет на фармакокинетику амлодипина. Препараты Ca^{2+} могут уменьшить эффект блокаторов медленных кальциевых каналов. Противовирусные средства (ритонавир) увеличивают плазменные концентрации блокаторов медленных кальциевых каналов, в т.ч. амлодипина. Нейролептики и изофлуран усиливают гипотензивное действие производных дигидропиридина.

Влияние других лекарственных средств на амлодипин

Ингибиторы CYP3A4: совместное применение амлодипина с сильными ингибиторами CYP3A4 (ингибиторы протеазы, противогрибковые азолы, макролиды, такие как эритромицин или кларитромицин, верапамил или дилтиазем) может значительно усилить воздействие амлодипина. Клинические последствия этих фармакокинетических взаимодействий могут быть более выраженными у пациентов пожилого возраста. При необходимости следует осуществлять клинический мониторинг и коррекцию дозы.

Индукторы CYP3A4: данные о влиянии индукторов CYP3A4 на амлодипин отсутствуют. Совместное применение индукторов CYP3A4 (например, таких как рифампицин, зверобой (препараты зверобоя продырявленного)) может уменьшить концентрацию в плазме амлодипина. Амлодипин следует использовать с осторожностью вместе с индукторами CYP3A4.

Совместное применение амлодипина с грейпфрутом или грейпфрутовым соком не рекомендуется, поскольку могут увеличиться биодоступность амлодипина и, соответственно, его гипотензивное действие.

Дантролен (парентерально): в опытах на животных после введения верапамила и дантролена внутривенно наблюдалось развитие смертельной фибрилляции желудочков и

сердечно-сосудистой недостаточности в связи с гиперкалиемией. В связи с риском гиперкалиемии рекомендуется избегать одновременного введения блокаторов кальциевых каналов, таких как амлодипин, пациентам с риском развития злокачественной гипертермии или тем, которые получают лечение злокачественной гипертермии.

Влияние амлодипина на другие лекарственные средства

Амлодипин усиливает антигипертензивный эффект других антигипертензивных препаратов. В клинических исследованиях взаимодействий амлодипин не влиял на фармакокинетику аторвастатина, циклоспорина.

Симвастатин: совместное многократное применение амлодипина в дозе 10 мг с симвастатином в дозе 80 мг приводило к увеличению воздействия симвастатина на 77% по сравнению с монотерапией симвастатином. Рекомендуется ограничивать дозу симвастатина до 20 мг ежедневно у пациентов, получающих амлодипин.

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.

Условия хранения

В защищенном от влаги и света месте при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Упаковка

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку. Одну или три контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Отпуск из аптек

По рецепту.

Производитель:
РУП "Белмедпрепараты",
Республика Беларусь, 220007, г. Минск,
ул. Фабрициуса, 30, т./ф.: (+375 17) 220 37 16,
e-mail: medic@belmedpreparaty.com

