

18.03.10

ИНСТРУКЦИЯ по медицинскому применению препарата АМЛОТОП®

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Амлотоп®

Международное непатентованное название: Амлодипин

Лекарственная форма: таблетки

Состав:

1 таблетка содержит:

активное вещество: амлодипина безилат в пересчете на амлодипин 5,0 или 10,0 мг.

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кальция стеарат, кроскармеллоза натрия (примеллоза), кремния диоксид коллоидный (аэросил).

Описание: таблетки белого или почти белого цвета плоскоцилиндрические с фаской и риской.

Фармакотерапевтическая группа: блокатор «медленных» кальциевых каналов.

Код АТХ C08CA01

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКОЕ ДЕЙСТВИЕ

Фармакодинамика

Производное дигидропиридина – блокатор «медленных» кальциевых каналов (БМКК) 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 ионов кальция в клетку (в большей степени в гладкомышечные клетки сосудов, чем в кардиомиоциты).

Антиангинальное действие обусловлено расширением периферических и коронарных артерий и артериол. При стенокардии уменьшает выраженность ишемии миокарда; расширяя периферические артериолы, снижает общее периферическое сосудистое сопротивление (уменьшает постнагрузку на сердце), не вызывая рефлекторного увеличения частоты сердечных сокращений, что способствует снижению потребления энергии; снижает потребность миокарда в кислороде. Расширяя коронарные артерии и артериолы в неизмененных и ишемизированных зонах миокарда, увеличивает поступление кислорода в миокард при вазоспастической стенокардии; предотвращает развитие коронароспазма (в том числе вызванного курением).

У больных стенокардией разовая суточная доза амлодипина увеличивает время до наступления первого ишемического эпизода во время физической нагрузки, препятствует развитию приступа стенокардии и «ишемической» депрессии сегмента ST (на 1 мм) на фоне физической нагрузки, снижает частоту приступов стенокардии и потребления нитроглицерина.

Гипотензивное действие обусловлено прямым вазодилатирующим влиянием на гладкие мышцы сосудов. Оказывает длительный дозозависимый гипотензивный эффект.

При артериальной гипертензии разовая суточная доза амлодипина обеспечивает клинически значимое снижение артериального давления (АД) на протяжении 24 часов (в положении больного «лежа» и «стоя»). Не вызывает резкого снижения АД, фракции выброса левого желудочка. Не оказывает влияния на сократимость и проводимость

миокарда. Уменьшает степень гипертрофии миокарда левого желудочка. У пациентов с ишемической болезнью сердца (ИБС) (включая коронарный атеросклероз с поражением одного сосуда и до стеноза 3-х и более артерий и атеросклероза сонных артерий), перенесших инфаркт миокарда, чрескожную транслюминальную ангиопластику коронарных артерий (ТЛАП) или страдающих стенокардией, применение амлодипина предупреждает развитие утолщения интимы-медии сонных артерий, снижает летальность от инфаркта миокарда, инсульта, ТЛАП, аорто-коронарного шунтирования, приводит к снижению числа госпитализаций по поводу нестабильной стенокардии и прогрессирования хронической сердечной недостаточности, снижает частоту вмешательств, направленных на восстановление коронарного кровотока.

Амлодипин не повышает риск смерти или развития осложнений, приводящих к смертельным исходам у больных с хронической сердечной недостаточностью (ХСН) (III-IV функциональный класс по классификации NYHA) на фоне терапии дигоксином, диуретиками и ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента (АПФ).

У больных с ХСН (III-IV функциональный класс по классификации NYHA) неишемической этиологии при применении амлодипина существует вероятность возникновения отека легких.

Амлодипин не оказывает какого-либо неблагоприятного влияния на обмен веществ и концентрацию липидов плазмы крови. Тормозит агрегацию тромбоцитов, повышает скорость клубочковой фильтрации, обладает слабым натрийуретическим действием. При диабетической нефропатии не увеличивает выраженность микроальбуминурии.

Время наступления эффекта - 2-4 часа, длительность эффекта 24 часа.

Фармакокинетика

Всасывание. После перорального приема амлодипин хорошо абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на всасывание амлодипина. Максимальная концентрация в сыворотке крови достигается через 6-12 часов после приема. Биодоступность составляет 60-65%. Средний объем распределения - 21 л/кг массы тела. Связь с белками плазмы - 90-97%. Препарат проникает через гематоэнцефалический барьер.

Метаболизм и выведение. Амлодипин подвергается медленному, но значительному метаболизму (90%) в печени с образованием неактивных метаболитов, имеет низкий печеночный клиренс (эффект «первого прохождения» через печень). Период полувыведения составляет в среднем 35 часов (варьирует от 35 до 50 часов), что соответствует назначению препарата один раз в сутки. Общий клиренс - 500 мл/мин.

Стабильная равновесная концентрация в плазме достигается через 7-8 дней терапии.

Выводится почками (10% в неизменном виде, 60% в виде метаболитов), с желчью и через кишечник - 20-25% в виде метаболитов, а также с грудным молоком. При гемодиализе не удаляется.

У пожилых пациентов, пациентов с печеночной недостаточностью и тяжелой ХСН время полувыведения увеличивается до 60-65 часов; при нарушении функции почек - не изменяется.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

Артериальная гипертензия (монотерапия или в комбинации с другими антигипертензивными средствами).

Стабильная стенокардия напряжения и вазоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала) (монотерапия или в комбинации с другими антиангинальными средствами).

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- повышенная чувствительность к амлодипину и другим производным дигидропиридина, а также к другим компонентам, входящим в состав препарата;

- выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст.);
- коллапс, кардиогенный шок;
- клинически значимый стеноз аорты;
- беременность и период лактации;
- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не изучены);
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция.

С осторожностью

Нарушение функции печени, синдром слабости синусового узла (выраженная брадикардия, тахикардия), хроническая сердечная недостаточность неишемической этиологии III-IV функционального класса по классификации NYHA, артериальная гипотензия (систолическое АД более 90 и менее 100 мм рт.ст.), аортальный стеноз, митральный стеноз, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия (ГОКМП), острый инфаркт миокарда (и в течение 1 месяца после инфаркта миокарда), пожилой возраст.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь, один раз в сутки, независимо от приема пищи, запивая достаточным количеством воды (100 мл).

Начальная доза при артериальной гипертензии и стенокардии обычно составляет 5 мг. В зависимости от индивидуальной реакции пациента, доза может быть увеличена максимально до 10 мг в сутки. Повышение дозы рекомендуется проводить через 7-14 дней после начала терапии (более быстрое повышение дозы требует тщательного наблюдения за пациентом).

Пациентам с небольшой массой тела, невысокого роста, пожилым больным, больным с нарушением функции печени в качестве гипотензивного средства амлодипин назначают в начальной дозе 2,5 мг (1/2 таблетки 5 мг), в качестве антиангинального средства - 5 мг. Начальная доза 2,5 мг может также использоваться при добавлении амлодипина к терапии другими гипотензивными препаратами.

У больных с почечной недостаточностью коррекции дозы не требуется.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Частота побочных реакций: часто - более 1%, нечасто - более 0.1% и менее 1%, редко - более 0.01% и менее 0.1%, очень редко - менее 0.01%.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - периферические отеки (лодыжек и стоп), ощущение сердцебиения, ощущение жара и "приливов" крови к коже лица; нечасто - чрезмерное снижение АД, ортостатическая гипотензия, васкулит; редко - развитие или усугубление сердечной недостаточности; очень редко - нарушения ритма сердца (включая брадикардию, желудочковую тахикардию и мерцание предсердий), инфаркт миокарда, боли в грудной клетке.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: часто - повышенная утомляемость, головокружение, головная боль, сонливость; нечасто - недомогание, обморок, повышенное потоотделение, астения, гипестезии, парестезии, периферическая нейропатия, тремор, бессонница, эмоциональная лабильность, необычные сновидения, нервозность, депрессия, тревога; редко - судороги, апатия, агитация; очень редко - атаксия, амнезия, мигрень.

Со стороны пищеварительной системы: часто - боль в брюшной полости, тошнота; нечасто - рвота, запор, метеоризм, диспепсия, диарея, 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 опорно-двигательного аппарата: нечасто - артралгия, судороги мышц, миалгия, боль в спине, артроз; редко - миастения.

Со стороны обмена веществ: очень редко — гипергликемия.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - одышка, ринит; очень редко — кашель.

Со стороны мочеполовой системы: нечасто - учащенное мочеиспускание (поллакиурия), болезненные позывы на мочеиспускание, никтурия, импотенция; очень редко - дизурия, полиурия.

Аллергические реакции: нечасто - кожный зуд, сыпь; очень редко - ангионевротический отек, мультиформная эритема, крапивница.

Прочие: нечасто - алопеция, «звон» в ушах, гинекомастия, увеличение/снижение массы тела, нарушения зрения, диплопия, нарушение аккомодации, ксерофтальмия, конъюнктивит, боль в глазах, извращение вкуса, озноб, носовое кровотечение; редко - дерматит; очень редко - паросмия, ксеродермия, «холодный» пот, нарушение пигментации кожи.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы: выраженное снижение АД с возможным развитием рефлекторной тахикардии и чрезмерной периферической вазодилатации (риск развития выраженного и стойкого снижения артериального давления, в том числе с развитием шока и летального исхода).

Лечение: прием активированного угля (особенно в первые 2 часа после передозировки), промывание желудка (в некоторых случаях), поддержание функции сердечно-сосудистой системы, контроль показателей функции сердца и легких, контроль за объемом циркулирующей крови и диурезом. Больному следует принять горизонтальное положение с возвышенным положением нижних конечностей.

При отсутствии противопоказаний симптоматическая терапия: сосудосуживающие препараты, внутривенное введение кальция глюконата. Гемодиализ неэффективен.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Ингибиторы микросомальных ферментов печени могут повышать концентрацию амлодипина в плазме крови, усиливая риск развития побочных эффектов, а индукторы микросомальных ферментов печени - уменьшать.

В отличие от других БМКК не отмечается клинически значимого взаимодействия амлодипина с нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП), особенно индометацином.

Возможно усиление антиангинального и гипотензивного действия БМКК при совместном применении с тиазидными и «петлевыми» диуретиками, бета-адреноблокаторами, альфа1-адреноблокаторами, верапамилом, ингибиторами АПФ и нитратами.

Одновременный прием БМКК с нейролептиками и изофлураном может повышать гипотензивный эффект.

Некоторые БМКК могут усиливать выраженное отрицательное инотропное действие антиаритмических препаратов, вызывающих удлинение интервала QT (амиодарон, хинидин), однако при применении препарата амлодипин отрицательного инотропного действия обычно не наблюдается.

Препараты кальция могут уменьшать эффект БМКК.

При совместном применении БМКК с препаратами лития возможно усиление проявлений их нейротоксичности (тошнота, рвота, диарея, атаксия, тремор, шум в ушах), однако данные о препарате амлодипин отсутствуют.

Циметидин не влияет на фармакокинетику амлодипина.

Амлодипин не вызывает значительных изменений фармакокинетики циклоспорина.

Однократный прием антацидов, содержащих алюминий/магний, не оказывает существенного влияния на фармакокинетику амлодипина.

Однократный прием силденафила в дозе 100 мг у больных с эссенциальной артериальной гипертензией не оказывает влияния на параметры фармакокинетики амлодипина.

Повторное одновременное применение амлодипина в дозе 10 мг и аторвастатина в дозе 80 мг не оказывает существенного влияния на фармакокинетику аторвастатина.

При одновременном применении дигоксина и амлодипина концентрация дигоксина в сыворотке и его клиренс не меняются.

Амлодипин не влияет на изменение протромбинового времени, вызванное варфарином.

При однократном и повторном применении в дозе 10 мг амлодипин не оказывает существенного влияния на фармакокинетику этанола.

Противовирусные средства (ритонавир) увеличивают плазменные концентрации БМКК, в том числе амлодипина.

Одновременный однократный прием 240 мг грейпфрутового сока и 10 мг амлодипина внутрь не сопровождается существенным изменением фармакокинетики амлодипина.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

При лечении артериальной гипертензии амлодипин можно применять в комбинации с тиазидными диуретиками, альфа- и бета-адреноблокаторами, ингибиторами АПФ, нитратами короткого и пролонгированного действия, НПВП, антибиотиками и пероральными гипогликемическими средствами.

При лечении стенокардии амлодипин можно назначать в виде монотерапии или в комбинации с другими антиангинальными препаратами, в том числе у больных, рефрактерных к лечению нитратами и/или бета-адреноблокаторами, в адекватных дозах.

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).

Амлодипин не влияет на плазменные концентрации калия, глюкозы, триглицеридов, общего холестерина, ЛПНП, мочевой кислоты, креатинина и азота мочевой кислоты и может применяться у больных бронхиальной астмой, сахарным диабетом и подагрой.

Амлодипин может применяться у пациентов, предрасположенных к вазоспазму/вазоконстрикции.

Пациентам с низкой массой тела или низкого роста, пожилым пациентам, а также пациентам с выраженной печеночной недостаточностью могут потребоваться меньшие дозы. При увеличении дозы необходимо тщательное наблюдение за пожилыми пациентами.

Несмотря на отсутствие у блокаторов «медленных» кальциевых каналов синдрома «отмены», перед прекращением лечения рекомендуется постепенное уменьшение доз.

Женщины детородного возраста в период лечения амлодипином должны использовать надежные методы контрацепции.

Таблетки амлодипина не рекомендуются при гипертоническом кризе.

Влияние на способность к управлению автомобилем и механизмами

У некоторых пациентов, преимущественно в начале лечения или при изменении режима дозирования, вследствие возможного выраженного снижения АД могут возникать сонливость, головокружение и другие побочные эффекты. При их возникновении не рекомендуется управление автомобилем и работа с механизмами.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки по 5 и 10 мг. По 10 или 30 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой. 2 или 3 контурные ячейковые упаковки по 10 таблеток или 1 контурная ячейковая упаковка по 30 таблеток вместе с инструкцией по

применению в пачке из картона.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

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

СРОК ГОДНОСТИ

3 года. Не использовать после истечения срока годности.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

По рецепту.

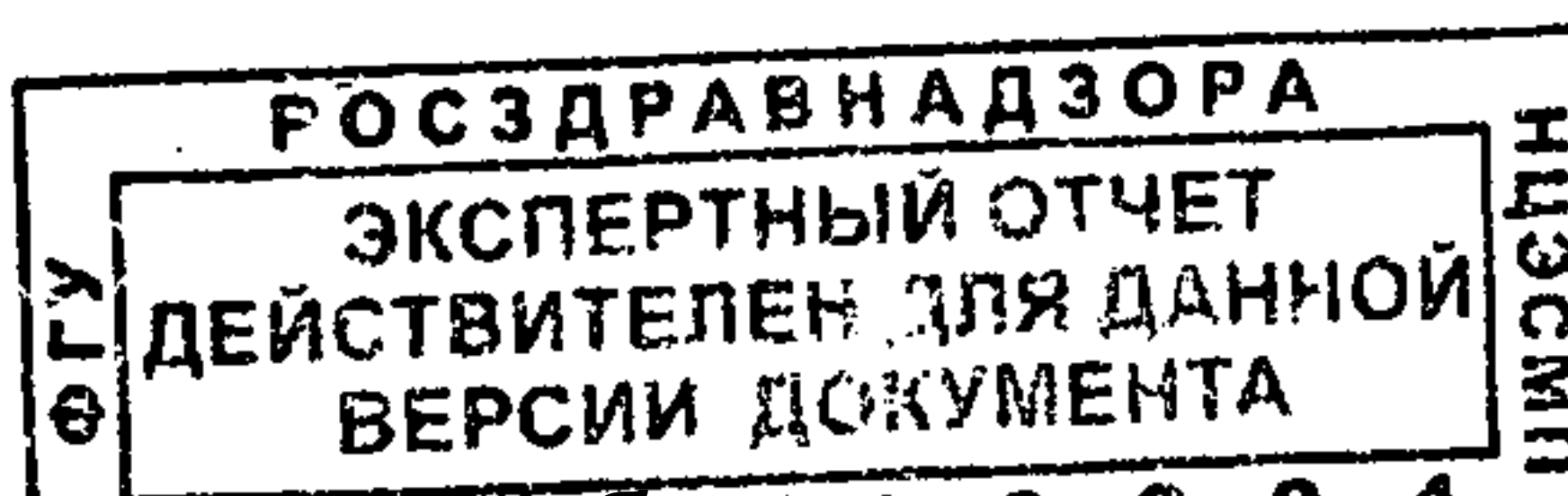
Производитель / Претензии потребителей направлять в адрес ЗАО «МАКИЗ-ФАРМА».

ЗАО «МАКИЗ-ФАРМА», Россия
109029, Россия г. Москва,
Автомобильный проезд, д. 6
тел.: (495) 974-70-00
факс: (495) 974-11-10
e-mail: mail@makiz-pharma.ru

Представитель ЗАО «МАКИЗ-ФАРМА»



О.Э.Петрушина



Больше информации об этом лекарстве на ПроТаблетки 55890.

<https://protabletky.ru/amlotop/>