

ЛИСТОК-ВКЛАДЫШ
(Информация для потребителей)

АМЛОДИПИН
5 мг таблетки для приема внутрь

Регистрационное свидетельство N 14870
Торговое название препарата – АМЛОДИПИН
Международное (непатентованное) название препарата -
АМЛОДИПИН (AMLODIPINE)

Лекарственная форма: таблетки для приема внутрь

Химическое название и CAS номер
2-[(2-Аминоэтокси)метил]-4-(2-хлорфенил)-1,4-дигидро-6-метил-3,5-пиридин дикарбоновой кислоты 3-этил 5-метилвый эфир (в форме бесилата); 111470-99-6.

Общая характеристика

Основные физико-химические свойства
Круглые плоские таблетки белого или почти белого цвета с риской.

Состав

Одна таблетка содержит:
активное вещество: амлодипин (в форме бесилата) - 5 мг;
вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат, микрокристаллическая целлюлоза, натрия крахмала гликолат, магния стеарат.

Фармакологическая группа: сердечно-сосудистые препараты
Селективные блокаторы кальциевых каналов, производные дигидропиридина.

Код АТХ
C08CA01

Фармакологические свойства

Фармакокинетика
После приема внутрь амлодипин хорошо абсорбируется из ЖКТ. Средняя абсолютная биодоступность составляет 64–80%, T_{max} в сыворотке крови — 6–12 ч. Стабильная равновесная концентрация в плазме крови (C_{ss}) достигаются после 7–8 дней терапии. Прием пищи не влияет на абсорбцию амлодипина, проникает через гематоэнцефалический барьер. Средний V_d (объем распределения) составляет 21 л/кг, 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. Амлодипин подвергается медленному, но активному метаболизму в печени при отсутствии значимого эффекта первого прохождения. Метаболиты не обладают существенной фармакологической активностью.

После однократного приема период полувыведения ($T_{1/2}$) варьирует от 35 до 50 ч. Около 60% принятой внутрь дозы выводится почками преимущественно в виде метаболитов, 10% — в неизменном виде, а 20–25% — через кишечник с желчью.

Фармакодинамика

Производное дигидропиридина — БКК III поколения, оказывает гипотензивный и антиангинальный эффект. Блокирует медленные кальциевые каналы, снижает трансмембранный переход ионов кальция в клетку (в большей степени — в гладкомышечные клетки сосудов, чем в кардиомиоциты). При стенокардии уменьшает выраженность ишемии миокарда, расширяя периферические артериолы, снижает ОПСС, уменьшает постнагрузку на сердце, снижает потребность миокарда в кислороде. Расширяет коронарные артерии и артериолы в неизмененных и в ишемизированных зонах миокарда, увеличивает поступление кислорода в миокард (особенно при вазоспастической стенокардии); предотвращает спазм коронарных артерий (в т.ч. вызванный курением).

У больных стабильной стенокардией разовая суточная доза увеличивает толерантность к физической нагрузке, замедляет развитие приступов стенокардии и ишемической депрессии сегмента ST, снижает частоту приступов стенокардии и потребления нитроглицерина и других нитратов.

Оказывает длительное дозозависимое антигипертензивное действие, механизм которого обусловлен прямым расслабляющим влиянием на гладкие мышцы сосудов. У пациентов с артериальной гипертензией разовая доза Амлодипина обеспечивает клинически значимое снижение АД на протяжении 24 ч как в положении лежа, так и стоя.

Ортостатическая гипотензия при применении амлодипина встречается достаточно редко.

У пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями (включая коронарный атеросклероз с поражением одного сосуда и до стеноза 3 и более артерий и атеросклероза сонных артерий), перенесших инфаркт миокарда, чрескожную транслюминальную ангиопластику коронарных артерий (ТЛП) или страдающих стенокардией, применение Амлодипина предупреждает развитие утолщения интимы-медии сонных артерий, снижает летальность от инфаркта миокарда, инсульта, ТЛП, аортокоронарного шунтирования, приводит к снижению числа госпитализаций по поводу нестабильной стенокардии и прогрессирования хронической сердечной недостаточности, снижает частоту вмешательств, направленных на восстановление коронарного кровотока.

Показания

-артериальная гипертензия (как в монотерапии, так и в сочетании с другими гипотензивными средствами)
-стабильная стенокардия и 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 объемом воды (100 мл).

При артериальной гипертензии и стенокардии обычная начальная доза составляет 5 мг, в зависимости от индивидуальной реакции больного ее можно увеличить до максимальной — 10 мг.

Применение у пожилых людей. Амлодипин рекомендуется применять в средней терапевтической дозе, коррекции дозы не требуется.

Применение при почечной недостаточности. Рекомендуется применять в обычных дозах, однако необходимо учитывать возможное незначительное увеличение $T_{1/2}$.

Изменение режима дозирования Амлодипина при одновременном применении тиазидных диуретиков, бета-адреноблокаторов или ингибиторов ангиотензин-превращающего фермента (АПФ) не требуется.

Курс лечения устанавливается лечащим врачом.

Применение у детей (6-17 лет)

Рекомендуемая антигипертензивная пероральная доза для детей составляет от 2,5 до 5 мг один раз в сутки. Дозы свыше 5 мг в сутки не исследовались для данной популяции пациентов.

Побочное действие

Центральная и периферическая нервная система: часто — головная боль, недомогание, сонливость; редко — гипертония, гипестезия, парестезия, периферическая нейропатия, тремор, извращение вкуса, обморок;

Сердечно-сосудистая система: часто - повышенное сердцебиение; редко -инфаркт миокарда, аритмия, боль в грудной клетке;

Сосудистые явления: часто — ощущение жара и приливов к лицу; редко — гипотензия, васкулит;

Желудочно-кишечный тракт: часто — боль в животе, тошнота; редко - запор, сухость во рту, диспепсия (включая гастрит), гиперплазия десен, панкреатит, тошнота;

Общие реакции: часто — отеки, повышенная утомляемость; редко — астения, недомогание, боли;

Кровотворная и лимфатическая система: редко — лейкопения, тромбоцитопения;

Обмен веществ: редко — гипергликемия; редко — снижение/ увеличение веса;

Со стороны психики: редко — бессонница, перепады настроения;

Со стороны зрительной системы: редко — нарушение зрения;

Со стороны слуха: редко — звон в ушах;

Респираторная система: редко — кашель, одышка, ринит;

Кожные покровы: редко — алопеция, повышенное потоотделение, крапивница, нарушение пигментации кожи, пурпура;

Скелетно-мышечная система и соединительная ткань: редко — артралгия, боль в спине, мышечные судороги, миалгия;

Мочевыводящая система: редко — учащение мочеиспускания, нарушение мочеиспускания, нокутия;

Репродуктивная система: редко — гинекомастия, импотенция;

Аллергические реакции: редко — кожный зуд, сыпь, ангионевротический отек, мультиформная эритема.

Крайне редко встречаются явления: гепатит, желтуха и повышение активности "печеночных " трансаминаз (обычно сочетающиеся с холестатическими явлениями).

Наиболее часто встречающиеся побочные явления для детей (6-17 лет)

Центральная и периферическая нервная система: головная боль, недомогание;

Сосудистые явления: вазодилатация;

Респираторная система: носовое кровотечение;

Желудочно-кишечный тракт: боль в животе;

Общие реакции: астения.