

АВТОРЕКС

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Торговое название
Авторекс

Международное непатентованное наименование
Амлодипин

Лекарственная форма
Таблетки

Состав

Авторекс 5 мг: каждая таблетка содержит **Активное вещество:**

Амлодипина бесилат, эквивалентно амлодипину 5 мг
Вспомогательные вещества: коповидон, маннитол, микрокристаллическая целлюлоза, очищенный тальк, натрия крахмалгликолят, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Авторекс 10 мг: каждая таблетка содержит **Активное вещество:**

Амлодипина бесилат, эквивалентно амлодипину 10 мг
Вспомогательные вещества: коповидон, маннитол, микрокристаллическая целлюлоза, очищенный тальк, натрия крахмалгликолят, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Описание

Авторекс 5 мг:

Таблетки белого цвета, однородные, круглые, двояковыпуклые с риской на одной стороне.

Авторекс 10 мг:

Таблетки белого цвета, однородные, круглые, с плоской поверхностью, с фаской и разделительной риской на одной стороне.

Фармакотерапевтическая группа

Селективные блокаторы кальциевых каналов с преимущественным влиянием на сосуды. Дигидропиридиновые производные.

Код АТХ: C08CA01

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Блокатор медленных кальциевых каналов II поколения, производное дигидропиридина. Оказывает антигипертензивное и антиангинальное действие.

Связываясь с дигидропиридиновыми рецепторами, блокирует кальциевые каналы, снижает трансмембранный переход ионов кальция в клетку (в большей степени в гладкомышечные клетки сосудов, чем в кардиомиоциты). Ангиоингибальное действие обусловлено расширением коронарных и периферических артерий и артериол. При стенокардии уменьшает выраженность ишемии миокарда. Расширяя периферические артериолы, снижает ОПСС, уменьшает преднагрузку на сердце, снижает потребность миокарда в кислороде. Расширяя главные коронарные артерии и артериолы в неизмененных и ишемизированных зонах миокарда, увеличивает поступление кислорода в миокард (особенно при вазоспастической стенокардии). Противопоставляет развитие вазоспастической стенокардии (в т.ч. вызванной курением).

У больных стенокардией разовая суточная доза Авторекс увеличивает время выполнения физической нагрузки, замедляет развитие стенокардии и ишемической депрессии сегмента ST, снижает частоту приступов стенокардии и потребления нитратов.

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 левого желудочка. Уменьшает степень гипертрофии миокарда левого желудочка, оказывает антиатеросклеротическое и кардиопротекторное действие при ИБС. Не оказывает влияния на сократимость и проводимость миокарда, не вызывает рефлекторного увеличения ЧСС.

Тромбоцит агрегацию тромбоцитов, повышает скорость клубочковой фильтрации, обладает слабым натрийуретическим действием.

При диабетической нефропатии не увеличивает выраженность микроальбуминурии. Не оказывает неблагоприятного влияния на обмен веществ и содержание липидов в плазме крови.

Терапевтическое действие развивается через 2-4 ч, длительность действия - 24 ч.

Фармакокинетика

Всасывание: После приема внутрь амлодипин медленно абсорбируется из ЖКТ. Время приема и состав пищи не влияют на степень абсорбции препарата. Абсолютная биодоступность составляет 64%. Стах достигается через 6-

9 ч. Выявляется линейная зависимость содержания амлодипина в крови от дозы препарата Авторекс. Прием пищи не изменяет биодоступность амлодипина.

Распределение: Средний Vd составляет 21 л/кг массы тела, что указывает на то, что большая часть препарата находится в тканях, а относительно меньшая - в крови. C_{ss} достигается через 7 дней постоянного приема препарата. Связывание с белками плазмы крови - 95%. Проникает через ГЭБ.

Метаболизм: Амлодипин подвергается медленному, но экстенсивному метаболизму (90% в печени с образованием неактивных метаболитов, подвергается эффекту "первого прохождения" через печень. Метаболиты не обладают значимой фармакологической активностью.

Выведение: После однократного приема внутрь T_{1/2} варьирует от 31 до 48 ч, а при повторном назначении составляет около 45 ч. В печени биотрансформируется около 90% амлодипина с образованием неактивных метаболитов. Выводится почками: 60% в виде метаболитов, 10% - в неизменном виде; с калом - 20-25% в виде метаболитов. Выделяется с грудным молоком. Общий клиренс составляет 0,116 мл/с/кг (7 мл/мин/кг, 0,42 л/ч/кг).

Фармакокинетика в особых клинических случаях: У пожилых пациентов старше 65 лет выведение амлодипина замедлено (T_{1/2} - 65 ч) по сравнению с молодыми пациентами, однако эта разница не имеет клинического значения. У пациентов с печеночной недостаточностью предполагается удлинение T_{1/2} и при длительном назначении кумуляция препарата в организме будет выше (T_{1/2} увеличивается до 60 ч). Почечная недостаточность не оказывает существенного влияния на кинетику амлодипина.

При гемодиализе не удаляется.

Показания к применению

- Артериальная гипертензия (монотерапия или в комбинации с другими гипотензивными средствами).
- Стенокардия напряжения, вазоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала) (в монотерапии или в комбинации с другими антиангинальными средствами).

Противопоказания

- тяжелая артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст.);
- коллапс;
- кардиогенный шок;
- нестабильная стенокардия (за исключением стенокардии Принцметала);
- беременность;
- период лактации (грудного вскармливания);
- детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);
- повышенная чувствительность к компонентам препарата;
- повышенная чувствительность к дигидропиридинам.

С осторожностью следует назначать препарат при нарушениях функции печени, СССУ (выраженная брадикардия, тахикардия), хронической сердечной недостаточности в стадии декомпенсации, мягкой или умеренной артериальной гипотензии, аортальном стенозе, митральном стенозе, гипертрофической обструктивной кардиомиопатии, остром инфаркте миокарда (и в течение 1 мес после), сахарном диабете, нарушениях липидного обмена, пациентам пожилого возраста.

Применение при нарушениях функции печени: с осторожностью следует назначать препарат при нарушениях функции печени.

Применение при нарушениях функции почек: При почечной недостаточности коррекция дозы не требуется.

Способ применения и дозы

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

Начальная доза при артериальной гипертензии и стенокардии составляет 5 мг 1 раз в сутки. Доза максимально может быть увеличена до 10 мг 1 раз в сутки. Повышение дозы рекомендуется проводить через 7-14 дней после начала терапии (более быстрое повышение дозы требует тщательного наблюдения за пациентом).

У пациентов пожилого возраста может увеличиваться T_{1/2} амлодипина и снижаться клиренс креатинина (КК). Изменение доз не требуется, но необходимо более тщательное наблюдение за пациентами.

Не требуется изменения дозы при одновременном применении с тиазидными диуретиками, бета-адреноблокаторами и ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (АПФ).

Не требуется изменения дозы у пациентов с почечной недостаточностью.

Побочные эффекты

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение, одышка, выраженное снижение АД, обморок, васкулит, отеки (отечность лодыжек и стоп), приливы крови к лицу; редко - нарушения ритма (брадикардия, желудочковая тахикардия,

трепетание предсердий), боль в грудной клетке, ортостатическая гипотензия; очень редко – инфаркт миокарда, боль в грудной клетке.

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение, утомляемость, сонливость, изменение настроения, судороги; редко - потеря сознания, гипестезия, нервозность, парестезия, тремор, вертиго, астеня, недомогание, бессонница, депрессия, необычные сновидения; нечасто – периферическая нейропатия, лабильность настроения, повышенная возбудимость; очень редко - атаксия, апатия, агитация, амнезия; неизвестно – экстропирамидные нарушения.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, боли в эпигастрии; редко - повышение уровня печеночных трансаминаз и желтуха (обусловленные холестазом), панкреатит, сухость во рту, метеоризм, гиперплазия десен, запор или диарея; очень редко - гастрит, повышение аппетита.

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

Дерматологические реакции: очень редко - кератодермия, алопеция, дерматит, пурпура, изменение цвета кожи.

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

Со стороны костно-мышечной системы: редко - артралгия, артроз, боль в спине, миалгия (при длительном применении); очень редко - миастения.

Со стороны органов чувств: редко - диплопия, конъюнктивит, боль в глазах, нарушение зрения, конъюнктивит, звон в ушах; очень редко - паросмия, нарушение вкусовых ощущений, нарушение аккомодации, ксерофтальмия.

Со стороны органов кроветворения: редко - тромбоцитопения, лейкопения; очень редко – тромбоцитопеническая пурпура.

Аллергические реакции: кожный зуд, сыпь (в т.ч. эритематозная, макуло-папулезная сыпь, крапивница), ангионевротический отек; очень редко – мультиформная эритема.

Прочие: редко - гинекомастия, увеличение/снижение массы тела, гипергликемия, носовое кровотечение, повышенное потоотделение, жажда; очень редко - холодный липкий пот.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение артериального давления, тахикардия, чрезмерная периферическая вазодилатация.

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля, поддержание функции сердечно-сосудистой системы, контроль показателей функции сердца и легких, возвышенное положение нижних конечностей, контроль за объемом циркулирующей крови и диурезом. Для восстановления тонуса сосудов - применение сосудосуживающих препаратов (при отсутствии противопоказаний к их применению); для устранения последстий блокады кальциевых каналов - внутривенное введение глюконата кальция. Гемодиализ не эффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Ингибиторы микросомального окисления повышают концентрацию амлодипина в плазме крови, усиливая риск развития побочных эффектов, а индукторы микросомальных ферментов печени уменьшают.

Гипотензивный эффект ослабляют нестероидные противовоспалительные препараты, особенно индометацин (задержка натрия и блокада синтеза простагландинов почками), альфа-адреностимуляторы, эстрогены (задержка натрия), симпатомиметики. Тиазидные и «петлевые» диуретики, бета-адреноблокаторы, верапамил, ингибиторы АПФ и нитраты усиливают антиангинальные и гипотензивные эффекты.

Эритромицин при совместном применении повышает Сmax амлодипина у молодых пациентов на 22%, а у пожилых - на 50%.

Однократный прием 100 мг силденафила у пациентов артериальной 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.

Этанол (напитки, содержащие алкоголь): амлодипин при однократном и повторном применении в дозе 10 мг не влияет на фармакокинетику этанола.

Противовирусные средства (ритонавир) увеличивают плазменные концентрации БМКК, в том числе и амлодипина. Амлодарон, хинидин, альфа 1-адреноблокаторы, антипсихотические лекарственные средства (нейролептики) и блокаторы «медленных» кальциевых каналов могут усиливать гипотензивное действие.

Не оказывает влияния на фармакокинетические параметры дигоксина и варфарина.

Циметидин не влияет на фармакокинетику амлодипина.

При совместном применении с препаратами лития возможно усиление проявлений их нейротоксичности (тошнота, рвота, диарея, атаксия, тремор, шум в ушах).

Препараты кальция могут уменьшить эффект блокаторов «медленных» кальциевых каналов.

Прокаинамид, хинидин и другие лекарственные средства, вызывающие удлинение интервала QT, усиливают отрицательный инотропный эффект и могут повышать риск значительного удлинения интервала QT.

Грейпфрутовый сок может снижать концентрацию амлодипина в плазме крови, однако это снижение настолько мало, что значимо не изменяет действие амлодипина.

Особые указания

В период лечения необходим контроль за массой тела и потреблением натрия.

Необходимо поддержание гигиены полости рта и частое посещение стоматолога (для предотвращения болезненности, кровоточивости и гиперплазии десен).

При применении препарата Авторекс у пациентов с хронической сердечной недостаточностью III и IV функционального класса по классификации NYHA возможно развитие отека легких.

Режим дозирования для пожилых такой же, как и для пациентов других возрастных групп.

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.

Авторекс не влияет на содержание калия и плазменные концентрации глюкозы, триглицеридов, общего холестерина, липопротеинов низкой плотности (ЛПНП), мочевой кислоты, креатинина и азота мочевиной кислоты. Авторекс может применяться для лечения артериальной гипертензии в комбинации с тиазидными диуретиками, альфа-адреноблокаторами, бета-адреноблокаторами или ингибиторами АПФ. У пациентов со стабильной стенокардией препарат можно комбинировать с другими антиангинальными средствами, например, с нитратами пролонгированного или короткого действия, бета-адреноблокаторами.

Применение при беременности и в период лактации

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами

Не было сообщений о влиянии Авторекс на управление транспортными средствами или работу с механизмами. Тем не менее, у некоторых пациентов преимущественно в начале лечения могут возникать сонливость и головокружение. При их возникновении пациент должен воздержаться от управления транспортными средствами и работы с механизмами.

Форма выпуска

10 таблеток по 5 мг или 10 мг в блистере.

3 блистера, вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

Условия хранения

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

Срок годности

3 года. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска

По рецепту врача.

Владелец торговой марки и регистрационного удостоверения:

Belinda Laboratories LLP,
Лондон, Великобритания

Производитель:

РЕПЛЕК ФАРМ Лтд, Скопье
1000, Скопье, ул. Козле 188,
Республика Македония

Адрес организации, принимающей на территории Кыргызской Республики претензии от потребителей по качеству продукции (товара):

ОсОО «Aman Pharm» (Аман Фарм),
Республика Кыргызстан, город Бишкек, ул. Шооруюкова 36.
Тел: (0312) 560466, E-mail: aman.pharm12@gmail.com



APPROVED for
KYRGYZSTAN

31.07.2019

