

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

АМЛОДИПИН АЛКАЛОИД® 5 mg таблетки
АМЛОДИПИН АЛКАЛОИД® 10 mg таблетки

AMLODIPIN ALKALOID® 5 mg tablets
AMLODIPIN ALKALOID® 10 mg tablets

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20070047/48
Разрешение №	11-18336718.06.2012
Одобрение №	

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 6.934 mg амлодипинов безилат еквивалентен на 5 mg амлодипин (amlodipine).

Всяка таблетка съдържа 13.869 mg амлодипинов безилат еквивалентен на 10 mg амлодипин (amlodipine).

За пълния списък на помощните вещества, вж. точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

* Таблетки

Амлодипин Алкалоид® 5 mg таблетки

Кръгли, двойноизпъкнали, бели таблетки с делителна черта от едната страна. Таблетката може да бъде разделена на две равни половини.

Амлодипин Алкалоид® 10 mg таблетки

Кръгли, двойноизпъкнали, бели таблетки с делителна черта от едната страна. Делителната черта е само за улесняване на счупването за по-лесно поглъщане, а не за разделяне на равни дози.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Хипертония

Амлодипин е предназначен за лечение на хипертония.

При пациенти с хипертония амлодипин е използван в комбинация с тиазидни диуретици, алфа-блокери, бета-блокери или с инхибитори на ангиотензин конвертиращия ензим.



Коронарна артериална болест

Хронична стабилна ангина

Амлодипин е показан за симптоматично лечение на хронична стабилна ангина.

Вазоспастична ангина (Принцметал ангина или вариант)

Амлодипин е показан за лечение на пациенти с доказана или предполагаема вазоспастична ангина.

При пациенти със стенокардия амлодипин може да се прилага като монотерапия или в комбинация с други антистенокардни средства в случай, че стенокардията е рефрактерна към нитрати и/или адекватни дози бета-блокери.

Амлодипин се понася добре от пациентите със сърдечна недостатъчност и с история за хипертония или исхемична болест на сърцето.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Възрастни: обичайната начална доза както за хипертония, така и за стенокардия е 5 mg амлодипин веднъж дневно като може да се увеличи до максимална доза от 10 mg в зависимост от индивидуалния отговор на пациента. Дозата се титрира в продължение на 7 до 14 дни, така че лекуващият лекар да може напълно да прецени индивидуалния отговор за всяко избрано ниво на дозата. Титрирането на дозата може да се извърши и в по-съкратен срок, ако това е клинично необходимо и ако е осигурено наблюдение на пациента.

Деца (възраст 6-17 години): Ефективната антихипертензивна перорална доза при деца на възраст 5-17 години е 2.5 mg до 5 mg веднъж дневно. Дози, надвишаващи 5 mg дневно не са изпитвани при деца в тази възраст.

Деца (възраст под 6 години): не се препоръчва.

При **отслабнали, изтощени** и пациенти **в напреднала възраст**, както и при пациенти с **чернодробна недостатъчност** началната доза е 2.5 mg дневно. Тази доза се прилага и когато амлодипин се добавя към съществуваща антихипертензивна терапия.

Пациенти с бъбречни увреждания: промените в плазмените концентрации на амлодипин не корелират със степента на бъбречно увреждане. Затова се препоръчват обичайните дози. Амлодипин не се диализира.

Едновременно приложение с други антихипертензивни и/или антистенокардни средства: Не са необходими корекции на дозата амлодипин при едновременно приложение с тиазидни диуретици, бета-блокери, инхибитори на ангиотензин конвектиращия ензим, бавно-действащи нитрати и/или сублингвален нитроглицерин.

4.3 Противопоказания

Амлодипин е противопоказан при пациенти със свръхчувствителност към дихидропиридинови, амлодипин или някое от помощните вещества. Амлодипин не трябва да се използва при кардиогенен шок, клинично значима аортна стеноза, нестабилна ангина пекторис (с изключение на *Принцметал*



ангина).

Амлодипин не трябва да се използва при бременност и кърмене.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Усилваща се стенокардия и/или инфаркт на миокарда: Рядко при започване на терапия с калциеви антагонисти или при увеличаване на дозата на калциевия антагонист у пациенти, особено такива с тежка обструктивна болест на коронарните артерии, се е появявала документирана увеличена продължителност, честота и/или тежест на стенокардни пристъп или остър миокарден инфаркт. Механизмът на този ефект не е изяснен.

Общо: Тъй като вазодилатиращият ефект, предизвикван от амлодипин, се проявява постепенно, рядко се съобщава за остра хипотензия след орален прием. Независимо от това необходимо е внимание при назначаването на амлодипин, както е при всеки периферен вазодилататор, особено при пациенти с тежка аортна стеноза.

Приложение при пациенти със застойна сърдечна недостатъчност: Най-общо калциевите антагонисти се прилагат внимателно при пациенти със сърдечна недостатъчност.

Преустановяване на приема на бета-блокери: Амлодипин не е бета-блокатор и затова не предпазва от опасностите при рязко преустановяване на приема на бета-блокери. Всяко преустановяване на приема на бета-блокери трябва да става постепенно чрез намаляване на дозата на бета-блокера.

Пациенти с чернодробна недостатъчност: Тъй като амлодипин се метаболизира в черния дроб и плазменият полуживот на елиминация ($t_{1/2}$) при пациенти с увредени чернодробни функции е 56 часа, необходимо е внимание при назначаването на амлодипин на пациенти с тежки чернодробни увреждания.

Важна информация относно някои от съставките на Амлодипин Алкалоид Амлодипин Алкалоид съдържа лактоза. Пациенти с редки наследствени проблеми на галактозна непоносимост, Lapp лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат това лекарство.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Амлодипин е прилаган безопасно с тиазидни диуретици, алфа-блокери, бета-блокери, инхибитори на ангиотензин конвертиращия ензим, нитрати с продължително действие, нитроглицерин, нестероидни противовъзпалителни средства, антибиотици и орални антидиабетни средства.

Данните от ин витро изследвания на човешка плазма показват, че амлодипин не оказва влияние върху свързването с белтъците на дигоксин, фенитоин, варфарин или индометацин.

Специални изследвания: Ефект на други лекарства върху амлодипин
Циметидин: едновременният прием на амлодипин с циметидин не променя фармакокинетиката на амлодипин.



Сок от грейпфрут: едновременният прием на 240 мл сок от грейпфрут с еднократна орална доза амлодипин от 10 mg от 20 здрави доброволци не е предизвикал значителен ефект върху фармакокинетиката на амлодипин.

Силденафил: при използването на амлодипин и силденафил в комбинация, двата медикамента са оказали независимо своя хипотензивен ефект върху кръвното налягане.

Специални изследвания: Ефект на амлодипин върху други лекарства

Аторвастатин: едновременното многократно приложение на дози от 10 mg амлодипин с 80 mg аторвастатин не е довело до значителни промени в равновесното състояние на фармакокинетичните параметри на аторвастатин.

Дигоксин: едновременното приложение на амлодипин с дигоксин не променя серумните нива на дигоксин и бъбречния клирънс на дигоксин при здрави доброволци.

Варфарин: Едновременното приложение на амлодипин и варфарин не променя ефекта на варфарин върху протромбиновото време.

Циклоспорин: фармакокинетичните изследвания със циклоспорин показват, че амлодипин не променя значително фармакокинетиката на циклоспорин.

Ефект върху лабораторните показатели: не са известни.

4.6 Бременност и кърмене

Въпреки че за някои дихидропиридинови съединения е познато, че са тератогенни при животни, при плхове и зайци върху които е прилаган амлодипин, няма данни за тератогенен ефект. Не съществува клиничен опит с амлодипин по време на бременност или кърмене. Съответно, не трябва да се приема по време на бременност или кърмене, както и при жени с детероден потенциал, освен ако се използва ефективна контрацепция.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Клиничният опит при амлодипин показва, че лечението с него не повлиява възможностите на пациента да шофира и да работи с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Възможните нежелани лекарствени реакции, за които е съобщавано, са класифицирани съгласно системно-органна класификация. Възприета е следната честота на нежеланите лекарствени реакции: много чести (>1/10); чести (>1/100, <1/10); не чести (>1/1,000, <1/100); редки (>1/10,000, <1/1,000) и много редки (<1/10,000), (вкл. изолирани съобщения).

Нарушения на кръвта и лимфната система

Много рядко: тромбоцитопения.

Нарушения на имунната система

Много рядко: алергична реакция.

Нарушения на метаболизма и храненето



Много рядко: хипергликемия.

Психични нарушения

Необичайно: безсъние, промени в настроението.

Нарушения на нервната система

Често: сънливост, замаяност, главоболие

Необичайно: тремор, променен вкус, синкоп, хипоестезия, парестезия

Много рядко: периферна невропатия

Нарушения на очите

Необичайно: нарушено зрение.

Нарушения на ухото и лабиринта

Необичайно: шум в ушите;

Много рядко: инфаркт на миокарда, аритмия, вентрикуларна тахикардия и камерна фибрилация.

Сърдечни нарушения

Често: палпитации.

Съдови нарушения

Често: зачервяване;

Необичайно: хипотензия;

Много рядко: васкулит.

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения

Необичайно: диспнея, ринит;

Много рядко: кашлица.

Стомачно-чревни нарушения

Често: гадене, коремни болки;

Необичайно: повръщане, диспепсия, промяна в обичайната перисталтика на червата (включително диария и запек), сухота в устата;

Много рядко: панкреатит, гастрит, гингивална хиперплазия.

Хепато-билиарни нарушения

Много рядко: хепатит, жълтеница и повишени чернодробни ензими (обикновено свързано с холестаза).

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

Необичайно: алоpecia, пурпура, депигментация на кожата, повишено потоотделяне, пруритус, обрив;

Много рядко: ангиоедем, еритема мултиформе, уртикария.

Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан

Необичайно: мускулни крампи, болки в гърба, миалгия и артралгия.

Нарушения на бъбреците и никочните пътища

Необичайно: микционни смущения, ноктурия, често уриниране.

Нарушения на възпроизводителната система и гърдата

Необичайно: импотентност, гинекомастия.

Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение

Често: едем, уморяемост;

Необичайно: гръдна болка, астения, болка, общо неразположение.

Изследвания

Необичайно: повишено тегло, отслабване на тегло.



4.9 Предозиране

Наличните данни предполагат, че масивното предозиране може да доведе до прекомерна периферна вазодилатация и вероятност от рефлексна тахикардия. Съобщено е за чувствителна и вероятно продължителна системна хипотензия, включително шок с фатален изход.

Прилагането на активен въглен на здрави доброволци веднага или до два часа след поглъщането на амлодипин 10 mg не е показало значително понижение в абсорбцията на амлодипин. Стомашната промивка може да помогне в някои случаи. Клинично значимата хипотензия в резултат на предозиране на амлодипин изисква активно сърдечно-съдово наблюдение, включващо често мониториране на сърдечната и дихателната функция, повдигане на крайниците и следене на циркулаторния обем и отделянето на урина. Назначаването на вазоконстриктор може да е от полза за възстановяването на съдовия тонус и кръвното налягане в случаите, когато не е налице контраиндикация за прилагането му. Венозното вливане на калциев глюконат може да се окаже благоприятно за обръщане на ефекта на блокада на калциевите канали. Тъй като амлодипин се свързва с висок афинитет с белтъците, счита се, че диализата не е от полза.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: селективен калциев антагонист,
АТС код: C08CA01

Амлодипин е инхибитор на калицевия инфлукс от групата на дихидропиридините (калциев антагонист, блокиращ навлизането на калция през бавните канали) и инхибира трансмембрания инфлукс на калциеви йони в сърдечните и съдовите гладкомускулни клетки.

Механизмът на антихипертензивното действие на амлодипин се дължи на директния релаксиращ ефект върху съдовата гладка мускулатура. Точният механизъм, по който амлодипин облекчава стенокардната болка не е определен напълно, но амлодипин редуцира исхемичното страдание чрез следните си действия:

- 1) Амлодипин разширява периферните артериоли и по този начин редуцира общото периферно съпротивление (следнатоварване), срещу което работи сърцето. Тъй като сърдечната честота остава стабилна, отбременяването на сърцето понижава консумацията на енергия и кислородната нужда на сърцето.
- 2) Механизмът на действие на амлодипин вероятно включва също дилатация на основните коронарни артерии и коронарни артериоли, както в незасегнатите, така и в исхемичните участъци. Тази дилатация увеличава доставката на кислород до миокарда при пациенти със спазъм на коронарните артерии (ангина на Принцметал и варианти)



При пациенти с хипертония еднократният дневен прием осигурява клинично значимо понижение на артериалното налягане както в легнало, така и в изправено положение за целия 24-часов интервал. Поради бавно настъпващия ефект няма опасност от остро настъпване на хипотензия при прием на амлодипин.

При пациенти със стенокардия еднократният дневен прием увеличава физическата издръжливост, времето до поява на следващ пристъп, времето за 1 мм депресия на STсегмента и намалява както честотата на стенокардните пристъпи, така и необходимостта от прием на таблетки нитроглицерин. Амлодипин не се свързва със странични метаболитни ефекти или промени в плазмените липиди и е подходящ за употреба при пациенти с астма, диабет и подагра.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция и Разпределение

След орален прием на терапевтични дози амлодипин се абсорбира добре като пикови нива в кръвта се достигат след 6-12 часа. Абсолютната бионаличност е между 64 и 80%. Обемът на разпределение е приблизително 21 л/kg. Изследвания ин витро показват, че приблизително 97.5% от циркулиращия амлодипин е свързан с плазмените белтъци.

Биотрансформация/елиминация

Крайният плазмен полуживот на елиминация на амлодипин е около 35-50 часа и е съвместим с еднократния дневен прием. Амлодипин се метаболизира екстензивно в черния дроб до неактивни метаболити като 10% от изходното съединение и 60% от метаболитите се излъчват с урината.

Фармакокинетиката на амлодипин не се повлиява съществено при бъбречни увреждания. Пациенти с бъбречна недостатъчност получават обичайната начална доза.

Пациенти в напреднала възраст и пациенти с чернодробна недостатъчност са с намален клирънс на амлодипин със съответно повишен приблизително 40-60% AUC (площ под кривата) и затова по-ниска начална доза е необходима. Подобно повишение на AUC се наблюдава при пациенти с умерена до тежка сърдечна недостатъчност.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни не разкриват особена опасност за хора, базирайки се на конвенционалните изследвания за фармакологична безопасност, продължителна токсичност, генотоксичност, канцерогенен потенциал, токсичност по отношение на репродукцията.



6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Лактоза монохидрат
Целулоза, микрокристална
Магнезиев стеарат

6.2 Несъвместимости

Неприложимо.

6.3 Срок на годност

3 (три) години.

6.4 Специални условия на съхранение

Този лекарствен продукт не изисква специални условия за съхранение.

6.5 Данни за опаковката

Амлодипин Алкалоид 5 mg таблетки са опаковани в блистери от PVC, запечатани с алуминиево фолио, по 10 таблетки във всеки блистер. Картонената кутия съдържа 30 таблетки (3 блистера) и листовка.

Амлодипин Алкалоид 10 mg таблетки са опаковани в блистери от PVC, запечатани с алуминиево фолио с 15 таблетки във всеки блистер. Картонената кутия съдържа 30 таблетки (2 блистера) и листовка.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма специални изисквания.

Не използваният продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

"Алкалоид" ЕООД
ж.к. "Мотописта" 2,
ул. "Рикардо Вакарини" № 2, ет.3, ап.10
гр.София 1404, Р. България
тел. +359 2 80 81 081
факс: +359 2 95 89 367



АМЛОДИПИН АЛКАЛОИД® 5 mg и 10 mg таблетки
Module 1.3.1.1. Кратка характеристика на продукта

e-mail: office@alkaloid.bg

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

**9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА
РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

04/2012

