



Кратка характеристика на продукта

1. Търговско име на лекарствения продукт

AMLOVAS® tablets 5 mg

АМАОВАС® таблетки 5 mg

2. Количествен и качествен състав

Лекарствено вещество: amlodipine

Всяка таблетка съдържа 6,944 mg amlodipine besylate, еквивалентен на 5 mg amlodipine.

(За състава на помощните вещества вижте раздел 6.1 Списък на помощните вещества и техните количества).

3. Лекарствена форма

Бяла, кръгла таблетка за перорално приложение.

4. Клинични данни

4.1 Показания

Амловас® е показан за лечението на лека и умерена хипертония и може да се използва самостоятелно за контрол на кръвното налягане при повечето пациенти.

При пациенти, при които не може да се постигне адекватен контрол на кръвното налягане само с един лекарствен продукт, може да се приложи комбинация от amlodipine и тиазиден диуретик, β-блокатор или АСЕ-инхибитор.

Amlodipine е лекарствен продукт на избор в лечението на исхемия на миокарда, дължаща се на постоянна обструкция (стабилна стенокардия) и/или вазоспазъм/вазоконстрикция (стенокардия на Prinzmetal или вариантна ангина) на коронарните съдове.

Amlodipine може да се прилага самостоятелно като монотерапия или в комбинация с други антистенокардни лекарствени продукти.

4.2 Дозировка и начин на употреба

Хипертония: Началната дозировка е 2.5 – 5.0 mg на ден. Обичайната терапевтична доза е 5 mg веднъж дневно, като може да се увеличи до максимална дозировка от 10 mg дневно.

Стенокардия: Обичайната дозировка е 5-10 mg, като при пациенти в напреднала възраст и пациенти с чернодробна недостатъчност се препоръчва прилагане на по-ниски дози.

Пациенти, подложени на диализа: Хемодиализата и перитонеалната диализа не водят до повишено елиминиране на amlodipine. Не е необходим допълнителен режим на дозиране.

Чернодробна недостатъчност: 2.5 mg дневно.

Деца: Не се препоръчва приложение при деца под 12 годишна възраст

Пациенти в напреднала възраст: При тази група пациенти е препоръчително терапията да стартира от най-ниската възможна дозировка, поради вероятността от намалена чернодробна и бъбречна функция, както и нарушена сърдечна дейност. При по-възрастните пациенти се наблюдава понижен клирънс на amlodipine.

4.3 Противопоказания

Amlodipine е противопоказан при пациенти с известна свръхчувствителност към дихидропиридинови производни.

Amlodipine не бива да се прилага в случай на кардиогенен шок и нестабилна стенокардия.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-13866/17.07.06	
700/104.07.06	Merf



Amlodipine е противопоказан при тежка хипотония, сърдечна недостатъчност след прекаран инфаркт на миокарда (през първите 28 дни), обструкция на изходния тракт на лявата камера (напр. високостепенна аортна стеноза).

4.4 Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба

Приложение при пациенти със сърдечна недостатъчност

В дългосрочно плацебо-контролирано проучване с amlodipine при болни със сърдечна недостатъчност клас III и IV по NYHA с неischemична етиология лечението с amlodipine е било свързано с повишена честота на белодробния оток, независимо от липсата на значима разлика в честотата на влошаване на сърдечната недостатъчност в сравнение с плацебо.

Тъй като индуцираната от amlodipine вазодилатация настъпва постепенно, рядко се съобщава за настъпване на остра хипотония след перорално прилагане на amlodipine. Въпреки това, трябва да се подхожда с внимание при едновременното прилагане на Амловас® и други периферно действащи вазодилататори, особено в случаите на пациенти с тежка аортна стеноза.

Amlodipine в сходни дози при по-млади или по-възрастни пациенти се понася еднакво добре.

Приложение при пациенти в напреднала възраст

При тази група пациенти е препоръчително терапията да стартира от най-ниската възможна дозировка, поради вероятността от намалена чернодробна и бъбречна функция, както и нарушена сърдечна дейност. При по-възрастните пациенти се наблюдава понижен клирънс на amlodipine.

Приложение при деца

Безопасността и ефективността на приложението на amlodipine при деца не са установени.

Синдром на отнемане при β -блокери

Amlodipine не е β -блокери и не осигурява защита срещу появата на синдром на отнемане при рязко спиране на лечението с β -блокери. По тази причина дозировката на β -блокери трябва да се намалява постепенно.

Пациенти с чернодробна недостатъчност

Amlodipine се метаболизира основно в черния дроб. При пациенти с увредена чернодробна функция, плазменият полуживот на amlodipine е 56 часа и по тази причина при тях трябва да се подхожда с повишено внимание.

4.5 Лекарствени и други взаимодействия

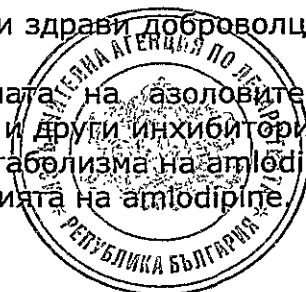
Amlodipine е прилаган безопасно в комбинация с тиазидни диуретици, β -блокери, ACE-инхибитори, лекарствени продукти с удължено действие, съдържащи нитрати, cimetidine, нестероидни противовъзпалителни лекарствени продукти, антибиотици. Едновременното приемане на amlodipine и digoxin или cimetidine не променя фармакокинетиката на amlodipine.

Данни от in vitro проучвания върху човешка плазма показват, че amlodipine няма ефект върху протеиновото свързване на изпитваните лекарства (digoxin, phenytoin, warfarin и indomethacin).

Едновременният прием на amlodipine и warfarin при здрави доброволци не променя протромбиновото време на warfarine.

Противогъбични лекарствени продукти от групата на азоловите производни (itraconazole, ketocanole, fluconazole), erythromycin и други инхибитори на цитохром P450 изоензимната система могат да инхибират метаболизма на amlodipine.

Сокът от грейпфрут умерено повишава концентрацията на amlodipine.



Amlodipine може да повиши нивата на ciclosporine.

Хипотензивното действие на sildenafil потенцира ефектите на amlodipine.

Rifampin (и други потенциални ензимни индуктори) ускоряват метаболизма на amlodipine.

Калцият намалява хипотензивния ефект на калциевите антагонисти като amlodipine.

Взаимодействие с етанол: Amlodipine няма значим ефект върху фармакокинетиката на етанол.

Взаимодействие с лекарствени продукти и/или хранителни добавки от растителен произход: Жълтият кантарион (*Hypericum perforatum*) може да понижи концентрацията на amlodipine. Не се препоръчва едновременната употреба на amlodipine с лекарства или добавки, съдържащи Dong quai (*Angelica sinensis*), ефедра, йохимбин, жен-шен и чесън.

4.6. Бременност и кърмене

Безопасността при приложение на amlodipine по време на бременност не е установена. По тази причина употребата му при бременни трябва да става само в случаите, когато това е крайно наложително и потенциалната полза от лечението превъзхожда рисковете за плода.

Не е известно дали amlodipine преминава в кърмата. Препоръчително е спиране на кърменето при започване на лечение с amlodipine.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Клиничният опит с amlodipine показва, че е малко вероятно да се наруши способността на пациентите за шофиране и работа с машини.

При пациенти със замаяване, главоболие, умора, гадене може да се повлияе способността за шофиране.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Честотата на наблюдаваните нежелани лекарствени реакции е в границите 0.1%-1%. Представени са следните възможни нежелани реакции, наблюдавани по време на клиничните изпитвания и/или постмаркетинговия период.

По време на плацебо контролираните изпитвания е установено, че най-честите нежелани лекарствени реакции са:

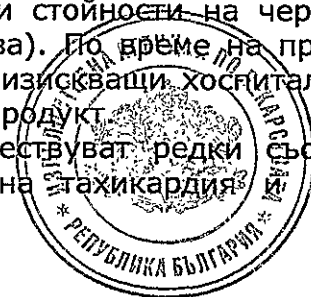
Главоболие, едем, сомнолентност, гадене, умора, абдоминална болка, зачервяване (flush), палпитации и замаяност.

Лечението с amlodipine не води до клинично значими промени в лабораторните показатели. Следните нежелани лекарствени реакции са наблюдавани с по-малка честота по време на постмаркетинговата фаза:

Констипация, артралгия, болки в гърба, диспепсия, кашлица, диспнея, ринит, гингивална хиперплазия, гинекомастия, хипергликемия, астения, импотентност, често уриниране, загуба на тегло, левкопения, умора, депресия, сухота в устата, мускулни крампи, миалгия, периферна невропатия, панкреатит, обилно изпотяване, синкоп, тромбоцитопения, васкулит, зрителни нарушения.

Рядко са наблюдавани алергични реакции като пруритус, обрив, ангиоедем, мултиформен еритем, както и хепатит и повишени стойности на чернодробните ензими (в повечето случаи последвано от холестаза). По време на прилагане на amlodipine са наблюдавани няколко тежки случая, изискващи хоспитализация, но не е била установена пряка връзка с лекарствения продукт.

Както и при другите калциеви антагонисти, съществуват редки съобщения за миокарден инфаркт, аритмия (включваща камерна тахикардия) и предсърдни фибрилации) и болка в гърдите.



4.9. Предозиране

Липсва достатъчна информация по отношение на предозирането с amlodipine. Наличните данни сочат, че предозирането с лекарствения продукт може да доведе до прекомерна периферна вазодилатация, което резултира в дълготрайна хипотония. При прием на много високи дозировки е препоръчително активно мониториране на сърдечните и респираторни функции, повдигане на крайниците и следене на циркулаторния обем и диурезата. Тъй като amlodipine се отличава с висока степен на свързване с плазмените протеини е малко вероятно хемодиализата да бъде от полза.

5. Фармакологични данни**5.1. Фармакодинамични свойства**

Amlodipine е калциев антагонист, производно на дихидропиридина с дълготрайно действие. Той блокира бавните волтаж-зависими калциеви канали в гладката мускулатура на съдовата стена, като по този начин блокира навлизането на калциеви йони към периферните и коронарни кръвоносни съдове и предизвиква вазодилатация в периферната съдова система. Настъпилата вазодилатация е особено изразена в областта на артериолите, като така се намалява сърдечното следнатоварване и кислородната консумация. Дилатацията на коронарните съдове осигурява повишено кръвоснабдяване на исхемичния миокард. В допълнение към способността си да намалява периферното съдово съпротивление, amlodipine понижава кислородната консумация на миокарда. Имайки предвид тези фармакологични свойства, amlodipine е показан при лечение на хипертония, стабилна и вазоспастична стенокардия.

5.2. Фармакокинетични свойства

След перорално приложение на терапевтични дози amlodipine се резорбира добре като максимални плазмени концентрации се достигат между 6-12 часа. Установено е, че абсолютната бионаличност е между 64%-90%. Обемът на разпределение е приблизително 21 l/kg.

Amlodipine се метаболизира в значителна степен в черния дроб до неактивни метаболити (90%), като 10% от изходното лекарство и 60% от метаболитите се екскретират чрез урината.

Бионаличността на amlodipine не се повлиява от присъствието на храна. Степента на свързване с плазмените протеини е 98%. Крайният плазмен елиминационен полуживот е около 30-50 часа, а равновесни плазмени концентрации се достигат след 7-8 дни.

Прилагането на еднократна доза amlodipine при пациенти с хипертония води до понижаване на кръвното налягане в легнало и в изправено положение в рамките на 24 часа. Поради постепенното настъпване на терапевтичния ефект обикновено не се наблюдава остра хипотония. Антихипертензивният ефект се поддържа поне в рамките на 24 часа след еднократно дневно приложение.

Времето за достигане на равновесни плазмени концентрации е сходно при по-възрастни и по-млади пациенти. При по-възрастни пациенти клирънсът на amlodipine е с тенденция към намаляване, което води до увеличаване на площта под кривата "концентрация/време" (AUC) и времето на елиминационен полуживот. При пациенти със застойна сърдечна недостатъчност нарастването на AUC и времето на елиминационен полуживот е било според очакването за съответната възрастова група.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Не са известни допълнителни данни относно безопасността на Амловас при различни от вече представените в другите раздели на кратката характеристика на продукта.



6. Фармацевтични данни**6.1 Списък на помощните вещества и техните количества**

Microcrystalline cellulose	124,056 mg
Anhydrous dibasic calcium phosphate	63,000 mg
Sodium starch glycolate	6,000 mg
Magnesium stearate	2,000 mg

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са установени.

6.3 Срок на годност

24 месеца.

6.4. Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25°C!

Да се пази от светлина!

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5 Опаковка

Amlovas® 5 mg е опакован в бели, непрозрачни PVC/PVDC, алуминиеви блистери, съдържащи 20 таблетки.

6.6 Препоръки при употреба

Няма специални препоръки.

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

DROGSAN İlaçları San. ve Tic. A.Ş. 06520

Balgat / ANKARA

8. Регистрационен № в регистъра по чл.28 от ЗЛАХМ**9. Дата на първото разрешаване за употреба на лекарствения продукт****10. Дата на последната редакция на текста**

28.10.2004 г.

