

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування лікарського засобу

СТАМЛО (STAMLO)

Склад:

діюча речовина: amlodipine

1 таблетка містить амлодипіну бесилату еквівалентно 5 мг або 10 мг амлодипіну;

допоміжні речовини: кальцію гідрофосфат, целюлоза мікрокристалічна, натрію крохмальгліколят (тип А), магнію стеарат, кремнію діоксид колоїдний безводний.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: білого або майже білого кольору, плоскі таблетки з фаскою, розподільчою рискою з одного боку і тисненням «5» або «10» з іншого.

Фармакотерапевтична група. Селективні антагоністи кальцію з переважним впливом на судини. Похідні дигідропіридину. Код АТХ C08C A01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Амлодипін – антагоніст кальцію (похідне дигідропіридину), що блокує надходження іонів кальцію до міокарда та до клітин гладеньких м'язів.

Механізм гіпотензивної дії амлодипіну зумовлений безпосередньою розслаблювальною дією на гладенькі м'язи судин. Точний механізм антиангінального ефекту амлодипіну встановлений недостатньо, однак наступні ефекти відіграють певну роль

1. Амлодипін розширює периферичні артеріоли і таким чином знижує периферичний опір (постнавантаження). Зниження навантаження на серце призводить до зниження споживання енергії та потреби міокарда у кисні.
2. Розширення головних коронарних артерій та коронарних артеріол, можливо, також відіграє роль у механізмі дії амлодипіну.

У пацієнтів з артеріальною гіпертензією застосування препарату 1 раз на добу забезпечує клінічно значуще зниження артеріального тиску протягом 24 годин у положенні як лежачи, так і стоячи. У пацієнтів зі стенокардією при застосуванні однієї добової дози препарату підвищується загальний час фізичного навантаження. Препарат знижує частоту нападів стенокардії та зменшує потребу у застосуванні нітрогліцерину.

Фармакокінетика.

Всмоктування/розподіл. Після перорального застосування терапевтичних доз амлодипін поступово абсорбується у плазму крові. Одночасне вживання їжі не впливає на всмоктування амлодипіну. Абсолютна біодоступність незміненої молекули становить приблизно 64-80 %. Максимальна концентрація у плазмі крові досягається протягом 6-12 годин після застосування. Об'єм розподілу становить приблизно 20 л /кг; константа дисоціації кислоти (pKa) амлодипіну становить 8,6. Дослідження *in vitro* продемонстрували, що зв'язування амлодипіну з білками плазми крові становить приблизно 97,5 %.

Метаболізм/виведення. Період напіввиведення із плазми крові становить приблизно 35-50 годин. Рівноважна концентрація у плазмі крові досягається після 7-8 днів безперервного застосування препарату. Амлодипін головним чином метаболізується з утворенням неактивних метаболітів. Близько 60 % введеної дози виводиться із сечею, приблизно 10 % з яких становить амлодипін у незмінному вигляді.

Пацієнти літнього віку. Час досягнення рівноважних концентрацій амлодипіну у плазмі крові подібний у пацієнтів літнього віку та у дорослих пацієнтів. Кліренс амлодипіну зазвичай є дещо зниженим, що у пацієнтів літнього віку призводить до збільшення площі під кривою «концентрація/час» (AUC) та періоду напіввиведення препарату.

Пацієнти із порушенням функцій нирок Амлодипін екстенсивно біотрансформується до неактивних метаболітів. 10 % амлодипіну виділяється у незміненому вигляді з сечею. Зміни концентрації амлодипіну у плазмі крові не корелюють зі ступенем порушення функцій нирок. Пацієнтам із порушенням функцій нирок можна застосовувати звичайні дози амлодипіну. Амлодипін не видаляється шляхом діалізу.

Клінічні характеристики.

Показання. Артеріальна гіпертензія, хронічна стабільна стенокардія, вазоспастична стенокардія (стенокардія Принцметала).

Противоказання. Відома підвищена чутливість до дигідропіридинів, амлодипіну або до будь-якого іншого компонента препарату; артеріальна гіпотензія тяжкого ступеня; шок (включаючи кардіогенний шок); обструкція вивідного тракту лівого шлуночка (наприклад, стеноз аорти тяжкого ступеня); нестабільна стенокардія; застосування протягом 8 днів після інфаркту міокарда; гемодинамічно нестабільна серцева недостатність після гострого інфаркту міокарда.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Вплив інших лікарських засобів на амлодипін.

Інгібітори СYP3A4. Одночасне застосування амлодипіну та інгібіторів СYP3A4 потужної або помірної дії (інгібітори протеаз, азольні протигрибкові засоби, макроліди, такі як еритроміцин чи кларитроміцин, верапаміл або дилтіазем) може призвести до значущого підвищення експозиції амлодипіну. Клінічне значення таких змін може бути більш вираженим у пацієнтів літнього віку. Може бути необхідним клінічний нагляд за станом пацієнта та підбір дози.

Індуктори СYP3A4. Інформації щодо впливу індукторів СYP3A4 на амлодипін немає. Одночасне застосування амлодипіну та речовин, що є індукторами СYP3A4 (наприклад, рифампіцин, звіробій), може призводити до зниження концентрації амлодипіну у плазмі крові, тому застосовувати такі комбінації слід з обережністю.

Вплив амлодипіну на інші лікарські засоби.

Гіпотензивний ефект амлодипіну потенціює гіпотензивний ефект інших антигіпертензивних засобів.

Клінічні дослідження взаємодії препарату показали, що амлодипін не впливає на фармакокінетику аторвастатину, циклоспорину.

Не рекомендується одночасно застосовувати амлодипін та грейпфрути або грейпфрутовий сік, оскільки у деяких пацієнтів біодоступність амлодипіну може підвищуватись, що, у свою чергу, призводить до посилення гіпотензивної дії.

Дантролен (інфузії).

У тварин спостерігалися шлуночкові фібриляції з летальним наслідком та серцево-судинний колапс, що асоціювалися з гіперкаліємією, після застосування верапамілу та дантролену внутрішньовенно. Через ризик розвитку гіперкаліємії рекомендовано уникати застосування блокаторів кальцієвих каналів, таких як амлодипін, схильним до злоякісної гіпертермії пацієнтам та при лікуванні злоякісної гіпертермії.

Особливості застосування. Безпека та ефективність застосування амлодипіну при гіпертонічному кризі не оцінювалися.

Пацієнти із серцевою недостатністю. Пацієнтам із застійною серцевою недостатністю блокатори кальцієвих каналів, включаючи амлодипін, слід застосовувати з обережністю, оскільки вони можуть підвищувати ризик серцево-судинних подій та летальних випадків у майбутньому.

Пацієнти із порушенням функції печінки. Період напіввиведення амлодипіну збільшується у пацієнтів із порушенням функції печінки; рекомендацій стосовно дози препарату немає. Тому даній категорії пацієнтів препарат слід застосовувати з обережністю.

Пацієнти літнього віку. Збільшувати дозу препарату даній категорії пацієнтів слід з обережністю.

Пацієнти із нирковою недостатністю. Даній категорії пацієнтів слід застосовувати звичайні дози препарату. Зміни концентрації амлодипіну у плазмі крові не корелюють зі ступенем порушень функцій нирок. Амлодипін не видаляється шляхом діалізу.

Амлодипін не впливає на результати лабораторних досліджень.

Не рекомендується застосовувати амлодипін разом із грейпфрутом або з грейпфрутовим соком, оскільки у деяких пацієнтів біодоступність може бути збільшена, що призведе до посилення гіпотензивного ефекту препарату.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Безпечність застосування амлодипіну жінкам у період вагітності встановлена. Застосовувати амлодипін у період вагітності рекомендується лише у випадках, коли немає безпечнішої альтернативи, а ризик, пов'язаний із самим захворюванням, перевищує можливу шкоду від лікування для матері та плода. Невідомо, чи проникає амлодипін у грудне молоко. При прийнятті рішення про продовження годування груддю або про застосування амлодипіну необхідно оцінювати користь грудного годування для дитини та користь від застосування препарату для матері. У ході досліджень на тваринах при застосуванні високих доз спостерігалася репродуктивна токсичність.

Фертильність.

Повідомлялося про оборотні біохімічні зміни головки сперматозоїда у деяких пацієнтів при застосуванні блокаторів кальцієвих каналів. Клінічної інформації щодо потенційного впливу амлодипіну на фертильність недостатньо.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Амлодипін може чинити незначний або помірний вплив на здатність керувати автотранспортом або працювати з іншими механізмами. Швидкість реакції може бути знижена при наявності таких симптомів як запаморочення, головний біль, сплутаність свідомості чи нудота.

Спосіб застосування та дози. Таблетки застосовувати внутрішньо незалежно від прийому їжі.

Дорослі. Зазвичай для лікування артеріальної гіпертензії та стенокардії рекомендована початкова доза становить 5 мг амлодипіну 1 раз на добу. Залежно від реакції пацієнта на терапію дозу можна збільшити до максимальної дози, що становить 10 мг 1 раз на добу.

Діти віком від 6 років з артеріальною гіпертензією. Рекомендована початкова доза амлодипіну для цієї категорії пацієнтів становить 2,5 мг 1 раз на добу. Якщо необхідний рівень артеріального тиску не буде досягнутий протягом 4 тижнів, дозу можна збільшити до 5 мг на добу. Застосування препарату у дозах вище 5 мг для даної категорії пацієнтів не досліджувались.

Пацієнти літнього віку. Немає необхідності у підборі дози для даної категорії пацієнтів. Підвищення дози слід проводити з обережністю.

Пацієнти з порушенням функції нирок. Немає необхідності у підборі дози для даної категорії пацієнтів.

Застосування пацієнтам з печінковою недостатністю. Дози препарату для застосування пацієнтам даної категорії не встановлені (див. розділ «Особливості застосування»).

Таблетки по 5 мг препарату Стамлоне призначені для розподілу навпіл для отримання дози 2,5 мг.

Діти. Препарат застосовувати дітям віком від 6 років. Вплив амлодипіну на артеріальний тиск пацієнтів до 6 років невідомий.

Передозування. Досвід навмисного передозування препарату є обмеженим.

Симптоми передозування: наявна інформація дає підстави вважати, що значне передозування амлодипіну призведе до надмірної периферичної вазодилатації та, можливо, до рефлекторної тахікардії. Повідомлялося про розвиток значної та, можливо, тривалої системної артеріальної гіпотензії, включаючи шок із летальним наслідком.

Лікування: клінічно значуща гіпотензія, зумовлена передозуванням амлодипіну, вимагає активної підтримки діяльності серцево-судинної системи, включаючи частий моніторинг функцій серця та дихання, підняття кінцівок, моніторинг об'єму циркулюючої рідини та сечовиділення.

Для відновлення тону судин та артеріального тиску можна застосувати судинозвужувальні препарати, упевнившись у відсутності протипоказань до їх застосування. Застосування кальцію глюконату внутрішньовенно може бути корисним для нівелювання ефектів блокади кальцієвих каналів.

У деяких випадках може бути корисним промивання шлунка. Застосування активованого вугілля здоровим добровольцям протягом 2-х годин після введення 10 мг амлодипіну значно зменшило рівень його всмоктування.

Оскільки амлодипін високою мірою зв'язується з білками плазми крові, ефект діалізу є незначним.

Побічні реакції.

З боку крові та лімфатичної системи: лейкоцитопенія, тромбоцитопенія.

З боку імунної системи: алергічні реакції.

Порушення метаболізму та аліментарні розлади: гіперглікемія.

З боку психіки: безсоння, зміни настрою (включаючи тривожність), депресія, сплутаність свідомості.

З боку нервової системи: сонливість, запаморочення, головний біль (головним чином на початку лікування), тремор, дисгевзія, гіпестезія, парестезія, гіпертонус, периферична нейропатія, екстрапірамідний синдром.

З боку органів зору: порушення зору (включаючи диплопію).

З боку органів слуху та лабіринту: дзвін у вухах.

З боку серця: посилене серцебиття, інфаркт міокарда, аритмія (включаючи брадикардію, шлуночкову тахікардію та мерехтіння передсердь).

З боку судин: припливи, артеріальна гіпотензія, васкуліт.

Респіраторні, торакальні та медіастинальні порушення: диспное, риніт, кашель.

З боку шлунково-кишкового тракту: біль у животі, нудота, блювання, диспепсія, порушення перистальтики кишечника (включаючи запор та діарею), сухість у роті, панкреатит, гастрит, гіперплазія ясен.

З боку гепатобіліарної системи: гепатити, жовтяниця, підвищення рівня печінкових ферментів (що найчастіше асоціювалося із холестазом).

З боку шкіри та підшкірної тканини: алопеція, пурпура, зміна забарвлення шкіри, підвищене потовиділення, свербіж, висип, екзантема, ангіоневротичний набряк, мультиформна еритема, кропив'янка, ексфолювативний дерматит, синдром Стівенса Джонсона, набряк Квінке, фоточутливість.

З боку скелетно-м'язової та сполучної тканин: набрякання гомілок, артралгія, міалгія, судоми м'язів, біль у спині.

З боку нирок та сечовидільного тракту: порушення сечовиділення, ніктурія, підвищена частота сечовипускання.

З боку репродуктивної системи та молочних залоз: імпотенція, гінекомастія.

Загальні порушення та стани у місці введення: набряк, стомлюваність, біль за грудиною, астенія, біль, нездужання.

Інші: збільшення або зменшення маси тіла.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати у захищеному від світла, недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка. По 10 таблеток у стрипі, по 2 або 3 стрипи упачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник/заявник. Д-р Редді'с Лабораторіс Лтд, Індія Dr. Reddy's Laboratories Ltd, India

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Дільниця № 42, 45, 46, с. Бачупалі, Кутбулапур Мандал, округ Ранга Редді, Андра Прадеш, Індія/
Survey No. 42, 45, 46, Bachupally Village Qutbullapur Mandal, Ranga Reddy District Andhra Pradesh, India