

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

ВАЗОТАЛ (VAZOTAL)

Склад:

діюча речовина: 1 таблетка містить амлодипіну бесилату (у перерахуванні на амлодипін) 5 мг або 10 мг;
допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, крохмаль прежелатинізований, магнію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Фармакотерапевтична група.

Селективні антагоністи кальцію з переважним впливом на судини. Код АТХ С08С А01.

Клінічні характеристики.

Показання.

Есенціальна артеріальна гіпертензія.

Хронічні форми ішемічної хвороби серця (стабільна стенокардія, вазоспастична стенокардія, в тому числі стенокардія Принцметала).

Протипоказання.

Підвищена чутливість до препаратів дигідропіридинового ряду, до амлодипіну або до будь-якого компонента препарату. Гострий інфаркт міокарда (до 4 тижнів від початку захворювання), кардіогенний шок, нестабільна стенокардія, виражений аортальний стеноз, артеріальна гіпотензія (артеріальний тиск менше 90 мм рт. ст.). Період вагітності та годування груддю. Дитячий вік.

Спосіб застосування та дози.

При артеріальній гіпертензії та стенокардії звичайна початкова доза Вазоталу становить 5 мг один раз на добу. Залежно від індивідуальної реакції хворого дозу можна збільшити до максимальної добової, яка дорівнює 10 мг.

Під час лікування Вазоталом необхідно здійснювати щоденний контроль артеріального тиску.

Побічні реакції.

З боку серцево-судинної системи: прискорене серцебиття, задишка, виражене зниження артеріального тиску, васкуліт, припливи крові до обличчя, рідко – стенокардія, інфаркт міокарда, аритмії (фібриляція передсердь і шлуночкова тахікардія); дуже рідко – розвиток або посилення серцевої недостатності, екстрасистоля.

З боку центральної нервової системи: головний біль, запаморочення, підвищена стомлюваність, сонливість, зміна настрою, судороги; рідко – астенія, втрата свідомості, зниження чутливості до подразників, нервозність, парестезії, тремор, вертиго, безсоння, депресія; дуже рідко – атаксія, апатія, ажитація, амнезія.

З боку травної системи: нудота, блювання, біль в епігастрії, гіпербілірубінемія; рідко – підвищення рівня печінкових трансаміназ, порушення функції печінки, жовтяниця, панкреатит, сухість у роті, метеоризм, запор або діарея, гіперплазія ясен; дуже рідко – гастрит, підвищення апетиту.

З боку сечостатевої системи: периферичні набряки (щиколоток і стоп); рідко – сексуальні порушення (в т.ч. зниження потенції), полакіурія, болючі позиви до сечовипускання, ніктурія; дуже рідко – дизурія, поліурія.

З боку опорно-рухового апарату: рідко – артралгія, артроз, міалгія (при тривалому застосуванні); дуже рідко – міастенія.

З боку шкірних покривів: дуже рідко – ксеродермія, алопеція, дерматит, пурпура, зміна кольору шкіри.

Алергічні реакції: рідко – шкірні висипання (в т.ч. еритематозні, макулопапульозні кропив'янка), свербіж.

З боку органів зору: порушення зору, кон'юнктивіт, диплопія, біль в очах; рідко – ксерофтальмія; дуже рідко – порушення акомодатії.

Інші: рідко – диспное, гінекомастія, урикемія збільшення/зменшення маси тіла, тромбоцитопенія, лейкопенія, гіперглікемія, шум у вухах, біль у спині, носова кровотеча, підвищене потовиділення; дуже рідко – холодний липкий піт, кашель, риніт, паросмія, порушення смакових відчуттів.

Передозування.

При передозуванні препарату спостерігається виражене зниження артеріального тиску, тахікардія та надмірна периферійна вазодилатація.

Клінічно значуща артеріальна гіпотензія, спричинена передозуванням Вазоталу, потребує проведення активних заходів, спрямованих на підтримку функцій серцево-судинної системи, включаючи моніторинг показників роботи серця та легенів, підняте положення кінцівок, контроль за об'ємом крові, що циркулює, та діурезом. Для відновлення тону судин та артеріального тиску може виявитися корисним застосування судинозвужувального препарату, якщо немає протипоказань для його призначення. З метою усунення наслідків блокади кальцієвих каналів може виявитися корисним внутрішньовенне введення глюконату кальцію. Оскільки амлодипін значною мірою зв'язується з білками, то ефективність діалізу мало ймовірна.

Досвід лікування навмисного передозування Вазоталу обмежений. У деяких випадках може виявитися корисним промивання шлунка.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Препарат протипоказаний при вагітності (безпеку застосування не встановлено).

За необхідності застосування препарату в період лактації слід припинити годування груддю.

Діти.

Безпека та ефективність застосування Вазоталу дітям не досліджені.

Особливості застосування.

Застосування хворим з порушенням функції печінки.

Період напіввиведення Вазоталу, як і інших антагоністів кальцію, збільшується у хворих з порушенням функції печінки, однак будь-які рекомендації стосовно корекції доз препарату дотепер не розроблені. Тому застосовувати препарат таким хворим слід з особливою обережністю і лише під ретельним наглядом лікаря.

Для хворих на печінкову недостатність рекомендована доза становить 2,5 мг на день.

Застосування хворим з нирковою недостатністю.

Таким хворим Вазотал застосовують у звичайних дозах. Зміна концентрації амлодипіну у плазмі крові не корелює зі ступенем тяжкості ниркової недостатності. Амлодипін не видаляється під час діалізу.

Застосування хворим літнього віку.

При одних і тих самих дозах пацієнти як літнього, так і молодшого віку однаково добре переносять Вазотал. Для хворих літнього віку рекомендована доза становить 2,5 мг на день.

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

У період лікування слід утримуватися від керування автотранспортом і занять потенційно небезпечними видами діяльності, які вимагають підвищеної концентрації уваги і швидкісних моторних реакцій, оскільки препарат може викликати запаморочення і сонливість (особливо на початку лікування).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Амлодипін безпечний при застосуванні разом з тiazидними діуретиками, α -адреноблокаторами, β -адреноблокаторами, інгібіторами АПФ, нітратами тривалої дії, нітрогліцерином, що застосовувався сублінгвально, з нестероїдними протизапальними препаратами, антибіотиками і пероральними гіпоглікемічними засобами.

Результати досліджень *in vitro* з використанням плазми крові людини свідчать, що амлодипін не впливає на зв'язування з білками таких препаратів, як дигоксин, фенітоїн, варфарин та індометацин.

Вплив препаратів на фармакокінетику амлодипіну: Сумісне застосування амлодипіну і циметидину не змінює фармакокінетику амлодипіну.

Одночасне застосування 240 мл грейпфрутового соку з разовою пероральною дозою амлодипіну 10 мг не змінювало фармакокінетику амлодипіну.

Сумісне застосування алюмінієвих/магнієвих антацидів з разовою дозою амлодипіну не впливало на фармакокінетику амлодипіну.

Одноразова доза силденафілу 100 мг у хворих на есенціальну артеріальну гіпертензію не впливала на фармакокінетичні параметри амлодипіну. При комбінованому застосуванні амлодипіну і силденафілу кожен з препаратів незалежно один від одного виявляв гіпотензивний ефект.

Вплив амлодипіну на фармакокінетику інших препаратів Сумісне багаторазове застосування 10 мг амлодипіну і 80 мг аторвастатину не впливало на рівноважні фармакокінетичні параметри аторвастатину. Одночасне застосування амлодипіну та дигоксину у здорових добровольців не змінює рівень останнього в сироватці крові та його нирковий кліренс.

Одноразові і багаторазові дози амлодипіну по 10 мг не змінювали фармакокінетику етанолу.

Амлодипін майже не впливає на фармакокінетику циклоспорину і не змінює вплив варфарину на протромбіновий час.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Амлодипін – антагоніст іонів кальцію (блокатор повільних кальцієвих каналів), який блокує надходження іонів кальцію крізь мембрани до клітин гладких м'язів міокарда та судин. Механізм гіпотензивної дії амлодипіну зумовлений безпосереднім впливом на гладкі м'язи судин.

Антиангінальний ефект Вазоталу реалізується у такі два способи:

1. Амлодипін розширює периферичні артеріоли і таким чином знижує загальний периферичний опір (постнавантаження). Оскільки частота серцевих скорочень практично не змінюється, зниження навантаження на серце призводить до зниження споживання енергії та потреби міокарда в кисні.
2. Амлодипін також сприяє розширенню коронарних артеріол як у незмінених, так і в ішемізованих зонах міокарда. Така дилатація збільшує надходження кисню до міокарда у хворих на вазоспастичну стенокардію (стенокардія Принцметала або варіантна стенокардія) і запобігає розвиткові коронарної вазоконстрикції.

У хворих на артеріальну гіпертензію разова доза Вазоталу забезпечує клінічно значуще зниження артеріального тиску протягом 24 годин у положенні як лежачи, так і стоячи. Завдяки повільному початку дії амлодипін не спричиняє гострої артеріальної гіпотензії.

У хворих на стенокардію Вазотал сприяє підвищенню фізичної працездатності (подовжує час виконання фізичного навантаження, затримує розвиток нападу стенокардії та депресії сегмента ST при навантаженнях), знижує частоту нападів стенокардії та зменшує потребу у прийомі таблеток нітрогліцерину.

Дослідження *in vitro* показали, що приблизно 97,5 % амлодипіну зв'язується з білками плазми крові. Амлодипін не має жодного несприятливого впливу на обмін речовин та ліпіди плазми крові, тому він придатний для лікування хворих на бронхіальну астму, цукровий діабет і подагру.

Геодинамічні дослідження та контрольовані клінічні випробування у хворих на серцеву недостатність II - III функціонального класу за класифікацією Нью-Йоркської асоціації серця (NYHA) показали, що амлодипін не викликає погіршення їх стану за такими критеріями, як толерантність до фізичного навантаження, фракція викиду лівого шлуночка та клінічна симптоматика.

У плацебо-контрольованих дослідженнях було показано, що застосування амлодипіну не призводить до підвищення ризику летальності або комбінованого показника летальності у пацієнтів із серцевою недостатністю III - IV класу (NYHA), які отримували дигоксин, діуретики та інгібітори ангіотензинперетворюючого ферменту (АПФ).

Фармакокінетика. Після прийому внутрішньо в терапевтичних дозах амлодипін добре всмоктується, досягаючи максимальної концентрації в крові через 6 - 12 годин у пацієнтів як середнього, так і літнього віку. Абсолютна біодоступність досягає 64 – 80 %. Об'єм розподілу становить приблизно 21 л/кг.

Вживання їжі не впливає на всмоктування амлодипіну.

Період напіввиведення з плазми крові становить приблизно 35 - 50 годин, що дозволяє призначати препарат один раз на добу. Стійка рівноважна концентрація у плазмі досягається після 7 - 8 днів регулярного застосування Вазоталу.

Амлодипін трансформується у печінці з утворенням неактивних метаболітів. Виводиться із сечею: 10 % введеної дози – у незміненому стані, 60 % - у вигляді метаболітів.

У пацієнтів літнього віку та хворих із застійною серцевою недостатністю відмічена тенденція до зниження кліренсу амлодипіну, що призводило до збільшення площі під кривою «концентрація-час» та періоду напіввиведення препарату.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі, пласкі таблетки від білого до майже білого кольору.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 30 °С у недоступному для дітей та захищеному від світла місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері, по 2 блістери в картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Виробник готового лікарського засобу, первинне пакування, вторинне пакування, контрольсерії

«Хемофарм»д.о.о.

Виробник, відповідальний за випуск серії:

«Хемофарм» АД.

Місцезнаходження.

Новаковічі б/н,78000, м. Баня Лука, Боснія і Герцеговина.

Белградський шлях б/н,26300, м. Вршац, Сербія.