

Amlodawa Leaflet

Size: A6

Amlodawa

Amlodipine Besylate

Quantitative composition.

Amlodawa 5: Each uncoated tablet contains: Amlodipine (as Besylate) USP 5mg

Amlodawa 10: Each uncoated tablet contains: Amlodipine (as Besylate) USP 10mg

Pharmaceutical form: Tablet.

Pharmacology:

Amlodipine tablets are a calcium ion influx inhibitor of the dihydropyridine group (slow channel blocker or calcium ion antagonist) and inhibit the transmembrane influx of calcium ions into cardiac and vascular smooth muscle.

Pharmacodynamic:

The mechanisms of the antihypertensive action of Amlodipine tablets are due to a direct relaxant effect on vascular smooth muscle. Amlodipine tablets dilate peripheral arterioles, reducing the total peripheral resistance against which the heart works. Since the heart rate remains stable, this unloading of the heart reduces myocardial energy consumption and oxygen requirements.

It also dilates the main coronary arteries and coronary arterioles, both in normal and ischaemic regions. This dilatation increases myocardial oxygen delivery in patients with coronary artery spasm

Pharmacokinetics:

After oral administration of therapeutic doses, Amlodipine is well absorbed with peak blood levels between 6-12 hours post dose. Absolute bioavailability has been estimated to be between 64 and 80%. The volume of distribution is approximately 21 l/kg. In vitro studies have shown that approximately 97.5% of circulating amlodipine is bound to plasma proteins.

The terminal plasma elimination half-life is about 35-50 hours and is consistent with once daily dosing. Amlodipine is extensively metabolized by the liver to inactive metabolites with 10% of the parent compound and 60% of metabolites excreted in the urine. The time to reach peak plasma concentrations of amlodipine is similar in elderly and younger subjects. Amlodipine clearance tends to be decreased with resulting increases in AUC and elimination half-life in elderly patients.

Indications:

-Prophylaxis of chronic stable angina pectoris.

-Prinzmetal's (variant) angina when diagnosed by a cardiologist

-In hypertensive patients, amlodipine tablets have been used in combination with a thiazide diuretic, alpha blocker, beta- adrenoceptor blocking agent, or an angiotensin converting enzyme inhibitor.

-For angina, amlodipine tablets may be used as monotherapy or in combination with other antianginal drugs in patients with angina that is refractory to nitrates and/or adequate doses of beta blockers.

-Amlodipine tablets are well tolerated in patients with heart failure and a history of hypertension or ischaemic heart disease.

Administration:

To be taken orally.

Dosage: For both hypertension and angina the usual initial dose is 5 mg Amlodipine tablets once daily which may be increased to a maximum dose of 10 mg depending on the individual patient's response.

Children with hypertension: Antihypertensive oral dose in paediatric patients ages 6 - 17 years is 2.5 mg once daily as a starting dose, up-titrated to 5 mg once daily if blood pressure goal is not achieved after 4 weeks. Doses in excess of 5 mg daily have not been studied in paediatric patients

Contraindications: Amlodipine tablets are contra-indicated in patients with a known sensitivity to dihydropyridine, amlodipine or any of the excipients. Amlodipine tablets should not be used in cardiogenic shock, clinically significant aortic stenosis, unstable angina (excluding Prinzmetal's angina) and severe hypotension.

Warning and Precautions: Amlodipine tablets in patients with NYHA III and IV heart failure of nonischaemic aetiology. Amlodipine was associated with increased reports of pulmonary oedema despite no significant difference in the incidence of worsening heart failure

Amlodipine should be administered with caution in patient with impaired liver function since its half-life is prolonged in patients with impaired liver function

Drug interaction:

CYP3A4 inhibitors: Concomitant use of amlodipine with strong or moderate CYP3A4 inhibitors (protease inhibitors, azole antifungals, macrolides like erythromycin or clarithromycin, verapamil or diltiazem) may give rise to significant increase in amlodipine exposure.

CYP3A4 inducers: The concomitant use of CYP3A4 inducers (e.g., rifampicin, hypericum perforatum) may give a lower plasma concentration of amlodipine. Amlodipine should be used with caution together with CYP3A4 inducers.

Co-administration of multiple doses of 10 mg of amlodipine with 80 mg simvastatin resulted in a 77% increase in exposure to simvastatin compared to simvastatin alone

Pregnancy and Lactation:

Use in pregnancy and lactation is only recommended when there is no safer alternative and when the disease itself carries greater risk for the mother and foetus.

Effects on ability to drive and use machines.

Amlodipine can have minor or moderate influence on the ability to drive and use machines. Caution is recommended especially at the start of treatment

Adverse reactions:

The most common include; Somnolence, dizziness, headache abdominal pain and nausea. Other include; Ankle swelling, Oedema, fatigue, palpitations and flushing.

Overdosage and treatment:

Gross overdosage could result in excessive peripheral vasodilatation and possibly reflex tachycardia. Administration of activated charcoal immediately. Gastric lavage may be worthwhile. Active cardiovascular support including frequent monitoring of cardiac and respiratory function, elevation of extremities, and attention to circulating fluid volume and urine output. A vasoconstrictor may be helpful in restoring vascular tone and blood pressure, provided that there is no contraindication to its use. Intravenous calcium gluconate is beneficial in reversing the effects of calcium channel blockade.

Presentation:

Amlodawa 5mg and Amlodawa 10mg tablets: 3 x 10 tablets in Alu-PVC blister pack per unit carton.

Shelf life: 3 years from the date of manufacture.

List of excipients: microcrystalline cellulose maize starch, sodium starch glycolate, colloidal anhydrous and magnesium stearate.

Storage: Store in a cool dry place, below 30°C. Protect from light. Keep all medicines out of reach of children.

Distribution category: Prescription only medicine (POM).

Manufactured by:



Dawa Limited

Plot No. 7879/8, Baba Dogo Road, Ruaraka. P. O. Box 16633-00620, Nairobi, Kenya.

Ref: 200999/09/2024

Amlodawa

Besylate D'Amlodipine

Composition quantitative

Amlodawa 5: Chaque comprimé non enrobé contient: Amlodipine (comme Besylate) USP 5mg
Amlodawa 10: Chaque comprimé non enrobé contient: Amlodipine (comme Besylate) USP 10mg

Forme pharmaceutique:

Comprimés.

Pharmacologie:

L'amlodipine est un inhibiteur de l'influx d'ions calcium du groupe de la dihydropyridine (inhibiteur des canaux lents ou antagonistes des ions calcium) et de l'influx transmembranaire des ions calcium dans le muscle cardiaque et les muscles lisses vasculaires.

Pharmacodynamique:

Classe pharmaco thérapeutique: inhibiteur calcique sélectif à principalement effet vasculaire

Code ATC: C08 CA01.

Le mécanisme de l'effet antihypertenseur de l'amlodipine est lié à un effet relaxant direct sur le muscle lisse vasculaire.

L'amlodipine dilate les artérioles périphériques, ce qui réduit la résistance périphérique totale contre laquelle le cœur agit. Puisque la fréquence cardiaque reste stable, ce déchargement du cœur réduit la consommation d'énergie myocardique et les besoins en oxygène. Il dilate également les principales artères coronaires et les artères coronaires, à la fois dans les régions normales et ischémiques. Cette dilatation augmente la délivrance d'oxygène au myocarde chez les patients atteints de spasme de l'artère coronaire (angor de Prinzmetal)

Pharmacocinétique:

Absorption, distribution, liaison aux protéines plasmatiques:

Après administration orale de doses thérapeutiques, l'amlodipine est bien absorbée avec des concentrations plasmatiques élevées entre 6 et 12 heures après la dose. La biodisponibilité absolue a été estimée entre 64 et 80%. Le volume de distribution est d'environ 21 L / kg. Les études in vitro ont montré qu'environ 97,5% de l'amlodipine en circulation est liée aux protéines plasmatiques. La biodisponibilité de l'amlodipine n'est pas affectée par la prise d'aliments (biotransformation / élimination).

La demi-vie d'élimination plasmatique terminale est d'environ 35 à 50 heures et correspond à une seule dose quotidienne. L'amlodipine est largement métabolisée par le foie en métabolites inactifs, avec 10% de la molécule mère et 60% des métabolites excrétés dans l'urine.

Utilisation en cas d'insuffisance hépatique: Des données cliniques très limitées sont disponibles concernant l'administration d'amlodipine chez les patients présentant une insuffisance hépatique. Les patients atteints d'insuffisance hépatique ont une clairance de l'amlodipine diminuée (résultant d'une demi-vie plus longue et d'une augmentation de l'ASC d'environ 40-60%).

Chez les personnes âgées:

Le temps d'atteindre les concentrations plasmatiques maximales d'amlodipine est similaire chez les personnes âgées et les plus jeunes. La clairance de l'amlodipine tend à diminuer avec les augmentations résultantes de l'AUC et la demi-vie d'élimination chez les patients âgés.

Les indications:

-Hypertension de l'angine de poitrine stable chronique.

-Hypertension

-Angor chronique stable

-L'angor de Prinzmetal (variante) lorsqu'elle est diagnostiquée par un cardiologue

Posologie et Mode d'administration

Posologie

Adultes

Pour l'hypertension et l'angor, la dose initiale habituelle est de 5 mg d'AMLODAWA une fois par jour, ce qui peut être porté à une dose maximale de 10 mg en fonction de la réponse individuelle du patient.

Chez les patients hypertendus, AMLODAWA a été utilisée en association avec un diurétique thiazidique, un alpha bloquant, un bêtabloquant ou un inhibiteur de l'enzyme de conversion de l'angiotensine.

Pour l'angor, AMLODAWA peuvent être utilisés en monothérapie ou en association avec d'autres médicaments anti angineux chez les patients atteints d'angor réflexaires aux dérivés nitrés et / ou à des doses adéquates de bêta-bloquants.

AMLODAWA est bien toléré chez les patients souffrant d'insuffisance cardiaque et d'antécédents d'hypertension ou de cardiopathie ischémique.

Mode d'administration: comprimé à prendre oralement.

Enfants souffrant d'hypertension: La dose orale antihypertenseur chez les patients pédiatriques âgés de 6 à 17 ans est de 2,5 mg une fois par jour en tant que dose de départ, qui peut être augmentée jusqu'à 5 mg une fois par jour si l'objectif de la pression artérielle n'est pas atteint après 4 semaines. Les doses supérieures à 5 mg par jour n'ont pas été étudiées chez les patients pédiatriques.

Contre-indications:

L'amlodipine est contre-indiqué chez les patients présentant :

• Une hypersensibilité connue aux dérivés de la dihydropyridine, à l'amlodipine ou à l'un des excipients.

• un choc cardiogénique.

• une sténose aortique cliniquement significative

• un angine instable (à l'exclusion de l'angine de Prinzmetal)

• une hypotension sévère.

Nis en garde spéciales et précautions d'emploi:

Patients atteints d'insuffisance cardiaque

Chez les patients atteints d'insuffisance cardiaque sévère de la NYHA III et IV de l'étiologie non ischémique, l'amlodipine a été associée à des rapports accrus d'œdème pulmonaire malgré une différence significative dans l'incidence de l'insuffisance cardiaque de l'aggravation

Patients atteints d'insuffisance hépatique

L'amlodipine doit être administré avec prudence chez un patient souffrant d'une insuffisance hépatique, car sa demi-vie est prolongée chez les patients atteints d'insuffisance hépatique

Interaction médicamenteuse:

Inhibiteurs du CYP3A4: L'utilisation concomitante d'amlodipine avec des inhibiteurs forts ou modérés du CYP3A4 (inhibiteurs de la protéase, antifongiques azolés, macrolides comme l'érythromycine ou la clarithromycine, le verapamil ou le diltazem) peut entraîner une augmentation significative de la concentration plasmatique d'amlodipine.

L'utilisation concomitante d'inducteurs de CYP3A4 (par exemple, rifampicine, hypericum perforatum) peut entraîner une concentration plasmatique plus faible d'amlodipine. L'amlodipine doit être utilisé avec prudence avec les inducteurs de l'isoenzyme CYP3A4.

La co-administration de doses multiples de 10 mg d'amlodipine avec 80 mg de simvastatine a entraîné une augmentation de 77% de l'exposition à la simvastatine par rapport à la simvastatine seule. La dose quotidienne de simvastatine doit être limitée à 20mg chez les patients sous amlodipine.

Grossesse et allaitement:

Grossesse

L'utilisation pendant la grossesse et l'allaitement n'est recommandée que s'il n'y a pas d'alternative plus sûre et lorsque la maladie elle-même entraîne un risque accru pour la mère et le fœtus. Allaitement n'a pas été établi si l'amlodipine est excrétée dans le lait maternel. La décision de poursuivre ou d'interrompre l'allaitement ou de poursuivre ou d'interrompre le traitement par l'amlodipine doit être prise en tenant compte du bénéfice de l'allaitement pour l'enfant et du bénéfice du traitement par l'amlodipine pour la mère.

Fécondités: modifications biochimiques réversibles au niveau de la tite des spermatozoïdes ont été rapportées chez certains patients traités par des inhibiteurs calciques. Les données cliniques sont insuffisantes concernant l'effet potentiel de l'amlodipine sur la fécondité. Dans une étude menée chez le rat, des effets indésirables ont été détectés sur la fertilité des mâles

Effets sur la capacité de conduire et d'utiliser des machines.

L'amlodipine peut avoir une influence mineure ou modérée sur la capacité de conduire et d'utiliser des machines. La prudence est recommandée surtout au début du traitement.

Effets indésirables:

Les plus courants comprennent: Somnolence, vertiges, maux de tête, douleurs abdominales et nausées. D'autres comprennent: l'enflure de la cheville, l'œdème, la fatigue, les palpitations et le rinçage.

Surdosage.

Symptômes: Les données disponibles suggèrent qu'un surdosage important peut entraîner une vasodilatation périphérique excessive et éventuellement une tachycardie réflexe. Une hypotension systémique marquée et probablement prolongée pouvant atteindre un choc avec issue fatale a été rapportée

Traitement

L'hypertension due au surdosage d'AMLODAWA nécessite un soutien cardiovasculaire actif, y compris une surveillance fréquente de la fonction cardiaque et respiratoire. Nivélution des extrémités et l'attention portée au volume circulant des liquides et à la production d'urine. Un vasoconstricteur peut être utile pour restaurer le tonus vasculaire et la pression sanguine, à condition qu'il y ait Aucune contre-indication à son utilisation. Le gluconate de calcium intraveineux est bénéfique pour inverser les effets du blocage des canaux calciques. Le lavage gastrique peut être intéressant dans certains cas. Chez les volontaires sains, l'absorption de charbon de bois jusqu'à 2 heures après l'administration de 10 mg d'amlodipine a été démontrée pour réduire le taux d'absorption de l'amlodipine. Comme l'amlodipine est fortement liée aux protéines, la dialyse n'est pas susceptible d'être bénéfique.

Pharmacocinétiques:

Liste des excipients: cellulose microcristalline amidon de maïs, sodium Carboxyméthylamidon, silice colloïdale anhydrous et le stéarate de magnésium.

Incompatibilités

Sans objet

Présentation: Blisters de 3 x 10 par unité de carton.

Durée de conservation: 3 ans à compter de la date de fabrication.

Précaution particulière de conservation: Conserver dans un endroit sec, inférieur à 30°C. Protéger de la lumière, Conservez tous les médicaments hors de portée des enfants.

Catégorie de distribution: médicament à prescription unique (POM)

Fabriqué par:

Dawa Limited

Plot No. 7879/8, Baba Dogo Road, Ruaraka. P. O. Box 16633-00620, Nairobi, Kenya.

Ref: 200999/09/2024