

เอกสารกำกับยาภาษาไทย

แอมโลเพรส 5

1. ชื่อผลิตภัณฑ์

แอมโลเพรส 5

2. ชื่อและความแรงของตัวยาสําคัญ

ใน 1 เม็ด ประกอบด้วย amlodipine besylate สวมมูลกับ amlodipine 5 มิลลิกรัม

3. ลักษณะของผลิตภัณฑ์

เม็ดรูปแปดเหลี่ยม แบน สีขาว ด้านหนึ่งมีขีดแบ่งครึ่งเม็ดยา มีอักษร “AP” และ “5” อยู่คนละข้างของขีดแบ่งครึ่ง อีกด้านหนึ่งมีอักษร “Rx”

4. เกสัชพลศาสตร์/เภสัชจลนศาสตร์

4.1 เกสัชพลศาสตร์

กลไกการออกฤทธิ์ของยา

Amlodipine ออกฤทธิ์เป็น calcium channel blockers (slow channel blockers หรือ calcium antagonist) มีความสามารถในการยับยั้งการส่งผ่านประจุ calcium ผ่านเยื่อหุ้มเซลล์ มีผลต่อระบบหัวใจและหลอดเลือด รวมทั้งลดการบีบตัวของกล้ามเนื้อหัวใจและกล้ามเนื้อเรียบ และลดการกำเนิดไฟฟ้าหัวใจ (ทำงานได้โดยอัตโนมัติ) และความเร็วในการนำของกระแสประสาท^[1]

4.2 เกสัชจลนศาสตร์

หลังจากรับประทานยา amlodipine besylate ความเข้มข้นของยาในพลาสมาขึ้นถึงสูงสุดภายใน 6 – 12 ชั่วโมง ค่า absolute bioavailability อยู่ในช่วง 64 – 90% อาหารไม่มีผลต่อการดูดซึมของยา amlodipine จับกับโปรตีนในพลาสมาประมาณ 93% ยาส่วนใหญ่ (ประมาณ 90%) ถูกทำลายที่ตับเป็นเมตาบอไลต์ที่ไม่มีฤทธิ์ ยา amlodipine ถูกขับออกทางปัสสาวะในรูปเมตาบอไลต์ (60%) และอยู่ในรูปที่ไม่เปลี่ยนแปลง (10%) ค่าครึ่งชีวิตของการกำจัดยาประมาณ 30 – 50 ชั่วโมง^[2]

5. ข้อบ่งใช้^{[3], [4]}

โรคความดันโลหิตสูง

amlodipine ใช้รักษาโรคความดันโลหิตสูง อาจใช้ยา amlodipine เพียงตัวเดียวหรือใช้ร่วมกับยาลดความดันโลหิตตัวอื่น

โรคหลอดเลือดแดงโคโรนารี (Coronary artery disease)

amlodipine ใช้ในการลดความเสี่ยงของการทำ coronary revascularization และความจำเป็นในการเข้ารับรักษาตัวในโรงพยาบาลเนื่องจากเลือดไปเลี้ยงกล้ามเนื้อหัวใจไม่เพียงพอในผู้ป่วยที่เป็นโรคหลอดเลือดแดงโคโรนารี

อาการเจ็บหน้าอกเนื่องจากเลือดไปเลี้ยงกล้ามเนื้อหัวใจไม่เพียงพอเรื้อรังแบบคงที่ (Chronic stable angina)

amlodipine ใช้เป็นการรักษาขั้นแรกในการรักษาโรคกล้ามเนื้อหัวใจขาดเลือด (myocardial ischemia) ไม่ว่าจะเกิดจากมีการอุดตันที่คงที่ของหลอดเลือด (stable angina) และ/หรือจากหลอดเลือดบีบเกร็ง / การหดตัวของหลอดเลือดโคโรนารี (Prinzmetal's or variant angina) อาจใช้ amlodipine ขนาดเดียวเป็นการบำบัดเดี่ยวๆ หรือใช้ร่วมกับยารักษาอาการเจ็บหน้าอกตัวอื่น เนื่องจากเลือดไปเลี้ยงกล้ามเนื้อหัวใจไม่เพียงพอ

6. ขนาดยาที่แนะนำ

ผู้ใหญ่^{[3], [4]}

โรคความดันโลหิตสูง: ขนาดยาเริ่มต้น คือ 5 มิลลิกรัม วันละครั้ง ซึ่งอาจเพิ่มขึ้นจนถึงขนาดยาสูงสุด คือ 10 มิลลิกรัม วันละครั้ง

โรคหลอดเลือดแดงโคโรนารี: ขนาดยา คือ 5 - 10 มิลลิกรัม วันละครั้ง

อาการเจ็บหน้าอกเนื่องจากเลือดไปเลี้ยงกล้ามเนื้อหัวใจไม่เพียงพอเรื้อรังแบบคงที่: ขนาดยา คือ 5 - 10 มิลลิกรัม วันละครั้ง ผู้ป่วยส่วนใหญ่จะได้รับขนาดยา 10 มิลลิกรัม เพื่อผลการตอบสนองที่เพียงพอ

เด็กอายุ 6 – 17 ปี^[3]

โรคความดันโลหิตสูง: ขนาดยา คือ 2.5 - 5 มิลลิกรัม วันละครั้ง

ผู้สูงอายุ^[3]

โรคความดันโลหิตสูง: ขนาดยาเริ่มต้น คือ 2.5 มิลลิกรัม วันละครั้ง

อาการเจ็บหน้าอกเนื่องจากเลือดไปเลี้ยงกล้ามเนื้อหัวใจไม่เพียงพอเรื้อรังแบบคงที่: ขนาดยา คือ 5 มิลลิกรัม วันละครั้ง

ผู้ป่วยที่มีการทำงานของตับบกพร่อง^[3]

โรคความดันโลหิตสูง: ขนาดยาเริ่มต้น คือ 2.5 มิลลิกรัม วันละครั้ง ปรับขนาดยาอย่างช้าๆ ในผู้ป่วยที่มีการทำงานของตับบกพร่องรุนแรง

อาการเจ็บหน้าอกเนื่องจากเลือดไปเลี้ยงกล้ามเนื้อหัวใจไม่เพียงพอเรื้อรังแบบคงที่: ขนาดยา คือ 5 มิลลิกรัม วันละครั้ง

7. วิธีการใช้ยา

Amlodipine besylate เป็นยาชนิดรับประทาน สามารถรับประทานยาโดยไม่ต้องคำนึงถึงมื้ออาหาร^[2]

8. ข้อห้ามใช้

ห้ามใช้ในผู้ป่วยที่แพ้ยา amlodipine หรือส่วนประกอบตัวอื่นๆ ในตำรับ^[2]

9. คำเตือนและข้อควรระวัง^[2]

1) อาการความดันโลหิตต่ำอาจเกิดขึ้นในผู้ป่วยที่ได้รับยา amlodipine โดยเฉพาะอย่างยิ่งในรายที่มีหลอดเลือดตีบรุนแรง อย่างไรก็ตามความดันโลหิตต่ำเฉียบพลันไม่น่าจะเกิดขึ้นเนื่องจากระยะเวลายาเริ่มออกฤทธิ์ค่อยๆ เพิ่มขึ้นช้าๆ

2) การแย่งของอาการเจ็บหน้าอกหรือกล้ามเนื้อหัวใจขาดเลือดเฉียบพลันอาจเกิดขึ้นได้ โดยเฉพาะอย่างยิ่งในผู้ป่วยโรคหลอดเลือดแดงโคโรนารีอุดตันรุนแรง เมื่อเริ่มต้นการรักษาด้วยยา amlodipine หรือการเพิ่มขึ้นของขนาดยา amlodipine

3) ระวังการให้ยาในผู้ป่วยที่มีการทำงานของตับบกพร่อง ค่า clearance ของยา amlodipine ลดลง และ ค่า AUC เพิ่มขึ้นประมาณ 40 – 60 % แนะนำควรให้ขนาดยาเริ่มต้นลดลงและควรค่อยๆ เพิ่มขนาดยาอย่างช้าๆ ภายหลัง

10. อันตรกิริยากับยาอื่นๆ^{[2], [4]}

1) การได้รับยา amlodipine ร่วมกับยากลุ่ม CYP3A inhibitors (ยาที่ยับยั้งการทำงานของ CYP3A ที่มีฤทธิ์ปานกลาง เช่น diltiazem หรือ ยาที่ยับยั้งการทำงานของ CYP3A ที่มีฤทธิ์แรง เช่น clarithromycin, itraconazole) ส่งผลให้ระดับยา amlodipine ในร่างกายเพิ่มขึ้น การลดขนาดยา amlodipine อาจมีความจำเป็น

2) การรับประทานน้ำผลไม้ grapefruit ร่วมกับ amlodipine ไม่ทำให้เปลี่ยนแปลงระดับยา amlodipine ในร่างกาย

3) การได้รับยา amlodipine 10 มก. ร่วมกับ simvastatin 80 มก. ส่งผลให้ระดับยา simvastatin ในร่างกายเพิ่มขึ้น 77% เมื่อเทียบกับกรให้ยา simvastatin เป็นยาเดี่ยว ดังนั้นควรให้ยา simvastatin ไม่เกิน 20 มก.ต่อวันในผู้ป่วยที่ได้รับยา amlodipine ร่วมด้วย

4) การให้ร่วมกับยากลุ่ม CYP3A4 inducers (เช่น rifampicin, hypericum perforatum) อาจทำให้ความเข้มข้นของยา amlodipine ในพลาสมาลดลง

5) การรับประทานแอลกอฮอล์ร่วมกับ amlodipine ไม่ทำให้เปลี่ยนแปลงระดับแอลกอฮอล์ในร่างกาย

6) การให้ยาลดกรดที่มี magnesium และ aluminium ร่วมกับ amlodipine ไม่ทำให้เปลี่ยนแปลงระดับยา amlodipine ในร่างกาย

7) การให้ยา cimetidine ร่วมกับ amlodipine ไม่ทำให้เปลี่ยนแปลงระดับยา amlodipine ในร่างกาย

- 8) การให้ยา amlodipine ร่วมกับ digoxin ไม่ทำให้เปลี่ยนแปลงระดับยา digoxin ในร่างกาย
- 9) การได้รับยา amlodipine ร่วมกับ atorvastatin ไม่ทำให้เปลี่ยนแปลงระดับยา atorvastatin ในร่างกาย
- 10) การได้รับยา amlodipine ร่วมกับ warfarin ไม่ทำให้ค่า prothrombin time เปลี่ยนแปลง

11. สตรีมีครรภ์และสตรีระหว่างให้นมบุตร ^[4]

สตรีมีครรภ์: Amlodipine จัดเป็น Pregnancy Category C ผลต่อกำเนิดทารกวิรูปและพิษต่อตัวอ่อนมีแสดงให้เห็นในสัตว์ขนาดเล็กโดยปกติพบในขนาดยาที่สูงกว่าขนาดยาที่ใช้ในมนุษย์ ยังไม่มีการศึกษาที่มีการควบคุมที่ดีในสตรีมีครรภ์ ควรใช้ยานี้ในสตรีมีครรภ์เฉพาะที่จำเป็นได้อย่างชัดเจนและเมื่อโอกาสที่ผู้ป่วยจะได้รับประโยชน์คุ้มค่าความเสี่ยงที่อาจเกิดกับทารกในครรภ์เท่านั้น

สตรีระหว่างให้นมบุตร: ยังไม่ทราบว่ายา amlodipine ถูกขับออกทางน้ำนมมารดาหรือไม่ ดังนั้นควรหยุดการเลี้ยงบุตรด้วยน้ำนมตนเองในระหว่างรับการรักษาด้วยยา amlodipine

12. อาการไม่พึงประสงค์ ^[2]

มีรายงานอาการไม่พึงประสงค์ 1% หรือมากกว่าในผู้ป่วยที่ได้รับยา amlodipine คือ อาการบวม เวียนศีรษะ หน้าแดง ใจสั่น เมื่อยล้า คลื่นไส้ ปวดท้อง และ ง่วงนอน ซึ่งอาการบวม น้ำ หน้าแดง ใจสั่น และ ง่วงนอน อาจเกิดขึ้นโดยปกติในผู้หญิงมากกว่าผู้ชาย อาการบวมความสัมพันธ์กับขนาดยาอาจเกิดขึ้นน้อยครั้งเมื่อได้รับยาร่วมกับยา angiotensin-converting enzyme (ACE) inhibitor หรือ angiotensin II receptor antagonist

13. การได้รับยาเกินขนาดและวิธีการรักษา ^[1]

อาการ: พบการเกิดความดันโลหิตต่ำอย่างมากและเป็นเวลานาน และหัวใจเต้นช้า รวมทั้งอาจส่งผลให้การเต้นของหัวใจลดลง

การรักษา: ถ้าผู้ป่วยรับประทานยามาไม่นาน ให้ทำการล้างท้อง, ให้ activated charcoal และยาระบาย โดยรักษาตามอาการ รักษาภาวะหัวใจล้มเหลวด้วย inotropic agents (isoproterenol, dopamine, หรือ dobutamine) และยาขับปัสสาวะ ในผู้ป่วยกล้ามเนื้อหัวใจหนา (hypertrophic cardiomyopathy) ให้ alpha-adrenergic agents (phenylephrine HCl หรือ metaraminol bitartrate) เพื่อรักษาความดันโลหิต หลีกเลี่ยงการใช้ isoproterenol หรือ norepinephrine รวมทั้งการตรวจระวังและติดตามการทำงานของหัวใจและระบบหายใจ และการยกแขนขาให้สูง เนื่องจากยา amlodipine จับกับโปรตีนสูง การล้างไตไม่น่าจะเป็นประโยชน์

14. สภาวะการเก็บรักษา

เก็บที่อุณหภูมิต่ำกว่า 30 องศาเซลเซียส

15. รูปแบบยาและขนาดบรรจุที่มีจำหน่าย

รูปแบบยา: ยาเม็ด

ขนาดบรรจุ: บรรจุแผงบลิสเตอร์ แผงละ 10 เม็ด บรรจุกล่องกระดาษ กล่องละ 10, 50 แผง

16. ชื่อและที่อยู่ของผู้ผลิต



บริษัท ชุมชนเภสัชกรรม จำกัด (มหาชน)

1 ซอยคูบัว 11 แขวงรามอินทรา เขตคันนายาว กรุงเทพฯ 10230 ประเทศไทย

โทรศัพท์: 0-2943-0935-7 แฟกซ์: 0-2510-7874

17. วันที่มีการแก้ไขปรับปรุงเอกสาร

10 พฤศจิกายน 2560

เอกสารกำกับยาภาษาอังกฤษ

AMLOPRESS 5

1. Product Name

AMLOPRESS 5

2. Name and strength of active ingredient

Each tablet contains amlodipine besylate equivalent to amlodipine 5 mg

3. Product description

White octagon plain tablet, there is “AP” and “5” on each side of the dash in half on one side and “Rx” on the other side.

4. Pharmacodynamic/Pharmacokinetics

4.1 Pharmacodynamic

Mechanism of action

Amlodipine is a calcium channel blockers (slow channel blockers, calcium antagonist), share the ability to inhibit movement of calcium ions across the cell membrane. The effects on the cardiovascular system include depression of mechanical contraction of myocardial and smooth muscle and depression of both impulse formation (automaticity) and conduction velocity. ^[1]

4.2 Pharmacokinetics

Following oral administration of amlodipine besylate, peak plasma concentrations of the drug are attained within 6 – 12 hours. Absolute bioavailability ranges from 64 – 90%; food does not affect bioavailability of amlodipine. Amlodipine is approximately 93% bound to plasma proteins. The drug is extensively (approximately 90%) metabolized to inactive metabolites in the liver. Amlodipine is excreted in the urine as metabolites (60%) and unchanged drug (10%). The terminal elimination half-life is about 30-50 hours. ^[2]

5. Indication ^{[3], [4]}

Hypertension

Amlodipine is indicated for the treatment of hypertension. Amlodipine may be used alone or in combination with other antihypertensive agents.

Coronary artery disease

Amlodipine is indicated to reduce the risk of coronary revascularization and the need for hospitalization due to angina in patient with coronary artery disease.

Chronic stable angina

Amlodipine is indicated for the first line treatment of myocardial ischemia, whether due to fixed obstruction (stable angina) and/or vasospasm/vasoconstriction (Prinzmetal's or variant angina) of coronary vasculature. Amlodipine may be used as monotherapy or in combination with other antianginal drugs.

6. Recommended Dose

Adult: ^{[3], [4]}

Hypertension: the usual initial dose is 5 mg once daily which may be increased to a maximum dose of 10 mg once daily.

Coronary artery disease: 5 – 10 mg once daily.

Chronic stable angina: 5 – 10 mg once daily. Most patients will require 10 mg for adequate effect.

Children 6 - 17 years of age: ^[3]

Hypertension: 2.5 – 5 mg once daily.

Elderly: ^[3]

Hypertension: 2.5 mg once daily initially.

Chronic stable angina: 5 mg once daily.

Hepatic function impairment: ^[3]

Hypertension: 2.5 mg once daily initially. Titrate slowly in patients with severe hepatic impairment.

Chronic stable angina: 5 mg once daily.

7. Mode of Administration

Amlodipine besylate is administered orally. Amlodipine generally can be given without regard to meals. ^[2]

8. Contraindication

Amlodipine is contraindicated in patients with known hypersensitivity to the drug or any ingredient in the formulation. ^[2]

9. Warning and Precaution ^[2]

1) Symptomatic hypotension may occur in patients receiving amlodipine, particularly in individuals with severe aortic stenosis; however, acute hypotension is unlikely because of the gradual onset of action of the drug.

2) Worsening of angina or acute myocardial infarction can occur, particularly in patients with severe obstructive coronary artery disease, upon initiation of amlodipine therapy or an increase in amlodipine dosage.

3) Use with caution in patients with hepatic impairment, amlodipine clearance is decreased and AUC is increased by about 40-60%. A reduced initial dosage of the drug is recommended, and subsequent dosage should be titrated slowly.

10. Interactions with Other Medication ^{[2],[4]}

1) Concomitant use of amlodipine with moderate (e.g., diltiazem) or potent (e.g., clarithromycin, itraconazole) inhibitors of cytochrome P-450 (CYP) 3A isoenzymes (CYP3A) results in increased systemic exposure to amlodipine. Reduction of amlodipine dosage may be necessary.

2) Concomitant administration of grapefruit juice with amlodipine did not alter systemic exposure to amlodipine.

3) Concomitant administration of amlodipine (multiple 10 mg) with simvastatin (80 mg) resulted in a 77% increase in simvastatin exposure compared with simvastatin alone. In patients receiving amlodipine, simvastatin dosage should not exceed 20 mg daily.

4) Concomitant use of CYP3A4 inducers (e.g., rifampicin, hypericum perforatum) may give a lower plasma concentration of amlodipine.

5) Concomitant use of alcohol with amlodipine did not alter systemic exposure to alcohol.

6) Concomitant administration of a magnesium- and aluminium antacid with amlodipine did not alter systemic exposure to amlodipine.

7) Concomitant administration of cimetidine with amlodipine did not alter systemic exposure to amlodipine.

8) Concomitant use of amlodipine with digoxin did not alter systemic exposure to digoxin.

9) Concomitant administration of amlodipine with atorvastatin did not alter systemic exposure to atorvastatin.

10) Concomitant administration of amlodipine with warfarin did not alter prothrombin time.

11. Pregnancy and Lactation ^[4]

Pregnancy: Category C. Teratogenic and embryotoxic effects have been demonstrated in small animals, usually at doses higher than the usual human dosage. There are no well-controlled studies in pregnant women. Use during pregnancy only when clearly needed and when potential benefits outweigh potential hazards to the fetus.

It is not known if amlodipine is excreted in breast milk. Discontinue nursing while taking amlodipine.

12. Undesirable Effects ^[2]

Adverse effect reported in 1% or more of patients receiving amlodipine include edema, dizziness, flushing, palpitations, fatigue, nausea, abdominal pain, and somnolence. Edema, flushing, palpitations, and somnolence may occur more commonly in women than in men. Edema is dose related and may be less frequent with concomitant use of an angiotensin-converting enzyme (ACE) inhibitor or angiotensin II receptor antagonist.

13. Overdose and Treatment ^[1]

Symptoms: Symptoms of overdosage include marked and prolonged hypotension and bradycardia, both of which may result in decreased cardiac output.

Treatment: If the patient is seen shortly after oral ingestion, employ lavage, activated charcoal, and cathartics. Treatment is supportive. Treat cardiac failure with inotropic agents (isoproterenol, dopamine, or dobutamine) and diuretics. In patients with hypertrophic cardiomyopathy, use alpha-adrenergic

agents (phenylephrine HCl or metaraminol bitartrate) to maintain blood pressure; avoid isoproterenol and norepinephrine. Monitor cardiac and respiratory function; elevate the extremities. Because these agents are highly protein bound, dialysis is not likely to help.

14. Storage Condition

Store at a temperature below 30 °C

15. Dosage Forms and Packaging Available

Dosage forms: Tablets

Packaging Available: 10 tablets in blister pack, which packed in carton box of 10, 50 blisters.

16. Name and Address of Manufacturing



COMMUNITY PHARMACY PUBLIC COMPANY LIMITED

1 Soi Khubon 11, Ramintra, Kannayao, Bangkok 10230, Thailand

Tel. 0-2943-0935-7 Fax. 0-2510-7874

17. Date of revision of package insert

November 10th, 2017