

العبوات
أجين^٥: أقراص: علبه من ٣٠ قرصاً.
أجين^{١٠}: أقراص: علبه من ٣٠ قرصاً.

التكوين
أجين^٥: يحتوي كل قرص على أملوديين بيزيلات بما يعادل ٥ ملغ من الأملوديين.
أجين^{١٠}: يحتوي كل قرص على أملوديين بيزيلات بما يعادل ١٠ ملغ من الأملوديين.

الأوسعة: سولوزون دقيق البلورية، ثاني أكسيد السيليكون الغرواني، ستيرات المغنيزيوم، الخصائص الدوائية

خصائص فعل الدواء
الفئة العلاجية: حاصرات قناة الكالسيوم.
CACA ٠١: ATC
أملوديين هو مضاد للكالسيوم يثبط تدفق أيونات الكالسيوم إلى داخل العضل الأملس القلبي والوعائي. تأتي آلية المفعول المضاد لغرط ضغط الدم نتيجة للتأثير المرخي على العضل الأملس الشرياني.

لم يتم بعد توضيح الآلية التي تسمح للأملوديين بتخفيف الذبحة الصدرية توضيحاً كاملاً غير أن الأنتين التالبيين تلعبان دوراً في ذلك:

يوسع الأملوديين الشريانات الطرفية وبالتالي يخفف إجمالي المقاومة الطرفية (الحمولة التولية) التي يعمل القلب ضدها. ويؤدي تخفيف حمولة القلب هذا إلى تخفيض استهلاك الطاقة واحتياجات عضلة القلب إلى الأكسجين.

يرجع أن يكون التوسع الوعائي الناجمة والشريانات الطرفية علاقة بفعل الأملوديين. فهذا التوسع يزيد تزويد عضلة القلب بالأكسجين لدى المرضى الذين يعانون من ذبحة بريونزمتال الصدرية.

لدى المرضى الذين يعانون من فرط ضغط الدم، يؤدي إعطاء واحد للدواء يومياً إلى تخفيض كبير لضغط الدم (في وضعية الاستلقاء وضعية الوقوف) يوم أربع وعشرين ساعة.

لدى المرضى الذين يعانون من الذبحة الصدرية، يولد إعطاء واحد للدواء يومياً من إجمالي وقت التمرين ومن الوقت الفاصل حتى حصول الذبحة للصداء ومن الوقت الفاصل حتى حصول هبوط من ١ ملغ في قطعة ST. يخفف الأملوديين عدد مرات حصول نوبات الذبحة الصدرية واستعمال أقراص ثلاثي نترات الغليسيريل.

خصائص حركيات الدواء

الامتصاص
بعد الإعطاء عن طريق الفم لجرعات علاجية، يتم امتصاص الأملوديين ببطء من القناة الهضمية. لا يتأثر التوافر الأحيائي للأملوديين بتناول الطعام بالتزامن. يتراوح التوافر الأحيائي المطلق للمادة الفاعلة من دون تغيير من ٦٤ إلى ٨٠٪ تقريباً. يتم بلوغ ذروة تركيزات البلازما في غضون ١٢-١٤ ساعة بعد الإعطاء التوزيع

يبلغ حجم التوزيع ٢٠ ل/كغ تقريباً. يبلغ ثابت تفكك الحمض pKa للأملوديين ٨.٦، وتبلغ نسبة الربط البروتيني للبلازما ٩٨٪.

التحلل الأحيائي
يتراوح عمر النصف للبلازما بين ٣٥ و ٥٠ ساعة. يتم بلوغ استقرار تركيز البلازما بعد فترة تتراوح بين ٧ و ١٤ أيام.

يتم استقلاب الأملوديين على نطاق واسع إلى أيضات حاملة الأيزلة.

يتم إفراز ٦٠٪ تقريباً من الجرعة المعطاة في البول، تكون نسبة ١٠٪ منها على شكل غير مستقلب.

دواعي الاستعمال
يوصف أجين^٥ لعلاج:
- فرط ضغط الدم الأساسي.
- الذبحة الصدرية المزمنة المستقرة والمشججة للأوعية.

الاستعمال
يتمتع استعمال الأملوديين لدى المرضى المصابين:
- بفرط حساسية ضد مشتقات الديهايدروبيريدين أو الأملوديين أو أي من الأوسعة.
- نقص ضغط الدم الحاد.
- الصدمة (بما في ذلك الصدمة القلبية).
- انسداد مسلك التدفق للبطيئ الأيسر (مثلاً تضيق الأبهر العالي الدرجة).
- قصور قلبي غير مستقر من الناحية الدينامية الدموية بعد احتشاء عضلي قلبي حاد.

الحاذير
لم يتم إثبات سلامة الأملوديين وفعاليتها في خلال نوبة فرط ضغط الدم.

البرضي المسنون بقصور قلبي
يجب معالجة المرضى المصابين بقصور قلبي بحذر. في دراسة طويلة الأمد مراقبة مع علاج إرضائي، لدى مرضى مصابين بقصور قلبي حاد (NYHA فئة III و IV) كان معدل حصول الوفاة الرئوية المغاد عنه أعلى لدى المجموعة المعالجة بالأملوديين منه لدى مجموعة العلاج الإرضائي. لكن هذا لم يتوافق مع تفاقم القصور القلبي.

الاستعمال لدى المرضى المصابين بضعف في الوظيفة الكبدية
لدى المرضى المصابين بقصور في الوظيفة الكبدية يطول عمر النصف للأملوديين؛ لم يتم تأكيد التوصيات المتعلقة بمقدار الجرعة. لذلك يجب إعطاء هؤلاء المرضى بالأملوديين بحذر.

الاستعمال لدى المرضى المسنين
لدى المرضى المسنين يجب زيادة مقدار الجرعة بعناية.

الاستعمال لدى المرضى المصابين بقصور كلوي
يمكن استعمال الأملوديين لدى هؤلاء المرضى بجرعات عادية.

إن التغييرات في تركيزات البلازما غير مرتبطة بدرجة الضعف الكلوي، ليس الأملوديين قابلاً للدليزة.

القدرة على القيادة واستعمال الآلات
يمكن أن يكون للأملوديين تأثير ضعيف أو معتدل على القدرة على القيادة واستعمال الآلات. إذا كان المرضى الذين يأخذون الأملوديين من الدواء أو الصداد أو التبغ أو الكافيين قد تصف دهرتهم على التفاعل.

الحمل والإرضاع
لم يتم التثبت من سلامة الأملوديين في الحمل لدى البشر.

لم تظهر الدراسات التأسلية لدى الفئران أي سمية إلا في حال تأخر تاريخ الولادة وطال وقتها عند أخذ جرعات تفوق بحسبين مرة مقدار الجرعة القصوى الموصى بها لدى البشر.

لا يوصى بالاستعمال في خلال فترة الحمل إلا عندما لا يتوافر بديل أكثر سلامة وعندما يشكل المرض بحد ذاته خطراً أكبر على الأم والجنين.

من غير المعروف إذا كان الأملوديين يفرز في حليب الثدي. لذلك فالقرار بمواصلة الإرضاع أو إيقافه أو بمواصلة العلاج أو إيقافه يجب اتخاذه مع الأخذ بعين الاعتبار فائدة الإرضاع بالنسبة إلى الطفل وفائدة العلاج بالنسبة إلى الأم.

التفاعلات الدوائية

تأثيرات أدوية أخرى على الأملوديين
منظطات CYP3A4: لا تستعمل المتزامن للإريثروميسين المثبط لـ CYP3A4 لدى المرضى من الشباب والبالغين لدى المرضى المسنين على التوالي ارتفع تركيز الأملوديين في البلازما بنسبة ٢٢٪ و ٥٠٪ على التوالي. غير أن الصلة السريعة لهذه النتائج غير مؤكدة. لا يمكن استعمال أن المثبطات القوية للـ CYP3A4 (مثلاً كيتوكونازول، إينزاكونازول، ريتونايفير) قد تزيد من تركيزات الأملوديين في البلازما أكثر من البوليغازيم. لذلك يجب استعمال الأملوديين بحذر بالتزامن مع منظطات CYP3A4. ولكن لم تتم الإبادة عن أي تأثيرات جانبية كنتيجة لهذا التفاعل.

محفزات CYP3A4: ما من معطيات متوافرة حول تأثير محفزات CYP3A4 على الأملوديين. فالاستعمال المتزامن لمحفزات CYP3A4 (مثلاً ريفاميسين، هابيكروم بيرفيراوتوم) قد يعطي تركيزاً أدنى للأملوديين في البلازما. لذلك يجب استعمال الأملوديين بحذر بالتزامن مع محفزات CYP3A4.

في دراسات التفاعل السريعة لم يؤثر عصير الكريب فروت والسميتيديين والألمونيوم/مغنيزيوم (مضاد للحموضة) والسليدينايفيل على الحركة الدوائية للأملوديين.

تأثيرات الأملوديين على أدوية أخرى
إن التأثير المخفف لضغط الدم للأملوديين يزيد من التأثيرات المخففة لضغط الدم لأدوية أخرى مضادة لغرط ضغط الدم.

في دراسات التفاعل السريعة، لم يؤثر الأملوديين على حركيات الأتورفاستاتين

والديجوكسين والإيثانول (الكحول) والوارفارين والسكلوسورين. لا يؤثر الأملوديين على المعامل المخبرية.

التأثيرات الجانبية
لاحظت التأثيرات الجانبية التالية وأفيد عنها في خلال العلاج بالأملوديين مع معدل حصول جرد أقل النحو الآتي: الشائعة جداً (≤ ١٠/٨٠): الشائعة (≤ ١٠٠/٨٠٠): غير الشائعة (≤ ١٠٠٠/٨٠٠٠): النادرة (≤ ١٠٠٠٠/٨٠٠٠٠): غير المعروفة (لا يمكن تقدير معدل حصولها استناداً إلى المعطيات المتوافرة).

الاضطرابات في الدم والجهاز اللمفاوي: قلة الكريات البيضاء، قلة الصفيحات النادرة (نادرة جداً).

اضطرابات جهاز المناعة: تأثيرات تجسسية (نادرة جداً).

اضطرابات الأيض والتغذية: فرط سكر الدم (نادر جداً).

الاضطرابات النفسية: تغييرات في المزاج (بما في ذلك القلق)، اكتئاب (غير شائعة)، فتوش (نادر).

اضطرابات الجهاز العصبي: نعاس، دوام صداع (بخاصة في بداية العلاج) (شائعة)، رجفة، خلل الذوق، إغماء، نقص الحس، تنمل (غير شائعة)، فرط توتر، اعتلال الأعصاب المحيطية (اضطراب جداً).

اضطرابات العينين: اضطراب بصري (بما في ذلك ازدواج الرؤية) (غير شائع).

اضطرابات الأذن والأذن الباطنة: طنين (غير شائع).

اضطرابات القلب: خفقان (غير شائع) احتشاء عضلي قلبي، لانتظمة (بما في ذلك بدء القلب وتوسع القلب البطني والرجف الأذيني) (نادرة جداً).

اضطرابات الأوعية الدموية: تورم (شائع)، نقص ضغط الدم (غير شائع)، التهاب الأوعية الدموية (نادر جداً).

اضطرابات التنفس والصدر والاضطرابات الدوائية: ضيق نفس، التهاب الأنف (غير شائعين)؛ سعال (نادر جداً).

الاضطرابات المعوية المعوية: ألم في البطن، غثيان (شائعين)؛ تقوؤ، عسر هضم، تغير في الحركة المعوية (بما في ذلك الإسهال والإمساك)، جفاف الفم (غير شائع)؛ التهاب البنكرياس، التهاب المعدة، تضخم اللثة (نادرة جداً).

الاضطرابات الكبدية الكبدية: التهاب الكبد، بقران، زيادة الأنزيمات الكبدية (تترافق في الغالب مع الركود الصفراوي) (نادرة جداً).

اضطرابات الجلد والشعر تحت الجلد: صلع، فرقرية، تغير لون الجلد، فرط التعرق، حكة، طفح، طفحية (غير شائعة)؛

حزب وعائي، حمامي متشكلة، شرى، التهاب الجلد التقشري، تاندر ستيفنز-جونسون؛ أوديميا كوتيك، حساسية تجاه الضوء (نادرة جداً).

الاضطرابات العضلية الهيكلية واضطرابات النسيج الضام العظم: تورم الكاحل (شائع)، ألم مفاصل، ألم عضلي، تشنج عضلي، ألم في الظهر (غير شائع).

الاضطرابات الكولوية والبولية: تبول، أثناء الليل، زيادة نسبة التبول (غير شائعة).

اضطرابات الجهاز التناسلي والتهديني: عجز جنسي، تقوؤ الرجل (غير شائعين).

اضطرابات عامة وأحوال موقع الإعطاء: أوديميا، تعب (شائعين)؛ ألم في الصدر، وهن، ألم، تورم (غير شائع).

الاستقصاءات: زيادة الوزن، انخفاض الوزن (غير شائعين).

مقدار الجرعة والإعطاء
لاستعمال عن طريق الفم.
يجب أخذ الأقرص مع كوب من السوائل (مثلاً كوب ماء) بعيداً عن أوقات الطعام. لا يؤثر تناول المتزامن للكريب فروت وعصير الكريب فروت على مفعول الأملوديين.

البالغين
لعلاج فرط ضغط الدم والذبحة الصدرية، تبلغ الجرعة العادية من أجين^٥ ٥ ملغ مرة واحدة يومياً. إذا لم يكن من الممكن تحقيق التأثير العلاجي المرغوب به في غضون أسبوعين إلى ٤ أسابيع، يمكن زيادة الجرعة حتى تبلغ جرعة قصوى من ١٠ ملغ يومياً (تعطى كجرعة مفردة) حسب التجارب الفردية للمرضى.

يمكن استعمال أجين^٥ كعلاج أحادي أو بالتزامن مع دواء مضاد للذبحة لدى المرضى الذين يعانون من الذبحة الصدرية.

الأطفال الذين يعانون من فرط ضغط الدم من عمر السادسة حتى السابعة عشرة تبلغ الجرعة الفعوية المضادة لغرط ضغط الدم الموصى بها لدى المرضى من الأطفال الذين يتراوح عمرهم بين ٦ و ١٧ عاماً ٢.٥ ملغ مرة واحدة يومياً كجرعة يومية. يمكن زيادتها حتى ٥ ملغ مرة واحدة يومياً إذا لم يتم تحقيق هدف ضبط ضغط الدم بعد ٤ أسابيع. تتم دراسة الجرعات التي تفوق ٥ ملغ يومياً لدى المرضى من الأطفال. إن تأثير أجين^٥ على ضغط الدم لدى الأطفال ما دون السادسة من العمر غير معروف.

المرضى المسنون
للمرضى المسنون يوصى بأخذ الجرعة العادية؛ لكن يجب اعتماد الحذر عند زيادة الجرعة.

المرضى المصابين بضعف كلوي
يمكن استعمال أجين^٥ لدى هؤلاء المرضى بالجرعات العادية.

إن التغييرات في تركيزات أجين^٥ في البلازما غير مرتبطة بدرجة الضعف الكلوي. ليس أجين^٥ قابلاً للدليزة.

المرضى المصابين بضعف كبد
لدى المرضى المصابين بضعف كبد، لم يتم تحديد أي نظام لتحديد مقدار الجرعة؛ لذلك يجب إعطاء أجين^٥ بحذر.

فرط الجرعة
لدى البشر، الخبرة مع فرط الجرعة المتعمد محدودة.

العوارض
حسب المعطيات المتوافرة، يمكن أن يسبب فرط الجرعة الكبير توسعاً مفرطاً في الشرايين المحيطية وتوسع القلب الأتغاسي. أفيد عن نقص ضغط مجموعي قوي ومطول حتى الإصابة بصدمة مع نتيجة مميتة.

العلاج
يستدعي نقص ضغط الدم الكبير من الناحية السريرية بسبب فرط جرعة الأملوديين معاً قلبياً وعائياً فاعلاً يتضمن مراقبة متكررة للوظيفة القلبية والتنفسية ورفع الأطراف الانتباه إلى حجم السائل الجاري والنتاج البولي. قد يكون من المفيد استعمال مضيق للأوعية في إرجاع التوتر الوعائي وضغط الدم شرط ألا يكون استعماله ممنوعاً. قد يكون حقن غلوكوكورتايد الكالسيوم داخل الوريد مفيداً في عكس حصر قناة الكالسيوم.

في بعض الحالات قد يكون من المفيد إجراء غسيل للمعدة لدى المتلوعين الأوصاء، ظنر أن استعمال الفحم غي غضون ساعتين بعد أخذ الأملوديين ١٠ ملغ يخفف من سرعة امتصاص الأملوديين.

بما أن الأملوديين مرتبط بالبروتين ارتباطاً عالياً، لا يرجح أن تكون الدليزة مفيدة.

شروط الحفاظ
إحفظ الدواء في حرارة لا تفوق ٢٥ درجة مئوية.

إحفظ الدواء في علبته الأصلية في ظروف سليمة.

تاريخ مراجعة النشرة: آذار ٢٠١٢.

هذا دواء:

- الدواء مستحضر يؤثر على صحتك، وإستهلاكه خلافاً للتعليمات يعرضك للخطر .
- إتبع وصفة الطبيب بدقة، وإرشادات الإستعمال، وتعليمات الصيدلاني الذي صرفها لك .
- إن الطبيب والصيدلاني هما الخبيران في الأدوية، فواتئها ومخاطرها .
- لا تقاطع فتره العلاج المحددة لك من تلقاء نفسك .
- لا تكرر نفس الوصفة دون إستشارة طبيبك .
- إحفظ الأدوية بعيداً عن متناول الأطفال .

مؤتمر وزراء الصحة العرب
 واتحاد الصيدالة العرب

