

LODINE Tablets



Composition: Each Lodine (5 – 10) Tablet contains:

Amlodipine Besylate equivalent to (5 or 10) mg Amlodipine.

Mechanism of Action:

Amlodipine inhibits the trans membrane influx of calcium ions into cardiac and vascular smooth muscle. The mechanism of its antihypertensive action is due to a direct relaxant effect on vascular smooth muscle causing reduction in peripheral vascular resistance. The precise mechanism by which it relieves angina has not been fully determined, the mechanism may be by dilates peripheral arterioles and coronary arteries, so it improves oxygen supply and reduced energy and oxygen requirement by the heart.

Pharmacokinetic:

After oral administration, amlodipine is well absorbed (Absolute bioavailability 64-80%). It is extensively metabolised (approx. 90%) by the liver to inactive pyridine derivatives. The terminal plasma elimination half-life is about 35-50 hours. 10% of the parent compound and 60% of inactive metabolites excreted in the urine, and 20-25 % with faeces.

Indications:

Lodine may be used alone or in combination with other medicines to treat:

- High blood pressure.
- Stable (chronic) angina pectoris and angina caused by vasospasm.
- Angiographically Documented CAD In patients with recently documented CAD by angiography and without heart failure or an ejection fraction <40%.

Contraindications: Lodine is contra-indicated in patients with:

- shock (including cardiogenic shock).
- hypersensitivity to amlodipine, dihydropyridine derivatives or any of the excipients.
- haemodynamically unstable heart failure after acute myocardial infarction (during the first 28 days).
- obstruction of the outflow-tract of the left ventricle (e.g., high grade aortic stenosis)

Warnings & Precautions:

- **Lodine** should be used with caution in patients with hepatic insufficiency and elderly patients.
- **Lodine** should be used with caution in patients with heart failure.

Pregnancy and lactation:

Pregnancy: Pregnancy Category C, there are no adequate studies for the use of amlodipine in pregnant women. Use only if the expected benefit is greater than the potential risk to the fetus.

Lactation: It is not known if this medicine is excreted in breast milk. Therefore, it is recommended that breastfeeding be discontinued when the mother is taking the medicine.

Drug Interactions:

- Studies indicate that there was no drug interaction of amlodipine with digoxin, phenytoin, warfarin and indomethacin at the level of binding to plasma proteins.
- CYP3A4 inhibitors (such as ketoconazole, macrolides, protease inhibitors and grapefruit juice): cause elevated blood levels of amlodipine.
- CYP3A4 inducers (such as rifampicin): reduce blood levels of amlodipine.

Side Effects: As with other calcium channel blockers, the most common symptoms include: headache, edema, fatigue, nausea, redness of the face, abdominal pain and constipation.

Driving and using machines: Lodine can have minor or moderate influence on the ability to drive and use machines.

Dosage and Administration: Lodine may be used alone or in combination with other medicines to treat:

- High blood pressure: **Lodine** is indicated for the treatment of high blood pressure, at an initial dose of 5 mg per day, which may be increased to 10 mg per day in adults.
- Stable (chronic) angina pectoris and angina due to vasospasm (Prinzmetal or variable angina): The recommended dose for stable or variable angina is 5-10 mg in adults.
- Angiographically Documented CAD In patients with recently documented CAD by angiography and without heart failure or an ejection fraction <40%: The recommended dose for coronary artery disease patients ranges from 5-10 mg once daily.
- In children: The effective dose for lowering blood pressure in children (6-17 years) is 2.5 - 5 mg once daily.

Overdose: Large overdose of amlodipine could result in excessive peripheral vasodilatation and possibly reflex tachycardia.

Cardiovascular and respiratory function should be monitored. A vasoconstrictor may be helpful in restoring vascular tone and blood pressure, and calcium gluconate can be given to counteract the blockade of calcium channels. Hemodialysis is not effective in removing an overdose of amlodipine due to its strong binding to plasma proteins.

Storage: Keep this medicine out of the sight and reach of children. Store below 30°C. Store in the original package.

Packaging: Each carton Lodine (5-10) contains: 20 or 30 tablets in two or three blister strips.



ريفا فارما

لودين مضغوطات

التكوين: كل مضغوطة لودين (٥ - ١٠) تحتوي على:
أملوديبين ببسيلات مايعادل (٥ أو ١٠) ملغ أملوديبين.
آلية التأثير:

يمنع أملوديبين تدفق شوارد الكالسيوم عبر الغشاء الخلوي في كل من عضلة القلب والعضلات الملساء الوعائية. ترجع آلية تأثيره الخافض للضغط إلى تأثيره المباشر المرخي للعضلات الملساء الوعائية مما يؤدي إلى تقليل مقاومة الأوعية الدموية المحيطة. لم يتم تحديد الآلية الدقيقة التي يؤثر بواسطتها على الذبضة الصدرية بشكل كامل، ويمكن أن تكون الآلية عن طريق توسيع الشرايين المحيطة والشرايين التاجية، لذا فهو يحسن إمداد الأوكسجين ويقلل من احتياجات القلب من الطاقة والأوكسجين.

الحرائك الدوائية:

يُمتص الأملوديبين بشكل جيد (التوافر الحيوي المطلق ٦٤ - ٨٠٪) بعد تناوله عند طريق الفم ويتم استقلابه في الكبد على نطاق واسع (حوالي ٩٠٪) إلى مشتقات بيريدين غير فعالة. يبلغ عمره النصف النهائي من ٣٥ إلى ٥٠ ساعة. حوالي ١٠٪ من المركب الأم و ٦٠٪ من المستقلبات غير النشطة تُطرح في البول، كما يُطرح ٢٠-٢٥٪ مع البراز.

الاستقطابات: يمكن أن يستعمل لودين لوحده أو بالمشاركة مع أدوية أخرى لمعالجة:

- ارتفاع الضغط.
- الذبضة الصدرية المستقرة (المزمنة) والذبضة الصدرية الناجمة عن التشنج الوعائي.
- الداء الشرياني التاجي المشخص بالتصوير الوعائي بدون قصور قلبي أو الجزء المقنوف EF أقل من ٤٠٪.

مضادات الاستقطاب:

- وجود حساسية على الأملوديبين أو أي من مركبات الديهيدروبيريدين أو أي من مكونات المستحضر.
- الصدمة (بما في ذلك الصدمة قلبية المنشأ).
- قصور القلب غير المستقر ديناميكياً بعد إحتشاء العضلة القلبية الحاد (خلال أول ٢٨ يوم).
- انسداد القناة الخارجة من البطين الأيسر (مثل تضيق الأبهر عالي الدرجة).

التحذيرات والاحتياطات:

- يستعمل لودين بحذر عند مرضى القصور الكبدى والمرضى كبار السن.
- يستعمل بحذر لدى مرضى قصور القلب.

الحمل والإرضاع:

الحمل: التصنيف الحلمي C، لا توجد دراسات كافية لاستعمال الأملوديبين عند النساء الحوامل. يستعمل فقط إذا كانت الفائدة المرجوة أكبر من المخاطر المحتملة على الجنين.

الإرضاع: من غير المعروف إذا كان الأملوديبين يُطرح في حليب الأم. لذا يوصى بإيقاف الإرضاع عند تناول الأم للدواء.

التداخلات الدوائية:

- تشير الدراسات لعدم وجود تداخل دوائي للأملوديبين مع الديجوكسين، الفينيتوين، الوارفارين والإنوميتاسين على مستوى الإرتباط مع بروتينات البلازما.
- مثبطات انزيم ستوكروم 3A4 (مثل كيتوكونازول، المكاروليدات، مثبطات البروتياز وعصير الغريب فروت): تسبب ارتفاع مستويات الأملوديبين الدموية.
- محفزات انزيم ستوكروم 3A4 (مثل ريفامبيسين): تقلل المستويات الدموية للأملوديبين.
التأثيرات الجاتبية: كما هو الحال مع حاصرات قنوات الكالسيوم الأخرى فإن أكثر الأعراض شيوعاً تتضمن: الصداع، الزدمة، الإرهاق، الغثيان، احمرار الوجه، ألم البطن والإمساك.
التأثير على القيادة واستخدام الآلات:
يمتلك لودين تأثيرات خفيفة أو متوسطة على القدرة على القيادة واستعمال الآلات.

الجرعة والإستعمال:

- ارتفاع الضغط: بجرعة مبدئية ٥ملغ يومياً يمكن أن ترتفع إلى ١٠ملغ يومياً عند البالغين.
- الذبضة الصدرية المستقرة (المزمنة) والذبضة الصدرية الناجمة عن التشنج الوعائي (ذبضة برزوميثال أو الذبضة المتغيرة): الجرعة الموصى بها هي ١٠-٥ ملغ عند البالغين.
- الداء الشرياني التاجي المشخص بالتصوير الوعائي بدون قصور قلبي أو الجزء المقنوف EF أقل من ٤٠٪:
تتراوح الجرعة الموصى بها من ١٠-٥ ملغ مرة واحدة يومياً.
- عند الأطفال: الجرعة الفعالة الخافضة للضغط الشرياني عند الأطفال بعمر (٦-١٧ سنة) هي ٢,٥ ملغ - ٥ ملغ مرة واحدة يومياً.

فرط الجرعة: تسبب فرط الجرعة توسعاً وعائياً محيطياً شديداً يليه انخفاض في ضغط الدم وربما حدوث تسرع قلب انعكاسي. يجب إجراء مراقبة لوظائف الجهاز القلبي الوعائي والجهاز التنفسي. يمكن إعطاء مقيض لاستعادة ضغط الدم والتقيض الوعائي إن أمكن ذلك، كما يمكن إعطاء غلوكونات الكالسيوم لمعكسة التأثير الحاصر لقنوات الكالسيوم. لا يجدي إجراء الغسيل الكلوي لإزالة الجرعة الزائدة من الأملوديبين نفعاً بسبب إرتباطه الشديد ببروتينات البلازما.

شروط الحفظ: احفظ الدواء بعيداً عن متناول الأطفال. يُحفظ بدرجة حرارة أقل من ٣٠ درجة مئوية وفي العلبة الأصلية.

التعبئة: بكل عبوة كرتونية لودين (٥ - ١٠) تحتوي على: ٢٠ أو ٣٠ مضغوطة ضمن شريطين أو ثلاث أسطوانات بليستر.