

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Neosorbid® 60 mg prolonged-release tablets

Неосорбид® 60 mg таблетки с удължено освобождаване

НАЦИОНАЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Изм. Рег. №	20050407
Разрешение №	11-14823 / 15. 09. 2011
Добавление №	

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа изосорбид-5-мононитрат (*isosorbide-5-mononitrate*) 60 mg

За пълния списък на помощните вещества, вж. точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки с удължено освобождаване.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Неосорбид® е показан за лечение на ангина пекторис.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Възрастни

Една таблетка веднъж дневно, приета сутрин. Дозата може да бъде увеличена до 120 mg (две таблетки) дневно, и двете приети веднъж дневно сутринта. Дозата може да бъде титрирана, за да се минимизира възможността за поява на главоболие, като се започне с 30 mg (половин таблетка) през първите 2-4 дни.

Не са открити доказателства за нуждата от рутинно коригиране на дозата при възрастни, но е възможно да се наложи специална грижа при тези с предразположение към хипотензия или подчертана чернодробна или бъбречна недостатъчност.

Сърцевината на таблетката е неразтворима в храносмилателните сокове, но се разпада на малки частици, когато цялото активно вещество е освободено. Понякога матриксът може да премине през гастро-интестиналния тракт, без да се разпадне и да бъде открит в изпражненията, като цялото активно вещество е било освободено.

Приложение

Таблетките Неосорбид® не трябва да се сдъвкват или разтрошават. Те трябва да се поглъщат цели с половин чаша вода.

Деца

Безопасността и ефективността на Неосорбид® при деца не са установени.

4.3 Противопоказания



Свръхчувствителност към някои от съставките. Конструктивна кардиомиопатия и перикардит, аортна стеноза, сърдечна тампонада, митрална стеноза и тежка анемия.

Силденафилът потенцира хипотензивния ефект на нитратите, затова съвместното му назначение с нитрати или съединения, доставящи азотен окис, е противопоказано.

Тежката мозъчно-съдова недостатъчност или хипотензия са относително противопоказани при употреба на Неосорбид®.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Неосорбид® не е показан за облекчение на остри ангинозни атаки; в случай на остра атака трябва да се използват таблетки глицерил-тринитрат сублингвално или букално.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Хипотензивният ефект на нитратите се потенцира от едновременното приемане на силденафил.

4.6 Бременност и кърмене

Безопасността и ефективността на Неосорбид® по време на бременност и кърмене не са установени.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са известни.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Повечето нежелани лекарствени реакции са фармакодинамично медиирани и дозозависими. В началото на лечението може да се появи главоболие, което обикновено изчезва след 1-2 седмици. Дозата може да се титрира, за да се минимизира възможността за поява на главоболие, като лечението се започне с 30 mg. Понякога се докладва за хипотензия, придружена от виене на свят и гадене. Тези симптоми обикновено изчезват при продължително лечение. Рядко е било докладвано за обрив и сърбеж. В много редки случаи – за миалгия.

4.9 Предозиране

Симптоми

Пулсиращо главоболие. По-сериозни симптоми са възбуда, червенина, студена пот, гадене, повръщане, световъртеж, припадък, тахикардия и падане на кръвното налягане.

Справяне с предозирането

Предизвикване на повръщане, приемане на активен въглен. В случай на ясно изразена хипотензия пациентът трябва първо да бъде поставен да легне по гръб с вдигнати крака. Ако е необходимо, трябва да се приложат течности интравенозно.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Принципното фармакологично действие на isosorbide-5-mononitrate, който е активен метаболит на isosorbide dinitrate, е отпускането на съдовата гладка мускулатура, осъществяваща вазодилатация на артериите и вените, като ефектът върху последните преобладава. Ефектът от лечението зависи от дозата. Ниските плазмени концентрации водят до венозна дилатация, в резултат на която се получава периферен приток на кръв, намалена венозна компенсация и намаление на диастоличното налягане в левокамерния край (преднатоварване). Високите плазмени концентрации също разширяват артериите, намалявайки системното съдово съпротивление и артериалното налягане, което води до намаляване на сърдечното следнатоварване. Isosorbide-5-mononitrate може също да има директен разширяващ ефект върху коронарните артерии. Чрез намаляване на крайното диастолично налягане и обем препаратът намалява и вътрестенното налягане, като по този начин води до подобряване на субендокардиалния кръвен поток.

Затова окончателният ефект, когато се предписва isosorbide-5-mononitrate, е намалено работно натоварване на сърцето и подобрен баланс между количеството доставян и необходим кислород в миокарда.

5.2 Фармакокинетични свойства

Isosorbide-5-mononitrate се абсорбира напълно и не подлежи на ефекта на първо преминаване в черния дроб. Това намалява вътре- и междуиндивидуалните вариации в плазмените нива и води до предвидими и възпроизводими клинични ефекти.

Елиминационният полуживот е около 5 часа. Свързването с плазмените протеини е малко от 5%. Обемът на разпределение е около 0,6 l/kg и тоталният клирънс е около 115 ml/min. Елиминацията е главно чрез денитрация и свързване в черния дроб. Метаболитите се екскретират главно през бъбреците. Само около 2% от приетата доза се екскретира непроменена през бъбреците.

Нарушената чернодробна или бъбречна функция нямат съществено влияние върху фармакокинетичните свойства.

Неосорбид® е лекарство с удължено освобождаване. Активното вещество се освобождава независимо от pH, в рамките на период от 10 часа. В сравнение с обикновените таблетки фазата на абсорбция е удължена и ефектът е по-продължителен.

Степента на бионаличност на Неосорбид® е около 90% в сравнение с таблетките с незабавно освобождаване. Абсорбцията не се засяга значително от приема на храна и не се наблюдава натрупване в стабилно състояние. Неосорбид® показва дозо-пропорционален кинетичен профил до 120 mg. След повторно перорално приложение с 60 mg веднъж дневно максимална плазмена концентрация (около 3 000 pmol/l) се достига след около 4 часа. След това плазмената концентрация постепенно пада до под 500 pmol/l в края на дозовия интервал (24 часа след приемане на дозата). Таблетките са делими.

В изследвания с плацебо Неосорбид®, приет веднъж дневно, ефективно контролира ангина пекторис както по отношение на упражнителните способности и симптоми, така и на намаляването признаците на миокардната исхемия. Продължителността на ефекта е поне 12 часа, като в този момент плазмената концентрация е на същото ниво, както 1 час след приемане на дозата (около 1 300 pmol/l).

Неосорбид® е ефективен и като монотерапия, и в комбинация с хронично блокираща терапия.

Клиничните ефекти на нитратите могат да отслабнат по време на повторно назначение поради високите и/или равни плазмени нива. Това може да бъде избегнато посредством допускане на ниски плазмени нива за определен период от дозовия интервал. Неосорбид®, когато се назначава веднъж дневно сутрин, има високи нива на плазмения профил през деня и ниски нива през нощта. Към Неосорбид®, приет веднъж дневно в доза 60 или 120 mg, не се развива толерантност по отношение на антиангиналния ефект. Феноменът на повторното свързване между дозите, наблюдаван при терапия с нитратни пластири, не се наблюдава при тази с Неосорбид®.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Достъпните данни показват, че isosorbide-5-mononitrate притежава очакваните фармакодинамични свойства на органичен нитратов естер, притежава прости фармакокинетични свойства и няма токсични, мутагенни или онкогенни ефекти

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Алуминиев силикат
Специален парафин
Хидроксипропилцелулоза ЛФ
Магнезиев стеарат
Колоидален безводен силициев двуокис
Хипромелоза 6 cps
Макрогол 6000
Титаниев диоксид E171
Жълт железен диоксид E172

6.2 Несъвместимости

Не са приложими за продукти с удължено освобождаване.

6.3 Срок на годност

3 години.

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 30°C.

6.5 Данни за опаковката

PVC/алуминиеви блистери
30 таблетки Неосорбид® 60 mg перорална употреба
100 таблетки Неосорбид® 60 mg перорална употреба

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Нео Балканика ЕООД
Ул. "Земляне" 35
София, България

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Неосорбид® 60 mg –

**9. ДАТА НА ПЪРВОТО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА
РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Януари 2010 г.