

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА (КХП)

1. НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Amigren 50 mg tablets
Амигрен 50 mg таблетки

Amigren 100 mg tablets
Амигрен 100 mg таблетки

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТА	
Приложение към разрешение за употреба № 11-17246/27.09.06	
703/19.09.06	<i>Ment</i>

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

- *Лекарствено вещество:*

Sumatriptan 50 mg tablets: 50 mg sumatriptan base (под формата на сукцинатна сол).

Sumatriptan 100 mg tablets: 100 mg sumatriptan base (под формата на сукцинатна сол).

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки

КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. ТЕРАПЕВТИЧНИ ПОКАЗАНИЯ

Sumatriptan е показан за бързо овладяване на мигренозни пристъпи, с и без наличие на аура.

Sumatriptan трябва да се прилага само при сигурна диагноза мигрена.

4.2. ДОЗИРАНЕ И НАЧИН НА ПРИЛОЖЕНИЕ

Възрастни

Sumatriptan таблетките са показани за бързо, интермитентно овладяване на мигренозен пристъп. Лекарственият продукт не трябва да се използва за профилактика на мигренозните атаки.

Препоръчително е Sumatriptan да се приеме възможно най-скоро след началото на мигренозния пристъп, въпреки, че той е еднакво ефективен независимо в кой стадий на пристъпа се прилага.

Препоръчителната перорална доза на Sumatriptan е една таблетка от 50 mg, еднократно. При някои пациенти се налага използване на доза от 100 mg. В случаите, при които пациентът се повлиява от еднократната доза, но симптоматиката се възобновява, може да се приложи втора доза в рамките на следващите 24 часа, като при това трябва да се осигури минимален интервал от 2 часа между двете дози и следва да не се приемат повече от 300 mg в рамките на даден 24 часов период.

Пациентите, които не се повлияват от еднократната предписана доза Sumatriptan, не трябва да приемат втора доза за овладяване на същата атака. Sumatriptan може да се приема при последващи мигренозни пристъпи.

Sumatriptan се препоръчва като монотерапия за остро лечение на мигрена и не трябва да се приема едновременно с други лекарствени продукти за лечение на остри мигренозни пристъпи. В случаите, при които пациентите не се повлияват от Sumatriptan, не съществуват основания нито от теоретично естество нито от ограничения клиничен опит да не се прилагат aspirin или други НСПВЛ за по-нататъшно овладяване на мигренозния пристъп.

Таблетките трябва да се приемат цели, с вода.

Деца (под 18 годишна възраст)



Безопасността и ефективността на Sumatriptan при деца не е установена.

Пациенти в старческа възраст (над 65 години)

Клиничният опит за употребата на Sumatriptan таблетки при пациенти на над 65 годишна възраст е ограничен. Фармакокинетичното поведение на Sumatriptan не се различава съществено от това при по-млади пациенти, но до натрупването на допълнителни клинични данни, употребата на Sumatriptan таблетки при пациенти на над 65 годишна възраст не е препоръчителна.

4.3. ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

При свръхчувствителност към лекарственото вещество и/или помощните вещества.

Sumatriptan не трябва да се прилага при пациенти, прекарвали инфаркт на миокарда, пациенти, страдащи от исхемична болест на сърцето (ИБС) и спазъм на коронарните артерии (ангина на Prinzmetal), периферни съдови заболявания, или при пациенти със симптоми характерни за ИБС.

Sumatriptan не трябва да се използва при пациенти с анамнестични данни за преходна исхемична атака или друг мозъчно-съдов инцидент.

Sumatriptan не трябва да се използва при пациенти с тежки чернодробни заболявания.

Употребата на Sumatriptan при пациенти със средно тежка или тежка форма на хипертония както и при лека, но не овладяна хипертония, е противопоказана.

Едновременната употреба на ergotamine и производните му (вкл. methysergide) е противопоказана (вж. Лекарствени и други взаимодействия).

Едновременната употреба на инхибитори на моноаминооксидазата и Sumatriptan е противопоказана (вж. Лекарствени и други взаимодействия).

Sumatriptan таблетки не трябва да се прилагат в продължение на поне 2 седмици след преустановяване на лечение с инхибитори на моноаминооксидазата.

4.4. СПЕЦИАЛНИ ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ И ПРЕДПАЗНИ МЕРКИ

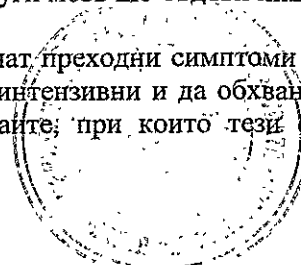
Sumatriptan трябва да се прилага само в случаите, при които диагностицирането на мигрена е несъмнено.

Sumatriptan не е показан за лечение на хемиплегична, базиларна или офталмоплегична мигрена.

Препоръчителните дози на sumatriptan не трябва да се превишават. Аналогично на другите лекарствени продукти за лечение на мигрена, преди да се пристъпи към овладяване на атаките от главоболие, е необходимо пациентите да бъдат диагностицирани като страдащи от мигрена, а при тези случаи, ако се наблюдават атипични прояви, е необходимо да се изключи наличието на други, потенциално сериозни неврологични състояния.

Трябва да се има предвид, че при пациентите, страдащи от мигрена, може да е налице повишен риск от преходна исхемична атака или други мозъчно-съдови инциденти.

След прилагането на sumatriptan могат да възникнат преходни симптоми вкл. болка и пристягане в гръдния кош, които могат да бъдат интензивни и да обхвалят и гърлото (Виж Нежелани лекарствени реакции). В случаите, при които тези симптоми се



приемат за проява на ИБС, не трябва да се приемат последващи дози sumatriptan и състоянието на пациента трябва внимателно да се оцени.

Sumatriptan не трябва да се прилага при пациенти, при които се преценява наличие на повишен риск от исхемична болест на сърцето без да се направи предварителна оценка на сърдечно-съдовия статус. Особено внимание трябва да се обърне на жените в постменопауза и на мъжете на възраст над 40 години. Предварителните изследвания обаче могат и да не идентифицират всички пациенти с наличие на сърдечно заболяване и в много редки случаи са описани сериозни сърдечни инциденти при пациенти без налично сърдечно-съдово заболяване.

Sumatriptan трябва да се прилага внимателно при пациенти с контролирана хипертония, тъй като е наблюдавано преходно повишаване на кръвното налягане и на периферното съдово съпротивление при ограничен брой пациенти.

Има редки пост-маркетингови съобщения за пациенти със астения, хиперрефлексия и нарушена координация след едновременна употреба на селективен инхибитор на обратното поемане на серотонин (SSRI) и sumatriptan. В случаите, при които е належащо и клинично оправдано да се прилагат едновременно sumatriptan и SSRI, е препоръчително пациентите да бъдат щателно наблюдавани.

Sumatriptan трябва да се прилага внимателно при пациенти в състояния, които могат значително да повлияят резорбцията, разпределението, метаболизма и екскрецията на лекарствата, като напр. нарушена чернодробна или бъбречна функция.

При пациенти с чернодробни нарушения трябва да се предвиди доза от 50 mg.

При пациентите със свръхчувствителност към сулфонамиди може да се прояви алергична реакция след прием на sumatriptan. Реакциите могат да варират от кожни прояви на свръхчувствителност до анафилаксия. Независимо, че данните за наличие на кръстосана свръхчувствителност са ограничени, е необходимо да се пристъпва внимателно към лечение със sumatriptan при такива пациенти.

Лекарственият продукт трябва да се прилага с особено внимание при пациенти с епилепсия, структурни лезии в ЦНС както и други състояния, свързани със снижаване на гърчовия праг.

Нежеланите лекарствени реакции могат да бъдат по-чести при едновременна употреба на триптани и продукти, съдържащи жълт кантарион (*Hypericum perforatum*).

Този лекарствен продукт съдържа аспартам, явяващ се източник на фенилаланин и крие риск от увреждания при пациенти с фенилкетонурия.

Пациентите с редки наследствени прояви на галактозна непоносимост, Lapp лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат този лекарствен продукт.

4.5. ЛЕКАРСТВЕНИ И ДРУГИ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

Изследвания, проведени със здрави доброволци, показват, че sumatriptan не взаимодейства с propranolol, flunarizine, pizotifen и етанол. Sumatriptan притежава потенциал за взаимодействия с MAO-инхибитори, ergotamine и производните му. Повишеният риск от коронарен вазоспазъм при едновременна терапия с тези лекарства е теоретичен и съвместната им употреба трябва да се избягва (виж също и противопоказания).



Описани са продължителни състояния на съдов спазъм при употреба на ergotamine. Тъй като е възможно тези ефекти да бъдат адитивни е необходимо преди да се пристъпи към лечение със sumatriptan да изминат 24 часа след прием на продукт, съдържащ ergotamine. Аналогично продукти, съдържащи ergotamine, не трябва да се приемат в продължение на 6 часа след прилагане на sumatriptan.

Рядко настъпват взаимодействия при едновременна употреба на sumatriptan и SSRI (виж специални предупреждения и предпазни мерки)

4.6. БРЕМЕННОСТ И КЪРМЕНЕ

Налични са пост-маркетингови данни за употребата на sumatriptan през първия триместър на бременността при повече от 1000 жени. Независимо, че тези данни са недостатъчни за формулиране на дефинитивни заключения, те не показват повишен риск от конгенитални дефекти. Клиничният опит за употребата на sumatriptan през втория и третия триместър са оскъдни.

Оценката на предклиничните експерименти върху животни не показва директни тератогенни ефекти или негативни ефекти върху перинаталното и постнаталното развитие. Установено е, обаче, повлияване на ембриофеталната жизненост при зайци (виж раздел 5.3.). Към прилагане на sumatriptan трябва да се прибегва, само ако ползата за майката се дефинира като по-голяма от потенциалния риск за плода.

Установено е, че след подкожно приложение sumatriptan се екскретира с кърмата. Рискът от експозиция у кърмачето може да се намали като се избягва кърменето в рамките на 24 часа след приема на sumatriptan.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Както самата мигрена, така и терапевтичното ѝ повлияване със sumatriptan могат да предизвикат сънливост. Препоръчва се особено внимание при пациенти, които шофират или работят с машини.

4.8. НЕЖЕЛАНИ ЛЕКАРСТВЕНИ РЕАКЦИИ

Общи

Наблюдават се симптоми като болки, чувство на топлина, тежест, стягане, изтръпване, които са обикновено преходни, но могат да бъдат изразени в значителна степен и да засегнат всяка част на тялото вкл. гръдния кош и гърлото. Наблюдавани са и следните симптоми, които обикновено са слабо до умерено интензивни и имат преходен характер: зачервяване на кожата, замайване и чувство на слабост.

Описани са също така и умора и сънливост.

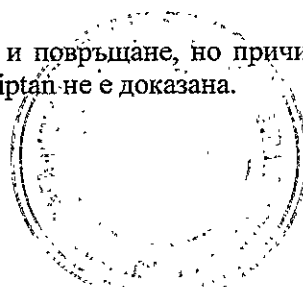
Сърдечно-съдови

Хипотония, брадикардия, тахикардия, палпитации.

Описано е преходно повишаване на кръвното налягане, проявяващо се скоро след приема на лекарствения продукт. В изключително редки случаи са наблюдавани тежки сърдечни ефекти като: сърдечни аритмии, исхемични ЕКГ промени, спазъм на коронарните артерии или инфаркт на миокарда (виж противопоказания и специални предупреждения и предпазни мерки). Описани са също така феномен на Рейно и исхемичен колит.

Гастроинтестинални

При някои пациенти са наблюдавани гадене и повръщане, но причинно-следствената връзка на тези явления с употребата на sumatriptan не е доказана.



ЦНС и неврологични

Описани са редки случаи на гърчове след употреба на sumatriptan. Независимо, че в повечето случаи гърчове са възниквали при пациенти с анамнезни данни за конвулсии и/или с предиспозиращи съпътстващи състояния, в някои от случаите не са установени подобни предразполагащи условия.

При пациентите, лекувани със Sumatriptan, рядко се наблюдава примигване.

Зрителни разстройства

Пациентите, лекувани със Sumatriptan, рядко се оплакват от зрителни разстройства като диплопия. Описани са също така и случаи на нистагъм, скотома и намалено зрение. Много рядко се наблюдава загуба на зрението, която обикновено е обратима. Важно е да се отбележи обаче, че зрителни нарушения настъпват по време на мигренозен пристъп.

Свръхчувствителност/кожа

Описани са реакции на свръхчувствителност, вариращи от кожни алергични прояви до анафилаксия.

Клинично-лабораторни показатели

Описани са незначителни изменения в тестовете за изследване на чернодробната функция.

4.9. ПРЕДОЗИРАНЕ

Описани са няколко случая на предозирание на sumatriptan. При прием на дози, надвишаващи 400 mg през устата, не са наблюдавани нежелани реакции, различни от горепосочените.

В случай на предозирание пациентът трябва да бъде внимателно проследяван в продължение на поне 10 часа като същевременно трябва да се извършва необходимото стандартно поддържащо лечение.

Не е известно какви са ефектите на хемодиализата и перитонеалната диализа върху плазмените концентрации на Amigren таблетки.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. ФАРМАКОДИНАМИЧНИ СВОЙСТВА

Фармакотерапевтична група: Селективни 5-HT₁ рецепторни агонисти, АТС-код: N02CC01

Sumatriptan е специфичен и селективен 5-хидрокситриптами_{1D} (5-HT_{1D}) рецепторен агонист, който не повлиява други 5HT рецепторни субтипове (5-HT₂, 5-HT₇). Съдовият 5-HT_{1D} рецептор се установява предимно в кръвоносните съдове на dura mater и медира вазоконстрикция. При експериментални животни sumatriptan предизвиква селективна вазоконстрикция на нивото на каротидната артериална циркулация без да повлиява мозъчния кръвен ток.

Каротидната циркулация обезпечава кръвоснабдяването на екстракраниални и интракраниални тъкани напр. менингите като дилатацията и/или формирането на оток на нивото на тези съдове се приема като основен патогенетичен механизъм на мигрената при човека.

При опити с експериментални животни е установено също така, че sumatriptan инхибира активността на n. trigeminus. И двата посочени механизма (селективна вазоконстрикция и инхибиране на тригеминалната нервна активност) могат да допринасят за антимигренозното действие на sumatriptan при човека.

Sumatriptan ефективно повлиява менструалната мигрена, т.е. мигрена без аура, която настъпва между 3 дни преди и до 5 дни след началото на менструацията. Sumatriptan трябва да се приеме възможно най-бързо при налична атака.

Терапевтичният ефект се проявява около 30 минути след пероралния прием на доза от 100 mg.

Независимо от това, че препоръчителната перорална доза на sumatriptan е 50 mg, мигренозните атаки се характеризират със значителни вариации в своя интензитет както при отделния пациент така и между различните пациенти. Дози от 25-200 mg са показали ефективност по-висока от тази на плацебо в рамките на проведените клинични изпитвания, но дозата от 25 mg е статистически значимо по-слабо ефективна от 50 и 100 mg.

5.2. ФАРМАКОКИНЕТИЧНИ СВОЙСТВА

След перорален прием sumatriptan се резорбира бързо като 70% от максималните плазмени концентрации се достигат за 45 min. След прием на доза от 100 mg максималната плазмена концентрация е 54 ng/ml. Средната абсолютна перорална бионаличност е само 14%, което се дължи на предсистемен метаболизъм както и на непълна резорбция. Плазменият полуживот на елиминиране е около 2 часа, въпреки, че има данни за по-продължителна терминална фаза на елиминиране. Степента на свързване с плазмените протеини е ниска (14-21%), средният обем на разпределение е 170 литра. Средният тотален плазмен клирънс е около 1160 ml/min и средният бъбречен клирънс е приблизително 260 ml/min.

Екстрареналният клирънс е 80 % от тоталния клирънс. Sumatriptan се елиминира основно за сметка на оксидативен метаболизъм, медиран от моноаминоксидаза, тип А. Основният му метаболит е производно на индолилоцетната киселина и се екскретира основно с урината, където се открива като свободна киселина както и като глюкурониден конюгат. Не е известно метаболитът да притежава ефекти, медиранни от 5HT₁ или 5HT₂ рецепторите.

Останалите метаболити на sumatriptan не са идентифицирани. Фармакокинетичните свойства на перорално прилагания sumatriptan не се повлияват от мигренозните пристъпи.

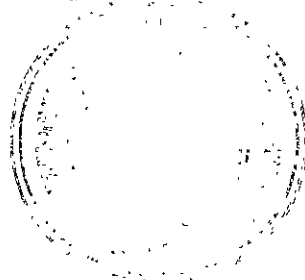
В рамките на проведено пилотно проучване не са установени значителни различия във фармакокинетичните параметри при млади и в напреднала възраст здрави доброволци.

5.3. ПРЕДКЛИНИЧНИ ДАННИ ЗА БЕЗОПАСНОСТ

Sumatriptan не показва генотоксична и канцерогенна активност при проучвания, проведени върху *in vitro* системи и експериментални животни.

При проучвания върху фертилитета на плъхове е установено намаляване на ефективността на оплождането след перорално прилагане на sumatriptan в дози, водещи до плазмени концентрации на sumatriptan 100 до 200 пъти по големи, в сравнение с тези, отчетени при пациенти, приемащи перорална доза от 100 mg.

При субкутанно прилагане на sumatriptan с постигане на плазмени концентрации 150 пъти по-високи от тези, отчетени при пероралния прием при човека, не са установени подобни ефекти върху фертилитета.



При зайци е установен леталитет у ембрионите, без наличие на изразени тератогенни дефекти. Значимостта на тези данни за безопасността на лекарствения продукт при човека е неизвестна.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. СПИСЪК НА ПОМОЩНИТЕ ВЕЩЕСТВА

AMIGREN 50/100 mg tablets

Lactose monohydrate

Cellulose microcrystalline

Croscarmellose sodium

Peppermint flavour

Talc

Aspartame

Povidone

Magnesium stearate

6.2. НЕСЪВМЕСТИМОСТИ

Не са известни

6.3. СРОК НА ГОДНОСТ

2 години

6.4. СПЕЦИАЛНИ ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ ЗА СЪХРАНЕНИЕТО

Да се съхранява само в оригиналната опаковка при температури не по-високи от 30°C.

6.5. ВИД И СЪДЪРЖАНИЕ НА ОПАКОВКАТА

AMIGREN 50 mg tablets: Aluminium/Aluminium блистер, съдържащ 2 или 4 таблетки.

AMIGREN 100 mg tablets: Aluminium/Aluminium блистер, съдържащ 2 или 4 таблетки.

6.6. УКАЗАНИЯ ЗА ИЗПОЛЗВАНЕ/СЪХРАНЕНИЕ

Няма специални указания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА/ПРОИЗВОДИТЕЛ:

АДИФАРМ ЕАД

бул. "Симеоновско шосе" № 130, 1700 София, България

тел./факс: 962 21 98; 962 21 90; 962 21 79

E-mail: adipharm@mbox.contact.bg; www.adipharm.com

8. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА:

Декември 2005

10. НАЧИН НА ОТПУСКАНЕ

Само по лекарско предписание.

