

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

NITRENDIPIN ACTAVIS
НИТРЕНДИПИН АКТАВИС



1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

NITRENDIPIN ACTAVIS 20 mg tablets

НИТРЕНДИПИН АКТАВИС 20 mg таблетки

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Лекарствено вещество в една таблетка: Нитрендипин /Nitrendipine/ 20 mg.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Показания

Лечение на артериална хипертония.

4.2. Дозировка и начин на употреба

По лекарско предписание! Приема се перорално с достатъчно количество течност, след хранене.

Лечението с Nitrendipin Actavis трябва да бъде съобразено с индивидуалните нужди и с поносимостта на пациента, като дозовия режим се определя и контролира от лекуващия лекар.

Обичайната дневна доза е 20 mg (1 таблетка) сутрин. При необходимост дневната доза се повишава до максимално 40 mg (2 таблетки) – по една таблетка сутрин и вечер.

При пациенти в напреднала възраст или при такива с хронични чернодробни заболявания, лечението започва с 10 mg дневно (1/2 таблетка) и при необходимост дозата се повишава до 20 mg дневно, разпределени в един или два приема.

Деца:

Този продукт не се препоръчва за деца. При тях безопасността и ефективността не е доказана.

4.3. Противопоказания

- свръхчувствителност към nitrendipine, други дихидропиридинови калциеви антагонисти или към някое от помощните вещества на продукта;
- кардиогенен шок;
- остър миокарден инфаркт (през първите 4 седмици);
- високостепенна аортна или субаортна стеноза;
- нестабилна стенокардия;



- хипотония (систолично налягане под 90 mmHg);
- бременност и кърмене.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения при употреба

По време на лечението трябва да се контролира артериалното налягане, сърдечната дейност, бъбречната и чернодробната функции.

Особено внимание се изисква при приложение при болни с декомпенсирана сърдечна недостатъчност, чернодробни и бъбречни заболявания и глаукома.

По време на лечение с nitrendipine може да се променят резултатите от някои диагностични и лабораторни тестове - титъра на антинуклеарните антитела (ANA); директния тест на Coombs; повишение на серумните трансаминази и алкалната фосфатаза. При пациенти в напреднала възраст е повишен рискът от хипотония, поради намаления клирънс и повишените серумни концентрации.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Хипотензивният ефект на nitrendipine се засилва при едновременна употреба с други антихипертензивни лекарствени продукти, особено с бета-блокери.

Nitrendipine може да повиши с около 15% плазмените нива на дигоксина. При съвместно лечение е необходимо да се следи за ефекти на предозиране и при необходимост да се коригира дозата на дигоксина.

Циметидин повишава плазмените нива на nitrendipine.

При едновременно приложение на празозин може да възникне хипотония.

Калциевите антагонисти могат да потенцират негативния инотропен ефект на антиаритмичните лекарствени продукти (като амиодарон и хинидин) и да доведат до синусов арест и/или AV-блок.

Антиконвулсантите, действайки като ензимни индуктори, приложени съвместно с дихидропиридинови, намаляват плазмените им концентрации, като усилват чернодробния им метаболизъм.

Ефектът на периферните мускулни релаксанти може да бъде удължен.

Нестероидните противовъзпалителни средства могат да антагонизират ефекта на калциевите антагонисти.

Рифампицин намалява плазмените концентрации на калциевите антагонисти, чрез засилване на чернодробния им метаболизъм.

Трицикличните антидепресанти засилват антихипертензивния ефект на nitrendipine и риска от ортостатична хипотония.

4.6. Бременност и кърмене

Не се препоръчва лечение с продукта по време на бременност или кърмене.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

В началото на лечението с nitrendipine или при промяна на дозата при отделни пациенти може да се наблюдава временно поява на отпадналост и световъртеж, което може да повлияе върху способността за шофиране и работа с машини.



4.8. Нежелани лекарствени реакции

Те са предимно от страна на сърдечно-съдовата система и са свързани с вазодилатацията ефект на nitrendipine. Наблюдават се в началото на лечението, постепенно отзвучават и не налагат прекратяване на терапията.

Най-често се наблюдава главоболие, зачервяване на лицето, топли вълни, тахикардия, палпитации, рядко претибиални и окологлезенни отоци. Много рядко може да предизвика болки в гърдите и ангинозен пристъп, което налага спиране на лечението. Възможни са гадене, коремни болки, диспептични нарушения, диария; повишена нервност, депресия; парестезии, мускулни крампи. Наблюдавани са изключително рядко обриви, уртикария, пруритус. В единични случаи са описани следните нежелани реакции при лечение с nitrendipine: миокарден инфаркт, миалгия, тремор, леки преходни промени в зрителната перцепция, хиперплазия на венците, гинекомастия при продължителна терапия, повишаване нивото на чернодробните ензими (серумната алкална фосфатаза, АСАТ, АЛАТ). Повечето от тези нежелани реакции са леки и обратими след преустановяване на лечението.

4.9. Предозиране

Симптоми на предозиране:

Интезивно зачервяване, главоболие, тежка хипотония, колапс, тахикардия, брадикардия, рядко AV-блок, който може да прогресира до асистолия.

Терапевтични мерки:

Мерките са насочени към елиминиране на лекарствения продукт и хемодинамично стабилизиране.

При перорално приемане на свръхдоза е показана стомашна промивка евентуално съчетана с тънкочревна промивка. При даване на лаксативи, трябва да се има предвид, че калциевите антагонисти инхибират чревната мускулатура до степен на чревна атония.

Хемодиализата не е подходяща, защото nitrendipine не може да се диализира. Препоръчва се обаче плазмафереза, поради високата степен на свързване с плазмените протеини и относително малкия обем на разпределение.

Брадикардията трябва да се лекува симптоматично с атропин и/или орципреналин. При животозастрашаваща брадикардия се налага поставяне на временен пейс-мейкър.

Хипотонията в резултат на кардиогенен шок и артериална вазодилатация се лекува с калций (1-2 g калциев глюконат венозно), допамин (до 25 µg/kg/min), добутамин (15 µg/kg/min), адреналин или норадреналин. Дозирането на тези лекарствени продукти се осъществява спрямо постигнатия терапевтичен ефект. Серумната калциева концентрация трябва да се поддържа около горната граница на нормата.

Поради риск от обременяване на сърцето, допълнителното прилагане на течности и обемни заместители трябва да става внимателно, при постоянен хемодинамичен контрол.



5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

АТС код: C08C A 08

Селективни калциеви антагонисти с предимно съдово действие.
Дихидропиридинови производни.

5.1. Фармакодинамични свойства

Nitrendipine представлява дихидропиридинов блокатор на калциевите канали, структурно близък до нифедипина, вазодилатор с антихипертензивни свойства. Механизмът на действие на nitrendipine е свързан с намаляване инфлукса на калциеви йони в гладкомускулните клетки на кръвоносните съдове. Той притежава голяма степен на селективност спрямо съдовата гладка мускулатура. Потиска вазоспастичните ефекти на ендогенните моноамини и олигопептиди. Това води до намаление на периферното съдово съпротивление и понижение на артериалното кръвно налягане. Оказва и известен коронародилатиращ и антиангинозен ефект. Антихипертензивното му действие след еднократен прием продължава повече от 24 часа.

Nitrendipine не проявява значими ефекти върху централната нервна система, двигателната активност и гастроинтестиналния пасаж.

5.2. Фармакокинетични свойства

Резорбира се добре в стомашно-чревния тракт след перорално приложение, но претърпява значителен метаболизъм при първо преминаване (first-pass effect). Абсолютната му бионаличност варира от 10 до 20% в зависимост от дозата. След многократно приложение бионаличността му се повишава до около 40%. Максимална плазмена концентрация се достига след 2 часа, както след еднократно, така и след многократно приложение. Времето на полуживот варира между 2.5 и 22.5 часа. Свързва се във висока степен със серумните протеини (около 97-99%). Метаболизира се предимно в черния дроб, главно чрез дехидрогенация на пиридиновите пръстени, разграждане на естерните групи чрез хидролиза на нивото на карбоксилните киселини и хидроксилиране на метиловите групи с последваща конюгация с глюкуронова киселина. Помалко от 0.1% от пероралната доза се отделя в непроменен вид с урината. След перорално приложение, 35-45% от дозата се екскретират през бъбреците като полярни метаболити през първите 24 часа. Около 77% се екскретират през бъбреците и приблизително 8% чрез фекалиите в рамките на 96 часа. Общият перорален клирънс на nitrendipine е около 81-87 L/h.

При пациенти с чернодробна недостатъчност бионаличността на nitrendipine се увеличава 2 до 3 пъти в резултат на намаления ефект на първо преминаване през черния дроб. Времето на елиминиране се удължава при пациенти с чернодробна недостатъчност.

При прием на nitrendipine със сок от грейпфрут, неговата бионаличност се увеличава, поради инхибиране на разграждането му при първо преминаване през черния дроб.

Nitrendipine преминава фето-плацентарната бариера и се излъчва в кърмата.

Nitrendipine не се диализира



5.3. Предклинични данни за безопасност

Остра токсичност

Острата токсичност (LD₅₀) на nitrendipine след перорално приложение е 2775-2910 mg/kg т.т. при мишки, повече от 10000 mg/kg т.т. при плъхове и 213 mg/kg т.т. при кучета.

LD₅₀ след интравенозно приложение е 33.4 mg/kg т.т. при плъхове.

LD₅₀ при интраперитонеално приложение е повече от 200 mg/kg т.т. при плъхове.

Хронична токсичност

Перорално приложение на nitrendipine в доза до 7.5 mg/kg/ден за 30 дни и 2.5 mg/kg/ден за 180 дни при кучета и до 200 mg/kg/ден за 30 дни и 75 mg/kg/ден за 180 дни при плъхове не са предизвикали токсични ефекти.

Репродуктивна токсичност

Проучване за репродуктивна токсичност при плъхове с дневни дози до 10 mg/kg т.т. пер ос не показва токсичен ефект върху фертилитета или перинаталното и постнаталното развитие. Проучвания върху маймуни за ембриотоксичност показват, че определено токсични за майката дози от 100 mg/kg т.т. предизвикват дефекти в областта на фалангите на плода.

Мутагенен и карциногенен потенциал

При различни проучвания in vitro и in vivo nitrendipine не показва мутагенен ефект.

При проучвания, проведени върху плъхове за период от две години (с използване на дози до 125 mg/kg) и върху мишки за 21 месеца (с използване на дози до 100 mg/kg) не е установен карциногенен ефект.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Царевично нишесте, микрокристална целулоза, повидон К-25, натриев лаурилсулфат, магнезиев стеарат.

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

3 (три) години от датата на производство.

6.4. Специални условия на съхранение

При температура под 25°C!

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5. Данни за опаковката

По 10 таблетки в блистер от PVC/AL фолио

Три блистера (30 таблетки) в една опаковка

6.6. Препоръки при употреба



Таблетките не трябва да се приемат със сок от грейпфрут, тъй като това може да увеличи ефекта на nitrendipine.

Лекарственият продукт да не се използва след изтичане срока на годност, указан на опаковката.

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

"Актавис" ЕАД,
ул. "Атанас Дуков" № 29
1407 София, България

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР В РЕГИСТЪРА ПО ЧЛ.28 ОТ ЗЛАХМ

Рег. № 20010898

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Протокол на КЛС № 497 от 26.09.1990г.

10. ДАТА НА (ЧАСТИЧНА) АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

Ноември 2008

