

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. Търговско име на лекарствения продукт

LACIPIL

2. Качествен и количествен състав

Таблетки, съдържащи 2 mg lacidipine - кръгли бели филмирани таблетки, с надпис от едната страна.

Таблетки, съдържащи 4 mg lacidipine - овални бели филмирани таблетки с разделителна линия от двете страни.

Таблетки, съдържащи 6 mg lacidipine - овални бели двойноизпъкнали филмирани таблетки.

3. Лекарствена форма

Филмирани таблетки.

4. Клинични данни

4.1. Показания

Лечение на артериална хипертония.

4.2. Дозировка и начин на употреба

Началната доза е 2 mg веднъж дневно.

Дозата може да бъде увеличена до 4 mg и при необходимост до 6 mg като се оставя достатъчно време за проявяване на пълния фармакологичен ефект. На практика това не трябва да става по-рано от 3-4 седмици, освен ако клиничното състояние не изисква по-бързо повишение на концентрацията.

Лечението на хипертонията трябва да се съобрази с тежестта на състоянието и индивидуалния отговор на пациента към терапията.

Лекарственият продукт трябва да се приема всеки ден по едно и също време, за предпочитане сутрин, независимо от храненето.

Чернодробно нарушение

При пациенти с чернодробно нарушение не се налага промяна в дозировката.

Бъбречно нарушение

При пациенти с бъбречно нарушение не се налага промяна на дозата, тъй като lacidipine не се екскретира чрез бъбреците.

Деца

Няма опит с приложението на Lacipil при деца.

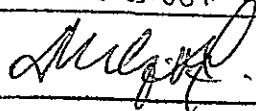
Пациенти в напреднала възраст

Не се налага промяна на дозата.

Лечението може да продължи неопределено дълго време.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към лекарственото вещество или към някоя от помощните вещества на продукта.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към	L3038-040
разрешение за употреба №	18.05.061.
684/25.10.05	



Подобно на другите дихидропиридинови, lacidipine е противопоказан при пациенти с тежка аортна стеноза, кардиогенен шок или тежко чернодробно увреждане с чернодробна недостатъчност.

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки за употреба

При специализирани проучвания lacidipine не е показал въздействие върху спонтанната функция на синусовия възел (SA). Не е предизвикал и удължаване на провеждането в атриовентрикуларния (AV) възел. Въпреки това, трябва да се има предвид теоретичната възможност калциевите антагонисти да повлияят върху функцията на синусовия и атриовентрикуларния възел. При пациенти със съществуващи вече нарушения в дейността на синусовия и атриовентрикуларния възел Lasicipil трябва да се прилага внимателно.

Както е съобщавано и за други дихидропиридинови антагонисти на калциевите канали, lacidipine трябва да се прилага внимателно при пациенти с вродено или документирано придобито удължаване на QT интервала. Lacidipine трябва да се прилага внимателно и при пациенти, лекувани едновременно с медикаменти, за които е известно, че удължават QT интервала като клас I и клас III антиаритмични лекарствени продукти, трициклични антидепресанти, някои антипсихотични вещества, антибиотици (erythromycin) и някои антихистаминови продукти (terfenadine).

Подобно на другите калциеви антагонисти lacidipine трябва да се прилага внимателно при пациенти със силно ограничен сърдечен резерв.

Подобно на другите дихидропиридинови калциеви антагонисти Lasicipil трябва да се използва внимателно при пациенти с нестабилна стенокардия или след скорошен миокарден инфаркт (до 4 седмици след инфаркта).

Lasicipil трябва да се прилага внимателно при пациенти с нарушени чернодробни функции, тъй като антихипертензивният му ефект може да се засили.

Няма данни lacidipine да нарушава глюкозния толеранс или да повлиява контрола на диабета.

В началото на лечението с lacidipine е възможно спадане на артериалното налягане и временно умерено увеличаване на сърдечната честота и помпената функция на сърцето. Тези ефекти са доза-зависими. Силно изразено увеличаване на сърдечната честота може да се компенсира с едновременно приложение на β -блокери.

Lasicipil таблетки съдържа лактоза. При деца и подрастващи са описани случаи на непоносимост към лактоза. Обаче, количеството на лактозата в таблетките вероятно няма да бъде достатъчно за да предизвика симптоми на непоносимост.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Едновременното приложение на Lasicipil и други вещества с установено хипотензивно действие, включително антихипертензивни лекарствени продукти (напр. диуретици, β -блокери или ACE инхибитори) може да доведе до адитивен хипотензивен ефект. Въпреки това в проучвания не са установени специфични взаимодействия с антихипертензивни продукти като β -блокери и диуретици, както и с digoxin, tolbutamide или warfarin.

Плазмените нива на lacidipine могат да се повишат при едновременен прием със cimetidine.

Подобно на другите дихидропиридинови, Lasicipil не трябва да се приема със сок от грейпфрут, тъй като това може да промени бионаличността му.

Известно е, че lacidipine се метаболизира от цитохром CYP3A4 и следователно инхибиторите и индукторите на CYP3A4, приложени едновременно с lacidipine, могат да повлияят метаболизма и елиминирането му.



4.6. Бременност и кърмене

Бременност:

Няма данни за безопасността на lacidipine по време на бременността при хора.

Проучвания при животни не са показали тератогенен ефект или нарушения в растежа.

Lacipil може да се прилага по време на бременност само когато потенциалните ползи за майката надвишават възможността от поява на нежелани реакции при плода или новороденото.

Трябва да се има предвид вероятността Lacipil да предизвиква релаксация на маточната мускулатура по време на раждане.

Кърмене:

Резултатите от проучвания за преминаване на lacidipine в кърмата при животни показват, че lacidipine (или метаболитите му) вероятно преминават в майчиното мляко.

Lacipil може да се прилага по време на кърмене само когато потенциалните ползи за майката надвишават възможността от поява на нежелани реакции при новороденото.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са наблюдавани ефекти върху способността за шофиране и работата с машини.

След прием на първата доза от лекарството е възможно да се появи замаяност. Тази нежелана реакция е временна и изчезва при продължаване на терапията с лекарствения продукт.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

За определяне честотата на нежеланите лекарствени реакции (от многа чести до не чести) са използвани данните от обширни клинични проучвания (вътрешни и публикувани).

Нежеланите реакции се класифицират по честота по следния начин: многа чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ и $< 1/10$), не чести ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$).

Lacipil обикновено се понася добре от организма. При някои пациенти могат да се появят слабо изразени нежелани реакции, свързани с фармакологичното действие на lacidipine – периферна вазодилатация. Тези нежелани реакции, обозначени с диез (#), са обикновено преходни и изчезват при продължителен прием на lacidipine в една и съща доза.

Реакции от страна на нервната система

Чести: # Главоболие, # замаяност.

Реакции от страна на сърдечно-съдовата система

Чести: # Палпитации

Не чести: Влошаване на съществуваща angina pectoris.

Както и при другите дихидропиридинови, при малък брой пациенти е наблюдавано влошаване на състоянието в случай на съществуваща вече angina pectoris, особено в началото на лечението. Това влошаване е по-вероятно при пациенти с клинично проявена исхемична болест на сърцето.

Реакции от страна на кръвоносната система

Чести: # Зачервяване.

Реакции от страна на гастро-интестиналния тракт



Чести: Стомашен дискомфорт, гадене
 Не чести: Хиперплазия на венците.

Реакции от страна на кожата и подкожната тъкан

Чести: Кожен обрив (вкл. еритем и сърбеж).

Реакции от страна на отделителната система

Чести: Полиурия.

Реакции от страна на целия организъм

Чести: Астения, # отоци.

Влияние върху лабораторните показатели

Чести: Обратимо повишаване на стойностите на алкалната фосфатаза (клинично значимите повишения са не чести).

4.9. Предозиране

Не са докладвани случаи на предозиране с Lacidipil.

Най-вероятният проблем би бил удължената периферна вазодилатация, свързана с хипотония и тахикардия.

Теоретично могат да се наблюдават брадикардия и удължено атриовентрикуларно провеждане.

Няма специфичен антидот. Трябва да се прилагат стандартните общи мерки за проследяване на сърдечната функция, както и подходяща поддържаща и лечебна терапия.

5. Фармакологични данни

АТС код: C08CA09

5.1. Фармакодинамични свойства

Lacidipine е специфичен и мощен калциев антагонист с доминираща селективност по отношение на калциевите каналчета в съдовата гладка мускулатура.

Основният механизъм на действието му е разширение на периферните артериоли, намаляване на периферното съдово съпротивление и понижаване на кръвното налягане.

След перорално приложение на 4 mg lacidipine при доброволци е наблюдавано минимално удължаване на QT интервала.

При четиригодишно рандомизирано двойно сляпо ELSA (European Lacidipine Study on Atherosclerosis) изпитване, основният параметър за ефикасно лечение на атеросклероза е бил измерването на дебелината интима-медиа (intima-media thickness –IMT) на каротиса чрез ултрасонография. Резултатите при пациентите, лекувани с lacidipine, са показали значителни ефекти върху IMT измененията, които са във връзка с анти-атерогенния ефект.

В клинично проучване с пациенти с бъбречна трансплантация, лекувани с cyclosporin, lacidipine възстановява намалените от cyclosporin бъбречен кръвоток и степен на гломерулна филтрация.

5.2. Фармакокинетични свойства

Lacidipil се резорбира бързо, но слабо от стомашночревния тракт след перорално приложение и претърпява значителен first-pass метаболизъм в черния дроб. Абсолютната бионаличност е средно около 10 %. Върховите плазмени концентрации се достигат между 30 и 150 минути.



Съществуват четири основни метаболита, които вероятно притежават малка или никаква фармакодинамична активност. Лекарството се елиминира главно чрез чернодробния метаболизъм (чрез P450 CYP3A4). Няма данни lacidipine да индуцира или инхибира чернодробните ензими.

Lacidipine се свързва във висока степен (>95%) с плазмените протеини албумин и α -1-гликопротеин.

Приблизително 70 % от приложената доза се елиминира под формата на метаболити с фекалиите, а останалите с урината.

Средният краен елиминационен полуживот на lacidipine варира между 13 и 19 часа в равновесно състояние.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Резултатите от проведените предклинични *in vivo* и *in vitro* проучвания за генотоксичност и канцерогенност не предполагат риск за човека.

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Сърцевина на таблетката:

Помощно вещество	Количество		
	Lacipil 2 mg	Lacipil 4 mg	Lacipil 6 mg
<i>Сърцевина на таблетката:</i>			
Lactose monohydrate	219,00 mg/tabl	197,00 mg/tabl	295,50 mg/tabl
Lactose monohydrate (spray dried)	58,25 mg/tabl	58,25 mg/tabl	87,38 mg/tabl
Povidone K30	20,00 mg/tabl	40,00 mg/tabl	60,00 mg/tabl
Magnesium Stearate	0,75 mg/tabl	0,75 mg/tabl	1,12 mg/tabl
<i>Филмово покритие:</i>			
Hypromellose*	10,0 % w/w		
Opaspray White M-1-7120*	10,0 % w/w		
Purified water	to 100,0 % w/w		

* Opadry White OY-S-7335 - 13,91 % w/w in water може да се използва вместо Hypromellose и Opaspray White M-1-7120.

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са установени.

6.3. Срок на годност

2 години.

6.4. Специални условия за съхранение

Lacipil таблетки трябва да се съхраняват при температура под 30°C.

Да се пазят от светлина и да не си изваждат от фолиевата опаковка преди времето за прием.

Ако дозировката налага прием на половин таблетка 4 mg, съдържанието на половинна трябва да се съхранява в оригиналната фолиева опаковка и да се използва в рамките на 48 часа.



Да се съхранява на място, недостъпно за деца.

6.5. Данни за опаковката

Първична опаковка: блистер от двойно алуминиево фолио.

6.6. Препоръки при употреба

Да не си изваждат от фолиевата опаковка преди времето за прием.

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

Glaxo Group Ltd.
Greenford road, Greenford,
Middlesex UB6 0NN, UK

8. Регистрационен номер в регистъра по чл. 28 ЗЛАХМ

Lacipil 2mg – регистрационен № 20040336

Lacipil 4mg – регистрационен № 20040337

Lacipil 6mg – регистрационен № 20040338

9. Дата на първо разрешаване за употреба на лекарствения продукт

В България – 13.07.2004 г.

10. Дата на (частична) актуализация на текста

07/03/2005, issue 12

