

1.3.1.1 Кратка характеристика на продукта

ОЦО-Р-001
10-11-08

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Фелодипин рациофарм 5 mg, таблетки с удължено освобождаване
Felodipine ratiopharm 5 mg prolonged release tablets
Фелодипин рациофарм 10 mg, таблетки с удължено освобождаване
Felodipine ratiopharm 10 mg prolonged release tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Фелодипин рациофарм 5 mg, таблетки с удължено освобождаване
1 таблетка с удължено освобождаване съдържа 5 mg фелодипин (felodipine).
Помощно вещество: Лактоза-монохидрат 23,95 mg

Фелодипин рациофарм 10 mg, таблетки с удължено освобождаване
1 таблетка с удължено освобождаване съдържа 10 mg фелодипин (felodipine).
Помощно вещество: Лактоза-монохидрат 21,45 mg

За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетка с удължено освобождаване

Фелодипин рациофарм 5 mg, таблетки с удължено освобождаване
Кръгла, биконвексна, светло-розова таблетка с филмово покритие, шампована с цифрата 5.

Фелодипин рациофарм 10 mg, таблетки с удължено освобождаване
Кръгла, биконвексна, червеникаво-кафява таблетка с филмово покритие, шампована с цифрата 10.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

- Есенциална хипертония
- Стенокардия

4.2 Дозировка и начин на приложение

Хипертония:



1.3.1.1 Кратка характеристика на продукта

При лека до умерена степен на хипертония, препоръчителната начална доза е 5 mg, при еднократен дневен прием. При тежка степен на хипертония, обикновено са необходими по-високи дози или да се обсъди комбинирано приложение на Фелодипин рациофарм с други антихипертензивни лекарства. Максималната дневна доза е 20 mg.

Стенокардия:

Препоръчително е започване на лечението с 5 mg веднъж дневно, като в случай на незадоволителни резултати, дозировката може да бъде увеличена до 10 mg веднъж дневно.

Пациенти в старческа възраст

Препоръчителната начална доза трябва да бъде адаптирана при пациентите старческа възраст. Последващи повишения на дозировката трябва да се предприемат с особена предпазливост.

Нарушена чернодробна функция

При пациенти с лека до умерена чернодробна недостатъчност, препоръчителната начална доза трябва да бъде снижена до минималната терапевтично ефективна доза на Фелодипин рациофарм. По време на коригирането на дозировката на Фелодипин рациофарм, кръвното налягане при тези пациенти трябва да бъде постоянно наблюдавано.

Деца и юноши

Фелодипин рациофарм не трябва да се прилага при деца и юноши, поради липсата на данни за безопасност и ефикасност в тази популационна група.

Начин на приложение

Таблетките Фелодипин рациофарм не трябва да бъдат раздробявани, сдвквани или разтваряни във вода. Таблетките Фелодипин рациофарм трябва да бъдат поглъщани цели, с вода (най-малко половин чаша) (вж. също точка 4.5). Фелодипин рациофарм може да бъде приеман без храна или с лека храна без мазнини.

4.3 Контраиндикации

- Свръхчувствителност към фелодипин (или други дихидропиридинови) или към някое от помощните вещества.
- Бременност
- Нелекувана декомпенсирана сърдечна недостатъчност
- Остър миокарден инфаркт
- Нестабилна стенокардия
- Кардиогенен шок (както и при другите калциеви антагонисти, лечението трябва да бъде прекъснато при пациенти, развиващи кардиогенен шок)



1.3.1.1 Кратка характеристика на продукта

- Тежка аортна или митрална стеноза
- Обструктивна хипертрофична кардиомиопатия
- Тежка чернодробна недостатъчност (напр. чернодробна цироза)

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Както другите артериални вазодилататори, фелодипин може да влоши декомпенсираната сърдечна недостатъчност при пациенти с нарушен отток и при пациенти с десностранна декомпенсирана сърдечна недостатъчност, в резултат на повишеното съпротивление на белодробните съдове (белодробно сърце, *cor pulmonale*).

Както другите артериални вазодилататори, фелодипин може, в редки случаи, да доведе до значима хипотония с тахикардия, която при предразположени индивиди може да доведе до миокардна исхемия.

Влошената орална хигиена увеличава възможността за развитието на гингивална хиперплазия.

Редуциране на дозата на фелодипин се изисква при пациенти с тежка чернодробна недостатъчност.

Пациентите с редки вродени проблеми по отношение на галактозната непоносимост, дефицит на Lарр лактаза или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат това лекарство.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Фелодипин може да усилва или допълни въздействията на други антихипертензивни лекарствени продукти.

Едновременната употреба с вещества, които биват също елиминирани от системата ензими цитохром Р450-3А4, би повлияла плазмените нива на фелодипин.

Плазмените нива на фелодипин могат да бъдат повишени от ензимни инхибитори (като циметидин, еритромицин, итраконазол, кетоназол и сок от грейпфрут).

Плазмените нива на фелодипин могат да бъдат снижени от ензимни индуктори (като фенитоин, карбамазепин и барбитурати).

Фелодипин не повлиява плазмените нива на циклоспорин.

Добавянето на Фелодипин радиофарм към диуретичната терапия би могло, временно, да повиши бъбречната екскреция на натрий и да усилва предходно съществуващата хипокалиемия.

Високите нива на плазмения протеин, свързващ се с фелодипина, не заемат несвързаната фракция на други, екстензивно свързващи се с плазмения протеин лекарства, като антикоагуланта варфарин.



1.3.1.1 Кратка характеристика на продукта

Необходимо е да се има предвид възможно клинично релевантно взаимодействие между фелодипин и сок от грейпфрут, тъй като е наблюдавано значимо повишение на C_{max} и "площта под кривата" на фелодипин, при едновременния му прием с грейпфрутов сок. Ето защо, сокът от грейпфрут не трябва да се приема заедно с фелодипин.

Антихипертензивните ефекти на фелодипин не се понижават при едновременната му употреба с нестероидни антивъзпалителни аналгетици (NSAID).

Кръвните нива на дигоксин се повишават при едновременното му приложение с фелодипин. Ето защо, при едновременното приложение на двете активни вещества, трябва да се има предвид намаляване дозата на дигоксин.

4.6 Бременност и кърмене

Липсват достатъчно данни за употребата на фелодипин по време на бременността при хора, за преценка на потенциален риск. Предклиничните изследвания установяват вредността на този медикамент. Фелодипин рациофарм не трябва да се приема по време на бременността. Това означава, че Фелодипин рациофарм може да бъде назначаван при жени във фертилна възраст, само след изключване на възможността за забременяване.

Фелодипин се екскретира в майчината кърма. При терапевтични дози обаче, нивото му в кърмата е ниско и не се очакват въздействия върху кърмачетата. Ето защо, при необходимост, е възможно използването на Фелодипин рациофарм по време на кърмене.

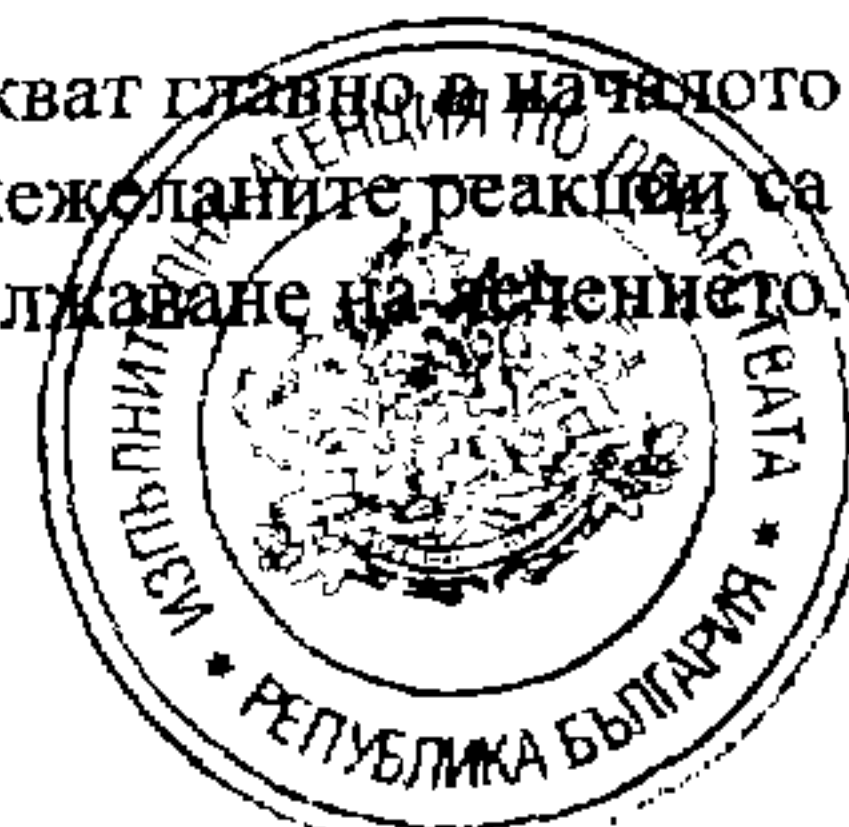
4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са провеждани проучвания за ефектите върху способността за шофиране и работа с машини. При пациенти, страдащи от замаяност, главоболие, умора или гадене, способността за реагиране може да бъде нарушена.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции са описани по-долу по органо-системен клас и честота. Честотите са определени като: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечести ($\geq 1/1,000$, $< 1/100$), редки ($\geq 1/10,000$, $< 1/1,000$), много редки ($< 1/10,000$), неизвестни (не могат да бъдат преценени въз основа на наличните данни).

Повечето от нежеланите реакции са дозо-зависими и възникват главно в началото на лечението или след повишаване на дозата. Повечето от нежеланите реакции са от преходно естество и интензитетът им намалява при продължаване на лечението. Съобщавани са следните нежелани реакции:



1.3.1.1 Кратка характеристика на продукта

Нарушения на нервната система

Главоболие, замаяност и умора; в редки случаи парестезия

Сърдечни нарушения

Оток на глезените, зачервяване; в редки случаи тахикардия, сърцебиене и синкоп/припадък.

Стомашно-чревни нарушения

В единични случаи гадене, повръщане, стомашна или коремна болка

Нарушения на кожата и мускулите

Редки: сърбеж, обрив, фотосенсибилизация. В много редки случаи: артралгия, мускулна слабост, алергични реакции като уртикария, ангиоедем и втрисане.

Други

Гингивална хиперплазия, гингивит.

В редки случаи: менорагия; наблюдавано е повишение на нивата на чернодробните ензими (най-вече алкална фосфатаза); импотентност/сексуална дисфункция; полиурия.

4.9 Предозиране

Симптоми

Предозирането може да причини прекомерна периферна вазодилатация с изразена хипотония, понякога придружавана от брадикардия.

Овладяване

Прилагането на стомашен лаваж, активен въглен и лаксатив може да предотврати абсорбцията. Ако хипотонията е тежка, необходимо е започването на симптоматично лечение. Пациентът трябва да бъде поставен по гръб, с вдигнати крака. При наличието на брадикардия, се прилага атропин 0,5-1 mg, интравенозно. Ако това се окаже недостатъчно, плазменият обем се увеличава чрез вливане на напр. глюкоза, физиологичен разтвор или декстран. Могат да бъдат приложени симпатомиметици.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармако-терапевтична група: Дериват на дихидропиридин
АТС-код: C08C A02

Фелодипин е съдово селективен калциев антагонист. Фелодипин ~~снизжава~~ артериалното кръвно налягане чрез намаляване на периферното съдово



1.3.1.1 Кратка характеристика на продукта

съпротивление. Поради липсата на повлияване както върху съдовата гладка мускулатура, така и върху адренергичната вазомоторна система, фелодипин обичайно не предизвиква ортостатична хипотония.

Фелодипин е ефективен при лечението на лека до умерена степен на хипертония.

Фелодипин може да бъде използван самостоятелно или в комбинация с други антихипертензивни лекарства при лечението на хипертония.

Фелодипин намалява както систолното, така и диастолното кръвно налягане и може да се използва при случаи на изолирана систолна хипертония.

Фелодипин има антистенокарден и анти-исхемичен ефект, дължащи се на подобрения миокарден кислороден баланс (снабдяване/нужда). Коронарното съдово съпротивление намалява и коронарният кръвоток, както и снабдяването на миокарда с кислород се увеличават в резултат на разширението на епикардните артерии и артериоли. Понижаването на системното кръвно налягане води и до намаляване на натоварването на лявата камера.

Фелодипин подобрява устойчивостта към физическо натоварване и намалява стенокардните пристъпи при пациенти със стабилна стенокардия, причинена от физически усилия. Както симптоматичната, така и асимптоматичната/тиха миокардна исхемия биват редуцирани от фелодипин при пациенти с вазоспастична стенокардия (ангина на Prinzmetal).

Фелодипин може да бъде използван като монотерапия или в комбинация с β -блокери при пациенти със стабилна стенокардия.

Фелодипин не влияе съществено върху нивото на глюкозата в кръвта или на профила на липидите.

Хемодинамични ефекти:

Редуцирането на общото периферно съдово съпротивление води до понижаване на кръвното налягане и леко и временно повишаване на сърдечната честота и обем на изтласкване.

След приема на първата доза може да се наблюдава понижаване на кръвното налягане. Продължителността на ефективността е най-малко 24 часа.

Плазмените концентрации на фелодипин и спада на общото периферно съдово съпротивление и кръвното налягане са обвързани с положителна корелация, както след прилагането на единична, така и след прилагането на многократни дози.

Ефекти, върху със сърдечната функция:

Фелодипин, прилаган като монотерапия или в комбинация с β -блокери не повлиява директно PQ- интервала. Единственият, непосредствено наблюдаван след прилагането на терапевтичната доза ефект (при инвазивни електрофизиологични изследвания) е леко удължаване на времето на провеждане от предсърдието до снопчето на Хис.

Бъбречни ефекти:



1.3.1.1 Кратка характеристика на продукта

Фелодипин има натриуретично и диуретично действие в резултат на директния тубулен ефект, водещ до временно повишена диуреза. Не е наблюдавана задръжка на вода и натрий.

Пациентите с тежка хипертония и намалена бъбречна функция (GFR < 55 ml/мин) могат да използват Фелодипин рациофарм за дългосрочно подобряване на скоростта на гломерулната филтрация.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция и разпределение

Фелодипин се абсорбира напълно в стомашно-чревния тракт след перорално приложение. Системната наличност на фелодипин е около 15% в резултат на усиления метаболизъм на «първото преминаване» и е дозово-зависима в обхвата на терапевтичните дозировки.

Абсорбционната фаза при Felodipine ratiopharm е удължена, което води до относително постоянни серумни концентрации за 24-часовия период.

Елиминиране и метаболизъм

Фелодипин се метаболизира предимно в черния дроб и всички идентифицирани метаболити са неактивни. Около 70% от дозата се екскретира във вид на метаболити в урината, останалата част се екскретира във фекалиите. По-малко от 0,5% от дозата остава непроменена в урината. Отчетеното време на елиминация на фелодипин е 25 часа. При възрастни пациенти и при пациенти с нарушена чернодробна функция, плазмените концентрации на фелодипин са, средно, по-високи. Фармакокинетиката остава непроменена при пациенти с нарушена бъбречна функция.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Няма съществени данни

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Силициев диоксид, колоиден, безводен (E551), жълт железен оксид (E172), хипромелоза (E464), лактоза монохидрат, магнезиев стеарат (E572), микрокристална целулоза (E460), повидон (поливинилпиролidon) (E1201), пропилен гликол, пропилгалат (E310), червен железен оксид (E172), талк (E553b) и титаниев диоксид (E171).

6.2 Несъвместимости



1.3.1.1 Кратка характеристика на продукта

Неприложимо

6.3 Срок на годност

4 години

6.4 Специални условия на съхранение

Този лекарствен продукт не изисква специални условия на съхранение

6.5 Данни за опаковката

PVC/PE/PVDC/Алуминиев блистер

Големини на опаковката: 14, 28, 30 и 50 таблетки с удължено освобождаване.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма специални изисквания

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Ratiopharm GmbH

89079 Ulm

Германия

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

