

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Grandaxin® 50 mg tablets
Грандаксин 50 mg таблетки

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към РУ	11-3384, 05.11.08
Одобрено:	23/30.09.08

2. КАЧЕСТВЕН КОЛИЧЕСТВЕН И СЪСТАВ

Лекарствено вещество: всяка таблетка съдържа 50 mg tofisopam.

За пълния списък на помощните вещества, вижте т. 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки за перорално приложение.

Описание на таблетките: бели или сивкаво бели, дисковидни, плоски, със скосени ръбове таблетки, с делителна ивица от едната страна и маркирани с "Grandax" от другата страна.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

- Лечение на психични (невротични) и соматични разстройства, характеризиращи се с напрегнатост, тревожност, вегетативни нарушения, липса на мотивация и енергичност, апатия, уморяемост, потиснато настроение;
- Симптоматично лечение на псевдоангина;
- При алкохолен синдром на отнемане, възбудна вегетативна симптоматика при пре-делир и делир.

Поради това, че tofisopam не притежава миорелаксиращ ефект, този лекарствен продукт може да бъде предписван в случаите когато миорелаксацията е противопоказана или нежелана (например при myasthenia gravis, миопатия и неврогенна мускулна атрофия).

4.2 Дозировка и начин на приложение

Обичайната доза за възрастни е 1-2 таблетки 1-3 пъти дневно (общо 50 mg до 300 mg дневно).



Когато се дава при конкретен случай, дозата може да бъде 1-2 таблетки. Поради добрата поносимост на Grandaxin таблетки и липсата на повлияване на бодрото състояние няма необходимост от титриране на дозата, така че пациентите могат да започнат да приемат дозата, с която се постига адекватен терапевтичен ефект още от самото начало на лечението.

4.3 Противопоказания

- свръхчувствителност към лекарственото, помощните вещества, или към други бензодиазепини;
- декомпенсирана дихателна недостатъчност;
- анамнеза за пароксизмална нощна апнея;
- анамнеза за кома.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

- Лекарственият продукт е противопоказан по време на първия триместър на бременността и по време на кърмене;
- Приложението при пациенти с компенсирани респираторна недостатъчност или при такива с анамнеза за остра дихателна недостатъчност трябва да става с повишено внимание;
- Лечение на пациенти в старческа възраст, такива с психични заболявания и такива с увредена бъбречна и/или чернодробна функция трябва да става с повишено внимание, защото честотата на нежеланите реакции при тях е по-висока;
- Едновременното приложение с депресанти на ЦНС (напр. алкохол, антидепресанти, антихистамини, успокоителни и сънотворни, антипсихотици, опиоидни аналгетици, общи анестетици), с Grandaxin може да доведе до усилване на ефектите им (виж т. 4.5.);
- Приложението на tofisopam не се препоръчва при хронични психотични заболявания, фобии и компулсивни състояния. Приложението му в тези случаи може да увеличи риска от суицидни опити и агресивно поведение. Затова приложение на Grandaxin като монотерапия не се препоръчва при депресия и при смесено депресивно-тревожно разстройство. При пациенти с деперсонализация лечението трябва да става с повишено внимание;
- При пациенти с органично мозъчно заболяване (напр. атеросклероза) лечението трябва да става с повишено внимание;
- Tofisopam може да провокира епилептични припадъци при пациенти с епилепсия;
- Лекарството не се препоръчва при пациенти с тяснооъгълна глаукома;
- Всяка таблетка Grandaxin съдържа 92 mg лактоза. Това трябва да се има предвид при предписване на пациенти с лактозна непоносимост.

Не трябва да се консумира алкохол по време на лечението с Grandaxin.



4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти други форми на взаимодействие

- Едновременното приложение с депресанти на ЦНС (напр. аналгетици, общи анестетици, антидепресанти, антихистамини, успокоителни и сънотворни, антипсихотици) с Grandaxin може да доведе до усиляване на ефектите на всяко от лекарствата (напр. седативния ефект, ефекта на потискане на дихателната функция);
- Индукторите на чернодробните ензими (алкохол, никотин, барбитурати, антиепилептици и др.) могат да ускорят метаболизма на tofisopam, което може да доведе до намаляване на плазмената му концентрация и съответно на терапевтичния му ефект;
- Някои антимикотици (ketokonazole, itraconazole) могат да потиснат чернодробния метаболизъм на tofisopam, което да доведе до увеличение на плазменото му ниво;
- Някои антихипертензивни лекарства (clonidine, калциеви антагонисти) могат да усилят ефектите на tofisopam. Бета-блокери, макар и без да е установено клиничното значение на този факт, могат да потиснат метаболизма на лекарственото вещество;
- Tofisopam може да повиши плазмените нива на дигоксина;
- Бензодиазепините могат да повлияят антикоагулантния ефект на warfarin;
- Продължителното лечение с disulfiram може да потисне метаболизма на tofisopam;
- Антиацидните лекарства могат да повлияят резорбцията на tofisopam. Cimetidine и omeprazole потискат метаболизма на tofisopam;
- Пероралните контрацептиви потискат метаболизма на tofisopam;
- Tofisopam намалява супресивния ефект на алкохола върху ЦНС.

4.6 Бременност и кърмене

Бременност

Tofisopam преминава през плацентата. Лечението с него е противопоказано по време на първия триместър на бременността, приложението му по-късно може да стане след внимателна преценка на съотношението риск/полза.

Кърмене

Лекарството се екскретира с кърмата, следователно приложението му при кърмачки е противопоказано.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Въпреки че Grandaxin не причинява сънливост и няма седативен ефект, пациентите не трябва да шофират и работят с машини в началото на лечението. По-късно степента и продължителността на това ограничение може да бъде разглеждано индивидуално.



4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции са разделени в следните категории според честота на поява: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечести ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редки ($\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1000$), много редки ($< 1/10\ 000$), с неизвестна честота (не може да се прецени според наличните данни).

Нежеланите лекарствени реакции на Grandaxin обикновено са леки и преходни, проявяват се най-вече при приложение на високи дози.

Нарушения на нервната система

Чести: безсъние; ***много редки:*** провокиран пристъп при пациенти с епилепсия.

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения

Редки: респираторна депресия.

Стомашно-чревни нарушения

Чести: повръщане, гадене, констипация, метеоризъм, сухота в устата.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

Редки: екзантем, скарлатиформен екзантем.

Нарушения на мускуло-скелетната система и на съединителната тъкан

Редки: напрежение в мускулите, мускулна болка.

Общи нарушения и ефекти намлястото на приложение

Чести: главоболне, сърбеж.

Хепатобилиарни нарушения

Много редки: холестатичен иктер.

Психични нарушения

Чести: раздразнителност, напрежение; ***редки:*** възбуда; ***много редки:*** обърканост.

4.9 Предозиране

Симптоми:

Ефекти на потискане на ЦНС се наблюдават само при приложение на високи дози (50-120mg/kg телесна маса). Такива дози могат да причинят повръщане, обърканост, кома, потискане на дишането и/или епилептични гърчове.

Лечение:

Стомашната промивка може да бъде от полза, но провокирането повръщане трябва да се избягва, защото е налице потискане на ЦНС. Даването на активен въглен и лаксативи потиска резорбцията на лекарството.



Flumazenil (Алехате) може да се даде като антидот, но не и ако предозирането е било едновременно с tofisopam и трициклични антидепресанти, а също и в случай на свръхчувствителност към бензодиазепини или flumazenil, или ако пациентът страда от епилепсия. Основните физиологични показатели трябва да бъдат стриктно следени на фона на подходящо симптоматично лечение. Асистирано дишане може да се прави едновременно с лечението с flumazenil, ако това се налага. Не се препоръчва приложението на стимуланти на ЦНС. Хипотонията се повлиява добре с приложението на течности i.v. и от поставяне на тялото в позиция Тренделенбург. Ако кръвното налягане не се възстанови с тези мерки може да се приложи допамин или норадреналин. Диализата и провокираната диуреза не са от полза.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: анксиолитици, бензодиазепинови производни
АТС: N05B A23

Механизъм на действие: tofisopam е мек анксиолитик с краткотраен ефект и голям терапевтична ширина. Точният му механизъм на действие не е изцяло известен. Tofisopam се различава от класическите 1,4-бензодиазепини не само по химична структура, но и по фармакологични и клинично-фармакологични свойства. Той е ефективен при лечението на тревожни състояния, съпроводени от вегетативна симптоматика, уморяемост и апатия. Tofisopam не показва обичайния седативен/сънотворен ефект на класическите бензодиазепини и няма миорелаксиращ и антиконвулсивен ефект. Той не потиска психомоторната активност, когнитивните и паметови функции, а обратно - притежава лек стимулиращ ефект. Токсичността на лекарственото вещество е много ниска, а нежеланите реакции са съвсем леки. Дори при дълготрайно приложение, не е наблюдавано развитие на физическа и психическа зависимост.

5.2 Фармакокинетични свойства

Tofisopam се резорбира бързо в стомашно-чревния тракт, а максимално плазмено ниво се достига 1-1,5 часа след приложението. Свързането с плазмените протеини е 50 %. След резорбцията той подлежи на интензивен "first-pass" метаболизъм в черния дроб, основно чрез деметилиране. Приблизително 60 % от приложената доза се екскретира с урината, а 40 % - с фецеса като метаболити. Времето му на полуживот е 6-8 часа.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Не беше наблюдаван тератогенен ефект при експериментите с животни



Данните от проучванията не показват повлияване на репродуктивната функция, нито е наблюдаван мутагенен или карциногенен ефект.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Лактоза монохидрат (92 mg)
Желатин
Стеаринова киселина
Картофено нишесте
Талк
Магнезиев стеарат
Целулоза микрокристална

6.2 Несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок годност

5 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25°C.

6.5 Данни за опаковката

20 таблетки са поставени в бутилка от тъмно стъкло или на блистерни ленти, поставени в картонена кутия, заедно с листовката за пациента.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Виж точка 4.2.

Режим на отпускане: По лекарско предписание.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

EGIS PHARMACEUTICALS PLC
1106 BUDAPEST, Keresztúri út 30-38.
УНГАРИЯ



8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

980 0215

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

Дата на първо Разрешение за употреба: 11 декември 1978 г.

Дата на последно подновяване: 05 август 2003 г.

10. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА

Септември 2008 г.

