

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

ANTISTENOCARDIN 25 mg coated tablets
АНТИСТЕНОКАРДИН 25 mg обвити таблетки

НАЦИОНАЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рез. №	2000 10 947
Разрешение №	11954 08.07.2011
Обработка №	/

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

2.1 Общо описание

Кръгли, двойноизпъкнали таблетки с червен цвят.

2.2 Качествен и количествен състав

Всяка таблетка съдържа активно вещество дипиридамол (dipyridamole) 25 mg.
Помощни вещества: лактоза монохидрат, пшенично нишесте, захароза, E110, E122.
За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Обвита таблетка

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

- Профилактика на тромбоемболични усложнения при пациенти на антикоагулантна терапия след клапно протезиране.
- Профилактика на системни тромбоемболични усложнения, самостоятелно или в комбинация с ацетилсалицилова киселина при коронарна болест на сърцето; при мозъчно-съдова болест; след сърдечни операции – аорто-коронарен байпас.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни

Препоръчаната доза като профилактично антиагрегантно средство е 150–300 mg дневно, разделено в 3-4 приема.

Максимална дневна доза 600 mg.

При комбинирано лечение с ацетилсалицилова киселина дозата е по 2 таблетки 3 пъти дневно.

Педиатрична популация

Употребата на Антистенокардин не се препоръчва при деца.

Начин на приложение

Таблетките се приемат преди хранене.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества;
- Болни с доказана тежка генерализирана коронаросклероза и инфаркт на миокарда в острият стадий.



4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

- Дипиридамола трябва да се назначава внимателно при пациенти с тежка коронарна сърдечна болест, включително нестабилна стенокардия, след наскоро прекаран миокарден инфаркт, при високостепенна сърдечна недостатъчност.
- При продължително приложение на дипиридамола е необходимо периодично мониториране на показателите на хемостазата. Продуктът трябва да се прилага с внимание при лица, склонни към кръвоизливи: хепаринизирани пациенти или такива на орална антикоагулантна терапия, болни с язвена болест, вродени или наследствени заболявания на системата на кръвосъсирване.
- Дипиридамола трябва да се прилага внимателно при пациенти с *myasthenia gravis*, при лица с хипотония или нестабилно артериално налягане поради риск от поява на тежки хипотонични реакции. При такива пациенти е възможно намаляване на дозировките.
- В състава на лекарствения продукт е включено пшенично нишесте. Пшеничното нишесте може да съдържа само следи от глутен и се счита за безопасно при хора с цюлиакия.
- Лекарственият продукт съдържа лактоза. Пациенти с редки наследствени проблеми на галактозна непоносимост, Lapp лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат това лекарство.
- Лекарственият продукт съдържа захароза. Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към фруктоза, глюкозо-галактозна малабсорбция или сукраза-изомалтазна недостатъчност не трябва да приемат това лекарство.
- Оцветителите E110, E122 могат да предизвикат алергични реакции.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

- Дипиридамола повишава плазмените нива и кардиоваскуларните ефекти на аденозин. Необходимо е редуциране дозата на аденозин при едновременното им приложение.
- При едновременно приложение на дипиридамола с други орални антикоагуланти или ацетилсалицилова киселина се усилва антитромботичния ефект на последните.
- Увеличава се рискът от развитие на хеморагии при едновременно приложение на дипиридамола и хепарин.
- Дипиридамола усилва действието на антихипертензивните продукти при едновременно приложение.
- Едновременната употреба с НСПВС повишава риска от кървене.
- Дипиридамола може да намали ефектите на холинестеразните инхибитори и да влоши състоянието на пациенти с *myasthenia gravis*.
- При едновременно приемане на дипиридамола с антиацидни средства може да се намали неговия ефект поради намалената му резорбция.
- Едновременното приложение на дипиридамола с новфилин и други ксантинови деривати води до понижаване на коронародилатиращите му свойства.
- Дипиридамола намалява усвояването на флударабин и понижава ефективността му.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Експериментални проучвания при животни не показват пряко или непряко вредно въздействие върху бременността, ембрионалното/феталното развитие. Поради липса на добре контролирани проучвания при бременни жени дипиридамола се назначава (особено в I триместър) само при строги показания, когато очаквания терапевтичен ефект надвишава потенциалния риск.

Кърмене

Дипиридамола се екскретира в кърмата. При необходимост от лечение с дипиридамола, кърменето трябва да се преустанови.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини



Антистенокардин не повлиява активното внимание и може да се прилага при шофьори и оператори на машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

При прилагане на дипиридамолен в терапевтични дози нежеланите реакции най-често са минимални и преходни. При продължително лечение с дипиридамолен първоначалните нежелани реакции обикновено изчезват.

Нежеланите лекарствени реакции са класифицирани по честота и по система орган-клас. Честотата по MedDRA отговаря на: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ и $<1/10$), нечести ($\geq 1/1000$ и $<1/100$), редки ($\geq 1/10000$ и $<1/1000$), много редки ($<1/10000$), с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

Нарушения на кръвта и лимфната система: редки - нарушения в кръвосъсирването; много редки – тромбоцитопения.

Нарушения на имунната система: много редки – тежък бронхоспазъм, ангиоедем.

Нарушения на нервната система: чести – главоболие, слабост, замаяност.

Сърдечни нарушения: редки – гръдна болка или влошаване симптомите на стенокардия; много редки - ангина пекторис, *steal syndrome* (“синдром на открадването”), сърдечни аритмии, тахикардия, брадикардия.

Съдови нарушения: редки – хипотония (понякога и колапс), топли вълни.

Стомашно-чревни нарушения: чести – гадене, повръщане, диария, главно в началото на лечението.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан: редки – зачервяване на лицето, алопеция; много редки – кожни обриви.

Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан: редки - мускулни болки, артрит.

Хепатобилиарни нарушения: много редки – хепатит, холелитиаза.

4.9 Преозиране

Симптоми

Топли вълни, зачервяване, изпотяване, безпокойство, чувство на слабост, стенокардна болка. Може да се наблюдава понижаване на артериалното налягане и тахикардия.

Лечение

Провежда се симптоматично лечение. Прилагането на ксантинови деривати (аминофилин) може да промени някои от нежеланите реакции при преозиране. Няма специфичен антидот. Дипиридамолен се свързва в голяма степен с плазмените протеини и по тази причина не може да бъде отстранен ефикасно чрез хемодиализа.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Антитромботични средства, потискащи агрегацията на тромбоцитите.
АТС код: B01AC07

Дипиридамолен предизвиква натрупване на аденозин в миокарда чрез блокиране на аденозиндезаминазата и потискане инфлуksа на аденозин в еритроцитите и други клетки. Той инхибира фосфодиестеразата, което води до повишаване нивото на цАМФ в тромбоцитите и до коронародилатация и антиагрегиращ ефект върху тромбоцитите. Блокира образуването на тромбосан А₂ – стимулатор на тромбоцитната активация. Стимулира синтеза на простагландини, който е мощен ендогенен вазодилатор и тромбоцитен антиагрегант.

Дипиридамолен оказва своя вазодилатиращ ефект върху малките коронарни артерии. Той намалява градиента на налягането между проксималните и дистални области на стенозата.



Дисталните съдове са максимално дилатирани в резултат на исхемията и ефектът на коронародилататорите се проявява предимно в проксималните здрави участъци. По този начин кръвта се преразпределя от исхемичната към здравата зона. Развива се “феномен на откраждане.”

5.2 Фармакокинетични свойства

Резорбция: След перорално приложение бързо се резорбира от гастроинтестиналния тракт. Максимални плазмени концентрации се достигат около 1 до 2 часа след перорално приложение. Бионаличността при перорално приложение е 37-66%.

Разпределение: Обемът на разпределение е между 2 и 3 l/kg. С плазмените протеини се свързва в 99%.

Метаболизъм: Дипиридамолен метаболитизира в черния дроб чрез глюкуронизация. Подлага се на частична enterohepaticна циркулация.

Екскреция: Елиминирането от плазмата протича двуфазно. Алфа-елиминационен полуживот 40 минути и бета-елиминационен полуживот 10 часа. Екскретира се основно чрез жлъчката под форма на моноглюкурониди. Минимални количества се екскретират с урината. Дипиридамолен се екскретира в майчиното мляко.

5.3 Предклинични данни за безопасност

LD₅₀ на дипиридамолен след перорално приложение върху плъхове е 6 000 mg/kg т.м., а при кучета 400 mg/kg т.м.

Дипиридамолен, прилаган върху плъхове в дози, надвишаващи 60 пъти максимално допустимите терапевтични дози, не показва негативно повлияване на фертилитета.

Дипиридамолен, прилаган върху опитни животни, не показва тератогенна, канцерогенна и мутагенна активност.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Лактоза монохидрат, пшенично нишесте; силициев диоксид, колоиден безводен; целулоза, микрокристална; желатин, магнезиев стеарат, талк, кросповидон.

Състав на обвивното покритие: талк, титанов диоксид, захароза, желатин, арабска гума, опалук червен AS-25053 (захароза, E122, E171, E1201, E211, E110, E132), макрогол 6000, глицерол.

6.2 Несъвместимости

Неприложимо

6.3 Срок на годност

5 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява в оригиналната опаковка, на защитено от светлина място, при температура под 25°C. Да се съхранява на място, недостъпно за деца.

6.5 Данни за опаковката

30 таблетки в блистер от PVC/алуминиево фолио; по 2 или 40 блистера в картонена кутия, заедно с листовка.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа



Няма специални изисквания.

Неизползваният продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

СОФАРМА АД
ул. Илиенско шосе 16, 1220 София, България

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20010947

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

25.09.2001

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Юни, 2010

