

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА 20100976

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
КЪМ РЕГ. №	20100976
Разрешение №	BG/MA/MP-79297
Общественост	13-01-2020
Обработка №	

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Екодорм 7,5 mg филмирани таблетки
Ecodorm 7,5 mg film-coated tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка филмирана таблетка съдържа 7,5 mg зопиклон (*zopiclone*).
Помощни вещества с известно действие: всяка таблетка съдържа 0,57 mg лактоза монохидрат и др.
За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка
Бели, кръгли, филмирани таблетки, изпъкнали от едната страна и вдлъбнати с делителна черта от другата страна.
Таблетката може да бъде разделена на две равни дози.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

За лечение на преходно, причинно-обусловено, краткотрайно безсъние при възрастни (включително трудности при заспиване, събуждане през нощта и ранно събуждане).
Като поддържаща терапия за ограничен период на лечение на хронично безсъние.
Зопиклон се предписва, когато заболяването е тежко, което ограничава активността на пациента или го подлага на силен дистрес.
Не се препоръчва продължителна употреба. Курсът на лечение трябва да започва с най-ниската ефективна доза.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Дозата трябва да се съобрази с възрастта, теглото и общото състояние на пациента в допълнение към типа безсъние.
Лечението трябва да бъде започнато с най-ниската препоръчителна доза.

Възрастни

Обичайната доза е 1 таблетка (7,5 mg) дневно, непосредствено преди лягане.

Пациенти с бъбречни нарушения

Препоръчва се начална доза от половин таблетка (3,75 mg) дневно, макар да не е наблюдавано натрупване на зопиклон или неговите метаболити при тази група пациенти (вж. точка 5.2).
При всички случаи, максималната дневна доза не трябва да надвишава 7,5 mg.

Пациенти с чернодробни нарушения или хронична дихателна недостатъчност



Препоръчаната доза е половин таблетка (3,75 mg) дневно, тъй като елиминирането на зопиклон може да е намалено при пациенти с чернодробна дисфункция (вж. точка 5.2). В някои случаи, дозата може да се увеличи до една таблетка, в зависимост от ефективността и поносимостта на пациента.

Пациенти в старческа възраст

При пациенти над 65 години се препоръчва начална доза от половин таблетка (3,75 mg) дневно. Ако е необходимо, дозата може да се увеличи до една таблетка дневно, в зависимост от ефективността и поносимостта на пациента.

Педиатрична популация

Зопиклон не трябва да се използва при деца и юноши (под 18 години), тъй като безопасността и ефикасността му не са установени при тази група пациенти (вж. точка 4.3).

Начин на приложение

За перорално приложение. Лекарството винаги трябва да се приема преди лягане. Таблетката трябва да се поглъща, без да се смуче или дъвче.

Продължителност на лечението

Лечението трябва да е възможно най-кратко, вариращо от няколко дни до максимум 2-4 седмици, включително периода на постепенно намаляване на дозата (вж. точка 4.4):

- преходно безсъние (включително по време на пътуване) – 2-5 дни;
- краткосрочно безсъние – 2-3 седмици (включително след сериозен инцидент).

В определени случаи, може да е необходимо удължаване периода на лечение повече, отколкото е максимално допустимият период. При такива случаи, периодът на лечение не трябва да се удължава без преценка на състоянието на пациента, тъй като при продължително лечение се увеличава рискът от развиване на зависимост или злоупотреба (вж. точка 4.4).

Прекратяване на лечението

Преди да се започне лечението, на пациентите трябва да им бъде обяснено, че лечението е краткосрочно и как да прекратят лечението постепенно. Постепенното прекратяване на лечението намалява риска от повторната поява на безсъние (вж. точка 4.4). Пациентите трябва да бъдат предупредени за възможността от повторна поява на безсъние след прекратяване на лечението, с цел намаляване на безпокойството, което може да причини възможните симптоми, свързани с прекратяването на терапията.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1;
- Миастения гравис;
- Остра чернодробна недостатъчност;
- Синдром на сънна апнея;
- Дихателна недостатъчност;
- Деца и юноши под 18 години.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Поносимост

След употреба в продължение на няколко седмици, може да се наблюдава намаляване на ефикасността на сънотворния ефект на бензодиазепините и бензодиазепиновите производни. Въпреки това при зопиклон няма данни за значителни отклонения по време на лечение с продължителност до 4 седмици. Дозата не трябва да се увеличава.



Зависимост

Употребата на седативи/сънотворни, подобни на зопиклон (дори и в терапевтични дози), може да доведе до развитие на физическа и психична зависимост или злоупотреба с тези продукти. Рискът от зависимост или злоупотреба се повишава с увеличаване на дозата, продължителността на лечението и едновременната употреба с други психотропни агенти или алкохол.

Рискът от зависимост или злоупотреба е по-голям и при пациенти с анамнеза на злоупотреба с алкохол и/или наркотични вещества или пациенти с подчертани личностни нарушения. Това трябва да се вземе под внимание при решение за започване на лечение с хипнотични лекарства при такива пациенти. В случай на развитие на физическа зависимост, рязкото прекратяване на лечението ще бъде придружено от симптоми на отнемане, които може да включват: силно безпокойство, главоболие, мускулни болки, напрежение, объркване и раздразнение. При сериозни случаи могат да се проявят следните симптоми: деперсонализация, неосъзнатост, хиперакузис, изтръпване и мравучкане на крайниците, свръхчувствителност към светлина, шум и физически контакт, халюцинации или епилептични припадъци. Докладвани са случаи на злоупотреба.

Повторна поява на безсъние и безпокойство

Преходен синдром може да се появи при спиране на терапията, когато симптомите, довели до лечението със седатив/сънотворно се възвръщат в засилена форма. Това може да бъде придружено от други реакции, включващи промяна в настроението, тревога и безпокойство. Този синдром най-често възниква вследствие на рязкото прекратяване на продължително лечение или употребата на дози, превишаващи максималната препоръчителна доза. Затова трябва да се избягва рязкото прекратяване на лечението – вместо това, дозата трябва да се намалява постепенно и пациентът трябва да бъде съобразно информиран (вж. точка 4.2).

Суицидни мисли/Депресия

Някои епидемиологични проучвания са показали увеличен риск от поява на суицидни мисли и опити за самоубийство при пациенти с или без съществуваща депресия, които са били лекувани с бензодиазепини и други хипнотични агенти, включително зопиклон. Въпреки това все още не е установена причинно-следствена връзка.

Зопиклон не трябва да се употребява самостоятелно за лечение на депресия или безпокойство, свързано с депресията (може да възникнат случаи на самоубийство при такива пациенти).

Зопиклон трябва да се приема с повишено внимание от пациенти, изпитващи признаци на депресия. Поради вероятност от проява на склонност към самоубийство, на тези пациенти трябва да бъде отпускано възможно най-малкото количество от лекарството с цел предотвратяване на риска от приемане на свръхдоза.

По време на лечението със зопиклон може да се проявят признаци на вече съществуваща депресия. Тъй като безсънието може да бъде признак на депресия, състоянието на пациента трябва да бъде преоценено, ако то продължи за по-дълъг период от време.

Преди започване на лечението, трябва да се оцени всяка друга потенциална причина за безсънието.

Амнезия

Може да възникне антероградна амнезия, обикновено няколко часа след приема на таблетката, особено при прекъсване на съня, или когато се забави лягането след приема на таблетката. Затова лекарството трябва да се приема непосредствено преди лягане (вж. точка 4.2), за да има непрекъснат сън от 7-8 часа (вж. точка 4.8). Докладвани са случаи на автоматични действия под въздействието на амнезия.

Други психични и парадоксални реакции



При някои пациенти, бензодиазепините и бензодиазепин-подобните лекарства могат да причинят парадоксални реакции:

- засилване на безсънието, кошмари;
- безпокойство, тревожност, раздразнение, агресивност, изблици на гняв;
- заблуда, халюцинации, психотични симптоми, неадекватно поведение и други разстройства в поведението (вж. точка 4.8).

Тези симптоми е по-вероятно да възникнат при пациенти в старческа възраст. Ако се появят такива симптоми, лечението трябва да бъде прекратено.

Сомнамбулизъм и асоциирано с него поведение

При пациенти, приемали зопиклон, които не са били напълно будни, са докладвани действия като ходене на сън и други свързани с него прояви в поведението, като „шофиране на сън”, приготвяне на храна и хранене или осъществяване на телефонни обаждания, без спомен за тези събития. Употребата на зопиклон в дози, превишаващи максималната препоръчителна доза или в комбинация с алкохол и други депресанти на ЦНС, увеличават риска от проява на подобно поведение. Силно наложително е прекратяване на лечението със зопиклон при пациенти, които съобщават за подобно поведение (вж. точки 4.5 и 4.8).

Психомоторни нарушения

Подобно на останалите седативи/сънотворни лекарства, зопиклон има потискащ ефект върху ЦНС. Рискът от психомоторни нарушения, като нарушения в способността за шофиране, се увеличава, ако тези дейности се извършват в рамките на 12 часа след приема на лекарството, ако е приета по-висока от препоръчаната доза или зопиклон е приеман едновременно с други потискащи ЦНС медикаменти, алкохол или други лекарства, които могат да увеличат нивата на зопиклон в кръвта (вж. точка 4.5). Пациентите трябва да бъдат внимателни при извършване на дейности, които изискват повишено внимание или двигателна координация, като работа с машини или шофиране, след употребата на зопиклон и особено в рамките на 12 часа след приема.

Риск при едновременно приложение с опиоиди

Едновременната употреба на бензодиазепини и бензодиазепин-подобни лекарствени продукти, включително зопиклон, с опиоиди, може да доведе до седация, респираторна депресия, кома и смърт. Поради тази причина, едновременната употреба на тези лекарства трябва да се прилага единствено при пациенти, за които няма друга алтернатива за лечение.

Ако едновременната употреба на зопиклон и опиоиди е наложителна, трябва да се използва най-ниската ефективна доза и продължителността на лечение с двата лекарствени продукта трябва да е възможно най-кратка (вж. точка 4.2 за общи препоръки за дозиране). Пациентите трябва да бъдат редовно проследявани за признаци на респираторна депресия и седация и да бъдат уведомени да следят за появата на подобни симптоми (вж. точка 4.5).

Други предупреждения

Винаги, когато е възможно, причината за безсънието трябва да бъде предварително установена и възможните причини отстранени, преди да се назначи лечение с хипнотик.

Специфични групи пациенти

- Това лекарство трябва да се използва със силно повишено внимание от пациенти, които злоупотребяват с алкохол или наркотици;
- Препоръчва се по-ниска доза за пациенти с хронична дихателна недостатъчност, поради риск от респираторна депресия. Сънотворните средства могат да потиснат дишането, затова е необходимо особено внимание, когато зопиклон е предписан на пациенти с компрометирана дихателна функция (вж. точка 4.8);
- Бензодиазепините и бензодиазепин-подобните лекарства не се препоръчват при пациенти с тежка чернодробна недостатъчност, тъй като могат да причинят енцефалопатия (вж. точка 4.3);
- Препоръчва се по-ниска доза при пациенти с бъбречни нарушения (вж. точка 4.2);



- Пациенти над 65 години трябва да приемат по-ниска доза (вж. точка 4.2);
- Бензодиазепините и бензодиазепин-подобните лекарства не се препоръчват за първично лечение на психични заболявания.

Педиатрична популация

Зопиклон не трябва да се използва при деца и юноши (под 18 години), тъй като безопасността и ефикасността му при тази група пациенти не са установени.

Помощни вещества

Екодорм филмирани таблетки съдържат лактоза. Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към галактоза, *Lapp* лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция, не трябва да приемат това лекарство.

Екодорм съдържа натрий

Това лекарство съдържа по-малко от 1 mmol натрий (23 mg) на таблетка, т.е. практически не съдържа натрий.

Отнемане

Прекратяването на лечението със зопиклон е малко вероятно да бъде свързано с ефекти на отнемане при продължителност на лечението до 4 седмици. За пациентите може да е от полза постепенното намаляване на дозата, преди прекратяване на лечението (вж. точка 4.8).

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Не се препоръчва

Алкохол

Алкохолът може да засили седативния ефект на зопиклон, което може да продължи до следващата сутрин и да попречи на пациента да шофира или да работи с машини. Трябва да се избегне едновременната употреба с алкохолни напитки или лекарства, съдържащи етанол.

Трябва да се има предвид

Комбинация с депресанти на ЦНС

Може да възникне увеличаване на централния депресивен ефект при едновременно приложение с антипсихотични средства (невролептици), хипнотици, анксиолитици/успокоителни, антидепресанти, наркотични аналгетици, противоепилептични средства, анестетици и седативни антихистамини.

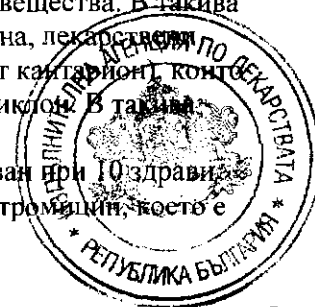
Едновременното приложение на бензодиазепин-подобни вещества с наркотични аналгетици може да засили тяхното еуфорично действие, което може да доведе до повишаване на психичната зависимост.

Употребата на зопиклон съвместно с клоzapин увеличава риска от шок с белодробен и/или сърдечен арест.

Инхибитори/индуктори на чернодробните ензими

Лекарствени продукти (като еритромицин, кларитромицин, хинупристин, далфопристин, итраконазол, кетоназол, ритонавир), които инхибират някои чернодробни ензими (особено цитохром P₄₅₀), могат да засилят действието на бензодиазепин-подобните вещества. В такива случаи може да се наложи дозата на зопиклон да се намали. От друга страна, лекарства (като карбамазепин, фенобарбитал, фенитоин, рифампицин, жълт кантарион), които индуцират чернодробните ензими, намаляват терапевтичния ефект на зопиклон. В такива случаи може да се наложи дозата на зопиклон да се увеличи.

Ефектът на еритромицин върху фармакокинетиката на зопиклон е изследван при 10 здрави доброволци. AUC на зопиклон се е увеличила с 80% при употребата с еритромицин, което е



показател, че еритромицин може да потиска метаболизма на лекарства, метаболизирани от СУРЗА4. Следователно, седативният ефект на зопиклон може да бъде засилен.

Опиоиди

Едновременната употреба на седативи като бензодиазепини или бензодиазепин-подобни лекарства (включително зопиклон) с опиоиди, увеличава риска от седация, респираторна депресия, кома и смърт, поради адитивния ефект на потискане на ЦНС. Дозата и продължителността на лечение при едновременно прилагане на двете групи вещества трябва да бъдат ограничени (вж. точка 4.4).

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Безопасността при употреба по време на бременност не е изследвана при хора и по тази причина не се препоръчва използването на зопиклон през бременността.

Проучвания при животни не са показали преки или косвени нежелани ефекти по отношение на репродуктивната токсичност.

Зопиклон преминава през плацентата.

Голям обем от данни от кохортни проучвания (при повече от 1000 бременности), не са показали наличие на малформации след употребата на бензодиазепини или бензодиазепин-подобни лекарствени продукти по време на първия триместър от бременността. Въпреки това, при някои контролирани проучвания е докладвана повишена честота на новородени с разцепване на устната или небцето, свързана с употребата на бензодиазепини по време на бременността. Описани са случаи на намалена подвижност на плода и отклонения в сърдечния ритъм след употребата на бензодиазепини или бензодиазепин-подобни лекарствени продукти по време на втори и/или трети триместър от бременността.

Приемът на бензодиазепини или бензодиазепин-подобни лекарствени продукти, включително зопиклон, по време на късната фаза на бременността или раждането, са показали странични ефекти при новородените, като хипотермия, хипотония, трудности при хранене (синдром на отпуснатото бебе) и респираторна депресия. Докладвани са също случаи на тежка респираторна депресия при новородените.

Също така, новородени, чиито майки са приемали периодично седативни/сънотворни средства по време на късната фаза от бременността, може да са развили психическа зависимост и да бъдат изложени на риск от развитие на симптоми на отнемане в постнаталния период. В такъв случай е необходимо подходящо наблюдение на новороденото през постнаталния период.

Кърмене

Известно е, че зопиклон се екскретира в майчиното мляко и затова майките трябва да избягват употребата му през периода на кърмене.

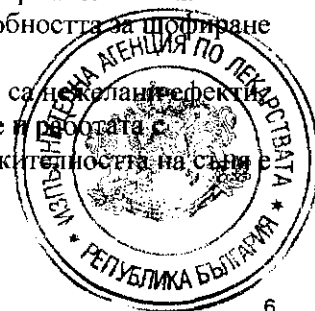
Жени в детеродна възраст

Ако продуктът е предписан на жена в детеродна възраст, тя трябва да бъде предупредена да се свърже със своя лекар с оглед спиране на продукта, ако възнамерява да забременее или подозира, че е бременна.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Зопиклон е седативно средство, причиняващо сънливост. Поради своите фармакологични свойства и ефекти върху ЦНС, зопиклон може да повлияе негативно способността за шофиране или работа с машини.

Седация, амнезия, нарушена концентрация и нарушена мускулна функция са нежеланите ефекти, които могат да повлияят неблагоприятно върху способността за шофиране и работата с машини. Рискът от нарушена бдителност е дори по-висок, когато продължителността на сън е



недостатъчна. Затова пациентите не трябва да шофират или работят с машини на следващия ден след приема на таблетката.

Рискът от психомоторни нарушения се увеличава, когато:

- лекарственият продукт е приет в последните 12 часа преди извършването на дейности, които налагат повишено внимание;
- приетата доза е по-висока от препоръчаната или
- зопиклон е употребен едновременно с други продукти, които потискат ЦНС, алкохол или други лекарства, които могат да увеличат нивата на зопиклон в кръвта.

Едновременният прием на алкохол може да засили седативното действие на зопиклон.

Пациентите трябва да бъдат внимателни при извършване на дейности, които изискват повишено внимание или двигателна координация, като работа с машини или шофиране след употребата на зопиклон и особено в рамките на 12 часа след приема.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Горчив или метален вкус в устата са най-често докладваните нежелани реакции.

Нежеланите реакции, по-долу са класифицирани съгласно MedDRA базата данни в системно-органен клас и следната конвенция за честота: 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 (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

Нарушения на имунната система

Много редки: анафилактични реакции и/или ангиоедем

Психични нарушения (вж. точка 4.4)

Нечести: кошмари, тревожност

Редки: състояние на объркване, нарушено либидо, раздразнителност, агресивност, халюцинации

С неизвестна честота: безпокойство, заблуда, гняв, състояние на депресия, психоза, неадекватно поведение (вероятно свързано с амнезия), сомнамбулизъм (вж. точка 4.4), зависимост (вж. точка 4.4), синдром на отнемане.

Нарушения на нервната система

Чести: дисгеузия (горчив вкус), сънливост (през деня)

Нечести: главоболие, замаяност

Редки: антероградна амнезия (може да възникне след прием на терапевтични дози). Рискът се увеличава при прием на високи дози. В някои случаи, могат да се наблюдават допълнителни поведенчески нарушения (вж. точка 4.4)

С неизвестна честота: атаксия, парестезия, нарушения във възприятията (напр. нарушения в паметта, говора, нарушено внимание).

Нарушения на очите

С неизвестна честота: двойно виждане

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения

Редки: диспнея (вж. точка 4.4)

С неизвестна честота: респираторна депресия (вж. точка 4.4)

Стомашно-чревни нарушения

Чести: горчив или метален вкус, сухота в устата

Нечести: гадене, повръщане

С неизвестна честота: диспепсия

Хепатобилиарни нарушения



Много редки: леко до умерено увеличаване на серумните трансминази и/или алкална фосфатаза

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

Редки: уртикария или кожен обрив, пруритус

Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан

С неизвестна честота: мускулна слабост

Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение

Нечести: умора

С неизвестна честота: замаяност, липса на координация

Нараняване, отравяне и процедурни усложнения

Редки: падане (предимно при възрастни пациенти)

Зависимост

Употребата (дори и в терапевтични дози) може да доведе до развитието на психическа зависимост: прекратяване на лечението може да доведе до отнемане или повторна поява на състоянието (вж. точка 4.4). Симптомите на отнемане варират и може да включват главоболие, мускулна болка, безпокойство, тремор, изпотяване, тревожност, объркване, раздразнение, сърцебиене, тахикардия, повторна поява на безсъние, кошмари, паник атаки, мускулни болки/крампи, стомашно-чревни смущения. При тежки случаи, може да възникнат следните симптоми: неосъзнатост, деперсонализация, хиперакузиз, изтръпване и мравучкане на крайниците, свръхчувствителност към светлина, шум и физически контакт, делириум, кошмари, халюцинации или припадъци. При много тежки случаи е възможно да настъпят припадъци. Може да възникне физическа зависимост. Докладвана е и злоупотреба.

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез Изпълнителна агенция по лекарствата, ул. „Дамян Груев” № 8, 1303 София, тел: +359 2 8903417, уебсайт: www.bda.bg

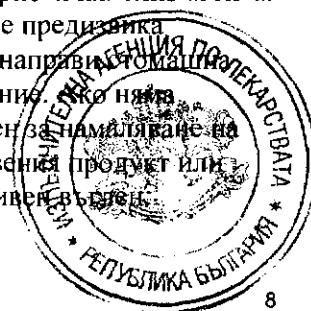
4.9 Предозиране

Симптоми

Обикновено предозирането се проявява чрез различни степени на потискане на ЦНС, вариращо от сънливост до кома. Предозирането не би трябвало да е животозастрашаващо, освен ако не се комбинира с лекарствени средства, потискащи ЦНС (включително алкохол). При леките случаи, симптомите включват сънливост, объркване и летаргия. При по-сериозните случаи, симптомите може да включват атаксия, хипотония, хипотензия, респираторна депресия и кома. Други рискови фактори, като наличието на съпътстващо заболяване и отслабено общо състояние на пациента, може да допринесе за обостряне на симптомите и много рядко може да доведе до фатален изход.

Лечение

За да се овладее предозирането, трябва да се има предвид, че може да са приети няколко агента. Лечението е симптоматично и поддържащо. След предозиране трябва да се предизвика повръщане (в рамките на един час), ако пациентът е в съзнание, или да се направи стомашна промивка с протекция на дихателните пътища, ако пациентът е в безсъзнание. Ако няма подобрене след изпразването на стомаха, трябва да се даде активен въглен за намаляване на абсорбцията. Ако възрастен пациент е приел повече от 150 mg от лекарствения продукт или дете – повече от 1,5 mg/kg, в рамките на един час може да се приложи активен въглен.



Специално внимание следва да се обърне на дихателните и сърдечносъдови функции в интензивно отделение.

Хемодиализата не е ефективна поради високата степен на проникване на зопиклон в организма. Специфичният антидот е флумазенил, в случай, че потискането на ЦНС е тежко. Той има кратък полуживот (около 1 час). Не трябва да се използва в случай на предозиране с няколко лекарствени продукта или като „диагностичен тест“.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Психолептици; сънотворни и седативни средства, бензодиазепин-подобни лекарства, АТС код: N05CF01

Механизъм на действие

Зопиклон е сънотворно средство от групата на циклопиролоновите съединения. Той действа бързо и поддържа съня без да намалява общия REM сън, като запазва дълбокия сън.

Пренебрежими остатъчни ефекти се наблюдават на следващата сутрин. Неговите фармакологични свойства включват хипнотично, седативно, анксиолитично, антиконвулсивно и отпускато мускулатурата действие. Макар да няма структурна връзка с бензодиазепините, зопиклон се свързва с висок афинитет и специфичност към GABA_A рецепторите. Въпреки това, зопиклон се свързва към място, различно от бензодиазепините и индуцира различни структурни промени в рецепторния комплекс, като по този начин модифицира действието на хлорния йонен канал.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

При перорално приложение, 7,5 mg зопиклон се абсорбира бързо, достигайки пикови плазмени нива след 1,5-2 часа, като те са приблизително 30 ng/ml и 60 ng/ml след приемане на съответно 3,75 mg и 7,5 mg. Абсорбцията не се повлиява от пол, храна или повторение на дозите.

Разпределение

Продуктът се разпределя бързо чрез съдовата система. Съществува линейна зависимост между плазмената концентрация и дозата в диапазона от 5 до 15 mg. Обемът на разпределение е 91,8 – 104,6 литра. Свързването с плазмените протеини е слабо (приблизително 45%) и не зависи от насищането. Съществува много нисък риск от лекарствени взаимодействия, в следствие от свързване на протеини и зопиклон. Времето на полуживот на зопиклон и неговия активен метаболит N-оксид варира между 3,5 и 6 часа.

Биотрансформация

При хората, зопиклон се метаболизира основно до два метаболита – N-оксид зопиклон (фармакологично активен при животни) и N-дезметил зопиклон (фармакологично неактивен при животни). Данни от *in-vitro* изследване показват, че основният изоензим, който участва в метаболизирането на зопиклон до двата метаболита, е цитохром P450 (CYP) 3A4, а CYP2C8 участва при формирането на N-дезметил зопиклон. Техният елиминационен полуживот (оценено на база данни от тестове на урина) е приблизително съответно 4,5 и 1,5 часа. Не е установено значимо акумулиране при повтарящи се дози (15 mg) за период от 14 дни. При животни не е наблюдавана индукция на ензими, дори при високи дози.

Елиминиране

Ниската стойност на бъбречния клирънс на непроменен зопиклон (средно 8,4 ml/min) в сравнение с плазмения клирънс (232 ml/min), показва, че зопиклон се елиминира основно



метаболично. Продуктът се елиминира чрез урината (приблизително 80%) в свободна форма (п-оксид и п-дезметил производни) и с фекалиите (приблизително 16%).

Специални групи пациенти

Различни проучвания при пациенти в старческа възраст не са показали натрупване на лекарството в плазмата при многократно дозиране, въпреки слабо намаления чернодробен метаболизъм и увеличения елиминационен полуживот приблизително до 7 часа. При бъбречна недостатъчност, не е установено натрупване на зопиклон или на някои от метаболитите му, след продължително приложение. Зопиклон преминава през диализни мембрани. При пациенти с цироза, плазмения клирънс на зопиклон намалява с намаляване на процеса на деметилиране : при тези пациенти, дозите трябва да бъдат променени.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Няма предклинични данни, които могат да бъдат от практическо значение за лекарите, като допълнение към вече включените в другите точки на кратката характеристика.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Ядро на таблетката

калциев хидрогенфосфат, безводен;
картофено нишесте;
магнезиев стеарат;
силициев диоксид;
натриев нишестен гликолат (тип А).

Филмиращо покритие на таблетката

опадрай бяло:

- хидроксипропилметилцелулоза (хипромелоза);
- титанов диоксид (E171);
- лактоза монохидрат;
- полиетилен гликол 3000 (макрогол);
- триацетин.

6.2 Несъвместимости

Неприложимо

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази от светлина и влага.

Да се съхранява при температура под 25°C.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Таблетките са опаковани в PVC/PVDC/Al блистери. 10 филмирани таблетки в блистер.
Опаковки от 10, 30 или 100 таблетки в картонена кутия.



Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

ЕКОФАРМ ГРУП АД
ул. Атанас Дуков №29, ет. 3,
1407 София, България
тел.: (02) 906 90 70
факс: (02) 906 90 71

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20100446

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

Дата на първо разрешаване: 09 юли 2010 г.
Дата на последно подновяване: 08 юли 2015 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

