

**КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА  
NEOSORBID® (ISOSORBIDE MONONITRATE 60MG) ТАБЛЕТКИ**

**1. ТЪРГОВСКО НАИМЕНОВАНИЕ НА ПРОДУКТА**

Неосорбид®

**2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ**

Isosorbide Mononitrate 60mg

**3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА**

Таблетки с удължено освобождаване.

**4. КЛИНИЧНИ ОСОБЕНОСТИ**

**4.1 Терапевтични показания**

Профилактично лечение на ангина пекторис.

**4.2 Дозировка и начин на приложение**

**Дозировка**

**Възрастни:**

Неосорбид® 60мг Ретард (една таблетка) веднъж дневно, приета сутрин. Дозата може да бъде увеличена до 120мг (две таблетки) дневно, и двете приети веднъж дневно сутринта. Дозата може да бъде титрирана, за да се минимизира възможността за поява на главоболие, като се започне с 30мг (половин таблетка) през първите 2-4 дни.

**Приложение:**

Таблетките Неосорбид® 60мг Ретард не трябва да се сдъвкват или разтрошават. Те трябва да се поглъщат цели с половин чаша вода.

**Деца**

Безопасността и ефективността на Неосорбид® 60мг Ретард при деца не са установени.

**Възрастни**

Не са открити доказателства за нуждата от рутинно коригиране на дозата при възрастни, но е възможно да се наложи специална грижа при тези предразположение към хипотензия или подчертана чернодробна или бъбречна недостатъчност.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВНООПАЗАВАНЕТО	
Препоръчителна цена	
Разрешение за употреба № 111250/24.07.05	
676/17.06.05	<i>Милев</i>



Сърцевината на таблетката е неразтворима в храносмилателните сокове, но се разпада на малки частици, когато цялото активно вещество е освободено. Понякога матриксът може да премине през гастро-интестиналния тракт, без да се разпадне и да бъде открит в изпражненията, като цялото активно вещество е било освободено.

#### **4.3 Противопоказания**

Свръхчувствителност към някоя от съставките. Конструктивна кардиомиопатия и перикардит, аортна стеноза, сърдечна тампонада, митрална стеноза и тежка анемия.

Силденафилът потенциира хипотензивния ефект на нитратите, затова съвместното му назначение с нитрати или съединения, доставящи азотен окис, е противопоказано.

Тежката мозъчно-съдова недостатъчност или хипотензия са относително противопоказани при употреба на Неосорбид® 60мг Ретард.

#### **4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба**

Неосорбид® 60мг Ретард не е показан за облекчение на остри ангинозни атаки; в случай на остра атака трябва да се използват таблетки глицерил-тринитрат сублингвално или букално.

#### **4.5 Лекарствени и други взаимодействия**

Хипотензивният ефект на нитратите се потенциира от едновременното приемане на силденафил.

#### **4.6 Бременност и кърмене**

Безопасността и ефективността на Неосорбид® 60мг Ретард по време на бременност и кърмене не са установени.

#### **4.7 Ефекти върху способността за шофиране и управление на машини**

Не са известни.

#### **4.8 Нежелани лекарствени реакции**

Повечето нежелани лекарствени реакции са фармакодинамично медиранни и дозозависими. В началото на лечението може да се появи главоболие, което обикновено изчезва след 1-2 седмици. Дозата може да се титрира, за да се минимизира възможността за поява на главоболие, като лечението се започне с 30мг. Понякога се докладва за хипотензия, придружена от виене на свят и гадене. Тези симптоми обикновено изчезват при продължително лечение. Рядко е било докладвано за обрив и сърбеж. В много редки случаи – за миалгия.



## 4.9 Предозиране

### Симптоми

Пулсиращо главоболие. По-сериозни симптоми са възбуда, червенина, студена пот, гадене, повръщане, световъртеж, припадък, тахикардия и падане на кръвното налягане.

### Справяне с предозирането

Предизвикване на повръщане, приемане на активен въглен. В случай на ясно изразена хипотензия пациентът трябва първо да бъде поставен да легне по гръб с вдигнати крака. Ако е необходимо, трябва да се приложат течности интравенозно.

## 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

### 5.1 Фармакодинамични свойства

Принципното фармакологично действие на Isosorbide Mononitrate, който е активен метаболит на Isosorbide Dinitrate, е отпускането на съдовата гладка мускулатура, осъществяваща вазодилатация на артериите и вените, като ефектът върху последните преобладава. Ефектът от лечението зависи от дозата. Ниските плазмени концентрации водят до венозна дилатация, в резултат на която се получава периферен приток на кръв, намалена венозна компенсация и намаление на диастоличното налягане в левокамерния край (преднатоварване). Високите плазмени концентрации също разширяват артериите, намалявайки системното съдово съпротивление и артериалното налягане, което води до намаляване на сърдечното следнатоварване. Isosorbide Mononitrate може също да има директен разширяващ ефект върху коронарните артерии. Чрез намаляване на крайното диастолично налягане и обем препаратът намалява и вътрестенното налягане, като по този начин води до подобряване на субендокардиалния кръвен поток.

Затова окончателният ефект, когато се предписва Isosorbide Mononitrate, е намалено работно натоварване на сърцето и подобрен баланс между количеството доставян и необходим кислород в миокарда.

### 5.2 Фармакокинетични свойства

Isosorbide Mononitrate се абсорбира напълно и не подлежи на ефекта на първо преминаване в черния дроб. Това намалява вътре- и междуиндивидуалните вариации в плазмените нива и води до предвидими и възпроизводими клинични ефекти.

Елиминационният полуживот е около 5 часа. Свързването с плазмените протеини е по-малко от 5%. Обемът на разпределение е около 0.6 л/кг и тоталният клирънс е около 115мл/минута. Елиминацията е главно чрез денитрация и свързване в черния дроб. Метаболитите се екскретират главно



през бъбреците. Само около 2% от приетата доза се екскретира непроменена през бъбреците.

Нарушената чернодробна или бъбречна функция нямат съществено влияние върху фармакокинетичните свойства.

Неосорбид® 60мг Ретард е лекарство с удължено освобождаване. Активното вещество се освобождава независимо от рН, в рамките на период от 10 часа. В сравнение с обикновените таблетки фазата на абсорбция е удължена и ефектът е по-продължителен.

Степента на бионаличност на Неосорбид® 60мг Ретард е около 90% в сравнение с таблетките с незабавно освобождаване. Абсорбцията не се засяга значително от приема на храна и не се наблюдава натрупване в стабилно състояние. Неосорбид® 60мг Ретард показва дозо-пропорционален кинетичен профил до 120мг. След повторно перорално приложение с 60мг веднъж дневно максимална плазмена концентрация (около 3000nmol/l) се достига след около 4 часа. След това плазмената концентрация постепенно пада до под 500nmol/l в края на дозовия интервал (24 часа след приемане на дозата). Таблетките са делими.

В изследвания с плацебо Неосорбид® 60мг Ретард, приет веднъж дневно, ефективно контролира ангина пекторис както по отношение на упражнителните способности и симптоми, така и на намаляването признаците на миокардната исхемия. Продължителността на ефекта е поне 12 часа, като в този момент плазмената концентрация е на същото ниво, както 1 час след приемане на дозата (около 1300nmol/l).

Неосорбид® 60мг Ретард е ефективен и като монотерапия, и в комбинация с хронично блокираща терапия.

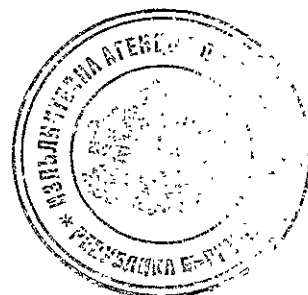
Клиничните ефекти на нитратите могат да отслабнат по време на повторно назначение поради високите и/или равни плазмени нива. Това може да бъде избегнато посредством допускане на ниски плазмени нива за определен период от дозовия интервал. Неосорбид® 60мг Ретард, когато се назначава веднъж дневно сутрин, има високи нива на плазмения профил през деня и ниски нива през нощта. Към Неосорбид® 60мг Ретард, приет веднъж дневно в доза 60 или 120мг, не се развива толерантност по отношение на антиангиналният ефект. Феноменът на повторното свързване между дозите, наблюдаван при терапия с нитратни пластири, не се наблюдава при тази с Неосорбид® 60мг Ретард.

### **5.3 Предклинични данни за безопасност**

Достъпните данни показват, че Isosorbide Mononitrate притежава очакваните фармакодинамични свойства на органичен нитратов естер, притежава прости фармакокинетични свойства и няма токсични, мутагенни или онкогенни ефекти.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ОСОБЕНОСТИ**

### **6.1 Списък на помощните вещества**



Алуминиев силикат, специален парафин, хидроксипропилцелулоза ЛФ, магнезиев стеарат, колоидален безводен силициев двуокис, хипромелоза бсрс, макрогол 6000, титаниев диоксид E171 и жълт железен диоксид E172.

## **6.2 Несъвместимости**

Не са приложими за продукти с удължено освобождаване.

## **6.3 Срок на годност**

3 години.

## **6.4 Специални условия на съхранение**

Да се съхранява под 30°C.

## **6.5 Вид и съдържание на опаковката**

PVC/алуминиеви блистери

30 таблетки Неосорбид® 60мг Ретард (в блистери по 10 таблетки)

100 таблетки Неосорбид® 60мг Ретард (в блистери по 10 таблетки)

## **6.6 Инструкции при употреба**

Таблетките не трябва да се смачкват или сдъвкват. Да се приемат с половин чаша вода.

## **7. Производител**

Edmond Pharma S.r.l.  
Via G.B. Grassi 15  
20157 Milano  
Italy

## **8. Притежател на разрешението за употреба**

Нео Балканика ООД  
Ул. "Земляне" 35  
София, България

## **9. Регистрационен номер**

## **10. Дата на първото/подновеното разрешение за употреба**

## **11. Дата на (частично) ревизиране на текста**

Юли 2004г.

