

Legalon® 140 **Легалон 140**

МИНИСТЕРСТВО НА СЪРАЗПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-7198/01.08.07	
N=7/21.04.03	<i>Ришанов</i>

1. Име на лекарственото средство

Legalon® 140

2. Качествен и количествен състав

1 капсула съдържа:

173,0 - 186.7 mg Cardui mariae fructus extractum siccum (36-44:1), съответстващи на 140 mg silymarin (пресметнат като silibinin)

Екстракт етилацетат > 96.7%

3. Лекарствена форма

Капсули

Кафяви твърди желатинови капсули, съдържащи жълт прах.

4. Клинични данни

4.1. Терапевтични показания

Симптоматично лечение на хронични токсични чернодробни увреждания; за поддържащо лечение при пациенти с хронични възпалителни заболявания на черния дроб или чернодробна цироза.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Ако не е предписано друго при започване на лечението и при тежки случаи трябва да се взема 1 капсула 3 пъти дневно, а като поддържаща доза е достатъчно да се приема 1 капсула 2 пъти дневно.

Капсулите трябва да се гълтат цели с достатъчно количество течност.

4.3. Противопоказания

При свръхчувствителност към някоя от съставките на продукта. За приложението при деца няма достатъчно клинични данни. Поради това Legalon® 140 не трябва да се прилага при деца под 12 години!

4.4. Специални предупреждения за употреба

Лечението с този продукт не служи като заместител на въздържанието в случай на чернодробно увреждане (напр. от алкохол).

Това лекарство не е подходящо за лечение на остри отравяния.

4.5. Лекарствени взаимодействия

Не са известни

4.6. Бременност и кърмене

Изследванията върху животни не показват директни или индиректни вредни въздействия съответно върху бременността, ембрионалното/феталното развитие, раждането и постнаталното развитие.

Няма данни по отношение на употребата на Legalon® по време на бременност и кърмене. Затова трябва да се предписва с внимание на бременни и кърмачки.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са известни

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Рядко се наблюдава леко слабително действие и болки в епигастриума. Възможни са прояви на свръхчувствителност.

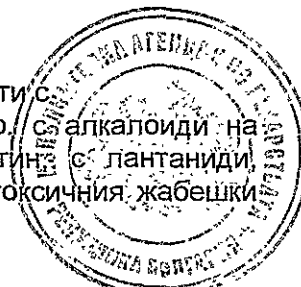
4.9. Предозиране

Белези и симптоми на отравяне досега не са наблюдавани. Няма специфичен антидот. Препоръчват се симптоматични мерки.

5. Фармакологични свойства

5.1. Фармакодинамични свойства

Антитоксичното действие на силимарина е демонстрирано при опити с животни при многобройни модели на чернодробно увреждане, напр. с алкалоиди на зелената мухоморка (Amanita bulbosa) - фалоидин и аманитин, с лантаниди, въглероден тетрахлорид, галактозамин, тиацетамин и хепатотоксичния жабешки вирус FV3.



Терапевтичното действие на силимарина може да се обясни с факта, че има няколко места или механизми на действие:

Поради силната си свързваща сила, силимаринът притежава антипероксидантна активност. Патофизиологичният процес на пероксидация на липидите, който е причина за разкъсване на клетъчните мембрани, се прекъсва или предотвратява. Нещо повече - в чернодробните клетки, които са били вече увредени, силимаринът стимулира синтеза на протеин и нормализира фосфолипидния метаболизъм. Цялостният резултат е, че клетъчните мембрани се стабилизират и загубата на разтворените в клетката съставки (напр. трансаминазите) от чернодробните клетки се ограничава или предотвратява.

Силимаринът ограничава достъпа до клетките на някои хепатотоксични субстанции (токсичните вещества на отровните гъби).

Увеличаването на протеиновата синтеза от силимарина се дължи на стимулиране на активността на РНК-полимераза I, ензим, който се намира в ядрото. Това води до повишено образуване на рибозомна РНК и поради това се синтезират в по-голямо количество структурни и функционални протеини. Резултатът е нарастване на възстановителната способност и регенеративните сили на черния дроб.

5.2. Фармакокинетични свойства

Главната съставка на силимарина е силибинин. Клиничните изследвания показват, че след абсорбцията му в храносмилателния тракт, той се екскретира главно чрез жлъчката (>80% от абсорбираното количество).

Като метаболити в жлъчката са били открити глюкоронириди и сулфати. Предполага се, че силибининът се реабсорбира след деконюгация и попада в ентерохепаталния кръг, както е било демонстрирано при експериментални животни. Както би могло да се очаква от преобладаващото елиминиране чрез жлъчката (място на действие - черния дроб), кръвните нива са ниски и излъчването чрез бъбреците е слабо. Времето на полуабсорбция е 2.2 часа, а на полueleминиране - 6.3 часа.

Когато Легалон се дава в терапевтични дози (140 mg силимарин 3 пъти дневно), нивата на силибинин, открити в човешката жлъчка след многократен прием са същите, каквито са и след еднократна доза. Тези резултати показват, че силибининът не се натрупва в организма.

След повторно прилагане на силимарин в дози 140 mg 3 пъти дневно, елиминирането чрез жлъчката достига постоянна стойност.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Силимаринът се характеризира с изключително ниската си токсичност и поради това е безопасно да се прилага в терапевтични дози дълго време.

Остра токсичност

Даван в еднократни дози перорално на плъхове и мишки, силимаринът се е оказал практически нетоксичен и LD₅₀ може да бъде определена на > 2000mg/kg.

Хронична токсичност

При дълговременни опити, продължили до 12 месеца, на плъхове и кучета е даван силимарин перорално в максимални дози съответно 2500 и 1200 mg/kg. Нито лабораторните резултати, нито аутопсионните находки са показали каквито и да било доказателства за токсично действие.

Репродуктивна токсичност

Изследвания върху плодовитостта при плъхове и зайци, а също и изследвания на предродовата, родовата и следродовата токсичност не са показали никакви нежелани ефекти в нито един от етапите на възпроизводството (максимална използвана доза - 2500 mg/kg). По-специално силимаринът не е показал данни за какъвто и да било тератогенен потенциал.

Мутагенност

Изследвания in vitro и in vivo със силимарин са дали отрицателен резултат.

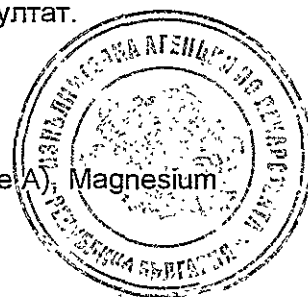
Канцерогенност

Още не са проведени съответни изследвания in vivo при гризачи.

6. Фармацевтични данни

6.1. Помощни вещества

Povidone K 29-32, Mannitol, Polisorbate 80, Sodium starch glycollate (Type A), Magnesium stearate.



Hard-gelatin two-pieces capsule: Gelatin, Iron oxide, red E 172, Titanium dioxide E 171, Sodium laurilsulfate, Iron oxide, black E 172

6.2. Несъвместимости

Не са известни

6.3. Срок на годност

5 години

6.4. Специални изисквания за съхранение

Няма

6.5. Вид и съдържание на опаковката

Алуминиеви/PVC блистери, опаковани в картонена кутийка.

Оригинални опаковки, съдържащи 20, 60 и 100 капсули.

Клинични опаковки, съдържащи 2000 капсули.

7. Име и адрес на производителя

Madaus AG

51101 Cologne

Germany

8. Номер на разрешението за продажба

980 005 6

9. Дата на първа регистрация

23.02.1998

10. Последна редакция на информацията

Юни 2000

