

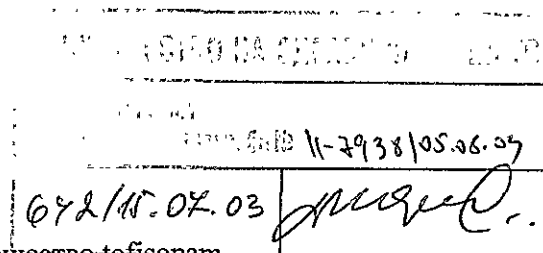
КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ТЪРГОВСКО НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Grandaxin® tablets
Грандаксин таблетки

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 50 mg от лекарственото вещество tofisopam.



3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки за перорална употреба.

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

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

- психични (невротични) и соматични разстройства, характеризиращи се с тревожност, вегетативни нарушения, липса на мотивация и/или енергия, апатия, уморяемост, потиснато настроение
- симптоматично лечение на псевдоангина
- при алкохолна абстиненция: намалява се вегетативната симптоматика и възбудата при пре-делир и делир.

Тези таблетки могат да бъдат давани когато приложението на лекарства с миорелаксиращ ефект е противопоказано, както е 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 използва спорадично, дозата може да бъде 1-2 таблетки.

Лечението се започва с подходящата доза, като обикновено не се налага постепенно увеличаване на дозата, тъй като лекарството се понася добре, а също така не се очаква потискане на бодрото състояние при лечение с Grandaxin таблетки.



4.3 Противопоказания

- известна свръхчувствителност към лекарственото и/или към някое от помощните вещества, или към друг бензодиазепин
- декомпенсиран респираторен дистрес, дихателна недостатъчност
- анамнеза за пароксизмална нощна апнея
- анамнеза за кома

Лекарственият продукт не се препоръчва по време на първия триместър на бременността и при кърмене (виж т. 4.6).

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

- лечението на пациенти с компенсирани респираторен дистрес или на такива с анамнеза за остра дихателна недостатъчност трябва да става с повишено внимание
- лечение на пациенти в напреднала възраст, такива със забавено умствено развитие 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
- комбинираната на вещества, потискащи 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).
- използването на Grandaxin таблетки 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 с лекарството трябва да става с повишено внимание.
- при пациенти с органично мозъчно заболяване (напр. атеросклероза) лечението трябва да става с повишено внимание.
- лечението с това лекарство може да причини епилептични припадъци при пациенти с епилепсия
- не се препоръчва лечението на пациенти със тяснооъгълна глаукома
- всяка таблетка Grandaxin съдържа 92 mg лактоза. Това трябва да се има предвид при предписване на пациенти с лактозна непоносимост.

Пациентите трябва да бъдат предупреждени да не употребяват алкохол по време на лечението с Grandaxin.

4.5 Взаимодействие с други лекарства и други видове взаимодействия

- комбинацията на вещества, потискащи ЦНС (напр. аналгетици, общи анестетици, антидепресанти, антихистамини, успокоителни и сънотворни, антипсихотици) с Grandaxin може да доведе до усилване на ефектите на всяко от лекарствата (напр. седативния ефект, ефекта на потискане на дихателната функция)



- индукторите на чернодробните ензими (алкохол, никотин, барбитурати, антиепилептици) могат да ускорят метаболизма на tofisopam, което може да доведе до намаляване на плазмената му концентрация и съответно на терапевтичния му ефект
- някои антимиотици (*ketoconazole*, *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 клинично значение 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 лактация

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 не се препоръчва.

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 условия на повишен риск от инциденти поне в началото на лечението. По-късно степента и продължителността на това ограничение може да бъде разглеждано индивидуално.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Те обикновено са леки и преходни и най-често се появяват при приложение на високи дози.

Гастро-интестинални: загуба на апетит, запек, газове, гадене и сухота в устата. В редки случаи може да се наблюдава холестатичен иктер.

ЦНС: главоболие, чувство за напрежение, безсъние, раздразнителност, възбуда. В редки случаи обърканост, конвулсии при пациенти с епилепсия.

Кожни: екзантем, скарлатиформен екзантем, сърбеж



Мускуло-скелетни: напрежение в мускулите, миалгия
Дихателна система: потискане на дишането

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: не се препоръчва провокирано повръщане при явни признаци на потискане на ЦНС. Може да се направи стомашна промивка. Даването на активен въглен потиска резорбцията на лекарството. Flumazenil (Anexate) 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 Фармакодинамика

INN: tofisopam
ATC: 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 бензодиазепини по химична структура и фармакологични и клинични свойства. Той е ефективен при лечението на тревожни състояния, съпроводени от вегетативна симптоматика, уморяемост и апатия. Tofisopam не показва обичайния седативен ефект на класическите бензодиазепини и няма миорелаксиращ и антиконвулсивен ефект. Той не потиска психомоторната активност, напротив той притежава лек стимулиращ ефект. Токсичността на лекарството е много ниска, а нежеланите реакции са съвсем леки. Дори при дълготрайно приложение, не е наблюдавано развитие на физическа и психическа зависимост.



5.2 Фармакокинетика

Tofisopam се резорбира бързо в стомашно-чревния тракт, а максимално плазмено ниво се достига 1-1.5 часа след приложението. Свързването с плазмените протеини е 50%. След резорбцията той подлежи на интензивен "first-pass" метаболизъм в черния дроб чрез основно деметилиране. Приблизително 60% от приложената доза се екскретира с урината, а 40% - с фецеса като метаболити. Времето на полу-живот 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 фертилитета, нито е наблюдаван мутагенен или карциногенен ефект.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Помощни вещества

Освен лекарственото вещество, всяка таблетка съдържа като помощни вещества lactose monohydrate Ph. Eur., potato starch Ph. Eur., cellulose microcrystalline Ph. Eur., gelatin Ph. Eur., talc Ph. Eur., stearic acid BP, magnesium stearate Ph. Eur.

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 Вид и състав на опаковката

Бутилка от тъмно стъкло с пластмасова капачка, или блистер от PVC/PVdC фолио поставена в картонена кутия, заедно с листовката за пациента. Брой таблетки в една опаковка: 20.



6.6 Указания за употреба и приложение

Виж точка 4.2

7. ПРОИЗВОДИТЕЛ

EGIS PHARMACEUTICALS LTD.
1106 BUDAPEST, Kereszturi ut 30-38.
HUNGARY
Phone: (36-1) 265 5555
Fax: (36-1) 265 5529

8. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РЕГИСТРАЦИЯТА

EGIS PHARMACEUTICALS LTD.
1106 BUDAPEST, Kereszturi ut 30-38.
HUNGARY
Phone: (36-1) 265 5555
Fax: (36-1) 265 5529

9. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР

980 0215 / 30.07.1998
П-1141 / 30.07.1998

10. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА

11. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА

Януари, 2003 год.

