

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

HISMANAL™

Хисманал

Описание

Хисманал е хистамин H_1 -антагонист за орално приложение.

Хисманал се произвежда под формата на бели таблетки с разделителна черта и под формата на бяла суспензия.

Всяка таблетка съдържа 10 mg astemizole.

Неактивните съставки на таблетката са: lactose 58.34 mg, maize starch 27.50 mg, microcrystalline cellulose 18 mg, pregelatinized potato starch 3.60 mg, polyvidone 1.20 mg, magnesium stearate 600 μ g, colloidal anhydrous silica 400 μ g and sodium lauril sulphate 360 μ g (formulation F8).

Суспензията съдържа 1 mg astemizole ml.

Неактивните съставки на суспензията 1 mg/ml са: alcohol 50 mg, propylene glycol 50 mg, microcrystalline cellulose and sodium carmellose 12 mg, disodium hydrogen phosphate anhydrous 4.75 mg, polysorbate 20,2mg, raspberry flavour 723.80 μ g, sodium saccharin 500 μ g, sodium dihydrogen phosphate monohydrate 115 μ g, sodium hydroxide 80 μ g, red currant flavour 73.36 μ g, purified water q. s. ad 1 ml.

Свойства**Фармакодинамика**

Хисманал е мощен хистамин H_1 -антагонист с продължителен ефект, лишен от централно, седативно и антихолинергично действие. Поради удълженото му действие еднократен дневен прием е достатъчен за потискане на симптомите на алергични реакции в продължение на 24 часа.

Фармакокинетика

Фармакокинетичните изследвания при хора показват, че астемизол се резорбира бързо, пикови плазмени концентрации се достигат в рамките на 1-2 часа.

Медикаментът се метаболизира почти напълно при първия пасаж през черния дроб и претърпява значително разпределение в тъканите. При равновесно ("стеиди-стейт") състояние средната пикова плазмена концентрация на астемизол плюс метаболита му дезметиластемизол (счита се, че заедно представляват фармакологично активната фракция в плазмата) е 3-5 нг/мл. Периодът на полуелиминиране е 1-2 дни за астемизол и 9-13 дни за дезметиластемизол. Астемизол се екскретира във вид на метаболити главно чрез жлъчния сок.

Изследванията върху свързването с рецепторите сочат, че астемизол, при фармакологични дози, осигурява пълно насищане на периферните H_1 -рецептори, но не достига H_1 -рецепторите в мозъка, тъй като лекарството не преминава кръвно-мозъчната бариера.

Показания

Хисманал се предписва за лечение на постоянни и сезонни алергични ринити, алергични конюнктивити, хронични уртикарии и други алергични състояния.

Противопоказания

Изявена свръхчувствителност към астемизол или някоя от неактивните съставки.

Тъй като Хисманал се метаболизира почти напълно в черния дроб, употребата му от пациенти със сериозно увредена чернодробна функция е противопоказана.

Едновременен прием с някое от следните средства:

- орална или парентерална форма на азолови противогъбични средства;
- макролидни антибиотици освен азитромицин;
- селективни серотонинови инхибитори на обратния захват (SSRIs);
- HIV-протеазни инхибитори;
- мибефрадил;
- хинин в терапевтични дози.

(виж "Взаимодействия")

Предупреждения и предпазни мерки

Препоръчаната дневна доза (една таблетка или препоръчаната доза за деца) не трябва да се превишава.

При пациенти със състояния, водещи до удължен QT- сегмент, е възможно удължаването на QT- сегмента и/или появата на вентрикулна аритмия при употреба на астемизол. Поради това е препоръчително да се избягва употребата му от пациенти с вроден QT- синдром, пациенти приемащи медикаменти, за които се съобщава, че удължават QT- интервала (включително антиаритмични средства, терфенадин и еритромицин) и пациенти с некоригирана хипокалемия.

Взаимодействия

Хисманал не потенцира действието на алкохола или други ЦНС депресанти.

Главният метаболитен път на астемизол е чрез CYP3A4. Едновременната употреба на лекарства, които значително инхибират тези ензими, може да доведе до повишени плазмени концентрации на астемизол, което би могло да повиши риска от удължаване на QT-сегмента. Поради това употребата на такива препарати е противопоказана. Включват се следните примери:

- орална или парентерална форма на азолови противогъбични средства;
- макролидни антибиотици освен азитромицин, който при *in vivo* изследване е показал незначително влияние върху бионаличността на астемизол;
- серотонинови инхибитори на обратния захват, като нефазодон;
- HIV-протеазни инхибитори, като ритонавир и индинавир - *in vitro* изследванията показват, че саквинавир е само слаб инхибитор;

- мибефрадил;

Установено е също така взаимодействие с хинин в терапевтични дози.

Употреба по време на бременност и през периода на лактация

Астемизол не влияе на фертилитета и не е тератогенен при животните. При много високи дози (40 мг/кг) се наблюдава ембриотоксичност при плъхове, но не при зайци. В обширно изследване при хора, Хисманал не е показал увеличаване на феталните аномалии. Все пак Хисманал следва да се използва при бременни жени само, когато очакваните предимства оправдават възможния риск за плода.

При кърмещи кучета астемизол и неговите метаболити се екскретират в майчиното мляко. Концентрациите в млякото са много ниски. Ако е необходима употребата на Хисманал по време на кърмене, трябва да се преценят ползите срещу потенциалния риск.

Действие върху шофьорските способности и работата с машини

В препоръчаните дози Хисманал не оказва влияние върху дейностите, изискващи умствена будност.

Дозировка и приложение

Възрастни и деца над 12 години:

1 таблетка веднъж дневно;

деца от 6 до 12 години:

5 мг веднъж дневно, т.е. 1/2 таблетка или 5 мл суспензия 1 мг/мл;

деца под 6 години:

2 мг на 10 кг/ден.

Препоръчаната дневна доза (една таблетка или препоръчаната доза за деца) не трябва да се превишава.

Хисманал таблетки не са подходящи за деца под 6-годишна възраст.

Нежелани реакции

Хисманал е лишен от нежелани седативни и антихолинергични ефекти.

Възможно е да настъпи увеличаване на теллото при продължително лечение.

Редки спонтанни съобщения, събрани в пост-маркетингови изследвания, обхващат реакции на свръхчувствителност, като ангиоедема, бронхоспазъм, фотофобия, сърбеж, обрив, анафилактични реакции. Наблюдавани са единични случаи с конвулсии, доброкачествени парестезии, миалгия/артралгия, едема, емоционални смущения, безсъние, кошмари, увеличаване на трансаминазите и хепатит.

В повечето случаи, причинната връзка с употребата на Хисманал е неизяснена.

Предозиране

Симптоми

Въпреки че са описани случаи на предозирание без тежки последици, при пациенти, превишаващи препоръчаните дози астемизол, са наблюдавани редки случаи на сериозни нежелани сърдечносъдови явления с опасност за живота, включващи удължаване на QT- сегмента, torsades de pointes (рядък вид аритмия) и други вентрикулни аритмии. Независимо от това, че повечето подобни явления са възникнали след значително предозирание с астемизол, съществуват съобщения за много редки случаи на torsades de pointes (аритмии) при дози от 20-30 мг дневно (дву- или трикратно превишаване на препоръчаната дневна доза).

В някои случаи тежките аритмии са били предшествани от или свързани с един или повече синкопни пристъпи. Поради това при появата на синкоп у пациенти, приемащи астемизол, следва лечението да бъде незабавно прекратено и да бъдат извършени съответните клинични изследвания, включително електрокардиография.

Лечение

Следва да бъдат предприети поддържащи мерки, включващи промивка на стомаха и предизвикване на повръщане, последвани от прилагане на активен въглен. При такива пациенти електрокардиографските показатели трябва внимателно да се следят. Ако QT- сегментът е удължен, мониторирането следва да продължи до нормализирането му. Може да се наложи прилагането на подходящо антиаритмично лечение, но трябва да се избягва лечение с антиаритмични средства, за които се знае, че удължават QT- сегмента. Изследванията при пациенти с бъбречна недостатъчност показват, че хемодиализата не повишава клирънса на лекарството.

Лекарствени форми и опаковки

Хисманал таблетки 10 мг се предлагат в опаковки по 10, и 30 таблетки
Хисманал суспензия 1 мг/мл се предлага във флакони от 100 мл с пипета от 5 мл, градуирана на кг телесно тегло.

Съхранение

При температура от 15 до 30°C.

Да се държи на недостъпно за деца място.

Срок на годност

5 години

Наименование и адрес на производителя

Janssen Pharmaceutica NV

Turnhoutseweg 30

B-2340 Beerse, Belgium

Дата, на която листовката е редактирана за последен път
18-и ноември 1997 г.