

SOUHRN ÚDAJŮ O PŘÍPRAVKU

1. Název přípravku

LUSOPRESS

tablety

2. Kvalitativní i kvantitativní složení

Nitrendipinum 20 mg v jedné tabletě.

Úplný seznam pomocných látek viz bod 6.1.

3. Léková forma

Tablety.

Popis přípravku: světle žluté, bikonvexní tablety s půlicí rýhou na jedné straně.

4. Klinické údaje

4.1. Terapeutické indikace

Nitrendipin je blokátor kalciového kanálu druhé generace, užívaný k léčbě esenciální arteriální hypertenze v monoterapii nebo v kombinaci s jinými antihypertenzivy. Přípravek lze kombinovat s thiazidovými diuretiky, beta blokátory nebo ACE inhibitory. Účinek nitrendipinu je dlouhodobý, lze jej užívat 1krát denně. Přípravek je určen pro dospělé a mladistvé od 16 let.

4.2. Dávkování a způsob podání

Dávkování je individuální, závislé na stupni hypertenze. Obvyklá dávka pro dospělé je 1krát denně 1 tableta (ráno) nebo 2krát denně 1/2 tablety (ráno a večer). Celková denní dávka je 20 mg nitrendipinu. Celkovou dávku lze zvýšit na 40 mg nitrendipinu rozděleně ve dvou jednotlivých dávkách (ráno a večer). V případě jaterního poškození dochází ke zpomalené metabolizaci léku, proto je třeba zahájit léčbu dávkou 5 mg denně (ráno) a rovněž snížit celkovou denní dávku. U dialyzovaných nemocných nebo pacientů s poruchou renální činnosti není úprava dávkování potřebná. Tablety se užívají nerozkousané s trochou tekutiny po jídle. Tablety se vyjímají z obalu těsně před užitím.

4.3. Kontraindikace

Lusopress nelze užívat při přecitlivělosti na složky přípravku, během těhotenství a v období kojení.

4.4. Zvláštní upozornění a zvláštní opatření pro použití

U nemocných s poškozením jater dochází k prodloužení plazmatického poločasu nitrendipinu a lék je třeba aplikovat se zvýšenou opatrností. Tito nemocní by měli užívat 5-10 mg nitrendipinu denně. Opatrnosti je rovněž zapotřebí u nemocných s glaukomem. Během léčby přípravkem Lusopress může dojít k vzestupu alkalických fosfatáz. Je proto doporučována pravidelná kontrola jaterních enzymů, v případě potřeby i přerušování léčby.

4.5. Interakce s jinými léčivými přípravky a jiné formy interakce

Nitrendipin je obvykle dobře tolerován i v kombinaci s dalšími antihypertenzivy. Může však dojít k výraznějšímu poklesu krevního tlaku, zejména v kombinaci s beta blokátory. Častější kontroly krevního tlaku jsou proto žádoucí. Cimetidin může zvyšovat účinek nitrendipinu. Nitrendipin může zvyšovat účinek digoxinu, dochází k vzestupu plazmatických hladin digoxinu a je třeba kontrolovat projevy digitalisové toxicity.

4.6. Těhotenství a kojení

Ve studiích reprodukční toxicity nebyl prokázán negativní vliv na průběh těhotenství, plod nebo novorozence. Nitrendipin nevykazuje známky mutagenity. Vzhledem k nedostatku klinických zkušeností však nelze užívání v období těhotenství a během kojení doporučit.

4.7. Účinky na schopnost řídit a obsluhovat stroje

V závislosti na individuální reakci se může, zejména na počátku léčby a při současném užití s alkoholem, projevit snížená způsobilost k řízení motorových vozidel a obsluze strojů.

4.8 Nežádoucí účinky

Po užití nitrendipinu se mohou objevit bolesti hlavy, pocity horka a flush. Tyto projevy obvykle nejsou závažné, objevují se většinou při zahájení léčby a v průběhu terapie ustupují. Lehké maleolární edémy vznikají dilatací kapilár a nikoliv retencí tekutin. Obvykle vymizí při přerušení léčby.

Ojedinele se vyskytují závratě, nevolnost, průjem, bušení u srdce, palpitace a tachykardie, zřídka dochází k hypotenzi, kožním exantémům, pruritu a k pocitu mravenčení končetin. Při dlouhodobém užívání byla pozorována reverzibilní hyperplázie dásní, která mizí po vysazení léku.

Nitrendipin může, zejména na začátku léčby, vést ke zvýšení diurézy. Stejně jako i jiné vasoaktivní látky může nitrendipin vyvolat, zejména při zahájení terapie, anginózní potíže, které nastupují za 15-30 minut po užití léku.

4.9. Předávkování

Akutní toxicita (LD50) p.o. činí 2775-2910 mg/kg hmotnosti u myši, více než 10 000 mg/kg hmotnosti u potkanů a 213,3 mg/kg hmotnosti u psů. Hodnota LD50 při i.v. aplikaci je 33,4 mg/kg u myši a 17,8 mg/kg u potkanů. Při i.p. podání je LD50 u potkanů vyšší než 200 mg/kg.

Orální podání nitrendipinu do dávky 7,5 mg/kg/den po dobu 30 dní a 2,5 mg/kg/den po dobu 1890 dní u psů nevyvolalo toxické projevy. Totéž platí pro podání 200 mg/kg/den po dobu 30 dní a 75 mg/kg/den po dobu 180 dní u potkanů. U člověka dosud nebyly popsány známky předávkování nitrendipinem.

Předávkování by mohlo vést k výrazné periferní vasodilataci a systémové arteriální hypotenzi. V takovém případě by měl být nemocný uložen do horizontální polohy a adekvátně léčen. Je vhodné i.v. podání calcium glukonátu. Nezbytné je pravidelné monitorování krevního tlaku. Nitrendipin není dialyzovatelný.

5. Farmakologické vlastnosti

5.1. Farmakodynamické vlastnosti

Nitrendipin patří do skupiny blokátorů vápníkového kanálu dihydropyridinové skupiny.

Mechanismus jeho účinku spočívá v blokádě pomalého vápníkového kanálu, v inhibici transmembránového transportu kalciových iontů do buněk hladkého svalstva myokardiálních a cévních buněk. Výsledkem je snížení periferní cévní resistance. Na základě pokusů na zvířatech byl prokázán antihypertenzivní, koronarodilatační, antikoronarospastický a kardioprotektivní efekt nitrendipinu.

Randomizovaná, dvojitě zaslepená, placebem kontrolovaná klinická studie SYST-EUR prokázala snížení rizika vzniku kardiovaskulární příhody o 31 % (95% CI 14–45 %, $p < 0,001$), cévní mozkové příhody o 42 % (95% CI 17–60 %, $p = 0,003$) a demence zahrnující Alzheimerovu, vaskulární i smíšenou demenci o 50 % (95% CI 0–76 %, $p = 0,05$). Nitrendipin neovlivňuje funkci CNS, motorickou aktivitu a gastrointestinální pasáž.

5.2. Farmakokinetické vlastnosti

Nitrendipin se po orálním podání rychle resorbuje z trávicího traktu, maximálních plazmatických koncentrací je dosaženo během 2 hodin a to i při opakované aplikaci. Biologický poločas kolísá mezi 2,5 až 22,5 hodinami. Nebyla pozorována kumulace léku. Biologická dostupnost činí 16% po jednotlivém podání a asi 40% po opakovaném podání. Nitrendipin se významně váže na plazmatické bílkoviny (z

98%). Nitrendipin je metabolizován převážně hydroxylací a konjugací v játrech a vylučován močí během 96 hodin. Jen 0,1% účinné látky je vylučováno v nezměněné podobě.

6. Farmaceutické údaje

6.1. Seznam pomocných látek

Kukuřičný škrob, mikrokrystalická celulóza, povidon, natrium-lauryl-sulfát, magnesium-stearát.

6.2. Inkompatibility

Inkompatibility nejsou známy.

6.3. Doba použitelnosti

3 roky

6.4. Zvláštní opatření pro uchování

Uchovávejte při teplotě do 25°C.

6.5. Druh obalu a velikost balení

Polyamid/Al/PVC blistr, krabička.

28, 98 tablet;

7. Držitel rozhodnutí o registraci

Istituto Luso Farmaco d'Italia S.p.A., Miláno, Itálie

8. Registrační číslo(a)

58/1017/97-C

9. Datum první registrace / prodloužení registrace

20. 10. 1997/8. 4. 2009

10. Datum revize textu

17.8.2011