

# ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНИТЕ НА ЛЕКОТ

## 1. ИМЕ НА ЛЕКОТ

Цинаризин Лек® 75 mg Таблети

## 2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

Една таблета содржи 75 mg цинаризин.

Помошни состојки:

Една таблета содржи 50 mg лактоза монохидрат и 7 mg натриум карбоксиметил скроб.

Останатите помошни состојки се наведени во делот 6.1.

## 3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

Таблети: бели до безбојни, рамни, округли таблети со заоблени краеве.

## 4. КЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ

### 4.1. ТЕРАПЕВТСКИ ИНДИКАЦИИ

Цинаризин Лек е наменет за:

- Третман на Менџере-ов синдром: тој ги елиминира пореметувањата во рамнотежата (вертиго), тинитус (зуење во ушите), нистагмус, гадење и повраќање.
- Превенција на морска болест.

### 4.2 ДОЗИРАЊЕ И НАЧИН НА УПОТРЕБА

Лекот е наменет за перорална употреба.

Дозирањето е индивидуално:

- вертиго и други пореметувања на рамнотежата: 75 mg еднаш до два пати на ден
- превенција на морска болест: 25 до 50 mg , 2 часа пред патување
- вестибуларни симптоми кај деца постари од 12 години: 25 до 100 mg на ден , поделени во две до три дози.

Максималната дневна доза изнесува 225 mg.

Деца на возраст меѓу 5 и 12 години треба да земаат половина од дозата за возрасни.



Искуствата за употреба на цинаризин кај деца под 5 годишна возраст се недоволни, и поради тоа не треба да се администрира кај оваа возрастна група.

Таблетите треба да се земаат после оброците.

#### **4.3 КОНТРАИНДИКАЦИИ**

Цинаризин не треба да се употребува кај пациенти кои се хиперсензитивни на цинаризин или на некоја од помошните состојки на лекот.

Употребата на цинаризин е контраиндицирана кај пациенти со порфирија. Употребата на цинаризин е контраиндицирана кај пациенти со Паркинсонова болест или други нарушувања на екстрапирамидалниот систем, сериозна депресија, бидејќи може да ја влоши состојбата.

#### **4.4 ПОСЕБНИ МЕРКИ НА ПРЕТПАЗЛИВОСТ И ПОСЕБНИ ПРЕДУПРЕДУВАЊА**

Лекувањето треба да се прекине веднаш кај пациенти кај кои се појавил Паркинсонизам за време на терапијата со цинаризин.

Лекот треба да се употребува со голема претпазливост кај пациенти со артериска хипотензија.

При подолго лекување, се препорачува следење на крвната слика и функцијата на хепарот и бубрезите.

Лекот треба да се администрира исто така, со голема претпазливост кај пациенти кои имале сериозен миокарден инфаркт и кај оние со срцева аритмија или пореметувања на коагулација на крвта.

Цинаризин треба да се администрира со претпазливост кај постари лица и пациенти со миастенија гравис.

Цинаризин може да предизвика лажно негативни резултати на тестови на осетливост на кожата, поради тоа се препорачува прекин на третманот најмалку 4 дена пред тестот.

#### **Важна информација за некоја од состојките на Цинаризин Лек**

Лекот содржи лактоза. Пациенти со ретки наследни проблеми во однос на неподносливост на галактоза, Ларп лактоза дефицит или глукозо-галактозна малапсорпција не може да го употребуваат овој лек.

#### **4.5 ИНТЕРАКЦИИ СО ДРУГИ ЛЕКОВИ И ДРУГИ ФОРМИ НА ИНТЕРАКЦИИ**

Цинаризин Лек не треба да се употребува истовремено со лекови кои може да предизвикаат екстрапирамидални дејства: неуролептици, антиеметици, резерпин или метилдопа. При истовремена употреба со вазодилататори и антихипертензивни, антихипертензивно дејство може да се зголеми. Етанол, седативи или трициклични антидепресиви го зголемуваат седативното дејство на цинаризин.



#### **4.6 УПОТРЕБА ЗА ВРЕМЕ НА БРЕМЕНОСТ И ДОЕЊЕ**

##### **Бременост**

Не постојат достапни податоци за употребата на цинаризин кај бременни жени. Испитувањата кај животни не покажале тератогено дејство, но потенцијалниот ризик кај луѓето не е познат. Цинаризин Лек не треба да се употребува за време на бременост.

##### **Доење**

Не е познато дали цинаризин се излучува во мајчиното млеко. Цинаризин не треба да се употребува за време на доење.

#### **4.7 ВЛИЈАНИЕ ВРЗ СПОСОБНОСТА ЗА ВОЗЕЊЕ ИЛИ РАКУВАЊЕ СО МАШИНИ**

Цинаризин Лек посебно на почетокот на лекувањето или доколку се конзумира алкохол, може да предизвика малаксаност и поспаност и со тоа да ја намали психофизичката способност. Поради тоа, не се препорачува возење или ракување со машини.

#### **4.8 НЕСАКАНИ ДЕЈСТВА**

Неасаканите дејства се класифицирани во однос на органските системи и честота на појавување :

многу чести ( $\geq 1/10$ ),

чести ( $\geq 1/100$ ,  $< 1/10$ ),

помалку чести ( $\geq 1/1000$ ,  $< 1/100$ ),

ретки ( $\geq 1/10000$ ,  $< 1/1000$ )

многу ретки ( $< 1/10000$ ), непозната честота (не може да се процени од расположивите податоци)

Најчесто забележани несакани дејства биле оние кои предизвикувале седација (поспаност, општа слабост), поради антихистаминското дејство на цинаризин. Овие дејства се обично благи и минливи.

##### *Пореметувања на нервниот систем*

Многу чести: поспаност, главоболка, вртоглавица, општа слабост

Ретки: екстрапирамидални симптоми (тремор, паркинсонизам) кои се понекогаш поврзани со депресија. Паркинсонизмот, кој се јавува поради долготрајно лекување со цинаризин и најчесто кај постари пациенти, е реверзибилен и обично исчезнува веднаш или најдоцна во тек на една недела по прекин на третманот со цинаризин.

##### *Гастроинтестинални пореметувања*

Чести: сува уста



Помалку чести: благи проблеми во желудникот (мачнина, гадење, повраќање, епигастрична болка)

*Пореметување на кожата и подкожните ткива*

Ретки: алергиски кожни реакции (фотосензитивност), потење

Многу ретки: lichen planus (синдром сличен на ериматозен лупус)

*Метаболни и нутритивни пореметувања*

Чести: зголемен апетит, зголемена телесна тежина

Помалку чести: губење на апетитот поради гастроинтестиналните пореметувања

*Хепатобилијарни пореметувања:*

Чести: променети црно-дробни ензими

Многу ретки: холестатска жолтица

*Психијатриски пореметувања:*

Ретки: парадоксална агитација, проблеми со спиењето, депресија како резултат на екстрапирамидалните симптоми.

*Лабараториски тестови*

Цинаризин може да предизвика лажно негативни резултати на тестови на осетливост на кожата, поради тоа се препорачува прекин на третманот најмалку 4 дена пред тестот

#### **4.9 ПРЕДОЗИРАЊЕ**

Почетните симптоми на предозирање се поспаност, вртоглавица и некоординирано движење. Прекумерно предозирање може да резултира со повраќање, тремор, хипотензија, хипотермија, конвулзии, кома и депресија на дишењето.

Специфичен антидот не постои, и лекувањето е симптоматско. Се препорачува испирање на желудникот и употреба на активен јаглен.

### **5. ФАРМАКОЛОШКИ СВОЈСТВА**

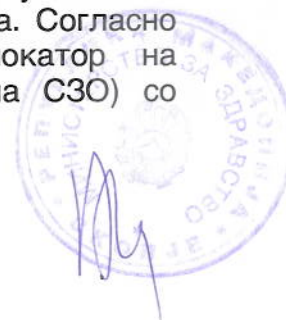
#### **Фармакотерапевтска група**

Лекови кои делуваат на нервниот систем, лекови против вртоглавица, цинаризин

АТС код: N07CA02

#### **5.1 ФАРМАКОДИНАМСКИ СВОЈСТВА**

Цинаризин е дериват на пиперазин кој прв пат бил регистриран во 1958 како антихистаминик; тој е антагонист на хистамин  $H_1$  рецептори. Во клиничка употреба е 40 години. Неговото антихистаминско дејство било докажано со стандардни тестови, т.е. со спречување на предизвикан од хистамин едем на стапало кај заморчиња, или со спречување на предизвикан од хистамин анафилактички шок кај заморчиња. Согласно новите откритија, покажано е дека цинаризин е блокатор на калциумовиот канал (Класа IV според класификацијата на СЗО) со



антиалергиски (антихистамински) и антивазоконстриктивни својства. Цинаризин припаѓа на неселективни тип Т блокатори на калциумовиот канал. Во случај на исхемија, тој го заштитува ткивото со инхибиција на зголемено навлегување на калциум во клетките и со тоа го намалува тонусот на мазните мускули во артериолите. На овој начин, тој го подобрува дотокот во ткивата и ги снабдува клетките со кислород и гликоза. Цинаризин е исто така ефикасен за пореметувања на рамнотежата, веројатно со подобрување на крвотокот во ушниот лабиринт и со вршење на директно дејство на  $H_1$  рецепторите.

## **5.2 ФАРМАКОКИНЕТСКИ СВОЈСТВА**

### **Апсорпција и плазматски концентрации**

Биорасположивоста на цинаризин многу се разликува и зависи од рН на желудочната мукоза – се намалува при високи рН вредности. Максимална плазматска концентрација ја постигнува два до три часа по перорална администрација.

Средната максималната плазматска концентрација по внесување на 75 mg цинаризин со единечна доза или со неколку дози е 0.265 микрограми/ml и 0.739 микрограми/ml, соодветно, за два до три часа.

За време на четримесечен третман со 75 mg од лекот три пати дневно, плазматските концентрации на цинаризин се движат меѓу 1,2 и 7,9 микрограми/ ml. Плазматски полуживот е приближно три часа, со терминален полуживот од 20 до 26 часа. Серумските концентрации достигнуваат *vsteady state* по 15 дена од администрацијата. Неговата акумулација во серумот исто така може да се одреди; индивидуалниот фактор на акумулација е меѓу 1,75 и 4,75.

### **Метаболизам и елиминација**

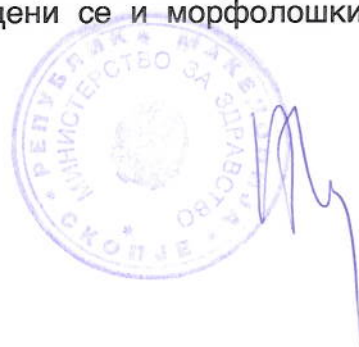
Цинаризин се метаболизира примарно во хепарот. Цинаризин се екскретира во фецесот главно како непроменет лек ( околу 67% ) и во урината доминантно во форма на метаболити ( околу 33% ) .Елиминацијата може да се детектира за околу 30 минути по апликацијата.

## **5.3 ПРЕДКЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ ЗА СИГУРНОСТА НА ЛЕКОТ**

Цинаризин е релативно безбеден лек кој е во употреба над 40 години.

Леталната доза кај глушец по интравенозна администрација е 36 mg/kg. Леталната доза за стаорци е значително повисока и изнесува до 2560 mg/kg.

Даден интраперитонеално кај глувци ја намалува телесната температура. Долготрајно лекување со цинаризин 6mg/kg/ден кај глувци предизвикало паркинсонизам. Се јавиле нарушувања во движењето и тремор. Симптомите биле поизразени кај постарите отколку кај помладите животни, и се повлекле со прекинувањето на терапијата. После долготрајно давање на цинаризин утврдено е и сермско снижување на тесторенот, естрадиолот и прогестеронот. Утврдени се и морфолошки промени на надбубрежната жлезда.



Цинаризин не покажал тератогени дејства при испитувања кај морски прасиња.

Нема податоци во литературата за било какви карциногени или мутагени дејства на цинаризин.

## **6. ФАРМАЦЕВТСКИ ПОДАТОЦИ**

### **6.1 ЛИСТА НА ЕКСЦИПИЕНСИ**

Анхидридна колоидна силика, пченкарен скроб, лактоза монохидрат, магнезиум стеарат, повидон, натриум скробгликолат, талк

### **6.2 ИНКОМПАТИБИЛНОСТИ**

Не се познати.

### **6.3 РОК НА ТРАЕЊЕ**

5 години.

Да не се употребува по истекот на рокот на траење.

### **6.4 НАЧИН НА ЧУВАЊЕ**

Лекот се чува на температура до 25°C.

Да се чува на места недостапни за деца.

### **6.5 ПРИРОДА И СОДРЖИНА НА ПАКУВАЊЕТО**

Кутија, блистер (Al/PVC фолија), 50 таблети (5 x 10) кои содржат 75mg цинаризин

### **6.6 ИНСТРУКЦИИ ЗА УПОТРЕБА/РАКУВАЊЕ**

Нема специјални барања.

## **7. НОСИТЕЛ НА ОДОБРЕНИЕТО ЗА СТАВАЊЕ НА ЛЕКОТ ВО ПРОМЕТ**

ЛЕК Скопје ДООЕЛ, Перо Наков б.б., Скопје, Р.Македонија

## **8. БРОЈ НА ОДОБРЕНИЕТО ЗА СТАВАЊЕ НА ЛЕКОТ ВО ПРОМЕТ**

15-5699/04

## **9. ДАТУМ НА ПРВОТО ОДОБРЕНИЕТО ЗА СТАВАЊЕ НА ЛЕКОТ ВО ПРОМЕТ И ДАТУМ НА ПОСЛЕДНОТО ОБНОВЕНО ОДОБРЕНИЕ**

12.06.1995 година, 08.10.2007 година

## **ДАТУМ НА ПОСЛЕДНАТА РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ**

Август 2009 година

