

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНТЕ НА ЛЕКОТ

1. ИМЕ НА ЛЕКОТ

Plitop[®] / Плитоп 0.1 mg таблети

2. КВАЛИТЕТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

Една таблета содржи 0,1 mg метилдигоксин.

Една таблета содржи 60,60 mg лактоза монохидрат.

3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

Таблета.

4. КЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ

4.1 Терапевтски индикации

Акутна и хронична срцева слабост.

Суправентрикуларни аритмии (атријална фибрилација, атријална ундулација и пароксимална суправентрикуларна тахикардија).

4.2 Дозирање и начин на употреба

Препорачаните дози се просечни вредности и истите може да бидат прилагодени според индивидуалната состојба и осетливоста на пациентот. Затоа, лекарот треба да ја утврди дозата на метилдигоксин за секој пациент засебно. Лекувањето се започнува со иницијална доза и се продолжува со доза на одржување.

Возрасни

Рapidна дигитализација (сатурација) може да се постигне со орална администрација од 0,2 mg на метилдигоксин три пати на ден, во период од 2 до 4 дена. Побавна дигитализација се постигнува со пониски дози на метилдигоксин (0,4 mg на ден) во период од 3 до 5 дена.

Дозата на одржување е 0,05 до 0,3 mg на ден (обично 0,15 до 0,2 mg на ден) како единечна доза или во поделени дози.

Деца

Метилдигоксинот се администрира кај деца според нивната телесна тежина.

Иницијалната доза е 0,01 mg/kg на секои 6 месеци (во 2 до 4 поделени дози). Лекувањето се продолжува со доза на одржување од 0,01 mg/kg на ден.

Таблетите се соодветни за деца со адекватна телесна тежина, кои се способни да проголтаат таблета. За сите други деца треба да се администрираат течни форми на лекот.

Дозирање кај пациенти со нарушени функции

Кај пациенти со ренални нарушувања, дозата треба да се прилагоди според сериозноста на нарушувањето и истата треба внимателно да се титрира. Во зависност од клиренсот на креатинин (серумските нивоа на креатинин), дозата треба адекватно да се намали или треба да се продолжи интервалот помеѓу дозите, како што е прикажано на подолната табела.

Серумски креатинин	Клиренс на креатинин	Доза
< 1,2 mg/100 ml (106 μmol/L)	>70 ml/мин	Вообичаена доза
< 2,0 mg/176 ml (176 μmol/L)	>45 ml/мин	½ доза
< 3,0 mg/100 ml (264 μmol/L)	>30 ml/мин	1/3 доза
> 3,0 mg/100 ml (264 μmol/L)	<30 ml/мин	¼ доза

Кај постари пациенти (над 65 години), може да дојде до намалување на гликозидната екскреција дури и кога не постојат докажани знаци на ренална инсуфициенција. Со тоа, концентрациите на серумски

креатинин не треба да се покачени. Затоа, во случаите на постари пациенти, дури и при нормални серумски нивоа на креатинин, треба да се размисли за намалена гликозидна екскреција, и кога има услови треба да се прилагоди обемот на дозата.

4.3 Контраиндикации

Метилдигоксинот не смее да се користи при:

- Преосетливост на метилдигоксин, други кардијални гликозиди или на било која помошна состојка на формулацијата
- Сомнение од интоксикација со дигиталис
- Вентикларна тахикардија или вентиклартна фибрилација
- Нарушување на AV состојбата (II и III степен AV блок)
- WPW синдром особено со атријална фибрилација
- Хипокалемија
- Хиперкалцемија, хипомагenezемија
- Хипертрофична опструктивна кардиомиопатија
- Анеуризам на торакалната аорта
- Синдром на каротиден синус
- Синдром на болен синус

4.4 Мерки на претпазливост и посебни предупредувања

Терапевтската широчина на метилдигоксинот е релативно мала. Поголемиот број на возрасни пациенти, соодветно се дигитализирани (без знаци на труење) при серумски концентрации на метилдигоксин од 0,8 до 2,0 ng/mg. Примероците на крв за мерење на серумската концентрација на лекот се земаат најдоцна 6 до 8 часа после земената доза, без оглед на начинот на употреба и формата на лекот. Кај пациенти кои се лекуваат со метилдигоксин треба редовно да се мерат серумските концентрации на електролити и треба да се проверува бубрежната функција.

На пациентите со оштетена бубрежна функција треба да им се даваат пониски нивоа на метилдигоксин, прилагодени според клиренсот на креатинин. На пациентите со хепатални оштетувања, Плитоп треба претпазливо да им се дава; доколку концентрацијата на лекот во крвта им се зголеми над терапевтската, дозата на метилдигоксин треба да се намали. Пред секоја примена на дозата на метилдигоксин треба да се изврши внимателна проценка на клиничката состојба на пациентот.

Треба да се биде особено внимателен со пациенти со малапсорпција или пациенти по хирушка интервенција во гастроинтестиналниот тракт, кога метилдигоксинот се администрира перорално (може да бидат неопходни повисоки дози).

Метилдигоксинот треба внимателно да се дава и на пациенти со инфаркт на миокардот (пациентите со акутен миокардијален инфаркт се обично хипокалемични и/или склони на нарушувања на срцевиот ритам), миокардитис (вклучително и ревматски и вирусен миокардитис) и со нарушувања на електролитите.

Потребно е особено внимание кај пациенти со брадикардијални аритмии, брадикардија како резултат на нарушувања во стимулацијата за формирање и/или спроведување, AV блок од I степен, кор пулмонале или хипоксемија како резултат на сериозно заболување на респираторните патишта или пред кардиоверзија.

На пациентите со хипертензија треба да им се даваат помали дози додека на пациентите со хипетриреодизам треба да примаат поголеми дози на Плитоп, зависно од серумската концентрација на хормони.

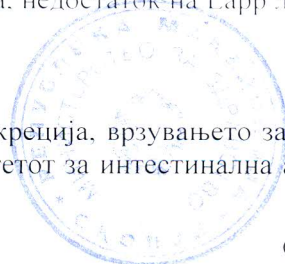
Потребно е внимание и при употреба на Плитоп кај постари и хипоксични пациенти, заради зголемената преосетливост на гликозиди дигиталис, поголема зачестеност на несакани дејства и чести труења.

Помошна состојка

Пациентите со ретки наследни проблеми на интолеранција на галактоза, недостаток на Lapp лактаза или малапсорпција на гликоза-галактоза не треба да го земаат овој лек.

4.5 Интеракции со други лекови или други форми на интеракција

Интеракциите може да бидат резултат на влијанието на реналната секреција, врзувањето за телесните ткива, врзувањето за плазматските протеини, дистрибуцијата, капацитетот за интестинална апсорпција и преосетливоста на метилдигоксин.



Како мерка на претпазливост, веројатноста од интеракција треба да се земе во предвид при воведување на било каква дополнителна терапија.

Препаратите на калциум и симпатомиметици со кардиотоници делуваат синергистички и можат да предизвикаат аритмии. Препаратите на рауволфија и гванетидин предизвикуваат минливо зголемување на нивоата на катехоламин, што исто така може да предизвика аритмии.

Бета-блокаторите или резерпинот применети со дигиталис можат да ја потенцираат брадикардијата.

Диуретиците, кортикостероидите и амфотерицинот В заради единечната хипокалемија ја зголемуваат токсичноста на дигиталисот.

Блокаторите на калциумовите канали (на пример, верапамил, дилтиазем), каптоприлот, амиодаронот, спиронолактонот, итраконазолот, квининот, атропинот, антиаритмичките агенси (квинин, амиодарон, флекаинид, пропафенон), индометацинот, алпразоламот, празосинот, антибиотиците (на пример, тетрациклините, еритромицин, гентамицин, триметоприм) ја зголемуваат плазматската концентрација на метилдигоксинот.

Антацидите, колестираминот и активниот јаглен ја намалуваат цревната апсорпција на гликозидот на дигиталис, па треба да се земаат во интервал од 2 часа.

Фенитоинот, фенобарбитонот, рифампицинот и останатите индуктори на ензимите на црниот дроб можат да ја намалат плазматската концентрација на метилдигоксин, намалувајќи го неговото терапевтско дејство.

Плазматските концентрации на метилдигоксинот може да се намалат при истовремена употреба на препарати на база на кантарион. Се препорачува пациентот будно да се следи, особено при воведување на кантарионот или по неговото повлекување и да се направи соодветно прилагодување на дозата на метилдигоксин.

4.6 Употреба за време на бременост и лактација

Заради можното несакано влијание врз фетусот и новороденчето, метилдигоксинот треба да се избегнува во тек на бременост и доење; треба да се администрира само доколку придобивките од лекот го оправдуваат потенцијалниот ризик.

4.7 Влијание врз способноста за возење или ракување со машини

Метилдигоксинот не влијае врз способноста за управување со возила и ракување со машини

4.8 Несакани дејства

Несаканите дејства на метилдигоксин најчесто се јавуваат заради мала граница измеѓу терапевтските и токсичните дози. Затоа, некои несакани дејства може исто така да бидат и симптоми на предозирање.

Од сите несакани дејства најсериозни се срцевите несакани дејства. Може да се појават сите нарушувања на срцевниот ритам: вентикларни аритмии вклучувајќи и екстрасистоли, вентикларна тахикардија, супервентикларна тахикардија вклучувајќи и атријска тахикардија со блок, синус брадикардија, синусатриски блок, AV блок.

Употребата на метилдигоксинот може да биде пропратена со губење на апетитот, мачнина (појавата на мачнина треба да се смета за ран знак на прекумерна доза), повраќање, а поретко и со болки во стомакот и пролив. Во индивидуални случаи била опишана и мезентеријална инфаркција.

Главоболка, слабост, вртоглавица, несоница, и ретко присутните ментални промени (на пример, ноќни мори, немир, конфузија) и исто така депресија, халуцинации и психози. Во индивидуални случаи пријавена е и афазија. Имало пријави и за слабост, апатија и неспокој.

Понекогаш може да дојде и до нарушувања на видот (замаглен вид, променета перцепција на боите).

Метилдигоксинот може да предизвика тромбоцитопенија, ренални нарушувања и гинекомастија.

Реакциите на преосетливост (уртикарични или скарлатоидни ерупции со еозинофилија, еритема) се ретки.

4.9 Предозирање

Терапевтската широчина на метилдигоксинот е мала. При серумски нивоа поголеми од 2 ng/ml, токсичните симптоми стануваат позачестени.

Симптоми

Во случај на предозирање, може да се појават кардијални, гастроинтестинални и CNS несакани ефекти кои се разликуваат од лице до лице но сите се карактеристични за дигиталис глукозиди. Не постои типичен редослед на појавата на симптомите. Екстракардијалните и кардијалните синдроми може да се

појават едни по други или истовремено, додека пак кардијалните знаци на дигиталис интоксикација треба да се проценат многу сериозно.

Интоксикацијата со гликозиди со фатални последици, по правило се последица на кардиотоксичното дејство на гликозидите.

Најважните кардијални симптоми се: аграмација на срцевата слабост и сите познати аритмии, од кои најчести се екстрасистолите од бигемин и тригемин тип. Може да се појават брадикардија, AV – дисоцијација, забрзан нодален ритам, атријска тахикардија со блок, вентикларна ундулација и фибрилација, како и асистолија. Од останатите знаци може да се појават и мачнина и повраќање, болки во stomакот, пролив или опстипација, главоболка, несоница, збунетост, вртоглавица и нарушувања на видот. Сериозноста на труењето зависи од количината на внесен гликозид и од ткивните и внатрешночестичните концентрации на калиум.

После акутно предозирање може да дојде до хиперкалемија, додека пак хипокалемијата обично се поврзува со хронично предозирање. Токсичниот ефект може да се зголемува и до 12 часа по акутното предозирање.

Лекување

Најдоцна 4 часа по земање на лекот треба да се изврши испирање на желудникот, и да се примени активен јаглен. Во случај на хипокалемија, треба да се надомести калиум (освен во случаи на срцев блок), да се поправи нарушувањето на останатите серумски електролити и хипоксијата, и доколку е потребно, да се примени и антиаритмик. Се додека траат знаци на труење, земањето на лекот треба да се прекине. Во случај на животнo опасни случаи на труење се применуваат специфични противтела на дигоксин антитела на дигоксин (Fab).

5. ФАРМАКОЛОШКИ ПОДАТОЦИ

5.1 Фармакодинамија

Фармакотерапевтска група: Кардијални гликозиди, Дигиталис гликозиди. АТС шифра: C01AA08

Метилдигоксинот е кардиотоничен гликозид. Тој има позитивно инотропично дејство на миокардиумот, зголемувајќи ја силата и брзината на контракцијата. Ова дејство е резултат на инхибицијата на поминувањето на натриумовите и калиумовите јони низ миокардијалната клеточна мембрана, заради формација на комплекси со аденозин трифосфатаза. Тоа го зголемува доводот на калциумови јони како и ослободувањето на слободни калциумови јони во миокардијаните клетки, зголемувајќи ја активноста на контрактилните кардијални мускулни влакна.

Метилдигоксинот исто така ја намалува кондуктивната брзина на импулсите низ срцевиот спроводен систем и го продолжува ефективниот AV рефракторен период (негативно дромotropно дејство). Освен тоа, го намалува срцевиот ритам (негативно хронотропно дејство) и ја зголемува раздразнетоста на миокардиумот (позитивно батмотропично дејство).

5.2 Фармакокинетика

Метилдигоксинот брзо се апсорбира по орална администрација. Биорасположивоста на метилдигоксинот по земање на таблетите е до 100%. Пик плазматските концентрации на метилдигоксинот од приближно 2 ng/ml се постигнуваат во рок од 30 минути по орална доза од 0.3 mg. Според тоа, значително позитивно инотропично дејство на метилдигоксинот се јавува во рок од 30 минути по орална администрација, додека највисокото дејство е забележано по 4 часа. Покрај фактот дека пик плазматските концентрации на гликозид по орална администрација на метилдигоксин се достигнуваат порapidно отколку по орална администрација на дигоксин, концентрациите се постигнуваат по администрација на метилдигоксин се приближно два пати повисоки (по администрација на истата доза). Соодносот на дозите на метилдигоксин и дигоксин со кои се постигнуваат истите плазматски концентрации е 1/1.5. Внесот на храна ја намалува стапката на апсорпција, но не влијае на апсорбираната количина на метилдигоксин администриран после оброк.

Метилдигоксинот има голем волумен на дистрибуција, околу 10 l/kg. Приближно 10-22 % од метилдигоксинот се врзува за серумските протеини. Високи концентрации се достигнуваат во различни органи и ткива, во плацентата и мајчиното млеко, и се особено високи во миокардиумот.

Метилдигоксинот се метаболизира на прво поминување низ црниот дроб, и околу 13% од оралната доза се деметилизира во дигоксин. Останатите метаболити се бис- и моногликозиди кои се излачуваат главно во фецесот. Во рок од 7 дена, 55% од оралната доза на метилдигоксин се излачува во урината, и околу 30% во фецесот. 31% од количината излачена во урина е во форма на непроменет метилдигоксин,

50% се излачува како дигоксин и 2 % во форма на бис- и моногликозиди. Полуживотот на елиминација на метидигоксинот е 1.5 – 2.5 дена.

5.3 Претклинички податоци за сигурноста

Не постојат претклинички податоци кои би биле од значење за оној што го препишува лекот а кои веќе не се споменати во другите делови од овој Збирен извештај за карактеристиките на лекот.

6. ФАРМАЦЕВТСКИ ПОДАТОЦИ

6.1. Листа на експииенси

Лактоза,
Повидон,
Силициум диоксид колоиден,
Микрокристална целулоза,
Магнезиум стеарат,
Натриум скроб гликолат.

6.2. Инкомпатибилност

Не применливо.

6.3. Рок на употреба

48 месеци.

6.4. Начин на чување

Да се чува на температура до 25 °C.

6.5. Пакување (природа и содржина на пакувањето)

PVC/Al блистер
50 таблети во кутија(5 блистери со по 10 таблети)

6.6. Упатство за употреба / ракување

Нема посебни услови.

7. ПОДАТОЦИ ЗА НОСИТЕЛОТ НА РЕШЕНИЕТО ЗА ПРОМЕТ

Носител на одобрението за промет



ПЛИВА Д.О.О.Е.Л.-СКОПЈЕ, Никола Параунов бб, СКОПЈЕ-МАКЕДОНИЈА

Производител



ПЛИВА ХРВАТСКА д.о.о., Прилаз баруна Филиповиќа 25, 10 000 Загреб, Хрватска

8. БРОЈ НА РЕШЕНИЕТО ЗА СТАВАЊЕ ВО ПРОМЕТ

9. ДАТУМ НА ПРВОТО РЕШЕНИЕ ЗА СТАВАЊЕ ВО ПРОМЕТ

10. ДАТУМ НА ПОСЛЕДНАТА РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ

Ноември 2008.

