



2008-09-08

**CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO****1. NAZWA WŁASNA PRODUKTU LECZNICZEGO**

SUSTONIT 6,5 mg tabletki o przedłużonym uwalnianiu

**2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY SUBSTANCJI CZYNNYCH**Jedna tabletki o przedłużonym uwalnianiu zawiera 6,5 mg glicerolu triazotanu (*Glyceroli trinitras*).

Produkt zawiera laktozę.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

**3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA**

Tabletki o przedłużonym uwalnianiu.

**4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE****4.1. Wskazania do stosowania**

Zapobieganie bólom wieńcowym w stabilnej dławicy piersiowej.

**4.2. Dawkowanie i sposób podawania**

Indywidualnie, zależnie od stanu i reakcji pacjenta, zwykle 1 tabletki (6,5 mg) do 2 tabletek (13 mg) 2 razy na dobę.

Zaleca się stosowanie tzw. dawkowania niesymetrycznego, tzn. 2 razy na dobę z odstępem 8-godzinnym (np. o godzinie 8.00 i o 16.00). Dłuższa przerwa powinna przypadać na okres małej aktywności fizycznej oraz na porę, w której dolegliwości są zwykle niewielkie. Tabletek nie należy rozgryzać i rozkruszać. Połykać w całości.

**Uwaga:** produkt nie nadaje się do przerywania napadu bólu wieńcowego.**4.3. Przeciwwskazania**

- Nadwrażliwość na glicerolu triazotan, inne azotany lub którąkolwiek substancję pomocniczą produktu.
- Ciężka niedokrwistość.
- Uraz głowy.
- Udar krwotoczny mózgu.
- Jaskra.

**4.4. Specjalne ostrzeżenia i zalecane środki ostrożności dotyczące stosowania**

Stosowanie glicerolu triazotanu (nitrogliceryny) należy rozważyć u pacjentów z:

- kardiomiopatią przerostową, ponieważ mogą nasilić się objawy dławicy piersiowej;
- niedociśnieniem, szczególnie jeśli ciśnienie skurczowe jest niskie, ponieważ może dojść do obniżenia ciśnienia tętniczego z bradykardią oraz mogą nasilić się objawy dławicy piersiowej;
- wczesnym okresem pozawałowym, ponieważ istnieje ryzyko wystąpienia niedociśnienia, tachykardii oraz pogłębienia się stanu niedokrwienia mięśnia sercowego;
- nadczynnością tarczycy;
- ciężką niewydolnością wątroby, ponieważ wzrasta ryzyko wystąpienia methemoglobinemii;

- nadmierną czynnością skurczową żołądka lub z zespołem złego wchłaniania.

Produkt należy odstawiać ostrożnie i stopniowo, aby uniknąć nasilenia objawów choroby niedokrwiennej serca.

U pacjentów w wieku podeszłym azotany mogą powodować niedociśnienie ortostatyczne. Wystąpienie niedociśnienia może być objawem przedawkowania azotanów. W takim przypadku należy jak najszybciej zmodyfikować dawkowanie.

Ze względu na zawartość laktozy, produkt nie powinien być stosowany u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją galaktozy, niedoborem laktazy typu Lapp lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy.

#### **4.5. Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji**

Alkohol może nasilać hipotensyjne działanie azotanów.

W skojarzeniu z lekami blokującymi receptory  $\beta$ -adrenergiczne lub antagonistami kanału wapniowego, azotany mogą niekiedy powodować znaczny spadek ciśnienia krwi. Azotany organiczne działają bezpośrednio na mięśnie gładkie naczyń; zastosowanie ich w skojarzeniu z innymi lekami rozszerzającymi naczynia krwionośne może nasilić lub osłabić ich efekt.

Podczas stosowania azotanów nie należy przyjmować sylденаfilu (i innych leków z grupy wybiórczych inhibitorów fosfodiesterazy swoistej dla cGMP typu 5), ponieważ może wystąpić groźne w skutkach, ciężkie, nieodwracalne niedociśnienie tętnicze.

Jednoczesne przyjmowanie glicerolu triazotanu i trójpierścieniowych leków przeciwdepresyjnych (pochodnych fenotiazyny) może spowodować znaczny spadek ciśnienia tętniczego.

#### **4.6. Cięża i laktacja**

Wpływ glicerolu triazotanu na płód nie jest znany. Produkt może być stosowany w ciąży jedynie w przypadkach, gdy w opinii lekarza korzyść dla matki przeważa nad potencjalnym zagrożeniem dla płodu.

Nie wiadomo, czy glicerolu triazotan przenika do mleka kobiecego.

Podczas stosowania produktu w okresie karmienia piersią należy zachować ostrożność.

#### **4.7. Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu**

Produkt nie wpływa na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu, chyba że występują takie objawy niepożądane, jak obniżenie ciśnienia tętniczego, zawroty i bóle głowy.

#### **4.8. Działania niepożądane**

Mogą wystąpić następujące działania niepożądane:

*Zaburzenia naczyniowe:*

niedociśnienie ortostatyczne, omdlenia.

*Zaburzenia układu nerwowego:*

ból i zawroty głowy (występują w początkowym okresie przyjmowania produktu i zwykle przemijają lub słabną w przebiegu leczenia);  
osłabienie, niepokój.

*Zaburzenia żołądka i jelit:*

nudności, wymioty.

*Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej:*

rozszerzenie naczyń krwionośnych skóry, zaczerwienienie twarzy, bledność lub zaczerwienienie skóry.

*Zaburzenia serca:*

tachykardia.

**4.9. Przedawkowanie**

Po przedawkowaniu azotanów organicznych może dojść do znacznego rozszerzenia naczyń i zastoju krwi w naczyniach obwodowych oraz do spadku ciśnienia tętniczego. Objawy nie odbiegają zwykle od działań niepożądanych związanych z rozszerzeniem łożyska naczyniowego. Po znacznym przedawkowaniu mogą wystąpić ciężkie zaburzenia przepływu krwi, utrata przytomności, sinica, methemoglobinemia, tachykardia.

Z uwagi na powolne wchłanianie substancji czynnej wystąpienie ciężkich objawów po niezamierzonym przedawkowaniu jest mało prawdopodobne. Jeśli pacjent zażył dużą ilość produktu, celowe jest jego usunięcie z przewodu pokarmowego poprzez spowodowanie wymiotów lub płukanie żołądka.

Postępowanie jest objawowe. W lekkich przypadkach wystarczające może być ułożenie pacjenta z uniesionymi kończynami dolnymi. W przypadku nasilenia się objawów konieczne może być np. dożylnie podanie płynów w celu wypełnienia łożyska naczyniowego. Przesłanki farmakologiczne wskazują na celowość podania leków zwężających naczynia, jednak ich skuteczności nie potwierdzono jednoznacznie. Postępowanie takie może być jednak niekorzystne w przypadku współistniejącej choroby nerek lub układu krążenia (niewydolność serca, choroba niedokrwienna, nadciśnienie).

W przypadku wystąpienia nasilonej methemoglobinemii stosuje się tlenoterapię i ewentualnie podaje dożylnie błękit metylenowy.

**5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE****5.1. Właściwości farmakodynamiczne**

Grupa farmakoterapeutyczna: leki rozszerzające naczynia stosowane w chorobach serca.

Azotany organiczne. Glicerolu triazotan.

Kod ATC: C01DA02

Glicerolu triazotan (nitrogliceryna) jest związkami o silnym i szybkim działaniu rozkurczowym na mięśnie gładkie naczyń krwionośnych i innych narządów. Mechanizm działania nitrogliceryny nie jest w pełni poznany, uważa się jednak, że wolne rodniki azotynowe ( $\text{NO}^\bullet$ ) wywierają efekt podobny do tlenku azotu, wydzielanego przez śródbłonek naczyniowy. Końcowym efektem działania azotanów jest zmniejszenie puli wolnego jonu wapniowego w cytosolu.

Do działania azotanów konieczne są wolne grupy sulfhydrylowe (SH) w cytosolu.

Wyczerpanie się ich w miarę działania azotanów jest powodem narastania tachyfilaksji,

utrzymującej się aż do chwili ponownego pojawienia się grup sulfhydrylowych w wystarczającej ilości. Powoduje to konieczność przerywanego stosowania nitrogliceryny, tzw. dawkowania niesymetrycznego (patrz p. 4.2).

Działanie glicerolu triazotanu związane jest z rozkurczem żył, głównie pozawłośniczkowych, prowadzącym do gromadzenia się krwi na obwodzie i zmniejszenia powrotu żylnego oraz ujawniającego się w większych stężeniach rozkurczu drobnych tętniczek przedwłośniczkowych i zmniejszenia oporu naczyniowego oraz ciśnienia tętniczego, co odciąża mięsień sercowy. Oba efekty w konsekwencji zmniejszają zapotrzebowanie na tlen. Wydaje się, że dla postaci o przedłużonym działaniu podstawowe znaczenie ma drugi efekt, stąd konieczność stosowania w leczeniu długotrwałym stosunkowo dużych dawek.

W postaciach choroby niedokrwiennej serca z komponentą skurczową może mieć znaczenie bezpośrednie działanie rozkurczowe na tętnice wieńcowe.

Dzięki przedłużonemu uwalnianiu glicerolu triazotanu z produktu, mimo szybkiej jego eliminacji, stężenie utrzymuje się we krwi przez kilka godzin na poziomie wystarczającym do zmniejszenia częstości napadów wieńcowych i zwiększenia wydolności wysiłkowej.

### **5.2. Właściwości farmakokinetyczne**

Glicerolu triazotan jest szybko wchłaniany z przewodu pokarmowego i w znacznym stopniu rozkładany w wątrobie w metabolizmie pierwszego przejścia. Skutkiem szybkiego rozkładu w wątrobie jest niewielka dostępność biologiczna, będąca przyczyną konieczności stosowania względnie dużych dawek. Okres półtrwania glicerolu triazotanu w osoczu wynosi 1 do 4 minut. Działanie preparatów o przedłużonym uwalnianiu utrzymuje się przez kilka godzin. Z uwagi na łatwy rozwój tachyfilaksji, azotany należy podawać w taki sposób, aby zapewnić pacjentowi kilkugodzinną przerwę w działaniu produktu, najlepiej w okresie niewielkiej aktywności fizycznej.

### **5.3. Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie**

Nie ma danych.

## **6. DANE FARMACEUTYCZNE**

### **6.1. Wykaz substancji pomocniczych**

Hypromeloza

Laktoza jednowodna

Krzemionka koloidalna uwodniona

Kwas stearynowy

Lak czerwieni koszenilowej (E 124)

### **6.2. Niezgodności farmaceutyczne**

Nie dotyczy.

### **6.3. Okres ważności**

3 lata.

### **6.4. Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu**

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C. Chronić od światła.

### **6.5. Rodzaj i zawartość opakowania**

30 tabletek w 3 blistrach Al/PVC po 10 szt. w jednym blisterze, w tekturowym pudełku.

**KOPIA**

**WERSJA 02**

**6.6. Instrukcja dotycząca przygotowania produktu leczniczego do stosowania i usuwania jego pozostałości**

Brak szczególnych zaleceń.

**7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

Warszawskie Zakłady Farmaceutyczne Polfa S.A.  
ul. Karolkowa 22/24; 01-207 Warszawa

**8. NUMER(-Y) POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

1180  
R/1830

**9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU / DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA**

24.01.1986 r.  
09.09.1988 r.  
27.05.1999 r.  
01.07.2004 r.  
07.10.2004 r.  
06.06.2005 r.

**10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO**

2008 - 10 - 20

MINISTERSTWO ZDROWIA  
Departament Polityki Lekowej i Farmacji  
00-952 Warszawa  
ul. Miodowa 15