

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към РУ <u>К-2403</u> <u>0207</u> <u>2008</u>
Одобрено: <u>6/09.10.07</u>

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

ТЕНАКСУМ 1mg таблетки
TENAXUM® 1mg tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Рилменидин (INN) дихидроген фосфат (*Rilmenidine dihydrogen phosphate*)... 1,544 mg
(Количество, съответстващо на рилменидин) 1 mg

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични показания

Есенциална хипертония.

4.2. Дозировка и начин на приложение

- Препоръчаната доза е 1 таблетка дневно, приемана еднократно сутрин, преди първото хранене за деня.
- Ако след едномесечно лечение артериалното налягане не се контролира адекватно, дозата може да се увеличи до 2 таблетки дневно, разделени на два приема (една таблетка сутрин и една вечер) в началото на храненията.
- Поради добрите клинични резултати и добрата поносимост на ТЕНАКСУМ, лекарственият продукт може да се прилага при възрастни пациенти с артериална хипертония, включително и такива, страдащи от диабет.
- При бъбречна недостатъчност, ако креатининовият клирънс е по-висок от 15 ml/min, не се изисква промяна в дозировката.
- Лечението може да продължи през целия живот.

4.3. Противопоказания

- Свръхчувствителност към рилменидин или към някое от помощните вещества
- Тежка депресия
- Тежка бъбречна недостатъчност / креатининов клирънс < 15 ml/min /, като предпазна мярка поради липса на достатъчно данни.

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

- При пациенти, при които дозировката е 2 mg дневно и лечението трябва да бъде спряно, дозировката следва да бъде намалявана постепенно до 1 mg на ден за период от 3 дни и тогава лечението да се преустанови.



- Както при всички антихипертензивни лекарства, при пациенти с остри съдови заболявания /мозъчен инсулт, миокарден инфаркт/ лечението с ТЕНАКСУМ изисква периодично лекарско наблюдение.
- По време на лечението консумацията на алкохол не е препоръчителна.
- При бъбречна недостатъчност, ако креатининовият клирънс е по-висок от 15 ml/min, не се налага корекция на доза.
- Поради липса на документирани изследвания ТЕНАКСУМ не трябва да се предписва на деца.
- Поради наличието на лактоза този лекарствен продукт не трябва да се използва от пациенти с редки наследствени заболявания като непоносимост към галактоза, глюкозо-галактозна малабсорбция или Lарр лактазен дефицит.

4.5. Взаимодействия с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Не се препоръчва едновременно прилагане с МАО-инхибитори. Внимателно трябва да се комбинира с трициклични антидепресанти, тъй като в такъв случай антихипертензивната активност на ТЕНАКСУМ може частично да се антагонизира.

4.6. Бременност и кърмене

- **Бременност:** прилагането на ТЕНАКСУМ трябва да се избягва при бременни жени, въпреки че при опити с животни не са наблюдавани тератогенни и ембриотоксични ефекти.
- **Кърмене:** тъй като ТЕНАКСУМ се екскретира с кърмата, неговото прилагане не се препоръчва по време на кърмене.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини.

ТЕНАКСУМ има пренебрежимо влияние върху способността за шофиране и работа с машини.

Ако ТЕНАКСУМ се комбинира с лекарства, способни да намалят вниманието и способността за концентрация, то водачите на моторни превозни средства и операторите на машини трябва да бъдат предупредени за възможна поява на сънливост.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции са изброени по-долу, използвайки следната установена практика: много чести (>1/10); чести (>1/100, <1/10); нечести (>1/1,000, <1/100); редки (>1/10,000, <1/10,000); много редки (<1/10,000).

Сърдечни нарушения:

Чести: сърцебиене

Нарушения на нервната система:

Чести: безсъние, сънливост, тревожност, депресивен синдром, сексуални нарушения



Стомашно-чревни нарушения:

Чести: стомашна болка, сухота в устата, диария, гадене, констипация

Нарушения на кожата:

Чести: кожен обрив, пруритус

Нарушения на мускулно-скелетната система:

Чести: крампи

Съдови нарушения:

Чести: ортостатична хипотония, горещи вълни, студени крайници, оток

Общи нарушения:

Чести: астения, умора при усилие

4.9. Предозиране

Съществуват малко данни за предозиране с рилменидин. В случай на предозиране очаквани симптоми са значителна хипотония и нарушена бдителност.

Могат да се използват симпатомиметици в допълнение на симптоматичното лечение.

ТЕНАКСУМ е слабо диализируем.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

АНТИХИПЕРТЕНЗИВЕН ПРОДУКТ

/ CO2AC: сърдечносъдова система /

- ТЕНАКСУМ е оксазолиново производно с антихипертензивни свойства, действа селективно върху имидазолиновите рецептори Λ_1 на вазомоторните центрове в продълговатия мозък, в периферията и особено в бъбреците. Свързването на рилменидин към имидазолиновите рецептори Λ_1 инхибира симпатомиметичната активност на две нива – в продълговатия мозък и периферията, като води до намаляване на артериалното налягане.

- ТЕНАКСУМ предизвиква дозо-зависимо понижаване на артериалното налягане при различни модели на нормотензивни и хипертензивни животни. Този ефект е потвърден при хипертензивни пациенти.

- ТЕНАКСУМ предизвиква дозо-зависимо понижаване на систоличното и диастоличното артериално налягане при легнало и изправено положение. Антихипертензивната **ефикасност** на ТЕНАКСУМ прилаган в терапевтични дози / 1 mg дневно в един прием или 2 mg дневно в два приема / при лека и умерена хипертония е доказана при двойно слепи проучвания при използване срещу плацебо и референтни препарати. Тази **ефикасност** продължава през



целия 24-часов период и по време на физически усилия. Тези резултати са потвърдени при продължителни проучвания, без да се наблюдава настъпване на толерантност.

- В терапевтични дози ТЕНАКСУМ не оказва влияние върху сърдечната дейност, не предизвиква задръжка на вода и натрий и не нарушава метаболитното равновесие:

- ТЕНАКСУМ поддържа значителна антихипертензивна активност 24 часа след приемането му, при което се намалява тоталното периферно съдово съпротивление без промяна на сърдечния дебит. Не се променят контрактилитета и електрофизиологичните индекси на сърцето.
- ТЕНАКСУМ не оказва влияние върху регулаторните механизми към ортостатизма, даже при пациенти в напреднала възраст, както и върху физиологичното приспособяване на сърдечната честота към физическо натоварване.
- ТЕНАКСУМ не предизвиква промени в бъбречния кръвоток, гломерулната филтрация или филтрационната фракция.
- ТЕНАКСУМ не влияе върху регулацията на глюкозата, включително на тази при инсулино-зависим или независим диабет и не повлиява показателите на липидната обмяна.

5.2. Фармакокинетични свойства

Резорбция:

Резорбцията е:

- бърза: максималната плазмена концентрация / 3.5 ng/ml / се достига 1.5 до 2 часа след приемане на еднократна доза от 1 mg ТЕНАКСУМ.
- цялостна: абсолютната бионаличност е 100 %; няма ефект на първопасажно преминаване през черния дроб.
- постоянна: няма значими междуиндивидуални различия; едновременното приемане на храна не променя бионаличността; при препоръчаните терапевтични дози няма вариация в степента на резорбция.

Разпределение:

Свързването с плазмените протеини е по-малко от 10%. Обемът на разпределение 5 l/kg.

Метаболизъм:

ТЕНАКСУМ слабо се метаболизира. В урината се откриват следи от метаболити, резултат от хидролизата или окислението на оксазолиновия пръстен. Тези метаболити са лишени от алфа2-агонистична активност.

Екскреция:

ТЕНАКСУМ се елиминира предимно през бъбреците: 65 % от приложената доза се екскретират непроменени с урината. Бъбречният клирънс представлява две трети от общия клирънс. Времето на полуживот е 8 часа. Приетата доза и многократното прилагане на продукта не изменят този параметър. Фармакологичното действие е по-продължително, значим антихипертензивен ефект се поддържа до 24 часа след приемането на лекарството при пациенти с хипертония, лекувани с дневна доза от 1 mg.



Многократно прилагане:

Steady state се достига след третия ден; при десетдневно проучване са установени постоянни стойности на плазмените нива.

Продължително контролиране на плазмените нива:

Плазмените концентрации на ТЕНАКСУМ остават стабилни при пациенти с хипертония, лекувани в продължение на две години.

При пациенти в напреднала възраст:

Фармакокинетични проучвания при пациенти на възраст 70 години или повече показват, че времето на полуживот е 13+/-1 часа.

При пациенти с чернодробна недостатъчност:

Времето на полуживот е 12+/-1 часа.

При пациенти с бъбречна недостатъчност:

Тъй като основният път на екскреция е бъбречният, при пациенти с бъбречна недостатъчност се наблюдава забавяне на елиминирането, което се съотнася към креатининовия клирънс. При пациенти с тежка бъбречна недостатъчност /креатининов клирънс < 15 ml/min/ времето на полуелиминиране е около 35 часа.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Максималната сублетална доза прилагана на гризачи е била около 4000 до 5500 пъти по-голяма от терапевтичната орална доза при хора. Симптомите на интоксикация са били преди всичко от страна на централната нервна система, като гърчове, които са били наблюдавани при прилагане на близки до леталните или летални дози.

При проучвания с многократно дозиране върху гризачи, кучета и маймуни, не са получени доказателства за увреждане функцията на екскреторните органи или патологични изменения от страна на други органи при прилагане на препарата в доза 1 mg / kg дневно, съответно в 30 пъти по-висока доза от оралната терапевтична доза при хора.

Прилаган в дози, 250 пъти по-високи от оралната терапевтична доза при хора, ТЕНАКСУМ не представлява ембриотоксичен / тератогенен риск.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Колоиден силициев двуокис, лактоза, магнезиев стеарат, микрокристална целулоза, парафин, натриева карбоксиметилова скорбяла, талк, бял пчелен восък.

6.2. Несъвместимости

Неприложимо

6.3. Срок на годност



2 години.

6.4. Специални условия на съхранение

Да се съхранява при температура под 25°C.

6.5. Данни за опаковката.

Картонена кутия с PVC/алуминиеви блистери.
Кутия от 30 таблетки.

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

LES LABORATOIRES SERVIER
22 rue Garnier
92200 Neuilly-sur-Seine
Франция

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР: 9600211

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ / ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО
27/11/2002

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА
06.2008

