

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА SECTRAL®

1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ SECTRAL

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Лекарствено вещество в една таблетка:

Acebutolol 400 mg

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филм-таблетки

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. ПОКАЗАНИЯ

- Артериална хипертония;
- Профилактика на пристъпи на стабилна стенокардия (стенокардия при усилие);
- Продължително лечение след миокарден инфаркт;
- Лечение на ритъмни нарушения: суправентрикуларни (тахикардии, предсърдно мъждене и трептене, AV-тахикардия) и вентрикуларни (камерна екстрасистолия, камерна тахикардия).

4.2. ДОЗИРОВКА И НАЧИН НА УПОТРЕБА

Артериална хипертония: обичайната дневна доза е 400 mg, назначена за предпочитане еднократно сутрин или в два приема сутрин и вечер. Дозата може да бъде увеличена в случай на тежка хипертония.

Профилактика на пристъпи на стенокардия при усилие, тахиаритмии: дневната доза може да варира от 400 до 800 mg, като се започва с ниска доза и постепенно се адаптира, съобразно клиничната картина и ЕКГ.

Продължително лечение след миокарден инфаркт: желателно е лечението със Sectral да започне между 3 и 21 ден след острия миокарден инцидент, дозировката е 400 mg дневно.

4.3. ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- свръхчувствителност към ацебутолол или към някое от помощните вещества, включени в състава на продукта;
- астма и хронична обструктивна белодробна болест (ХОББ) - тежки форми;
- неконтролирана с лечение сърдечна недостатъчност;
- кардиогенен шок;
- атрио-вентрикуларен блок – втора и трета степен;
- стенокардия на Prinzmetal (при чисти форми и когато е монотерапия)

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-6792/30.01.07	
03.12.02/680	дмевинт.



- болест на синусовия възел (включително сино-атриален блок);
- брадикардия (<45-50 удара в минута);
- феномен на Raynaud и тежки форми на периферни артериални нарушения;
- нелекуван феохромоцитом;
- хипотония;
- анамнеза за анафилактични реакции.

4.4. СПЕЦИАЛНИ ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ И ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ ЗА УПОТРЕБА

Лечението със Sactal при пациенти със стенокардия никога не се прекратява рязко: внезапното спиране може да доведе до тежки ритъмни нарушения, миокарден инфаркт или внезапна смърт. Дозата трябва да се намалява постепенно, в продължение на 1-2 седмици, като в случай на необходимост се започва субституиращо лечение, за да се избегне влошаване на стенокардията.

Sactal може да се използват само при леките форми на астма и ХОББ в ниска начална доза. Препоръчва се провеждане функционално изследване на дишането преди започване на лечението. В случай на поява на пристъп по време на лечението може да се използват бета-миметични бронходилататори. При контролирана с лечение сърдечна недостатъчност, в случай на нужда, Sactal може да се назначи в много ниски дози, които постепенно се покачват и то в условия на стриктно лекарско наблюдение.

Ако сърдечната честота падне под 50-55 удара в минута в покой и ако пациентът показва симптоми на брадикардия, дозата трябва да бъде намалена.

Имайки предвид негативната дромotropна активност на Sactal, предписването му при пациенти с атрио-вентрикуларен блок I степен трябва да става с повишено внимание.

Sactal може да увеличи честотата и продължителността на пристъпите при пациенти, страдащи от стенокардия на Prinzmetal. Употребата на бета I кардиоселективен бета блокер се допуска при леки форми и при условие, че в лечението е включен вазодилататор.

При пациенти, страдащи от заболявания на периферните артерии (болест или синдром на Raynaud, хронични или облитериращи артериити или артериопатии на долните крайници) Sactal може да доведе до влошаване на състоянието.

Употребата на Sactal при лечение на хипертония, дължаща се на феохромоцитом, който се лекува, изисква стриктно наблюдение на артериалното налягане.

В случаите на бъбречна недостатъчност е необходимо дозата да се адаптира към бъбречната функция, достатъчно е да се следи сърдечната честота и да



се намалява дозата при поява на екстремна брадикардия (<50-55 уд/мин в покой).

Необходимо е пациентите с диабет да бъдат предупредени да засилят контрола на кръвно-захарните си нива в началото на лечението. Началните симптоми на хипогликемия (по специално тахикардията, треперенето и потенето) могат да бъдат маскирани от Sectral.

Възможно е влошаване на псориазиса при употреба на Sectral. В такива случаи неговото назначаване трябва да бъде внимателно преценено.

При пациенти, предразположени към тежки анафилактични реакции, независимо от причината им (вкл. към йодо-контрастни продукти, флуктафенин или в хода на десенсибилизираща терапия), лечението със Sectral може да доведе до влошаване на реакцията и до резистентност към лечение с обичайни дози адреналин.

При обща анестезия е необходимо анестезиологът да бъде информиран, че пациентът е на лечение със Sectral. Ако се прецени, че спирането на лечението е необходимо, постепенното спиране в рамките на 48 часа може да се счита достатъчно за възвръщане на чувствителността към катехоламините.

Лечението със Sectral не може да бъде преустановено:

- При пациенти с коронарна недостатъчност е препоръчително лечението със Sectral да продължи до интервенцията, поради рисковете, които носи рязкото спиране на бета-блокериите.
- В случай на спешност или на невъзможност за спиране на Sectral, пациентът трябва да бъде подложен на премедикация с атропин. Анестезията трябва да се прави с лекарствени продукти с възможно най-слабо кардиодепресивно действие и кръвозагубите трябва да бъдат съевременно компенсирани.

Sectral може да маскира кардиоваскуларните симптоми на тиреотоксикозата.

Вниманието на спортистите трябва да е насочено към факта, че това лекарство съдържа активна съставка, способна да предизвика позитивиране на тестовете, които са включени в антидопинговия контрол.

При новородени, чиито майки са лекувани със Sectral, действието на последния продължава дни след раждането и се проявява в брадикардия, респираторни проблеми и хипогликемия, но най-често това е без клинично значение. Все пак поради подтискане на компенсаторните кардиоваскуларни реакции е възможно да се стигне до сърдечна слабост, изискваща хоспитализация и реанимационни мерки (виж Предозиране), като се избягват обем заместващи разтвори.

В редки случаи е наблюдавана поява на антинуклеарни антитела, които само в изключителни случаи са били свързани с клинична изява на лупус-синдром и които са отзвучавали при спиране на лечението.



Лекарственият продукт съдържа *лактоза*, поради което е неподходящ при хора с лактазна недостатъчност, галактоземия или глюкозен/галактозен синдром на малабсорбция.

Поради наличието на *пшенично нишесте*, лекарственият продукт може да представлява опасност за хора с цьолиакия (глутенова ентеропатия).

4.5. ЛЕКАРСТВЕНИ И ДРУГИ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

Комбинации, които са противопоказани

При шок или хипотония, дължащи се на *флоктафенин* се наблюдава редуциране на компенсаторните кардиоваскуларни реакции от *Sectral*.

При съвместно приложение със *султоприд* е налице повишен риск от ритъмни нарушения с камерен произход и специално *torsades de pointes*.

Комбинации, които не се препоръчват

При едновременно лечение с *амиодарон* могат да се наблюдават нарушения на контрактилитета, на автоматизма и на провеждането (подтискане на компенсаторните симпатикови механизми).

Комбинации, изискващи повишено внимание

При приложение на *халогенирани инхалаторни анестетици* е налице редуциране на кардиоваскуларните компенсаторни реакции от *Sectral* (бета-адренергичното инхибиране може да бъде отстранено по време на интервенцията чрез бета-миметици). Като правило не се практикува спиране на лечението с бета-блокери и във всеки случай се избягва рязкото спиране на лечението. Необходимо е анестезиологът да е информиран за провежданото лечение.

При съвместно приложение с някои *калциеви антагонисти* (*бепридил*, *дилтиазем*, *верапамил*) са налице нарушения в автоматизма (екстремна брадикардия, синусов арест), нарушения на сино-атриалната и атрио-вентрикуларната проводимост и сърдечна слабост (синергични ефекти). Такава комбинация може да бъде назначавана само под строг клиничен и ЕКГ контрол, което е особено важно при пациенти в напреднала възраст или в началото на лечението. Комбинацията с калциеви антагонисти води до хипотония, сърдечна слабост при болни с латентна или неконтролирана сърдечна недостатъчност (поради негативния инотропен ефект на дихидропиридиновите производни, по-малко или повече изразена в зависимост от използвания продукт и възможност за сумиране с негативните инотропни ефекти на бета-блокерите). Лечението с бета-блокери може да намали рефлекторната симпатикова реакция, която се задейства в случаи на изразени хемодинамични нарушения.

Едновременна употреба с *антиаритмична лекарства* (*пропафенон* и клас Ia: *хинидин*, *хидрохинидин* и *дизопирамид*) води до нарушения в контрактилитета, автоматизма и проводимостта (подтискане на компенсаторните симпатикови механизми). В такива случаи се налага внимателно клинично и ЕКГ наблюдение.

Баклофен усилва антихипертензивния ефект на *Sectral*. Налага се наблюдение на артериалното налягане и адаптиране на дозировката на антихипертензивното лекарство в случай на необходимост.

В комбинация с *инсулин* и *сулфонамидни хипогликемици* могат да бъдат маскирани някои симптоми на хипогликемия: треперене и тахикардия. Пациентът трябва да бъде предупреден и особено в началото на лечението самонаблюдението на кръвно-захарните проби да бъде засилено.

При съвместно приложение се наблюдава завишаване на плазмените концентрации на *лидокаина* с възможно засилване на неврологични и сърдечни нежелани лекарствени реакции (намаляване на чернодробния метаболизъм на *лидокаина*). Необходимо е адаптиране дозата на *лидокаина*, клинично и ЕКГ наблюдение и евентуално проследяване на плазмените концентрации на *лидокаина* по време на лечението и след прекратяването му.

В случай на хипотензивен шок, дължащ се на *йодо-контрастни продукти*, *Sectral* намалява компенсаторните кардио-васкуларни реакции. Лечението трябва да се прекратява всеки път, когато предстои радиологично излагане. В случай на необходимост от продължаване на лечението с бета-блокър, лекарят трябва да разполага с подходящи средства за реанимация.

Комбинирано приложение с *такрим* води до риск от екстремна брадикардия (сумиране на брадикардните ефекти). Изисква се редовно клинично наблюдение.

Комбинации, които трябва да бъдат взети предвид

Едновременно прилагане с *НПВС* води до намаляване на антихипертензивния ефект (инхибиране на вазодилаторните простагландини от *НПВС* и задръжка на натрий при пиразолонови *НПВС*).

С *антидепресанти от имипраминов тип* и *невролептици* съществува риск от засилен антихипертензивен ефект и ортостатична хипотония (адитивен ефект).

Кортикостероидите и *тетракозактид* могат да доведат до намаляване на антихипертензивния ефект (натриева задръжка при кортикоидна терапия).

При комбинация с *мефлокин* съществува риск от брадикардия (сумиране на брадикардни ефекти).

4.6. БРЕМЕННОСТ И КЪРМЕНЕ

В клиниката до този момент няма съобщения за тератогенен ефект и резултатите от няколко контролирани проспективни проучвания с бета-блокери не са показали малформации при раждането.

Sectral може да бъде изписван, ако бременната се нуждае от него. В случай, че лечението продължи до раждането се препоръчва наблюдение на новороденото (сърдечна честота и гликемия в първите 3-5 дни).



При лечение със Sactal, кърменето е противопоказано, поради значително преминаване на лекарството в майчиното мляко (виж Фармакокинетични свойства).

4.7. ЕФЕКТИ ВЪРХУ СПОСОБНОСТТА ЗА ШОФИРАНЕ И РАБОТА С МАШИНИ

Не влияе върху способността за шофиране или работа с машини.

4.8. НЕЖЕЛАНИ ЛЕКАРСТВЕНИ РЕАКЦИИ

Често съобщавани нежелани лекарствени реакции са:

- астения;
- студенина в крайниците;
- брадикардии;
- болки в стомаха, гадене, повръщане;
- безсилие.

Рядко съобщавани нежелани лекарствени реакции са:

- забавяне на атрио-вентрикуларната проводимост или задълбочаване на съществуващ атрио-вентрикуларен блок;
- сърдечна недостатъчност;
- рязко спадане на кръвното налягане;
- бронхоспазъм;
- хипогликемия;
- синдром на Raynaud;
- влошаване на съществуващо клаудикацио интермитенс;
- различни кожни прояви, включително псориазоподобни обриви или обостряне на псориазис;
- в изключителни случаи имуно-алергични пулмопатии.

4.9. ПРЕДОЗИРАНЕ

В случаи на екстремна брадикардия или хипотония се предприема венозно приложение на: атропин, 1-2 mg болус и глюкагон в дози 10 mg, бавен болус, последвано при нужда от перфузия от 1-10 mg/h.

Ако все още е необходимо се прави или бавна инжекция изопреналин в доза 15 до 85 µg, която евентуално се повтаря като общото количество не бива да надхвърля 300 µg изопреналин или добутамин 2,5 до 10 µg/kg/min.

В случай на сърдечна декомпенсация при новородени, чиито майки са лекувани с бета-блокери се прави глюкагон в доза 0.3 µg/kg. Прилагат се изопреналин и добутамин: обикновено във високи дози и продължително време, което изисква специализирано наблюдение.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. ФАРМАКОДИНАМИЧНИ СВОЙСТВА

Селективен бета-блокер.



Ацебутололът се характеризира с три основни фармакологични свойства:

- бета 1 селективна бета-блокираща активност;
- антиаритмично действие;
- частична агонистична активност (средностепенна вътрешна симпатомиметична активност).

5.2. ФАРМАКОКИНЕТИЧНИ СВОЙСТВА

Абсорбция:

Приложен перорално ацебутололът се абсорбира бързо и почти напълно. Все пак ефектът на първо преминаване през черния дроб е от значение и бионаличността е около 40%. Върхови плазмени концентрации се достигат за 2-4 часа приблизително.

Метаболизъм:

По-голямата част от ацебутолола се метаболизира в черния дроб до N-ацетилиран дериват – диацетолол, който е активен метаболит. Този метаболит достига върхови плазмени концентрации за около 4 часа, като плазмените концентрации на диацетолол са двойно по-високи от тези на ацебутолола.

Разпределение:

Свързването с плазмените протеини е слабо – 9-11% за ацебутолол и 6-9% за диацетолол.

Елиминиране:

Ацебутололът и диацетололът се екскретират основно през бъбреците.

Рискови групи пациенти

Бъбречна недостатъчност

При бъбречна недостатъчност времето на полуживот на ацебутолола и още повече на диацетолола се увеличават. Наблюдава се значима зависимост между клирънса на креатинина и реналния клирънс на диацетолола.

При двукратно дневно дозиране при тези пациенти е налице риск от акумулиране. Необходимо е намаляване на дозите и внимателно клинично наблюдение.

Пациенти в напреднала възраст

Физиологичното намаление на бъбречната функция може да доведе до увеличение на времето на полуживот на ацебутолола и диацетолола.

Бременност

Ацебутололът преминава през плацентата. Средното съотношение на концентрациите в кръвта на пъпната връв/майчината кръв на ацебутолола и неговия активен метаболит диацетолола са около 1.6 при дози от 200 до 400 mg. Максимални концентрации за ацебутолола се наблюдават 4-5 часа след последния прием, а за диацетолола 5-7 часа след последния прием.

Кърмене

Ацебутололът се екскретира в майчиното мляко. Концентрацията на ацебутолол в майчиното мляко е максимална между 4 и 6 часа след приема.



Средното съотношение на концентрациите в майчиното мляко/майчината кръв варират от 4 до 5,5 за дози от 200 и 400 mg респективно. За диацетолола това съотношение варира между 3 и 4 часа, като максималната концентрация се наблюдава 7 часа след приема на от 200 mg и 12 часа след прием на 400 mg.

5.3. ПРЕДКЛИНИЧНИ ДАННИ ЗА БЕЗОПАСНОСТ

Проучвания върху животни не са показали тератогенен ефект. При отсъствие на тератогенен ефект при животните, не се очаква поява на малформации при хора.

На практика до сега, веществата, които предизвикват малформации при хора, показват тератогенност при контролирани проучвания върху 2 животински вида.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. СПИСЪК НА ПОМОЩНИТЕ ВЕЩЕСТВА

Lactose monohydrate

Wheat starch

Talc

Silica colloidal anhydrous

Povidone K25

Magnesium stearate

Таблетна обвивка

Hypromellose

Polyoxyethylene glycol 20000

6.2. ФИЗИКО-ХИМИЧНИ НЕСЪВМЕСТИМОСТИ

Не са известни.

6.3. СРОК НА ГОДНОСТ

4 (четири) години

6.4. СПЕЦИАЛНИ УСЛОВИЯ НА СЪХРАНЕНИЕ

На сухо и защитено от светлина място, при температура под 25⁰С.

6.5. ДАННИ ЗА ОПАКОВКАТА

По 10 таблетки в блистер от PVC/алуминиево фолио.

По 3 блистера в една опаковка.

6.6. ПРЕПОРЪКИ ПРИ УПОТРЕБА

Продуктът не трябва да се употребява след изтичане срока на годност, указан на опаковката.

Прилага се по лекарско предписание.



7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Aventis Pharma S.A. 20 Avenue Raymond Aron, 92165 Antony Cedex, France.
Произведено от Балканфарма-Дупница АД, ул.Самоковско шосе № 3, 2600,
Дупница, България по лиценз на **Aventis Pharma S.A. France.**

**8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР В РЕГИСТЪРА ПО ЧЛ. 28 ОТ
ЗЛАХМ**

**9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА/
ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ
ПРОДУКТ**

Протокол № 460/06.04.83г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

юли, 2002 г.

