

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

| | |
|--|-----------------|
| ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОВАТА | |
| Кратка характеристика на продукта - Приложение 1 | |
| Към Рег. № | 9900124/26 |
| Разрешение № | BG/MK/MK-4546-7 |
| Одобрение № | 08-04-2019 |

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Физиотенс 0,2 mg филмирани таблетки
Физиотенс 0,4 mg филмирани таблетки
Physiotens 0,2 mg film-coated tablets
Physiotens 0,4 mg film-coated tablets

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Филмиран и таблетки за перорално приложение, съдържащи 0,2 или 0,4 mg моксонидин (moxonidine).
За пълния списък на помощните вещества, моля виж т. 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка

Физиотенс 0,2 mg - кръгли, конвексни светло-розови филмирани таблетки с надпис 0,2 от едната страна

Физиотенс 0,4 mg - кръгли, конвексни червени филмирани таблетки с надпис 0,4 от едната страна

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Физиотенс е показан за лечение на хипертония.

4.2 Дозировка и начин на употреба

Обичайната начална доза Физиотенс е 0,2 mg дневно с максимална дневна доза от 0,6 mg, приета като две отделни дози. Максималната еднократна доза, която може да се приема е 0,4 mg. Дневната доза се определя съобразно индивидуалния отговор на пациента.

Физиотенс може да се приема с или без храна.

Пациенти с бъбречно увреждане

При пациенти с умерено до тежко бъбречно увреждане началната доза е 0,2 mg дневно. Ако е необходимо и се понася добре, дозата може да бъде увеличена до 0,4 mg дневно при пациенти с умерено бъбречно увреждане и до 0,3 mg дневно при пациенти с тежко бъбречно увреждане (вж. точка 4.4).

При пациенти на хемодиализа началната доза е 0,2 mg дневно. Ако е необходимо и се понася добре, дозата може да бъде увеличена до 0,4 mg дневно.

Педиатрична популация

Физиотенс не се препоръчва за употреба при деца и юноши под 18-годишна възраст поради липса на данни за ефикасност и безопасност.

4.3 Противопоказания

Физиотенс е противопоказан при пациенти с:

- свръхчувствителност към активната субстанция или към някое от помощните
- синдром на болния синусов възел
- брадикардия (сърдечна честота в покой <50 удара/минута)
- AV - блок 2-ра и 3-та степен
- сърдечна недостатъчност.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Докладвани са постмаркетингови случаи на различни степени AV блок при пациенти на лечение с Физиотенс. Въз основа на тези доклади, ролята на Физиотенс в забавяне на атрио-вентрикуларното провеждане не може да се изключи напълно. Следователно се препоръчва повишено внимание при



лечение на пациенти с възможна предразположеност за развитие на AV блок. Когато Физиотенс се използва при пациенти с AV блок първа степен, трябва да се положат специални грижи за избягване на брадикардия. Физиотенс не трябва да се използва при висока степен на AV блок (вж. точка 4.3).

Когато Физиотенс се прилага при пациенти с тежка коронарна болест или нестабилна стенокардия е необходимо повишено внимание поради факта, че има ограничен опит с тази пациентска популация.

Препоръчва се повишено внимание при приложение на Физиотенс при пациенти с бъбречно увреждане, тъй като той се отделя предимно през бъбреците. При тези пациенти се препоръчва внимателно титриране на дозата, особено в началото на лечението.

Лечението трябва да започне с 0,2 mg дневно и да се повиши до максимум 0,4 mg дневно, при пациенти с умерено бъбречно увреждане (GFR > 30 ml/min, но < 60 ml/min) и максимално 0,3 mg дневно, при пациенти с тежко бъбречно увреждане (GFR < 30 ml/min), ако е клинично показан и се понася добре.

Ако Физиотенс се използва в комбинация с β -блокери и двете лечения трябва да се прекратят, първо трябва да се спре приемът на β -блокери, а след няколко дни - и този на Физиотенс.

До сега не е наблюдаван re-bound ефект върху кръвното налягане след прекратяване на лечението с Физиотенс. Въпреки това, не се препоръчва рязкото спиране на терапията. Дозата трябва да се намалява постепенно за период от две седмици.

Пациенти с редки наследствени проблеми на галактозна непоносимост, Lapp лактазна недостатъчност или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат този лекарствен продукт.

4.5 Взаимодействия с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействия

Едновременното приложение на Физиотенс с други антихипертензивни лекарства води до адитивен ефект.

Тъй като трицикличните антидепресанти могат да намалят ефективността на централно-действащи антихипертензивни лекарствени средства, не се препоръчва трицикличните антидепресанти да се приемат едновременно с Физиотенс.

Физиотенс може да засили седативния ефект на трицикличните антидепресанти (да се избягва едновременното предписване), транквиланти, алкохол, седативи и хипнотици.

Физиотенс умерено усилва нарушените когнитивни функции при пациенти, приемащи лоразепам. Физиотенс би могъл да засили седативния ефект на бензодиазепини при едновременен прием.

Физиотенс се екскретира чрез тубуларната екскреция. Взаимодействието с други вещества, които се екскретират по същия начин, не може да бъде изключено.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Няма подходящи данни за използването на Физиотенс при бременни жени. Изпитванията при животни показват ембриотоксичен ефект (вж т. 5.3.). Потенциалният риск при хората е неизвестен. Физиотенс не трябва да се прилага по време на бременност, освен при категорична необходимост.

Кърмене

Физиотенс се отделя в майчиното мляко и следователно не трябва да се прилага по време на кърмене. Ако лечението с Физиотенс е абсолютно необходимо, кърменето трябва да се спре.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са проведени проучвания върху способността за шофиране и работа с машини, особено с повишена сънливост и замаяност. Това трябва да се има предвид при изпълнението на тези дейности.



4.8 Нежелани лекарствени реакции

Най-често съобщаваните нежелани реакции при прием на Физиотенс са сухота в устата, замаяност, обща отпадналост и сънливост. Тези симптоми често намаляват след първите няколко седмици от лечението.

Нежелани лекарствени реакции по системно-органни класове (наблюдавани по време на плацебо-контролирани клинични изпитвания с n=886 пациенти, лекувани с Физиотенс, съгласно честотата на поява по-долу):

| Системна органна класификация | Много чести (≥10) | Чести (≥1/100 до <1/10) | Нечести (≥1/1000 до <1/100) |
|---|-------------------|--|----------------------------------|
| Психични нарушения | | Безсъние | Нервност |
| Нарушения на нервната система | | Главоболие*, замаяност, вертиго, сънливост | Синкоп* |
| Нарушения на ухото и лабиринта | | | Тинитус |
| Сърдечни нарушения | | | Брадикардия |
| Съдови нарушения | | | Хипотония*, (вкл. остростатична) |
| Стомашно-чревни нарушения | Сухота в устата | Диария, гадене, повръщане, диспепсия | |
| Нарушения на кожата и подкожната тъкан | | Кожен обрив, сърбеж | Ангиоедем |
| Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан | | Болки в гърба | Болки във врата |
| Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение | | Астения | Едем |

*Няма повишение в честотата, в сравнение с плацебо

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване на употреба на лекарствения продукт е важно. То позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез национална система за съобщаване.

Изпълнителна агенция по лекарствата

ул. „Дамян Груев“ № 8

1303 София

Тел.: +35 928903417

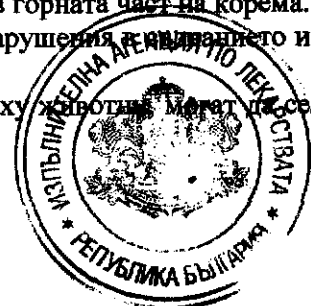
уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

Симптоми при предозиране

Има съобщения за някои случаи на предозиране, при погълната доза до 19,6 mg без фатален изход. Съобщените признаци и симптоми включват: главоболие, седация, сънливост, хипотония, замаяност, обща отпадналост, брадикардия, сухота в устата, повръщане, умора и болки в горната част на корема. В случай на тежко предозиране се препоръчва внимателно наблюдение за нарушения на дишането и потискане на дишането.

Като допълнение, според данните от няколко изпитвания с високи дози върху животни могат да се появят преходна хипертония, тахикардия и хипергликемия.



Лечение на предозирането

Не е известен специфичен антидот. В случаи на хипотония може да се обмисли поддържане на циркулацията чрез прилагане на течности и допамин. Брадикардията може да бъде лекувана с атропин.

α -рецепторните антагонисти биха могли да намалят или да премахнат парадоксалния хипертензивен ефект на свръхдозата Физиотенс.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Имидазолинови рецепторни агонисти, моксонидин

АТС класификация: C02AC05

Механизъм на действие

При различни животински модели Физиотенс се проявява като ефикасно анти-хипертензивно средство. Налични експериментални данни показват, че мястото на анти-хипертензивното действие на Физиотенс е централната нервна система (ЦНС). В мозъчния ствол, Физиотенс стимулира избирателно имидазолиновите рецептори. Тези чувствителни към имидазолин рецептори са съсредоточени в ростралната вентро-латерална медула, място критично за централния контрол на периферната симпатиковата нервна система. Стимулирането на имидазолиновите рецептори води до намаляване на симпатиковата активност и понижава кръвното налягане.

Фармакодинамични ефекти

Физиотенс се различава от други симпатиколитични антихипертензивни лекарствени средства по това, че проявява много слаб афинитет към известни (α_2 -адреноцептори, в сравнение с имидазолиновите рецептори. На този слаб афинитет към α_2 -адреноцепторите се дължи ниската степен на нежелани реакции на седация и сухота в устата при лечение с Физиотенс.

Клинична ефикасност и безопасност

При хора, Физиотенс води до намаляване на системната съдова резистентност и последващо понижаване на артериалното налягане. Антихипертензивният ефект на Физиотенс е демонстриран при двойно-слепи, плацебо-контролирани рандомизирани проучвания. Публикуваните данни показват, че при хипертонични пациенти с лява вентрикуларна хипертрофия (LVH), за едно и също намаляване на кръвното налягане, при употребата на ангиотензин II антагонист едновременно с Физиотенс се достига по добра регресия на лявата вентрикуларна хипертрофия сравнено със свободната комбинация от тиазид и инхибитор на калциевите канали.

В терапевтично проучване с двумесечна продължителност Физиотенс подобрява индекса на чувствителност на инсулина с 21% в сравнение с плацебо при пациенти със затлъстяване, инсулинова резистентност и умерена хипертония.

Педиатрична популация

Физиотенс не се препоръчва за употреба при деца и юноши под 18-годишна възраст поради липса на данни за ефикасност и безопасност.

5.2 Фармакокинетични свойства

Резорбция

След перорален прием Физиотенс се резорбира бързо (t_{max} около 1 час) и почти напълно от горния гастро-интестинален тракт. Абсолютната му бионаличност е около 88%, показваща незначителен first-pass метаболизъм. Приемът на храна не повлиява фармакокинетиката на Физиотенс.

Разпределение

Свързането с плазмените протеини, определено ин витро, е около 7,2%.



Биотрансформация

В проби от човешка плазма се идентифицира само дехидрогениран моксонидин. Фармакодинамичната активност на дехидрогениран моксонидин е около 1/10 в сравнение с моксонидин.

Елиминиране

За 24 часов период, седемдесет и осем процента от общата доза се екскретира в урината като моксонидин и 13% - като дехидрогениран моксонидин. Други незначителни метаболити, които се намират в урината са около 8% от дозата. Под 1% се елимина през изпражненията. Средните полуживоти на моксонидин и неговите метаболити са около 2,5 и 5 часа, респективно.

Фармакокинетика при пациенти с хипертония

При тази група пациенти не са наблюдавани фармакокинетични промени в сравнение с фармакокинетиката при здрави доброволци.

Фармакокинетика при пациенти в старческа възраст

Наблюдавани са промени във фармакокинетиката, свързани с възрастта и те най-вероятно са поради намалена метаболитна активност и/или леко по-висок бионаличност при пациенти в старческа възраст. Въпреки това, тези разлики не са приети за клинично значими.

Фармакокинетика при деца

Тъй като Физиотенс не се препоръчва за употреба при деца, не са провеждани проучвания в тази субпопулация.

Фармакокинетика при бъбречни увреждания

Елиминирането на Физиотенс е значимо свързано с креатининовия клирънс. При пациенти с умерено увредена бъбречна функция (GFR 30-60 ml/min), равновесните плазмени концентрации и крайният полуживот са около 2 пъти и 1,5 пъти по-високи, съответно, в сравнение с пациенти с нормална бъбречна функция (GFR>90 ml/min) При пациенти с тежко бъбречно увреждане (GFR<30 ml/min) равновесните концентрации и крайният полуживот са около 3 пъти по-високи. Не е наблюдавано неочаквано натрупване на продукта след многократно дозиране. При пациенти с краен стадий на увреждане (GFR<10 ml/min) на хемодиализа, AUC и крайният полуживот са съответно 6 пъти и 4 пъти по-високи, съответно, сравнено с хипертонии с нормална бъбречна функция. При пациенти с умерено бъбречно увреждане максималните плазмени концентрации на Физиотенс са само 1,5-2 пъти по-високи.

Следователно, при пациенти с бъбречно увреждане дозата трябва да се титрира индивидуалните изисквания.

Физиотенс се елиминира в малка степен при хемодиализа.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Неклинични данни не показват специални заплахи за хора, базирайки се на конвенционални проучвания за безопасността, токсичност при многократен прием, карциногенен потенциал и токсичност върху репродукцията.

Изследвания при животни са показали ембрио-токсични ефекти при токсични дози за майката. Изследвания върху репродуктивната токсичност не са показали ефект върху фертилността и тератогенен потенциал.

Ембрио-токсикологични ефекти са наблюдавани при плъхове при дози от и над 9 mg/kg/дневно и при зайци при дози над 0,7 mg/kg/дневно. При пери- и пост-натално проучване при плъхове е наблюдавано влияние върху развитието и виталността при дози от и над 3 mg/kg/дневно.



6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Лактоза монохидрат
Повидон К25
Кросповидон
Магнезиев стеарат
Хипромелоза
Етилцелулоза
Макрогол 6000
Талк
Червен железен оксид
Титанов диоксид

6.2 Несъвместимости

Няма

6.3 Срок на годност

Физиотенс 0,2 mg - 2 години
Физиотенс 0,4 mg - 3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Физиотенс 0,2 mg - да се съхранява при температура под 25°C.
Физиотенс 0,4 mg - да се съхранява при температура под 30°C

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Физиотенс 0,2 mg филмирани таблетки в PVC/PVDC/Al или PVC/Al блистерна опаковка по 14, 28 или 98 в кутия
Физиотенс 0,4 mg филмирани таблетки в PVC/PVDC/Al или PVC/Al блистерна опаковка по 14, 28 или 98 в кутия

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Mylan Healthcare GmbH
Freundallee 9A
30173 Hannover
Германия

8. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА ПАРАЛЕЛЕН ВНОС

“Беста Мед” ЕООД, ул. Кънчо Скорчев №8, 5350 Трявна, България

9. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Физиотенс 0,2 mg film-coated tablets - рег. № 9900124
Физиотенс 0,4 mg film-coated tablets - рег. № 9900126

10. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване: 23 януари 1991 г.
Дата на последно подновяване: 29 септември 2010 г.

11. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

08/2015

