

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Тиалера 12,5 mg филмирани таблетки
Tialera 12.5 mg film-coated tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка филмирана таблетка съдържа 12,5 mg тианептин натрий (tianeptine sodium).
За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка.
Светложълта, кръгла, двойноизпъкнала филмирана таблетка с диаметър от 7 mm.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични показания

Тиалера е показан за лечение на депресия.
Тиалера е показан за възрастни.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Препоръчваната дозировка е 12,5 mg 3 пъти дневно (сутрин, обед и вечер) преди хранене.

Не е необходима корекция на дозата при пациенти с алкохолна зависимост със или без цироза.

При пациенти над 70-годишна възраст и с бъбречна недостатъчност дозата трябва да бъде намалена на 2 таблетки дневно.

Употреба при деца и юноши:

Ефикасността и безопасността не са оценявани при индивиди на възраст под 18 години.

4.3. Противопоказания

- Свръхчувствителност към тианептин или към някое от помощните вещества;
- Едновременно прилагане на неселективни МАО-инхибитори.

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Самоубийство/мисли за самоубийство или клинично влошаване

Депресията е свързана с повишен риск от мисли за самоубийство, от самонараняване и от самоубийство. Този риск съществува чак до настъпване на значителна ремисия. Тъй като подобрението може да не настъпи през първата или последващите седмици от лечението, пациентите трябва да се наблюдават внимателно до настъпване на

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20110634
Разрешение №	21934 / 29. 04. 2013
Одобрение №	



подобрение. Според клиничния опит рискът от самоубийство може да се увеличи в ранните стадии на възстановяването.

Пациентите с анамнеза за суицидно поведение или онези, които проявяват в значителна степен склонност към самоубийство преди започване на лечението, са подложени на по-висок риск от мисли за самоубийство или от опити за самоубийство и трябва да се наблюдават внимателно по време на лечението. Мета-анализ на плацебо-контролирани клинични проучвания върху антидепресанти при възрастни с психиатрични заболявания показва повишаване (в сравнение с плацебото) на риска от суицидно поведение сред пациентите на възраст под 25 години, които използват антидепресанти. По време на лечението, особено в ранните стадии на лечение и след промяна на дозировката, пациентите и особено онези с висок риск, трябва да се наблюдават внимателно.

Пациентите (и лицата, които се грижат за тях) трябва да са предупредени за необходимостта да се наблюдават за всякакви признаци на клинично влошаване, суицидно поведение или мисли и за необичайни промени в поведението, както и за нуждата незабавно да се свържат с лекаря при поява на подобни симптоми.

- Пациентите с риск за самоубийство, особено в ранните стадии на лечението, трябва да се наблюдават внимателно.
- В случай на спешни оперативни процедури, пациентите трябва да се наблюдават внимателно през целия постоперативен период.
- Ако е необходима обща упойка, анестезиологът трябва да бъде информиран за прилагането на тианептин и да спре лечението 24 или 48 преди процедурата.
- При спешни случаи, операцията може да се извърши без междинен период на прочистване; трябва да се извърши периперативно наблюдение.
- Както при останалите психотропни лекарства, и при този продукт спирането на лечението не трябва да става изведнъж. Дозата трябва постепенно да се намали в продължение на 7 до 14 дни.
- В случай на анамнеза за зависимост от алкохол или лекарства/наркотици, трябва да се внимава особено много, за да се избегне увеличаването на дозата.
- Препоръчителните дози не трябва да се надвишават.

Едновременната употреба на МАО-инхибитори и тианептин е противопоказана, поради повишаване на риска от циркулаторен колапс, пароксизмална хипертония, хипертермия, конвулсии и смърт. С оглед на тези сериозни и понякога фатални взаимодействия с МАО-инхибитори и други антидепресанти, ако се приеме, че е необходимо лечение с МАО-инхибитори, приемът на тианептин трябва да се спре най-малко 15 дни преди прилагането на МАО-инхибиторите.

При тежка бъбречна недостатъчност трябва да се обмисли намаляване на дозата (вж. точка 4.2)

Употреба при деца и юноши на възраст под 18 години – тианептин не трябва да се използва за лечение на деца и юноши на възраст под 18 години. Суицидното поведение (опити за самоубийство и мисли за самоубийство) и враждебност (преобладаваща агресия, поведение на противопоставяне и гняв) при клиничните изпитвания са наблюдавани по-често сред деца и юноши, лекувани с антидепресанти в сравнение с тези, които са третирани с плацебо. Ако въпреки това, на базата на клиничната необходимост, се вземе решение за прилагане на лечението, пациентът трябва да се наблюдава внимателно за поява на суицидни симптоми. Освен това, няма данни за безопасност в дългосрочен план при деца и юноши по отношение на растежа, съзряването и когнитивното и поведенческо развитие.



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

Комбинации, които не се препоръчват:

- Тианептин не трябва да се използва с МАО-инхибитори поради риск от циркулаторен колапс, пароксизмална хипертония, хипертермия, конвулсии, смърт.
- Миансерин: поради антагонистичен ефект, наблюдаван в експериментални модели при животни.

4.6. Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Липсват адекватни данни от употребата на тианептин при бременни жени. Проучванията върху животни са недостатъчни по отношение на ефекта върху бременността и ембрионалното/феталното развитие. Потенциалният риск при хората е неизвестен. Тиалера не трябва да се използва по време на бременност.

Кърмене:

Тъй като няма специфично проучване за отделянето в кърмата на тианептин и трициклически антидепресанти, кърменето не се препоръчва по време на лечението.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Тиалера повлиява в малка степен способността за шофиране и работа с машини. При някои пациенти може да настъпи нарушение на психомоторната функция. Пациентите, които шофират или работят с машини трябва да бъдат предупредени да внимават във връзка с потенциалния риск от сънливост.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

По време на лечение с тианептин са наблюдавани следните нежелани лекарствени реакции. Те се класифицират според честотата на възникването им.

Много чести ($\geq 1/10$); **чести** ($\geq 1/100$ до $< 1/10$); **нечести** ($\geq 1/1\,000$ до $< 1/100$); **редки** ($\geq 1/10\,000$ до $< 1/1\,000$); **много редки** ($< 1/10\,000$), с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

Нарушения на метаболизма и храненето	Чести: анорексия
Психични нарушения	Чести: кошмарни сънища. Редки: лекарствена зависимост и пристрастяване, особено при пациенти под 50-годишна възраст, които имат анамнеза за пристрастяване към лекарства/наркотици или алкохол. С неизвестна честота: случаи на суицидни идеи и суицидно поведение се съобщават по време на лечение с тианептин или в ранните фази след



	прекратяване на лечението (вижте точка 4.4).
Нарушения на нервната система	Чести: безсъние, сомнолентност, световъртеж, главоболие, колапс, тремор.
Нарушения на очите	Чести: нарушено зрение.
Сърдечни нарушения	Чести: тахикардия, сърцебиене, екстрасистолни, прекордиална болка (болка в гърдите).
Съдови нарушения	Чести: горещи вълни.
Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения	Чести: диспнея.
Стомашно-чревни нарушения	Чести: суха уста, запек, коремна болка, гадене, повръщане, диспепсия, диария, газове, стомашни киселини
Нарушения на кожата и подкожната тъкан	Нечести: макулопапулозен или еритематозен обрив, сърбеж, уртикария.
Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан	Чести: болки в гърба, миалгия.
Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение	Чести: астения, чувство на заседнала в гърлото бучка.
	Интензивността и честотата на повечето нежелани лекарствени реакции намалява с течение на времето в хода на терапията и обикновено не води до прекратяване на лечението. В повечето случаи може да бъде трудно нежеланите лекарствени реакции на тианептин да се диференцират от обичайните соматични оплаквания на депресирания пациент.

Интензивността и честотата на повечето нежелани лекарствени реакции намалява с течение на времето в хода на терапията и обикновено не води до прекратяване на лечението.

В повечето случаи може да бъде трудно нежеланите лекарствени реакции на тианептин да се диференцират от обичайните соматични оплаквания на депресирания пациент.



4.9. Предозиране

В случаи на предозиране лечението трябва незабавно да се прекрати и пациентите трябва да бъдат внимателно наблюдавани.

Трябва да се приложат следните мерки:

- стомашна промивка;
- следене на сърдечни и жизнени показатели, бъбречна функция и метаболитни показатели;
- в случай на никакви клинични симптоми, трябва да се приложат симптоматични поддържащи мерки, и по-конкретно асистирано дишане, корекция на бъбречната и метаболитните функции.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: психоаналептики; други антидепресанти
АТС код: N06AX14

Тианептин е трицикличесен антидепресантен медикамент.

При проучвания върху животни са наблюдавани следните свойства на тианептин:

- повишаване на електрическата активност на пирамидалните клетки на хипокампа и ускорено възвръщане на активността му след функционално потискане.
- усиление на обратното захващане на серотонин в невроните на кората и хипокампа.
- за разлика от други трицикличесни антидепресанти, тианептинът усилюва обратното захващане на серотонина (5-HT) в невроните; този механизъм поставя под въпрос конвенционалните теории за депресията; в допълнение, тианептинът повишава мозъчния метаболизъм на допамина и намалява отделянето на ацетилхолин, но приносът на тези ефекти към антидепресантната ефикасност на тианептин не е изяснен.

При проучвания върху хора, тианептин показва:

- ефект върху нарушенията на настроението; тианептин заема междинно място между стимулиращите и анксиолитичните антидепресанти;
- видим ефект върху соматичните нарушения, и особено стомашно-чревните и свързаните с фобия и нарушение на настроението.

В допълнение, тианептин:

- няма ефект върху съня и бодърстването;
- няма ефект върху холинергичната система; (липса на антихолинергични събития).

Начало и продължителност:

- в случаи на депресия: 7 до 14 дни след перорално прилагане;
- в случаи на депресия с тревожност: 7 до 14 дни след перорално прилагане;
- в случаи на депресия при посталкохолна абстиненция: 4 до 8 седмици след перорално прилагане.



5.2. Фармакокинетични свойства

Абсорбция

Тианептин се абсорбира бързо и почти напълно (бионаличността е равна на 99%) в стомашно-чревния тракт и не е предмет на ефекта на първичното преминаване. Времето за достигане на максимална концентрация след перорално приложение на 12,5 mg е 1 до 2 часа. Степента на абсорбция не се влияе значително от храна и активното вещество може да се дава с храната за подобряване на спазването на лечението от пациентите.

Разпределение

Разпределението на тианептин в организма става бързо; средно времето на полуразпределение е около 0,7 часа. Разпределението е ограничено, като очевидният обем на разпределение е около 0,8 L/kg и е почти еднакво след венозно приложение. Времето на полуразпределение е 0,7 часа. Тианептин се свързва в значителна степен с плазмените белтъци (95% до 96%), предимно с албумина. При пациенти с хронична бъбречна недостатъчност поради високата концентрация на неестерифицирани мастни киселини, се наблюдава повишение на свободната му фракция.

Метаболизъм

Тианептин се метаболизира предимно чрез бета-окисление и (в по-малка степен) чрез N-деметиране в черния дроб. Може да се ангажират и други локализации (напр. плазмен, бъбречен метаболизъм).

Производното на пентаноевата киселина е основният активен метаболит (MC5), производното на пропионовата киселина (MC3) е неактивен метаболит, който се среща предимно в урината.

Биотрансформациите на тианептина не се медираат от цитохром P450.

Елиминиране

Тианептин се елиминира през бъбреците и през екстраренални пътища. Едва 8% от неметаболизираното активно вещество се елиминира през бъбреците; метаболитите се екскретират предимно в урината. Екскрецията през жлъчката представлява 15%. Тоталният клирънс от организма е 240 ml/минута.

Времето на полуелиминиране на оригиналното вещество е 2,5 до 3 часа, а това на активния метаболит MC5 е 7 до 8 часа.

Пациенти в напреднала и старческа възраст

Фармакокинетичните проучвания, проведени върху пациенти в напреднала и старческа възраст (над 70 години) при дългосрочно лечение с тианептин показват, че времето на полуелиминиране в тази популация е по-дълго, с 4 до 9 часа. В съответствие с това е необходима и корекция на дозата.

Нарушение на чернодробната функция

При пациенти с нарушена функция на черния дроб, алкохолна зависимост със или без цироза – фармакокинетичните показатели са непроменени.

Нарушение на бъбречната функция

Проучвания при пациенти с нарушена бъбречна функция показват, че времето на полуелиминиране на тианептин и метаболитите му се увеличава с 1 час. В съответствие с това е необходима и корекция на дозата.



5.3. Предклинични данни за безопасност

Няма допълнителни данни

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Ядро на таблетката:

манитол (E421)
царевично нишесте
хидроксипропилцелулоза (E463)
магнезиев стеарат

Филмово покритие:

хипромелоза (E464)
целулоза, микрокристална (E460)
стеаринова киселина (E570)
съполимер на метакриловата киселина
талк (E553b)
титаниев диоксид (E171)
триетил цитрат (E1505)
безводен колоидален силикагел
натриев хидроген карбонат (E500ii)
жълт железен оксид (E172)
натриев лаурилсулфат

6.2. Несъвместимости

Неприложимо

6.3. Срок на годност

36 месеца

6.4. Специални условия на съхранение

За блистери от PVC/PVdC/алуминий:
Да се съхранява под 25°C

За блистери от алуминий/алуминий: този лекарствен продукт не изисква специални условия за съхранение.

6.5. Данни за опаковката

Блистери от PVC/PVdC/алуминий,
Блистери от алуминий/алуминий
Количество в една опаковка:

15 филмирани таблетки
20 филмирани таблетки
28 филмирани таблетки
30 филмирани таблетки



60 филмирани таблетки
90 филмирани таблетки
100 филмирани таблетки
300 филмирани таблетки

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне

Неизползваният продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Alvogen IPCo S. à r.l
5, rue Heienhaff, L-1736 Senningerberg Люксембург

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

II-15559

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

31.10.2011

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

