

676/99.11.03 *Мед***КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА****1. Търговско име на лекарствения продукт****ATENOLOL LaborMed Pharma****2. Количествен и качествен състав :**

Всяка таблетка съдържа 100 mg atenolol

3. Лекарствена форма

Таблетки

4. Клинични данни**4.1. Показания****Хипертония**

Atenolol е ефикасен самостоятелно или в комбинация с други антихипертензивни средства, особено диуретици тиазиден-тип за лечение на артериалната хипертония.

Стенокардия, която се дължи на коронарна атеросклероза :

Atenolol е показан при продължително лечение на пациенти със стенокардия; той не е показан при остра криза.

Остър миокарден инфаркт

Atenolol е показан при лечение на хемодинамично стабилизирани пациенти с категоричен или подозиран остър миокарден инфаркт за намаляване на кардиоваскуларната смъртност. Лечението трябва да започне веднага, щом клиничното състояние на пациента позволява.

Тахиаритмии

Atenolol се прилага за лечение на тахиаритмии (суправентрикуларна тахикардия, мъждене, предсърдно трептене, надкамерни или камерни екстрасистолии).

4.2. Дозировка и начин на употреба**Хипертония**

Началната доза atenolol е 50 mg, приети като една таблетка дневно самостоятелно или прибавен към диуретична терапия. Пълният ефект от тази дозировка обикновено се наблюдава след една до две седмици. Ако не е постигнат оптимален резултат, дозата трябва да се увеличи на 100 mg, приети като 1 таблетка дневно. Увеличаването на дозата над 100 mg дневно не се прилага, защото не води до по-добър ефект.



Ангина пекторис (стенокардия)

Началната доза atenolol е 50 mg, приети като една таблетка дневно. Ако до една седмица не е постигнат оптимален ефект, дозата трябва да се увеличи на 100 mg, приети като 1 таблетка дневно. Някои пациенти се нуждаят от 200 mg веднъж дневно за постигане на оптимален ефект. 24 часов контрол с един път дневно дозиране се достига с даване на по-голяма доза от необходимата за постигане на незабавен максимален ефект. Максимален ранен ефект при изявен толеранс се получава с дози от 50 до 100 mg, но при тези дози ефектът за 24 часа е намален, достигайки средно около 50 до 75% от този, наблюдаван при перорална еднократна дневна доза от 200 mg.

Остър миокарден инфаркт

При пациенти с доказан остър миокарден инфаркт или със съмнение за такъв, лечението с atenolol интравенозно трябва да започне, колкото е възможно по-скоро веднага след пристигането на пациента в болницата и след констатиране на състоянието му. Пациент, който понася пълната интравенозна доза (10 mg), трябва да започне с atenolol таблетки от 50 mg 10 минути след последната интравенозна доза, последвана от друга таблетка от 50 mg перорално 12 часа по-късно. Съобразно с това, atenolol трябва да се дава орално или 100 mg веднъж дневно, или 50 mg два пъти дневно в продължение на 6-9 дни или до изписване от болницата.

Ако се появят брадикардия, хипотония или други нежелани лекарствени реакции, трябва да се прекрати даването на atenolol.

По-възрастни пациенти или пациенти с бъбречни увреждания :

Atenolol се отделя през бъбреците; в случай на тежко нарушена бъбречна функция, следващата доза трябва да бъде съобразена с това. Може също да се определи намаляване на дозата при пациенти в напреднала възраст, когато намалената бъбречна функция е физиологична последица от стареенето.

Незначително акумулиране на atenolol се получава, когато креатининовият клирънс падне под 35ml/min.1.73 m².

Натрупване на atenolol и удължаване на неговия полуживот са наблюдавани при пациенти с креатининов клирънс между 5 и 105 ml/min. Максималните плазмени нива са значително повишени при пациенти с креатининов клирънс под 30 ml/min.



Следващите максимални орални дози се препоръчват за хора в напреднала възраст и бъбречно увредени, поради тази причина :

Креатин. клирънс (ml/min/1.73 m ²)	Елиминиране на atenolol полуживот (часове)	Максимална доза
15 - 35	16 - 27	50 mg дневно
< 15	> 27	mg дневно

Пациентите на хемодиализа трябва да получават 50 mg перорално след всяка диализа; това трябва да се извършва в болнична обстановка, тъй като е възможно да се получи силно понижаване на артериалното налягане.

4.3. Противопоказания

Atenolol е противопоказан при синусова брадикардия, сърдечен блок втора или трета степен, кардиогенен шок и остра сърдечна недостатъчност, хипотония, метаболитна ацидоза, тежки нарушения на периферната артериална циркулация, синдром на болния синусов възел, нелекуван феохромоцитом, декомпенсирана сърдечна недостатъчност. Алергия към atenolol.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

Общо

При пациенти, които са на бета-блокери, трябва внимателно да се прецени преди да се назначи atenolol. Началната и следващите дози трябва да се приспособят в зависимост от клиничните наблюдения, включващи пулс и кръвно налягане. Atenolol може да влоши периферните артериални смущения.

Може да увеличи броя и продължителността на стенокардните пристъпи при болни с ангина на Prinzmetal, дължащи се на вазоконстрикция на коронарните артерии, предизвикана от противоположно действие на алфа-рецепторите.

Нарушена бъбречна функция

Лекарството трябва да се използва с повишено внимание при пациенти с нарушена бъбречна функция.

Сърдечна недостатъчност

Необходима е стимулация на симпатикуса за поддържане на кръвообръщението при болни с конгестивна сърдечна недостатъчност. Бета-блокадата води до потенциален риск



за бъдещо подтискане на миокардните съкращения и пресичане на последваща тежка недостатъчност.

При пациенти, които имат конгестивна сърдечна недостатъчност, контролирана с дигиталис и/или диуретици, atenolol трябва да се прилага внимателно (двата, заедно с дигиталис забавят предсърдно-камерната проводимост).

При пациенти без сърдечна недостатъчност в анамнезата, продължителното подтискане на миокарда с бета-блокери за период от време може, а в някои случаи и води до сърдечна недостатъчност.

Поради негативния ефект върху времето на провеждане, трябва да се прилага с повишено внимание при пациенти с I-ва степен сърдечен блок.

Прекратяване (спиране) на лечението с atenolol

Пациентите със заболяване на коронарните артерии, които се лекуват с atenolol трябва да се съветват да не прекратяват внезапно приложението на лекарството. След рязкото прекъсване на лечението с β -блокери се наблюдават тежки пристъпи на Angina pectoris, миокарден инфаркт, камерни аритмии. Последните две усложнения могат да се развият без предварително изостряне на ИБС. Както и при другите β -блокери, когато прекъсването на лечението е предварително планирано, болните трябва да бъдат внимателно наблюдавани и съветвани да ограничат физическата си активност. Ако след прекратяване на лечението с лекарствения продукт се наблюдава влошаване на ИБС и развитие на остър миокарден инфаркт, приложението му следва да бъде незабавно възстановено, поне временно. Тъй като коронарните заболявания протичат често безсимптомно, уместно е това да се спазва и при пациенти, приемащи atenolol за лечение на артериална хипертония.

Бронхоспастично заболяване

Пациенти с бронхоспастични заболявания обикновено не трябва да приемат бета-блокери. Поради своята относително β_1 -селективност atenolol може да се използва внимателно при пациенти с бронхоспастично заболяване, които не отговарят или не могат да понасят друго антихипертензивно лечение.



Анестезия и голямата хирургия

Не е препоръчително да се спрат бета-блокери преди операция при повечето пациенти.

Диабет и хипогликемия

Atenolol трябва внимателно да се използва при диабетици, ако се изисква прилагането на бета-блокаращ агент. Бета-блокери могат да маскират тахикардия, проявяваща се с хипогликемия, но други прояви като световъртеж, изпотяване, могат да не се проявят значително. В препоръчвани дози atenolol не потенцира инсулин-индуцирана хипогликемия и за разлика от неселективните бета-блокери не забавя възстановяването на нормалните стойности на кръвната захар.

Тиреотоксикоза

β -адренергичната блокада може да маскира определени клинични симптоми (тахикардия) на хипертиреозидизъм.

Рязкото прекъсване на лечението с atenolol може да ускори развитието на тиреотоксична криза. Затова болните със суспекция за хипертиреозидизъм трябва да се мониторира след прекратяване на лечението с β -блокери.

Алергии

Може да причини по-тежка реакция към редица алергени, когато се дава на пациенти с анамнеза за анафилактична реакция към такива алергени. Такива пациенти може да не отговорят на обичайната доза адреналин, използван за лечение на анафилактични реакции.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Катехоламин-освобождаващите лекарства могат да имат усилен ефект, когато се дават с β -блокери.

Калциевите антагонисти могат също така да имат усилен ефект, когато се дават с atenolol.

Бета-блокери съвместно с клонидин могат да доведат до риск от развитие на rebound хипертония, която може да се предизвика от спирането на клонидина. Ако двата лекарствени продукта са прилагани едновременно, бета-блокери трябва да бъде прекъснат няколко дни преди спирането на клонидина. Когато въвеждайки клонидин при лечение с бета-блокери, въвеждането на бета-блокери



трябва да бъде отложено с няколко дни, след като прилагането на клонидин е било спряно.

Едновременното прилагане на бета-блокери с дигиталисови гликозиди може да удължи времето за AV провеждане и да доведе до забавяне на пулса.

Анестетици, които причиняват миокардна депресия трябва изборително да бъдат избягвани при пациенти на бета-блокери. Да се избягват анестетици с известен отрицателен инотропен ефект. Хипотензивните ефекти на бета-блокерите могат да бъдат потенцирани от общите анестетици.

Изобщо няма клинично взаимодействие при аспирин и бета-блокерите при установен миокарден инфаркт.

Докато приемат бета-блокери, пациенти с анамнеза за анафилактичния реакция към различни алергени, могат да развият повторна тежка реакция случайно, диагностично или терапевтично. Тези пациенти могат да не се повлияват от обичайните дози епинефрин, използван за лечение на алергичната реакция.

4.6. Бременност и кърмене

Atenolol може да причини увреждания на плода, когато се прилага при бременни. Той преминава през плацентата. Прилагането на atenolol при бременни за дълго време при лечението на лека до средна хипертония се съпътства от вътреутробно забавено развитие.

Ако това лекарство се използва по време на бременността или пациентките забременеят по време на лечението, те трябва да бъдат известени за потенциалния риск за плода.

Трябва да се внимава, когато atenolol се прилага при кърмачки, понеже той се отделя в майчината кърма в съотношение 1.5 към 6.8 в сравнение с концентрациите в плазмата. Съобщавано е за клинично значима брадикардия при кърмачета. Преждевременно родени деца и деца с увредена бъбречна функция са по-склонни към развитие на нежелани лекарствени реакции.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма известни.



4.8. Нежелани лекарствени реакции

Най-често срещаните нежелани лекарствени реакции при всички бета-блокери са повишени нива на кръвната захар, напълняване, лесна уморяемост и импотентност.

Обикновено лекарството се понася добре. Нежеланите лекарствени реакции са леки и преходни. Най-често срещаните са умора, световъртеж, депресия, изстиване на крайниците. При лечението на острия миокарден инфаркт, могат да възникнат брадикардия и хипотония.

В зависимост от продължителността на лечението могат да възникнат следните нежелани лекарствени реакции :

повишени стойности на чернодробните ензими и или билирубина, главоболие, импотентност, болест на Reugonie, псориазиформен обрив или обостряне на псориазиса, пурпура, обратима алоpecia и тромбоцитопения. Atenolol, както и другите бета-блокери е свързан с развитието на антинуклеарни антитела (ANA) и лупус синдром.

Потенциални нежелани лекарствени реакции :

Хематологични : агранулоцитоза.

Алергични : температура, комбинирана с болезнено и възпалено гърло, ларингоспазъм и респираторни смущения.

Централна нервна система : обратимо подтискане на мисълта, прогресиращо до кататония, зрителни смущения, халюцинации, остра краткотрайна загуба на паметта, емоционална лабилност със замъглено съзнание, намалено времетраене и сила на психичните процеси.

Стомашно-чревни : мезентериална тромбоза, исхемичен колит.

Разни : кожни обриви, феномен на Raymond, сухота в очите.

4.9. Предозиране

Преобладаващите симптоми, съобщавани при предозиране са летаргия, нарушено дишане, синусов блок и брадикардия, конгестивна сърдечна недостатъчност, хипотония, бронхоспазъм и/или хипогликемия.

Други общо срещани ефекти при предозиране на бета-адренергичните блокери са конгестивна



недостатъчност, хипотония, бронхоспазъм и/или хипогликемия.

Лечението при предозиране се състои в отстраняване на всяко нерезорбирано лекарство чрез предизвикване на повръщане, стомашна промивка и приемане на активен въглен. Atenolol се отстранява от общото кръвообращение при хемодиализа. Други методи на лечение могат да се приложат по лекарско указание.

5. Фармакологични данни

5.1. Фармакодинамични свойства

Atenolol е β_1 -селективен (кардиоселективен) блокиращ β -адренергичните рецептори лекарствен продукт без мембраностабилизиращи или съществени симпатомиметични (частичен агонист) свойства.

Във високи дози atenolol инхибира β_2 -адренергичните рецептори, локализирани главно в бронхиалната и съдовата мускулатура. Механизмът на действие все още не е установен.

Адрено-рецепторната β -блокираща активност се проявява чрез :

1. Намаляване в покой и усилие на сърдечния пулс и сърдечния дебит.
2. Намаляване на систоличното и диастоличното налягане в покой и при усилие.
3. Инхибиране на изопротеренол-индуцираната тахикардия.
4. Намаляване на рефлекторната ортостатична тахикардия.

Намаляването на тахикардията при усилие е очевидно до 1 час след перорално приложение на единична доза atenolol. Този ефект е максимален от 2 до 4 часа и персистира поне 24 часа. Продължителността на действието е дозо-зависима и също поддържа линейно отношение към логаритъма на плазмената концентрация на atenolol. Антихипертензивният ефект не е свързан с плазменото ниво. Съгласно неговия негативен хронотропен ефект по време на β -блокадата на синусовия възел, atenolol увеличава времетраенето на синусовия цикъл и времето за възстановяване на синусовия възел. Провеждането в атриовентрикуларния възел също удължено.



Atenolol е лишен от мембрано-стабилизиращо действие и повишавайки дозата над тази, която води до β -блокада, по-нататък не подтиска миокардния контрактилитет.

Atenolol, приеман в единична дневна перорална доза, е активно антихипертензивно средство, осигуряващо 24 – часово понижаване на кръвното налягане.

В комбинация с тиазидни диуретици ефектът върху кръвното налягане е приблизително адитивен. Atenolol е също така съвместим с хидралазин и празосин, чиято комбинация с тях се изразява в по-продължително понижаване на кръвното налягане, отколкото при самостоятелното им приложение. Блокирайки позитивните хронотропни и инотропни ефекти на катехоламините и понижавайки кръвното налягане, atenolol обикновено понижава кислородните потребности на сърцето при физическо усилие, което е от полза за много пациенти с ангина пекторис, които са на продължително лечение. От друга страна atenolol може да повиши кислородните потребности чрез нарастване на левокамерната мускулна дължина и крайното диастолично налягане, особено при пациентите със сърдечна недостатъчност.

5.2. Фармакокинетични свойства

Абсорбцията на една орална доза е бърза, но непълна. Около 50% се абсорбират през гастроинтестиналния тракт, а остатъкът се екскретира в непроменен вид с фекалиите.

Пикови кръвни нива се достигат между 2 и 4 час след приемане.

Atenolol претърпява леко или никакво метаболизиране в черния дроб и се отделя предимно чрез бъбречна екскреция. Atenolol е свързан с плазмените протеини в съвсем малко количество (6 – 16 %). Елиминационният полуживот на atenolol при перорално приложение е около 6-7 часа и няма промяна в кинетиката на лекарството при продължителното му прилагане.

При перорална доза 50 или 100 mg двата ефекта на atenolol (β -блокиращият и антихипертензивният) персистират поне 24 часа.

Когато бъбречната функция е увредена, елиминирането на atenolol е тясно свързано със стойността на гломерулната филтрация.



5.3. Предклинични данни за безопасност

Няма данни

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Gelatin	5.00 mg	Ph.Eur.3
Maize starch	129.00 mg	BP 98/ Ph.Eur.3
Heavy magnesium carbonate	190.00 mg	Ph.Eur.3
Sodium lauryl sulphate	8.00 mg	Ph.Eur.3 and Manuf. Sp.
Talc	13.50 mg	Ph.Eur.3Add 1999/ USP 24 and Manuf. Sp.
Magnesium stearate	4.50 mg	Ph.Eur.3.Add.2000,BP98 and USP 24

6.2. Физико - химични несъвместимости

Няма известни

6.3. Срок на годност: 2 години.

6.4. Специални условия на съхранение

Да се съхранява при температура под 25°C, в оригиналната опаковка.

6.5. Данни за опаковката

Първична опаковка : блистери от PVC/алуминиево фолио, с по 10 бр. таблетки във всеки.

Вторична опаковка : картонена кутия с 2 бр. блистери.

6.6. Препоръки при употреба : няма специални изисквания.

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба и производителя :

S.C. LABORMED PHARMA S.A.
319, Splaiul Independentei, sector 6,
BUCHAREST, ROMANIA

8. Регистрационен № в Регистъра по чл. 28 от ЗЛАХМ

9. Дата на първо разрешаване за употреба на лекарствения продукт (подновяване на разрешението) :

10. Дата на (частична) актуализация на текста : юли 2001 г.

