

ПРИЛОЖЕНИЕ I
КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към Рег. № 20020823
Разрешение № 22572-5 / 13. 06. 2013
Одобрение № /

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

TABEX 1,5 mg film-coated tablets
ТАБЕКС 1,5 mg филмирани таблетки

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа цитизин (*cytisine*) 1,5 mg.
Помощни вещества: лактоза и други.
За пълния списък на помощните вещества, вж. точка 6.1

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка
Кръгли, бежови, двойноизпъкнали таблетки с диаметър 6 mm.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Хроничен никотизъм (табакизъм) – за отказване от тютюнопушене.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Таблетките се приемат цели с достатъчно количество течност. Прилага се по следната схема: от 1 до 3 ден - по 1 таблетка на 2 часа (6 таблетки дневно). В тези дни се очаква постепенно намаляване броя на изпушените цигари. Ако резултатът е незадоволителен лечението се прекратява и след 2-3 месеца може да започне отново. При добро повлияване лечението продължава по следната схема:

от 4 до 12 ден – по 1 таблетка на 2,5 часа (5 таблетки дневно);
от 13 до 16 ден – по 1 таблетка на 3 часа (4 таблетки дневно);
от 17 до 20 ден – по 1 таблетка на 5 часа (3 таблетки дневно);
от 21 до 25 ден – по 1-2 таблетки дневно.

Окончателното прекратяване на пушенето трябва да стане към петия ден от започване на лечението. След приключване на лечебния курс пациентът трябва да прояви воля и да не си позволява изпушване на нито една цигара.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към активното или някое от помощните вещества;
остър инфаркт на миокарда;
нестабилна стенокардия;
сърдечна аритмия;
наскоро прекаран цереброваскуларен инцидент;
атеросклероза;
бременност и период на кърмене.

Относителни противопоказания за прилагането му са:

някои форми на шизофрения;
хромафинни тумори на надбъбречната жлеза;
гастрозофагеална рефлуксна болест.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба



Табекс трябва да се назначава само когато пациентът има сериозно намерение да се откаже от тютюнопушене. Лечението с него и продължаване на пушенето може да доведе до засилване на нежеланите ефекти на никотина (никотинова интоксикация).

Няма достатъчен клиничен опит от приложението на Табекс при пациенти с исхемична болест на сърцето, сърдечна недостатъчност, артериална хипертония, мозъчносъдови заболявания, облитериращи артериални заболявания, хипертиреоидизъм, пептична язва, диабет, бъбречна или чернодробна недостатъчност. Употребата на Табекс при тези болни трябва да става след внимателна преценка от лекуващия лекар.

Няма достатъчен клиничен опит за безопасното приложение на Табекс при деца под 18 години и възрастни над 65 години, поради което не се препоръчва употребата му при тези възрастови групи.

Лекарственият продукт съдържа помощно вещество лактоза. Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към галактоза, лактазен дефицит на Lapp или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат лекарството.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Табекс не трябва да се прилага едновременно с туберкулостатици поради риск от засилване на нежеланите реакции.

При едновременно приложение на Табекс с холиномиметици и антихолинестеразни лекарствени продукти е възможно усилване на холиномиметичните нежелани лекарствени реакции.

Едновременното приложение с антихиперлипидемични лекарствени продукти (статици) повишава риска от поява на миалгия.

Едновременното приложение на Табекс с антихипертензивни лекарствени продукти може да понижи ефекта им.

4.6 Бременност и кърмене

Табекс не се прилага по време на бременност и в периода на кърмене.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Табекс не повлиява способността за шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Проведените клинични изследвания и постмаркетингови наблюдения показват добра поносимост към продукта. Наблюдаваните нежелани лекарствени реакции са слаби до умерено изразени. Повечето от тях са в началото на лечението и отзвучават в хода на лечението. Най-често те са свързани с никотинова зависимост.

Сърдечни нарушения: тахикардия, леко повишаване на артериалното налягане, палпитации;

Нарушения на нервната система: главоболие, замаяване, безсъние или сънливост, повишена раздразнителност;

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения: диспнея;

Стомашно-чревни нарушения: промени във вкуса и апетита, сухота в устата, гадене, коремни болки, запек, диария;

Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан: миалгии;

Нарушения в метаболизма и храненето: повишено потоотделяне, отслабване;

Общи нарушения: болки в гръдния кош.

4.9 Предозиране

Симптоми на предозиране: гадене, повръщане, разширяване на зениците, обща слабост, тахикардия, клонични гърчове, парализа на дишането.

Лечение: стомашна промивка, инфузионно лечение с водносолеви и глюкозни разтвори, противогърчови средства, кардиотоници, дихателни analeптици и други симптоматични средства.

Мониторират се дишането, артериалното налягане и сърдечната честота.



5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Лекарства, използвани при никотинова зависимост. АТС код: N07BA.

Алкалоидът цитизин, който е активната съставка на продукта, притежава N-холиномиметично действие. Ефектите му се изразяват в следното: възбужда ганглиите на вегетативната нервна система, рефлекторно възбужда дишането, предизвиква отделяне на адреналин от медулната част на надбъбрека, повишава артериалното налягане.

Механизмът на действие на цитизин е сходен с този на никотина, но е с много по-ниска токсичност и по-голям терапевтичен индекс. Цитизин конкурентивно потиска взаимодействието на никотин със съответните рецептори, което води до постепенно намаляване и изчезване на никотиновата зависимост.

5.2 Фармакокинетични свойства

Фармакокинетичните параметри на цитизин са определени след еднократно прилагане върху зайци на перорална доза 5 mg/kg и интравенозно 1 mg/kg и върху мишки 2 mg/kg - перорално и интравенозно.

Резорбция

Цитизин се резорбира бързо и непълно в стомашно-чревния тракт. Степента на резорбция при мишки след перорален прием е 42%, а при зайци 34%.

Максимална плазмена концентрация при перорален прием при мишки се достига след 2 часа, а при зайци - след 35 минути.

Разпределение

Високи плазмени концентрации на цитизин след перорално и интравенозно приложение се установяват в черен дроб, бъбреци и надбъбречни жлези. Обемът на разпределение (Vd) при зайци след перорално и венозно прилагане е 6,21 l/kg и съответно 1,02 l/kg.

Екскреция

18% от приетата перорална доза при мишки се елиминира чрез урината за 24 часа. Елиминационният полуживот при мишки след интравенозно приложение е около 200 минути, след орално приложение - 52 минути, а при зайци след интравенозно прилагане - 37 минути.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Токсикологичните изследвания на продукта при плъхове в продължение на 30 и 90 дни показват добра резорбция и липса на токсични ефекти върху хемопоезата и вътрешните органи.

Пероралното приложение на продукта при мишки в продължение на 45 дни, плъхове и кучета (180 дни) не предизвиква токсични промени в хемопоезата и вътрешните органи, с изключение на различни по степен дистрофични изменения на черния дроб.

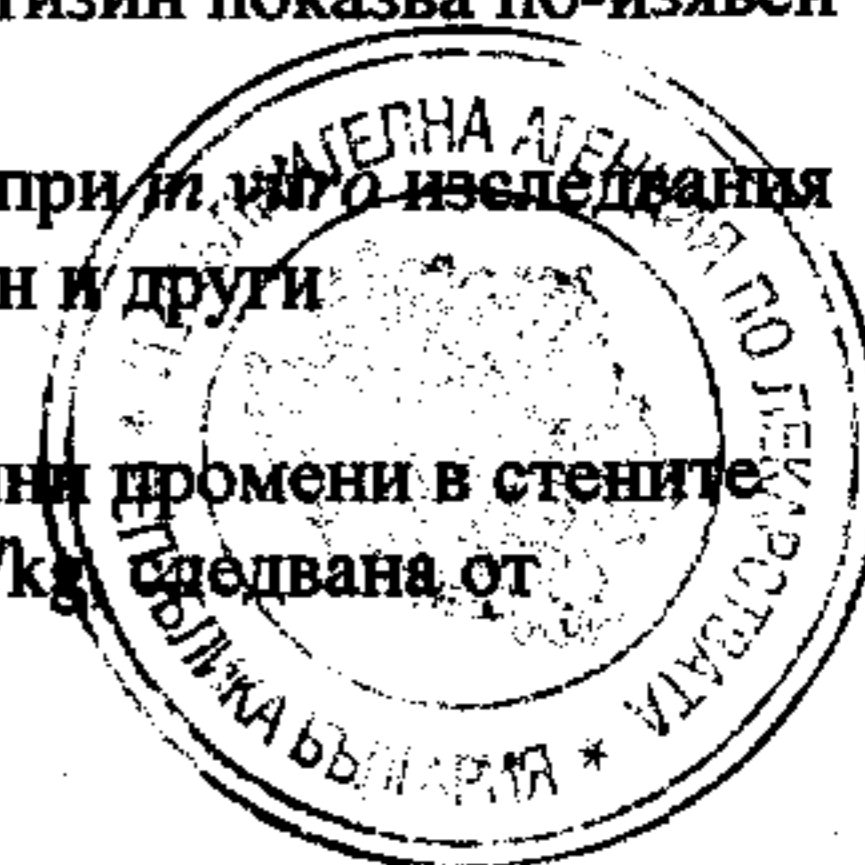
Еднократни перорални дози цитизин (1 и 5 mg/kg) и никотин (1 и 5 mg/kg) не предизвикват промени в сърдечната честота или удължаване на QT интервала при мъжки и женски морски свинчета.

Цитизин в дози 1 mg/kg и 5 mg/kg има по-добър профил на безопасност по отношение на стомашната лигавица в сравнение с никотин в същата доза при плъхове.

При изследване на цитизин и никотин в еквимоларни концентрации в изолирани хепатоцити се установява, че цитизин предизвиква значително по-слаба токсичност върху виталността на хепатоцитите и деплецията на GSH в сравнение с никотин. Същевременно цитизин показва по-изявен токсичен ефект върху продукта на липидната пероксидация – MDA.

Цитизин (6,25–200 μM) показва извънредно нисък нефротоксичен потенциал при ~~in vitro~~ изследвания върху човешки ембрионални бъбречни епителни клетки в сравнение с никотин и други нефротоксични продукти.

При 5-дневно третиране на плъхове с цитизин и никотин се доказват значителни промени в стените на бъбречните кръвоносни съдове в групата, третирана с никотин в доза 5 mg/kg, следвана от



никотин в доза 1 mg/kg, цитизин в доза 5 mg/kg и незначителни промени в групата животни, третирани с цитизин в доза 1 mg/kg.

Сравнително изследване на генотоксичния потенциал на цитизин, никотин и добре известни генотоксични вещества (митомицин С и циклофосфамид) показва, че цитизин в терапевтични дози не проявява кластогенна активност.

Няма данни за карциногенен потенциал на цитизин.

Цитизин в дози 3 mg/kg и 4 mg/kg не предизвиква ембриотоксичен ефект при плъхове.

При кокоши ембриони прилагането на цитизин в терапевтични дози не предизвиква ембриотоксичен и тератогенен ефект; във високи дози обаче оказва ембриотоксично действие.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Лактоза монохидрат (таблетоза 70),

микростална целулоза (тип 102),

талк,

магнезиев стеарат.

Състав на филмовото покритие:

Опадрай II кафяв

- поливинилов алкохол – частично хидролизиран

- титанов диоксид (E171)

- макрогол 3350

- талк (E553b)

- жълт железен оксид (E172)

- червен железен оксид (E172)

- черен железен оксид (E172)

6.2 Несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок на годност

2 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази от влага.

Да се съхранява под 25°C.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5 Данни за опаковката

По 20 филмирани таблетки в блистер от PVC/алуминиево фолио; по 5 блистера в картонена кутия, заедно с листовка.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

СОФАРМА АД



ул. Илиенско шосе 16, 1220 София, България

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Рег. №: 20020873/06.11.2002

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

06.11.2002

25.02.2009

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Април 2013

