

RIASSUNTO DELLE CARATTERISTICHE DEL PRODOTTO

1. DENOMINAZIONE DEL MEDICINALE

TENSIBLOCK 100 mg compresse

2. COMPOSIZIONE QUALITATIVA E QUANTITATIVA

Una compressa contiene: Principio attivo: atenololo 100 mg

Per gli eccipienti vedere 6.1

3. FORMA FARMACEUTICA

Compresse divisibili.

4. INFORMAZIONI CLINICHE

4.1 Indicazioni terapeutiche

- Ipertensione arteriosa, compresa quella di origine renale.
- Angina pectoris.
- Aritmie.
- Intervento precoce nell'infarto miocardico acuto.

4.2 Posologia e modo di somministrazione

Adulti

Ipertensione arteriosa, compresa quella di origine renale

Mezza o una compressa (50-100 mg) il giorno. Di solito il pieno effetto antipertensivo si raggiunge dopo una o due settimane di terapia. Se necessario, è possibile ottenere un'ulteriore riduzione dei valori pressori associando TENSIBLOCK con altri farmaci antipertensivi.

In particolare, la somministrazione contemporanea di TENSIBLOCK con un diuretico determina un effetto antipertensivo superiore a quello prodotto dai singoli farmaci.

Angina pectoris

La maggior parte dei pazienti risponde alla somministrazione di una compressa (100 mg) al giorno.

Aumentando la posologia non si ottiene generalmente un ulteriore beneficio.

Aritmie

Dopo aver controllato le aritmie con una formulazione iniettabile di atenololo, si consiglia una posologia di mantenimento per via orale di 50-100 mg/die.

Intervento precoce nell'infarto miocardico acuto

Il trattamento con una formulazione iniettabile di atenololo deve essere iniziato entro le 12h dall'insorgenza del dolore precordiale nell'infarto miocardico acuto. Dopo 15 minuti dall'iniezione in bolo, somministrare 50 mg di TENSIBLOCK (½ compressa) per via orale seguiti da altri 50 mg dopo 12 ore dall'iniezione. Successivamente si consiglia una terapia di mantenimento per via orale alla dose di 100 mg/die che dovrebbe essere iniziata dopo altre 12 ore.

Qualora compaia bradicardia e/o ipotensione (di entità tale da richiedere un intervento terapeutico) o altri gravi effetti collaterali, TENSIBLOCK deve essere sospeso.

Anziani

Può rendersi necessario ridurre la posologia, particolarmente nei pazienti con compromissione della funzionalità renale.

Bambini

Non esistono esperienze cliniche relative all'impiego pediatrico di TENSIBLOCK; pertanto se ne sconsiglia la somministrazione ai bambini.

Insufficienza renale. Poiché TENSIBLOCK è escreto per via renale è necessario ridurre il dosaggio nei pazienti con grave compromissione della funzionalità renale. Non si verifica accumulo significativo di TENSIBLOCK nei pazienti che hanno una clearance della creatinina superiore a $35 \text{ ml/min/1,73m}^2$ (il limite normale è di $100\text{-}150 \text{ ml/min/1,73m}^2$). Nei pazienti con clearance creatinica di $15\text{-}35 \text{ ml/min/1,73m}^2$ (equivalente a $3,4\text{-}6,8 \text{ mg\%}$ di creatininemia) la posologia deve essere di 50 mg al giorno o 100 mg a giorni alterni.

Per i pazienti con clearance creatinica $<15 \text{ ml/min/1,73m}^2$ (equivalente a $6,8 \text{ mg\%}$ di creatininemia) la posologia deve essere di 50 mg a giorni alterni o 100 mg ogni 4 giorni.

Ai pazienti in emodialisi TENSIBLOCK deve essere somministrato per via orale alla dose di 50 mg dopo ogni seduta; la somministrazione deve essere effettuata in ambiente ospedaliero, in quanto possono verificarsi marcate riduzioni della pressione arteriosa.

4.3 Controindicazioni

Come gli altri beta-bloccanti, TENSIBLOCK non deve essere somministrato a pazienti con: ipersensibilità al principio attivo o ad uno qualsiasi degli eccipienti; bradicardia; shock cardiogeno; ipotensione; acidosi metabolica; gravi disturbi della circolazione arteriosa periferica; blocco atrioventricolare di 2° e 3° grado; malattie del nodo del seno; feocromocitoma non trattato; scompenso cardiaco non controllato da una terapia adeguata.

TENSIBLOCK non deve essere associato a terapia con verapamil o diltiazem.

4.4 Avvertenze speciali e opportune precauzioni d'impiego

Sebbene TENSIBLOCK sia controindicato nello scompenso cardiaco non controllato da una terapia adeguata (ved. paragrafo 4.3) può essere somministrato a pazienti i cui segni di insufficienza cardiaca risultino controllati e, con la dovuta cautela, a pazienti con una riserva cardiaca scarsa.

Nei pazienti affetti da angina di Prinzmetal, TENSIBLOCK può aumentare il numero e la durata delle crisi anginose tramite vasocostrizione arteriosa coronarica mediata dagli alfa recettori. Tuttavia, seppur con la massima cautela, può essere considerato il suo impiego in questi pazienti, in quanto TENSIBLOCK è un beta-bloccante beta-1 selettivo.

Come già indicato al nel paragrafo 4.3, TENSIBLOCK non deve essere somministrato a pazienti affetti da gravi disturbi della circolazione arteriosa periferica. Durante il suo impiego, in pazienti affetti da disturbi vascolari periferici di modesta entità, si può anche verificare un aggravamento di tali disturbi.

Particolare cautela nella somministrazione di TENSIBLOCK va rivolta ai pazienti con blocco atrioventricolare di 1° grado, a causa del suo effetto negativo sul tempo di conduzione.

TENSIBLOCK può modificare la tachicardia indotta da ipoglicemia.

TENSIBLOCK può mascherare i segni di tireotossicosi.

La riduzione della frequenza cardiaca è un'azione farmacologica indotta da TENSIBLOCK. Dovrà essere considerata una riduzione del dosaggio nei rari casi in cui compaiono sintomi attribuibili all'eccessiva riduzione della frequenza cardiaca.

E' importante non interrompere bruscamente il trattamento con TENSIBLOCK, specialmente nei pazienti affetti da cardiopatia ischemica.

Nei pazienti in terapia con TENSIBLOCK e con una storia di reazioni anafilattiche a diversi allergeni, si può verificare un aggravamento delle reazioni allergiche in occasione di ripetuti stimoli da parte dell'allergene.

Questi pazienti possono non rispondere adeguatamente alle dosi di adrenalina comunemente impiegate nel trattamento delle reazioni allergiche.

Nei pazienti asmatici TENSIBLOCK può indurre un aumento della resistenza delle vie respiratorie; tuttavia, seppur con la massima cautela, può essere considerato il suo impiego in questi pazienti, in quanto TENSIBLOCK è un beta-bloccante beta-1 selettivo. In caso di aumento della resistenza delle vie respiratorie, la somministrazione di TENSIBLOCK deve essere interrotta e, se necessario, deve essere instaurata una terapia con preparati broncodilatatori (come il salbutamolo).

4.5 Interazioni con altri medicinali e altre forme di interazione

TENSIBLOCK non deve essere somministrato a pazienti in terapia con calcio-antagonisti con effetto inotropo negativo (es. verapamil, diltiazem); è necessario che siano trascorse almeno 48 ore dalla sospensione di uno di questi farmaci prima di iniziare l'altra terapia.

L'uso concomitante con diidropiridine (es. nifedipina) può aumentare il rischio di ipotensione e possono verificarsi casi di insufficienza cardiaca in pazienti con insufficienza cardiaca latente.

I farmaci glicosidi-digitalici, associati ai beta-bloccanti, possono provocare un aumento del tempo di conduzione atrioventricolare.

I beta-bloccanti possono aggravare il brusco rialzo dei valori pressori che può verificarsi dopo la sospensione della clonidina. Se i due farmaci vengono somministrati contemporaneamente, il beta-bloccante deve essere sospeso parecchi giorni prima di interrompere la terapia con clonidina. Se la terapia con beta-bloccante deve sostituire quella con clonidina, è necessario che l'inizio del trattamento con beta-bloccante avvenga parecchi giorni dopo l'interruzione della terapia con clonidina.

Particolare cautela richiede la somministrazione di TENSIBLOCK a pazienti in trattamento con farmaci antiaritmici appartenenti alla I classe, come la disopiramide.

I farmaci simpaticomimetici, come l'adrenalina, possono contrapporsi all'effetto dei beta-bloccanti se usati contemporaneamente.

L'uso concomitante di farmaci inibitori la sintesi prostaglandinica (ibuprofene, indometacina) può ridurre gli effetti ipotensivi dei beta-bloccanti.

E' necessario porre particolare cautela nell'uso degli agenti anestetici in pazienti trattati con TENSIBLOCK.

Occorre che l'anestesista sia informato di tale terapia e, in questo caso, deve essere impiegato un agente anestetico con una minima attività inotropica negativa.

L'uso dei beta-bloccanti con agenti anestetici può provocare un'attenuazione della tachicardia riflessa e aumentare il rischio di ipotensione. E' da evitare l'uso di agenti anestetici che causano depressione miocardica.

4.6 Gravidanza ed allattamento

Gravidanza

TENSIBLOCK attraversa la barriera placentare e si sono riscontrati livelli ematici nel cordone ombelicale.

Non sono stati effettuati studi sull'impiego di TENSIBLOCK nel 1° trimestre di gravidanza e pertanto non può essere esclusa la possibilità di un danno fetale.

TENSIBLOCK è stato impiegato, sotto stretto controllo medico, per il trattamento dell'ipertensione nel 3° trimestre. L'uso di TENSIBLOCK in donne gravide, per il trattamento dell'ipertensione lieve-moderata, è stato associato a un ritardo della crescita intra-uterina.

L'uso di TENSIBLOCK, in donne che sono in gravidanza o che possono iniziarla, richiede un'attenta valutazione dei benefici indotti dalla terapia rispetto ai possibili rischi, particolarmente nel 1° e 2° trimestre di gestazione.

Allattamento

Si riscontra un accumulo significativo di TENSIBLOCK nel latte materno. Deve essere adottata cautela quando TENSIBLOCK viene somministrato a donne che allattano.

I nati da madri che hanno assunto TENSIBLOCK poco prima di partorire o durante l'allattamento possono essere a rischio di ipoglicemie e bradicardia. Bisogna porre attenzione quando TENSIBLOCK è assunto durante la gravidanza o l'allattamento.

4.7 Effetti sulla capacità di guidare veicoli e di usare macchinari

E' improbabile che TENSIBLOCK influisca sulla capacità di guidare veicoli e sull'uso di macchinari. Tuttavia va tenuto in considerazione che si possono occasionalmente verificare capogiri o affaticamento.

4.8 Effetti indesiderati

Tensibloc è ben tollerato. Negli studi clinici, gli eventi indesiderati segnalati sono generalmente attribuibili alle azioni farmacologiche dell'atenololo.

I seguenti effetti indesiderati, elencati per sistema corporeo, sono stati riportati con le seguenti frequenze: molto comuni ($\geq 10\%$), comuni (1 - 9,9%), non comuni (0,1 - 0,9%), rari (0,01% - 0,09%), molto rari ($< 0,01\%$) inclusi casi isolati.

Disturbi cardiaci:

comuni: bradicardia;

rari: deterioramento della funzionalità cardiaca; insorgenza di blocco cardiaco

Disturbi vascolari:

comuni: freddo alle estremità

rari: ipotensione posturale che può essere associata a sincope; aggravamento della claudicazione intermittente; nei pazienti sensibili fenomeno di Raynaud

Disturbi del sistema nervoso:

rari: capogiri; cefalea; parestesia

Disturbi psichiatrici:

non comuni: disturbi del sonno similmente a quanto riportato da altri beta-bloccanti

rari: cambiamenti dell'umore; incubi; psicosi o allucinazioni; aggravamento di sindromi nervose con depressione mentale, catatonia, confusione e turbe della memoria.

Disturbi gastrointestinali:

comuni : disturbi gastrointestinali

rari: secchezza delle fauci;

Esami di laboratorio:

comuni: aumenti dei livelli di transaminasi

molto rari: è stato osservato un incremento di anticorpi antinucleo, tuttavia non è chiara la rilevanza clinica.

Disturbi epatobiliari

rari: tossicità epatica, inclusa la colestasi intraepatica.

Disturbi del sangue e del sistema linfatico:

rari: porpora; trombocitopenia;

Disturbi della pelle e del tessuto sottocutaneo:

rari: alopecia; reazioni cutanee di tipo psoriasico; aggravamento della psoriasi; rash cutaneo;

Disturbi oculari:

rari: secchezza agli occhi; disturbi della vista

Disturbi del sistema riproduttore e della mammella:

rari: impotenza

Disturbi respiratori; toracici e del mediastino:

rari: in pazienti con asma bronchiale o con una storia di problemi asmatici può verificarsi broncospasmo.

Disturbi generali

Comune: affaticamento.

Qualora, secondo il giudizio clinico, la qualità di vita del paziente venisse negativamente interessata dalla presenza di un qualsiasi effetto indesiderato sopraelencato, deve essere considerata la sospensione del trattamento.

4.9 Sovradosaggio

I sintomi di sovradosaggio possono manifestarsi con bradicardia, ipotensione, insufficienza cardiaca acuta e broncospasmo.

Le misure di supporto generali devono comprendere: stretta sorveglianza medica, ricovero nel reparto di terapia intensiva, lavanda gastrica, impiego di carbone attivo e di un lassativo per prevenire l'assorbimento di qualsiasi farmaco ancora presente nel tratto gastrointestinale, impiego di plasma o emoderivati per trattare l'ipotensione e lo shock.

E' da considerare la possibilità di utilizzare l'emodialisi o l'emoperfusione.

Una spiccata bradicardia può essere corretta con 1-2 mg di atropina somministrata per via endovenosa e/o con un pace-maker cardiaco. Se necessario, a questa può far seguito una dose di 10 mg di glucagone in bolo per via endovenosa, che può essere ripetuta o seguita da 1-10 mg/h di glucagone per infusione endovenosa in funzione della risposta.

Nel caso non vi fosse risposta al glucagone o questo non fosse disponibile, si ricorra a uno stimolante beta-adrenocettore come la dobutamina alla dose di 2,5-10 mcg/kg/min per infusione endovenosa. La dobutamina, per i suoi effetti inotropi positivi, potrebbe anche essere usata per trattare l'ipotensione e l'insufficienza cardiaca acuta. E' probabile che queste dosi siano inadeguate per contrastare gli effetti cardiaci indotti dal beta-blocco in caso di ampio sovradosaggio. La dose di dobutamina deve essere quindi aumentata, se necessario, per ottenere la risposta desiderata sulla base delle condizioni cliniche del paziente.

Il broncospasmo può generalmente essere risolto mediante la somministrazione di preparati broncodilatatori.

5. PROPRIETA' FARMACOLOGICHE

Proprietà farmacodinamiche Categoria farmacoterapeutica: Beta-bloccanti, selettivi, non associati.

Codice atc: C07AB03

L'atenololo è un beta-bloccante beta-1 selettivo (per es. agisce preferenzialmente sui beta-1 recettori adrenergici cardiaci). La selettività diminuisce con l'aumentare della dose.

L'atenololo è privo di attività simpaticomimetica intrinseca e di attività stabilizzante di membrana e, come gli altri beta-bloccanti, possiede effetti inotropi negativi (è quindi controindicato nella insufficienza cardiaca non controllata).

Come con gli altri beta-bloccanti, il modo d'azione dell'atenololo nel trattamento dell'ipertensione non è chiaro.

L'efficacia dell'atenololo nell'eliminare o ridurre i sintomi nei pazienti affetti da angina è probabilmente determinata dalla riduzione della frequenza cardiaca e della contrattilità.

E' improbabile che qualsiasi proprietà addizionale ausiliaria posseduta da S (-) atenololo, rispetto alla miscela racemica, dia origine a diversi effetti terapeutici.

TENSIBLOCK è efficace e ben tollerato dalla maggior parte delle etnie, anche se una risposta inferiore può verificarsi nei pazienti di razza nera.

TENSIBLOCK è compatibile con i diuretici, con altri farmaci antipertensivi e antianginosi (vedere paragrafo 4.5)

5.2 Proprietà farmacocinetiche

Dopo somministrazione endovenosa, i livelli ematici dell'atenololo decadono in modo tri-esponenziale con un'emivita di eliminazione di circa 6 ore.

Nel range di dosaggio di 5-10 mg per via endovenosa il livello del profilo ematico risponde a una farmacocinetica lineare e il beta-blocco è ancora misurabile 24 ore dopo una dose di 10 mg per via e.V.

Dopo somministrazione orale, l'assorbimento dell'atenololo è consistente, ma incompleto (circa 40-50%) con un picco di concentrazioni plasmatiche di 2-4 ore dopo la dose.

I livelli ematici dell'atenololo sono consistenti e soggetti a una lieve variabilità.

Non risulta una significativa metabolizzazione epatica dell'atenololo e più del 90% dell'atenololo assorbito raggiunge la circolazione sistemica in modo inalterato.

L'emivita plasmatica è di circa 6 ore, ma può aumentare nei pazienti con grave insufficienza renale, poiché il rene è la principale via di eliminazione.

L'atenololo penetra scarsamente nei tessuti a causa della sua bassa solubilità lipidica e la sua concentrazione nei tessuti cerebrali è bassa. La quota di atenololo legata alle proteine plasmatiche è minima (circa 3%).

TENSIBLOCK è efficace per almeno 24 ore dopo una singola dose orale giornaliera. La semplicità posologica facilita la compliance per la sua accettabilità da parte del paziente.

5.3 Dati preclinici di sicurezza

Con l'atenololo è stata ottenuta un'ampia esperienza clinica.

Le varie informazioni riguardanti la sua somministrazione sono riportate nei paragrafi specifici.

6. INFORMAZIONI FARMACEUTICHE

6.1 Elenco degli eccipienti

Magnesio carbonato pesante, amido di mais, sodio laurilsolfato, magnesio stearato.

6.2 Incompatibilità

Non sono note incompatibilità.

6.3 Periodo di Validità

3 anni.

6.4 Speciali precauzioni per la conservazione

Conservare nella confezione originale per tenerlo al riparo da luce e umidità.

6.5 Natura e contenuto del contenitore

Blister di PVC/Alluminio.

TENSIBLOCK 100 mg compresse - 42 compresse

6.6 Istruzioni per l'impiego e la manipolazione

Nessuna istruzione particolare.

7. TITOLARE DELL'AUTORIZZAZIONE ALL'IMMISSIONE IN COMMERCIO

EPIFARMA Srl Via San Rocco, 6 – 85033 EPISCOPIA (PZ)

8. NUMERO DELL'AUTORIZZAZIONE ALL'IMMISSIONE IN COMMERCIO

TENSIBLOCK 100 mg compresse - 42 compresse

A.I.C. n. 036541011

9. DATA DELLA PRIMA AUTORIZZAZIONE/RINNOVO DELL'AUTORIZZAZIONE

08/09/2005

10. DATA DI REVISIONE DEL TESTO

08/09/2005